



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 108349888 B

(45) 授权公告日 2022.03.25

(21) 申请号 201680066096.9

G・博杰克 H・赫尔姆克

(22) 申请日 2016.10.04

D・施姆茨勒 H・迪特里希

(65) 同一申请的已公布的文献号

E・加茨魏勒 C・H・罗辛格

申请公布号 CN 108349888 A

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285

(43) 申请公布日 2018.07.31

代理人 周志明 钟守期

(30) 优先权数据

(51) Int.CI.

15188613.2 2015.10.06 EP

C07D 209/54 (2006.01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

A01N 43/38 (2006.01)

2018.05.11

A01P 13/00 (2006.01)

(86) PCT国际申请的申请数据

(56) 对比文件

PCT/EP2016/073590 2016.10.04

W0 01/74770 A1, 2001.10.11

(87) PCT国际申请的公布数据

CN 1173866 A, 1998.02.18

W02017/060203 DE 2017.04.13

CN 101006056 A, 2007.07.25

(73) 专利权人 拜耳作物科学股份公司

W0 2015/040114 A1, 2015.03.26

地址 德国莱茵河畔蒙海姆

CN 1129444 A, 1996.08.21

(72) 发明人 A・安格曼 S・莱尔 R・菲舍尔

审查员 李雅琴

权利要求书2页 说明书30页

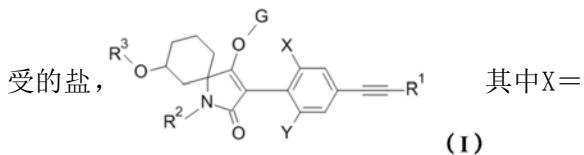
(54) 发明名称

新的炔基-取代的3-苯基吡咯烷-2,4-二酮

及其用作除草剂的用途

(57) 摘要

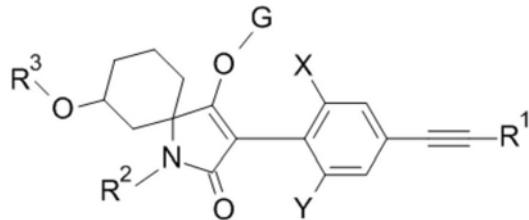
本发明涉及新的活性的式(I)的炔基-取代的N-苯基吡咯烷-2,4-二酮或其农业化学上可接

C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基或C₃-C₆-环烷基，Y=C₁-C₄-烷基或C₃-C₆-环烷基，R¹=氢、C₁-C₆-烷基或C₃-C₆-环烷基，R²=氢或甲基，R³=C₁-C₆-烷基或C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烷基，G=氢、可裂解基团

B L或阳离子E。本发明还涉及包含通式(I)的化合物的除草剂组合物和本发明化合物用于防治经

L或阳离子E。本发明还涉及包含通式(I)的化合物的除草剂组合物和本发明化合物用于防治经济作物栽培中的杂草和禾本科杂草的用途。

1. 通式(I)的炔基-取代的N-苯基吡咯烷-2,4-二酮或其盐，



(I)

其中

X=C₁-C₄-烷基或C₃-C₆-环烷基，

Y=C₁-C₄-烷基或C₃-C₆-环烷基，

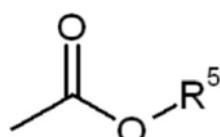
R¹=甲基、乙基、异丙基或环丙基，

R²=氢，

R³=C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烷基，

G=可裂解基团L，其中

L=下列基团之一



其中

R⁵=C₁-C₄-烷基。

2. 根据权利要求1的化合物，其中R³=C₁-C₃-烷氧基-C₂-C₄-烷基。

3. 根据权利要求1至2中任一项的化合物，其中X=甲基、乙基或环丙基且Y为甲基或乙基。

4. 根据权利要求1至2中任一项的化合物，其中X=甲基、乙基或环丙基，Y=甲基或乙基，且R²=氢。

5. 除草剂组合物，其包含权利要求1至4中任一项的通式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐以及任选地农业化学上可接受的载体、稀释剂和/或溶剂。

6. 根据权利要求5的除草剂组合物，包含至少一种选自杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂、安全剂和生长调节剂的农业化学活性物质。

7. 根据权利要求6的除草剂组合物，包含安全剂。

8. 根据权利要求5至7中任一项的除草剂组合物，包含其他除草剂。

9. 防治不想要的植物生长的方法，其中将权利要求1至4中任一项的化合物施用至待防治的植物、植物部位、植物种子或不想要的植物生长进行的区域。

10. 根据权利要求9的方法，其中不想要的植物生长选自草状单子叶杂草。

11. 根据权利要求9或10的方法，其中防治有用植物中抗性禾本科草的植物生长，且其中将权利要求1至4中任一项的除草剂组合物施用至待防治的杂草上。

12. 根据权利要求11的方法，其中有用植物选自小麦、大麦、黑麦、燕麦、稻、甘蔗、大豆、油菜、向日葵和玉米。

13. 权利要求1至4中任一项的式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐用于防治有害植物的用途。

14. 根据权利要求13的用途,特征在于将式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐用于防治在有用植物的作物中的有害植物。

15. 根据权利要求14的用途,特征在于所述有用植物为转基因有用植物。

新的炔基-取代的3-苯基吡咯烷-2,4-二酮及其用作除草剂的用途

[0001] 本发明涉及新的除草有效的通式(I)的炔基-取代的3-苯基吡咯烷-2,4-二酮或其农业化学上可接受的盐,还涉及其用于防治有用植物的作物中的杂草和禾本科杂草的用途。

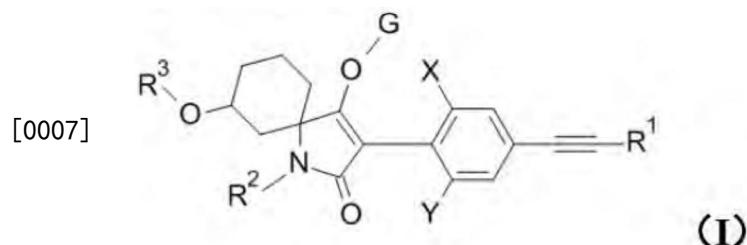
[0002] 3-芳基吡咯烷-2,4-二酮类化合物及其制备和用作除草剂的用途是现有技术中已知的。此外,还记载了具有除草、杀虫或杀真菌效果的双环3-芳基吡咯烷-2,4-二酮衍生物(EP-A-355 599,EP-A-415 211和JP-A 12-053 670等)和取代的单环3-芳基吡咯烷-2,4-二酮衍生物(EP-A-377 893和EP-A-442 077等)。

[0003] 具有除草效果的炔基-取代的3-苯基吡咯烷-2,4-二酮还已知于WO 96/82395,WO 98/05638,WO 01/74770,WO 14/032702或WO 15/040114。

[0004] 这些除草剂抵抗有害植物的效力取决于许多参数,例如取决于使用的施用率、剂型(制剂)、在各种情况下待防治的有害植物、有害植物谱、气候和土壤比例,以及除草剂的作用时间和/或降解速率。为产生足够的除草效果,许多来自3-芳基吡咯烷-2,4-二酮类的除草剂需要高施用率和/或窄的有害植物谱,这使得其应用在经济上缺乏吸引力。因此,存在对具有改良的性能和在经济上有吸引力并且同时有效的可替代除草剂的需求。

[0005] 因此,本发明的目的是提供不具有所述缺点的新的化合物。

[0006] 因此,本发明涉及通式(I)的新的炔基-取代的N-苯基吡咯烷-2,4-二酮或其农业化学上可接受的盐,



[0008] 其中

[0009] X=C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基或C₃-C₆-环烷基,

[0010] Y=C₁-C₄-烷基或C₃-C₆-环烷基,

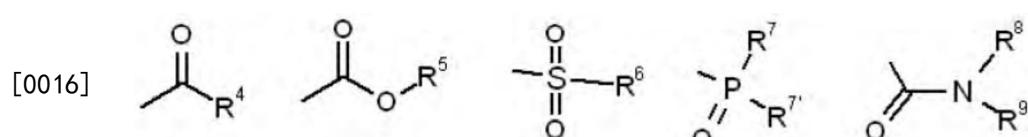
[0011] R¹=氢、C₁-C₆-烷基或C₃-C₆-环烷基,

[0012] R²=氢或甲基,

[0013] R³=C₁-C₆-烷基或C₁-C₆-烷氧基-C₂-C₆-烷基

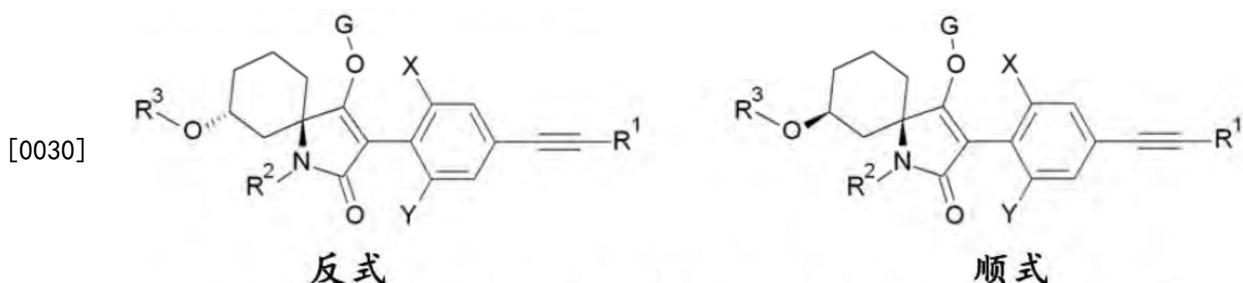
[0014] G=氢、可裂解基团L或阳离子E;其中

[0015] L=下列基团之一



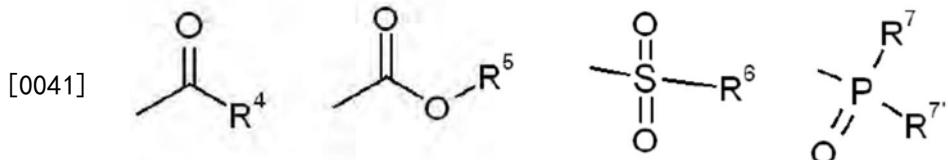
[0017] 其中

- [0018] $R^4=C_1-C_4$ -烷基或 C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，
- [0019] $R^5=C_1-C_4$ -烷基，
- [0020] $R^6=C_1-C_4$ -烷基、未取代的苯基或被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 - 卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基或氰基取代一次或多次的苯基，
- [0021] R^7, R^8 =彼此独立地为甲氧基或乙氧基，
- [0022] R^8 和 R^9 =各自彼此独立地为甲基、乙基、苯基或一起形成饱和 5-元、6-元或7-元环，或与氧原子或硫原子一起形成饱和5-元、6-元或7-元杂环，
- [0023] $E=$ 碱金属离子、碱土金属的离子等价物、铝的离子等价物或过渡金属的离子等价物、镁卤素阳离子，或
- [0024] 铵离子，其中任选地一个、两个、三个或全部四个氢原子被相同或不同的选自氢、 C_1-C_5 -烷基、 C_1-C_5 -烷氧基或 C_3-C_7 -环烷基的基团取代，所述基团在每种情况下可被氟、氯、溴、氰基、羟基取代一次或多次或被一个或多个氧或硫原子中断，或环状仲或叔脂族或杂脂族铵离子，例如吗啉𬭩 (morpholinium)、硫代吗啉𬭩、哌啶𬭩 (piperidinium)、吡咯烷𬭩 (pyrrolidinium) 或在每种情况下质子化的1,4-二氮杂二环[1.1.2]辛烷 (DABC0) 或1,5-二氮杂二环[4.3.0]十一碳-7- 烯 (DBU)，或
- [0025] 杂环铵阳离子，例如在每种情况下质子化的吡啶、2-甲基吡啶、3-甲基吡啶、4-甲基吡啶、2,4-二甲基吡啶、2,5-二甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、5-乙基-2-甲基吡啶、吡咯、咪唑、喹啉、喹喔啉、1,2-二甲基咪唑、1,3-二甲基咪唑𬭩甲基硫酸盐或还为锍离子。
- [0026] 式(I)给出了本发明化合物的一般定义。上文和下文中提及的式中给出的优选取代基或所述基团的范围在下文中阐明：
- [0027] 在式(I)和下文所有的式中，具有多于两个碳原子的烷基基团可为直链或支化的。烷基基团为，例如甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基或2丁基、戊基如正戊基、2,2-二甲基丙基和3-甲基丁基。环烷基为具有3至6个碳原子的碳环的饱和环体系，例如环丙基、环丁基、环戊基或环己基。
- [0028] 卤素为氟、氯、溴或碘。
- [0029] 根据取代基的类型，式(I)的化合物可以以不同的组成、例如以如下文所定义的顺式或反式形式作为几何异构体和/或光学异构体或异构体混合物存在，其为如下定义：



- [0031] 可在合成中出现的异构体混合物可通过常规技术方法分离。
- [0032] 本发明提供纯异构体以及互变异构体和异构体混合物、其制备和用途以及包含这些的组合物。然而，为简单起见，下文中使用的术语是式(I)的化合物，尽管纯化合物以及任选地具有不同比例的同分异构化合物和互变异构化合物的混合物都是预期的。
- [0033] 优选化合物，其中

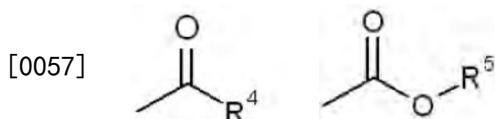
- [0034] $X=C_1-C_4$ -烷基或 C_3-C_6 -环烷基，
 [0035] $Y=C_1-C_4$ -烷基或 C_3-C_6 -环烷基，
 [0036] $R^1=$ 氢、甲基、乙基、异丙基或环丙基，
 [0037] $R^2=$ 氢或甲基，
 [0038] $R^3=C_1-C_6$ -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基，
 [0039] $G=$ 氢、可裂解基团L或阳离子E，其中
 [0040] $L=$ 下列基团之一



- [0042] 其中
 [0043] $R^4=C_1-C_4$ -烷基，
 [0044] $R^5=C_1-C_4$ -烷基，
 [0045] $R^6=C_1-C_4$ -烷基、未取代的苯基或被卤素、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基取代的苯基，
 [0046] $R^7, R^7=$ 彼此独立地为甲氧基或乙氧基，
 [0047] $E=$ 碱金属离子、碱土金属的离子等价物、铝的离子等价物或过渡金属的离子等价物或
 [0048] 铵离子，其中任选地一个、两个、三个或全部四个氢原子被相同或不同的选自氢或 C_1-C_5 -烷基的基团取代，或叔脂族或杂脂族铵离子，或杂环铵阳离子，例如在每种情况下质子化的吡啶、喹啉、喹喔啉、1,2-二甲基咪唑、1,3-二甲基咪唑鎓甲基硫酸盐或还为锍离子。

- [0049] 特别优选通式(I)的化合物，其中

- [0050] $X=$ 甲基、乙基或环丙基，
 [0051] $Y=$ 甲基或乙基，
 [0052] $R^1=$ 氢、甲基、乙基、异丙基或环丙基，
 [0053] $R^2=$ 氢，
 [0054] $R^3=C_1-C_4$ -烷基或 C_1-C_3 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基，
 [0055] $G=$ 氢、可裂解基团L或阳离子E，其中
 [0056] $L=$ 下列基团之一



- [0058] 其中
 [0059] $R^4=C_1-C_4$ -烷基，
 [0060] $R^5=C_1-C_4$ -烷基，
 [0061] $E=$ 碱金属离子、碱土金属的离子等价物、铝的离子等价物或过渡金属的离子等价物或为镁卤素阳离子、四- C_1-C_5 -烷基铵阳离子或杂环铵阳离子，例如在每种情况下质子化

的吡啶或喹啉。

[0062] 非常特别优选式(I)的化合物,其中

[0063] X=甲基或乙基,

[0064] Y=甲基或乙基,

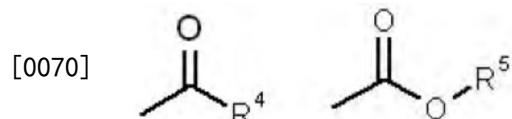
[0065] R¹=氢、甲基、乙基或环丙基,

[0066] R²=氢,

[0067] R³=C₁-C₄-烷基或C₁-C₃-烷氧基-C₂-C₄-烷基,

[0068] G=氢、可裂解基团L或阳离子E,其中

[0069] L=下列基团之一



[0071] 其中

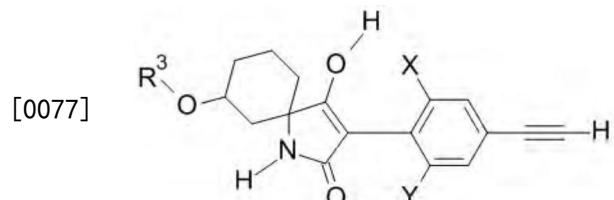
[0072] R⁴=甲基、乙基或异丙基,

[0073] R⁵=甲基、乙基或异丙基,

[0074] E=钠、钾、三甲基铵、吡啶鎓、喹啉鎓或三甲基锍阳离子或钙的离子等价物或镁的离子等价物。

[0075] 为便于说明,可特别提及下列本发明的化合物:

[0076] 表1:实施例编号1.01-1.42其中R¹=H



实施例编号	R ³	X	Y
1.01	甲基	氢	甲基
1.02	甲基	氢	乙基
1.03	甲基	甲基	甲基
1.04	甲基	甲基	乙基
1.05	甲基	乙基	乙基

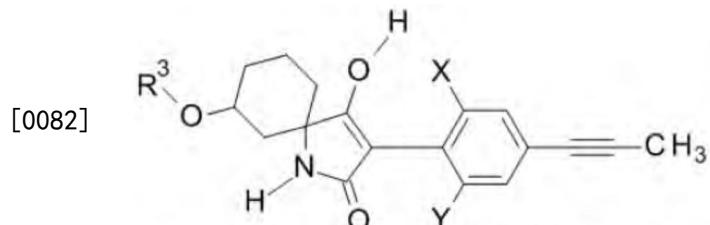
[0078]

实施例编号	R ³	X	Y
1.06	甲基	环丙基	甲基
1.07	甲基	环丙基	乙基
1.08	乙基	氢	甲基
1.09	乙基	氢	乙基
1.10	乙基	甲基	甲基
1.11	乙基	甲基	乙基
1.12	乙基	乙基	乙基
1.13	乙基	环丙基	甲基
1.14	乙基	环丙基	乙基
1.15	正丙基	氢	甲基
1.16	正丙基	氢	乙基
1.17	正丙基	甲基	甲基
1.18	正丙基	甲基	乙基
1.19	正丙基	乙基	乙基
1.20	正丙基	环丙基	甲基
1.21	正丙基	环丙基	乙基
1.22	异丙基	氢	甲基
1.23	异丙基	氢	乙基
1.24	异丙基	甲基	甲基
1.25	异丙基	甲基	乙基
1.26	异丙基	乙基	乙基
1.27	异丙基	环丙基	甲基
1.28	异丙基	环丙基	乙基
1.29	正丁基	氢	甲基
1.30	正丁基	氢	乙基
1.31	正丁基	甲基	甲基
1.32	正丁基	甲基	乙基
1.33	正丁基	乙基	乙基
1.34	正丁基	环丙基	甲基
1.35	正丁基	环丙基	乙基
1.36	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O-	氢	甲基
1.37	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O-	氢	乙基
1.38	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O-	甲基	甲基

[0079]

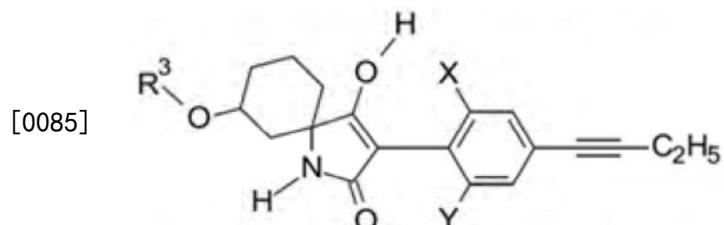
实施例编号	R ³	X	Y
1.39	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O-	甲基	乙基
1.40	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O-	乙基	乙基
1.41	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O-	环丙基	甲基
1.42	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O-	环丙基	乙基

[0081] 表2:实施例编号2.01-2.42其中R¹=CH₃



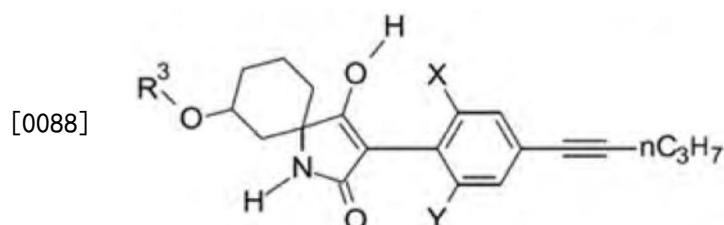
[0083] 实施例编号2.01-2.42,其中R³、X和Y与表1中的那些相同

[0084] 表3:实施例编号3.01-3.42其中R¹=C₂H₅



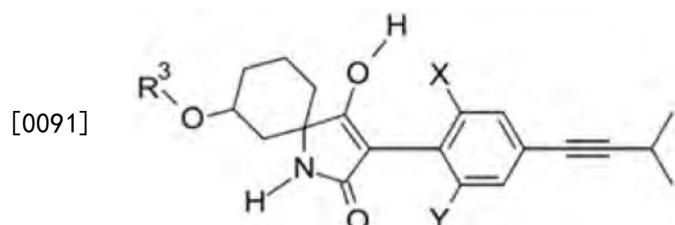
[0086] 实施例编号3.01-3.42,其中R³、X和Y与表1中的那些相同

[0087] 表4:实施例编号4.01-4.42其中R¹=nC₃H₇



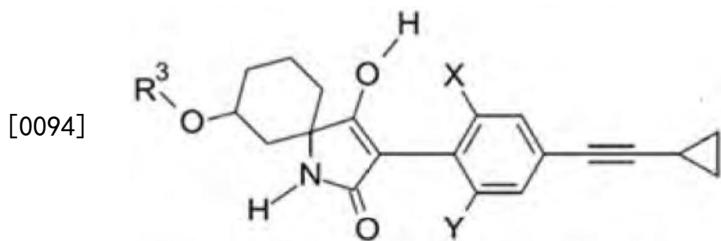
[0089] 实施例编号4.01-4.42,其中R³、X和Y与表1中的那些相同

[0090] 表5:实施例编号5.01-5.42其中R¹=异丙基



[0092] 实施例编号5.01-5.42,其中R³、X和Y与表1中的那些相同

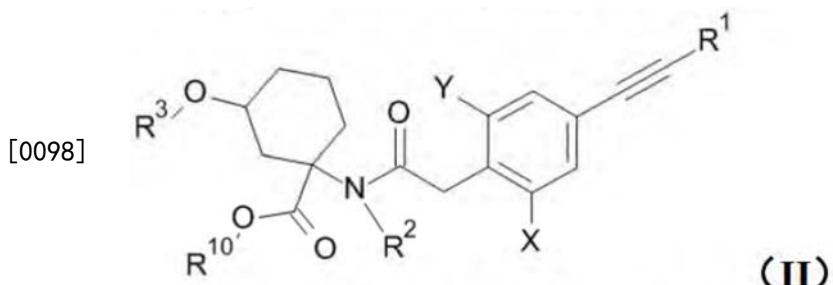
[0093] 表6:实施例编号6.01-6.42其中R¹=环丙基



[0095] 实施例编号6.01-6.42,其中R³、X和Y与表1中的那些相同

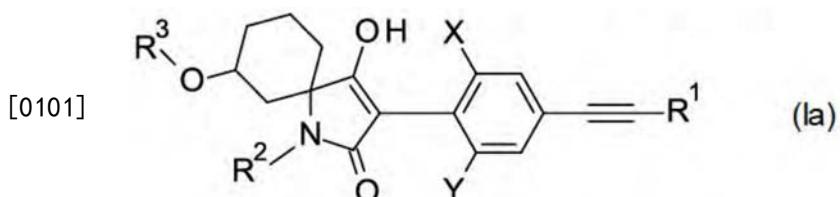
[0096] 可根据文献中已知的方法进行本发明的通式(I)的化合物的制备,例如通过

[0097] a) 任选地在合适的溶剂或稀释剂的存在下,用合适的碱通过正式裂解掉基团R¹⁰OH,而环化通式(II)的化合物



[0099] 其中X、Y、R¹、R²和R³具有上文给出的含义,且R¹⁰为烷基,优选甲基或乙基,或

[0100] b) 任选地在合适的溶剂或稀释剂以及合适的碱的存在下,使通式(Ia)的化合物与通式(III)的化合物反应,

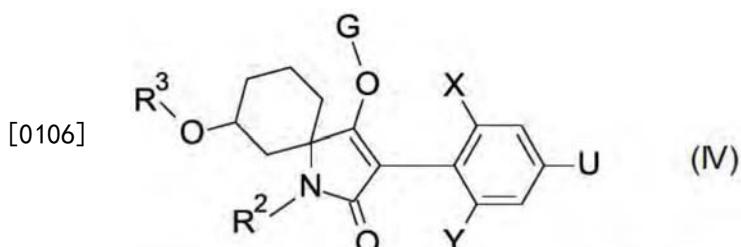


[0102] 其中X、Y、R¹、R²和R³具有上文给出的含义,

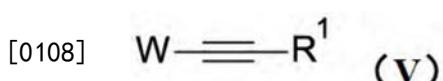
[0103] Hal-L (III)

[0104] 其中L具有上文给出的含义且Hal为卤素,优选氯或溴或可为磺酸基团,

[0105] c) 任选地在合适的催化剂和合适的碱的存在下,使通式(IV)的化合物与合适的通式(V)的炔基试剂反应,



[0107] 其中X、Y、R²和R³具有上文给出的含义,且U为合适的离去基团诸如,例如,溴、碘、三氟甲磺酸酯或全氟丁磺酸酯,

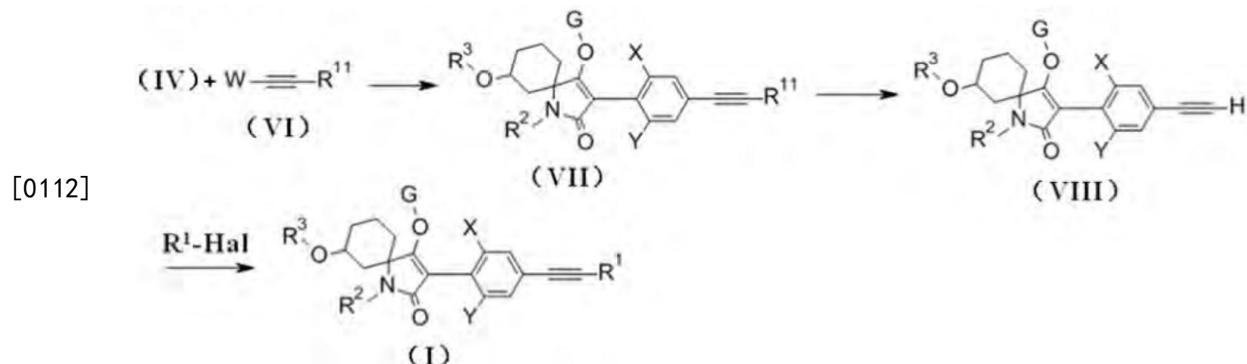


[0109] 其中R¹具有上文给出的含义且W为氢或合适的离去基团。合适的离去基团W为,例

如,卤素原子如氯、溴或碘;烷基磺酸酯基团,例如三氟甲磺酸酯、甲磺酸酯或全氟丁磺酸酯;氯化镁;氯化锌;三烃基锡;羧基以及硼酸基团如-B(OH)₂或-B(0烷基)₂。特别是pd⁰复合物非常容易适用作催化剂,其中在许多情况下添加Cu^(I)盐也是非常有利的。

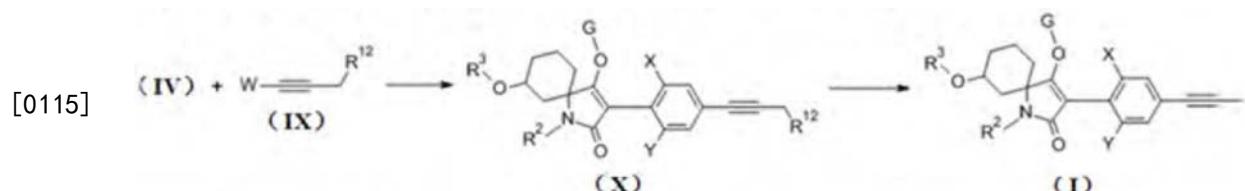
[0110] 所述方法论在现有技术文献中是已知的而且此外在关键词“钯- 催化的交叉-偶联”、“Sonogashira-偶联、Negishi-偶联、Suzuki-偶联、Stille-偶联或Kumada-偶联”下建立关联。

[0111] 或者,在与上文所述偶联方法类似的应用中,也可使通式(IV) 的化合物与通式(VI) 的炔基试剂反应,然后裂解成通式(VIII) 的乙炔基化合物并用合适的烷基化试剂将其最终转化为本发明的化合物(I),其中在每种情况下X、Y、R¹、R²、R³、G、U和W具有所述含义且可裂解基团R¹¹可为例如(C₁-C₄-烷基)₂C-OH基团或三甲基硅烷基。



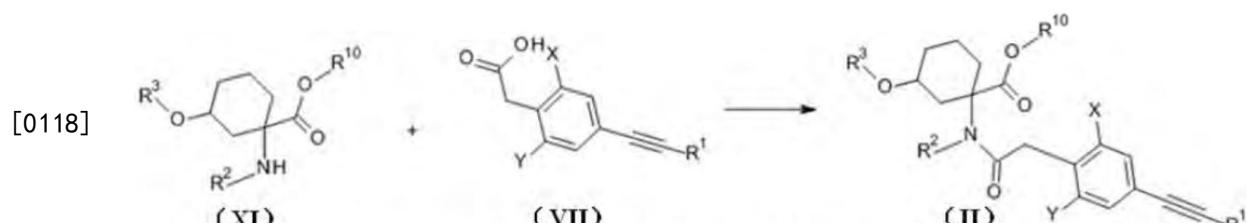
[0113] 该技术同样已知于文献中,并例如在Beilstein Journal of Organic Chemistry 2011, 7 (55), 426-431和Catalysis Communications 2015, 60, 82-87中作了更详细的解释。

[0114] 如果通式(I)中的基团R¹为甲基且X、Y、R²、R³和G、U和W也具有上文所述含义,则其他替代方法包括在与上文所述偶联方法类似的应用中,使通式(IV)的化合物与通式(IX)的炔基试剂(其中R¹²例如为C₁-C₄-三烷基甲硅烷基且W具有上文给出的含义)反应以产生通式(X)的化合物。然后可在合适的条件下裂解掉R¹²基团,产生本发明式(I)的化合物(其中R³=甲基)。



[0116] 例如在Journal of Medicinal Chemistry 2007, 50 (7), 1627-1634中记载了文献中已知的该技术。

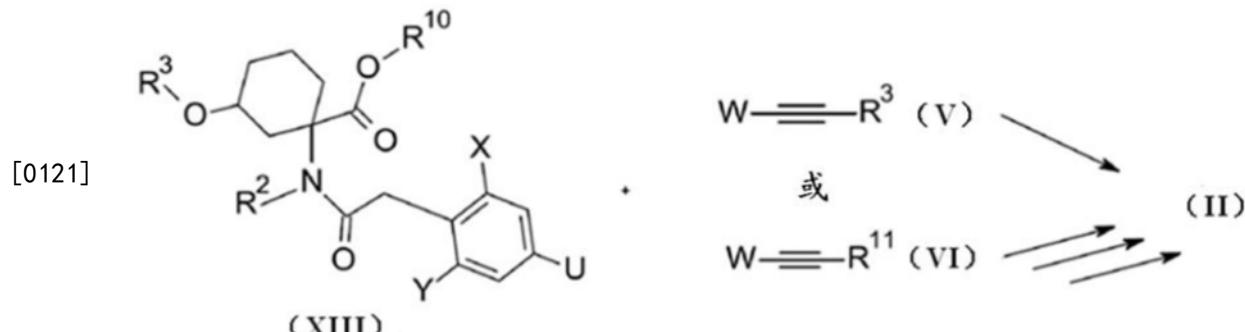
[0117] 所需的通式(II)的前体可以以类似于已知的方法制备,



[0119] 例如使通式(XI)的氨基酸酯与通式(XII)的苯乙酸反应(其中X、Y、R¹、R²和R³和R¹⁰

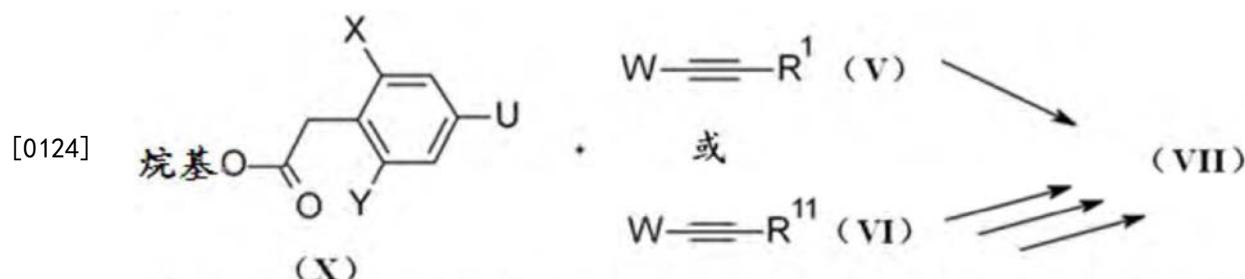
具有上文所述含义),任选地通过添加脱水剂和任选地在合适的溶剂或稀释剂的存在下进行。

[0120] 制备通式(II)的前体的其他变形尤其也包括通过所述的交叉-偶联方法使通式(XIII)的化合物(其中X、Y、R²、R³、R¹⁰和U具有上文给出的含义)与通式(V)或通式(VI)的化合物(其中W、R³和R¹¹具有上文给出的含义)反应:



[0122] 通式(VII)的苯乙酸——即2,6-二甲基-4-炔丙基苯乙酸——原则上在WO 2015/040114中被提及,但未记载这些化合物的获取方法。

[0123] 然而,可根据文献中已知的方法制备所述化合物,例如再次用上述技术,使通式(X)的化合物(其中X、Y、U如上文所定义且R=C₁-C₄-烷基)与通式(V)或(V)的试剂(其中W、R¹和R¹¹如上文所定义)反应。



[0125] 本发明通式(I)的化合物和/或其盐(下文中统称为“本发明的化合物”)对广谱的经济上重要的单子叶和双子叶一年生杂草具有优良的除草效力。活性成分也有效作用于由根茎、根状茎和其他多年生器官发芽并且难以防治的多年生杂草。

[0126] 因此,本发明还提供一种防治不想要的植物或用于调节植物(优选在植物作物中)生长的方法,其中将一种或多种本发明的化合物施用于植物(例如有害植物如单子叶或双子叶杂草或不想要的作物植物)、种子(例如谷粒、种子或营养繁殖体如块茎或带芽的嫩枝部位)或植物生长区域(例如栽培区域)。本发明的化合物可例如在播种前(如果合适,也可通过掺入土壤中)、苗前或苗后施用。特别地,举列来说,可提及许多可通过本发明的化合物防治的单子叶和双子叶杂草植物群,但并不意图根据列举限制于特定的树种。

[0127] 单子叶有害植物属:山羊草属(Aegilops)、冰草属(Agropyron)、剪股颖属(Agrostis)、看麦娘属(Alopecurus)、阿披拉草属(Apera)、燕麦属(Avena)、臂形草属(Brachiaria)、雀麦属(Bromus)、蒺藜草属(Cenchrus)、鸭跖草属(Commelina)、狗牙根属(Cynodon)、莎草属(Cyperus)、龙爪茅属(Dactyloctenium)、马唐属(Digitaria)、稗属(Echinochloa)、蓼属(Eleocharis)、蟋蟀草属(Eleusine)、画眉草属(Eragrostis)、野黍属(Eriochloa)、羊茅属(Festuca)、飘拂草属(Fimbristylis)、异蕊花属(Heteranthera)、

白茅属 (*Imperata*)、鸭嘴草属 (*Ischaemum*)、千金子属 (*Leptochloa*)、黑麦草属 (*Lolium*)、雨久花属 (*Monochoria*)、稷属 (*Panicum*)、雀稗属 (*Paspalum*)、鶴草属 (*Phalaris*)、梯牧草属 (*Phleum*)、早熟禾属 (*Poa*)、罗氏草属 (*Rottboellia*)、慈姑属 (*Sagittaria*)、藨草属 (*Scirpus*)、狗尾草属 (*Setaria*)、高粱属 (*Sorghum*)。

[0128] 双子叶植物杂草属:白麻属 (*Abutilon*)、苋属 (*Amaranthus*)、豚草属 (*Ambrosia*)、单花葵属 (*Anoda*)、春黄菊属 (*Anthemis*)、蔷薇属 (*Aphanes*)、蒿属 (*Artemisia*)、滨藜属 (*Atriplex*)、雏菊属 (*Bellis*)、鬼针草属 (*Bidens*)、芥属 (*Capsella*)、飞廉属 (*Carduus*)、决明属 (*Cassia*)、矢车菊属 (*Centaurea*)、藜属 (*Chenopodium*)、薊属 (*Cirsium*)、旋花属 (*Convolvulus*)、曼陀罗属 (*Datura*)、山蚂蝗属 (*Desmodium*)、刺酸模属 (*Emex*)、糖芥属 (*Erysimum*)、大戟属 (*Euphorbia*)、鼬瓣花属 (*Galeopsis*)、牛膝菊属 (*Galinsoga*)、猪殃殃属 (*Galium*)、木槿属 (*Hibiscus*)、番薯属 (*Ipomoea*)、地肤属 (*Kochia*)、野芝麻属 (*Lamium*)、独行菜属 (*Lepidium*)、母草属 (*Lindernia*)、母菊属 (*Matricaria*)、薄荷属 (*Mentha*)、山靛属 (*Mercurialis*)、粟米草属 (*Mullugo*)、勿忘我属 (*Myosotis*)、罂粟属 (*Papaver*)、牵牛属 (*Pharbitis*)、车前属 (*Plantago*)、蓼属 (*Polygonum*)、马齿苋属 (*Portulaca*)、毛茛属 (*Ranunculus*)、萝卜属 (*Raphanus*)、蔊菜属 (*Rorippa*)、节节菜属 (*Rotala*)、酸模属 (*Rumex*)、猪毛菜属 (*Salsola*)、千里光属 (*Senecio*)、田菁属 (*Sesbania*)、黄花稔属 (*Sida*)、芥属 (*Sinapis*)、茄属 (*Solanum*)、苦苣菜属 (*Sonchus*)、尖瓣花属 (*Sphenoclea*)、繁缕属 (*Stellaria*)、蒲公英属 (*Taraxacum*)、菥蓂属 (*Thlaspi*)、三叶草属 (*Trifolium*)、荨麻属 (*Urtica*)、婆婆纳属 (*Veronica*)、堇菜属 (*Viola*)、苍耳属 (*Xanthium*)。

[0129] 如果将本发明的化合物在萌芽前施用于土壤表面,则可完全阻止杂草幼苗出土,或者杂草生长至其到达子叶期,但随后其停止生长并最终在三至四周后完全死亡。

[0130] 如果将活性成分在出苗后施用至植物的绿色部位,则生长在处理后停止,且所述有害植物停留在施用时所处的生长阶段,或其在一定时间后完全死亡,从而非常旱地并以持久的方式消除对作物植物有害的杂草引起的竞争。

[0131] 尽管本发明的化合物对单子叶和双子叶杂草具有优良的除草活性,但仅可忽略地损害或一点也不损害经济上重要的作物的作物植物,这取决于本发明特定化合物的结构和其施用率,所述作物植物为例如双子叶作物属:落花生属 (*Arachis*)、甜菜属 (*Beta*)、芸苔属 (*Brassica*)、黄瓜属 (*Cucumis*)、南瓜属 (*Cucurbita*)、向日葵属 (*Helianthus*)、胡萝卜属 (*Daucus*)、大豆属 (*Glycine*)、棉花属 (*Gossypium*)、番薯属 (*Ipomoea*)、莴苣属 (*Lactuca*)、亚麻属 (*Linum*)、番茄属 (*Lycopersicon*)、烟草属 (*Nicotiana*)、菜豆属 (*Phaseolus*)、豌豆属 (*Pisum*)、茄属 (*Solanum*)、蚕豆属 (*Vicia*),或单子叶作物属:葱属 (*Allium*)、菠萝属 (*Ananas*)、天门冬属 (*Asparagus*)、燕麦属、大麦属 (*Hordeum*)、稻属 (*Oryza*)、黍属、甘蔗属 (*Saccharum*)、黑麦属 (*Secale*)、高粱属、黑小麦属 (*Triticale*)、小麦属 (*Triticum*)、玉蜀黍属 (*Zea*),特别是玉蜀黍属和小麦属。因为这些原因,本发明的化合物非常适于在作物植物(如农业上有用的植物或观赏植物)中选择性防治不想要的植物的生长。

[0132] 此外,本发明化合物(根据其特殊结构和使用的施用率)在作物植物中具有显著的生长-调节性能。它们通过调节作用干扰植物自身的新陈代谢,并因此可例如通过引发脱水和矮化生长用于定向影响植物成分和促进收获。此外,它们还适于一般性防治和抑制不想要的植物生长,而在此过程中不会杀死植物。营养生长的抑制对许多单子叶及双子叶作物

具有极大作用,因为例如可以减少或完全防治储藏形成。

[0133] 所述活性成分凭借其除草性能和植物生长调节性能,也可用于防治基因修饰作物或通过常规诱变而改性的植物作物中的有害植物。通常,转基因植物的特征是特别有利的性能,例如对某些农药(特别是某些除草剂)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。其他具体的性能涉及例如有关收获材料的数量、品质、贮存性、组成和具体成分。例如,已知的具有增加的淀粉含量或改变的淀粉品质的转基因植物,或收获材料中具有不同脂肪酸组成的那些转基因植物。

[0134] 就转基因植物而言,优选将本发明化合物施用在经济上重要的有用植物和观赏植物的转基因作物(例如谷类如小麦、大麦、黑麦、燕麦、黍、稻、木薯和玉米或作物如甘蔗、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他植物种类)中。优选地,本发明化合物可在对除草剂的植物毒害作用有抗性或已通过基因工程使其有抗性的有用植物作物中用作除草剂。

[0135] 制备与现有植物相比具有改进性能的新植物的常规方法包括例如传统栽培方法和产生突变体。或者,可借助重组方法产生具有改进性能的新植物(例如参见,EP-A-0221044、EP-A-0131624)。例如,记载了下述几种情形:

[0136] -基因修饰作物植物以改性植物中合成的淀粉(例如WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806),

[0137] -对草铵膦类(参见,例如EP-A-0242236、EP-A-242246)或草甘膦类(WO 92/00377)或磺脲类(EP-A-0257993、US A 5013659)的某些除草剂有抗性的转基因作物植物,

[0138] -能够产生苏云金杆菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素(Bt毒素)的转基因作物植物(例如棉花),所述毒素可使植物对某些害虫有抗性(EP-A-0142924,EP-A-0193259)),

[0139] -具有改变的脂肪酸组成的转基因作物植物(WO 91/13972),

[0140] -具有新的成分或次级代谢物(例如新的植物抗毒素,可引起增加的抗病性)的基因修饰作物植物(EPA 309862, EPA0464461),

[0141] -光呼吸作用降低的基因修饰植物,其具有更高产率以及更高胁迫耐受性(stress tolerance)(EPA 0305398),

[0142] -产生制药上或诊断上重要的蛋白质的转基因作物植物(“分子药耕(molecular pharming)”),

[0143] -以较高的产量或较好的质量为特征的转基因作物植物,

[0144] -以(例如)上述新性能的组合为特征的转基因作物植物(“基因叠加(gene stacking)”)

[0145] 许多可用于制备具有改进性质的新的转基因植物的分子生物学技术原则上是已知的;参见,例如I.Potrykus and G.Spangenberg(编辑)Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual(1995),Springer Verlag Berlin,Heidelberg,或Christou,“Trends in Plant Science”1 (1996) 423-431)。

[0146] 对于这样的重组操作,可将允许通过DNA序列重组引起突变或序列改变的核酸分子引入到质粒中。借助于标准方法,可例如进行碱交换、移除部分序列或添加天然序列或合成序列。为使DNA片段彼此连接,可向所述片段添加接头(adapters)或连接体(linkers),参见例如Sambrook等人,1989,Molecular Cloning,A Laboratory Manual,第1版,Cold Spring Harbor Laboratory Press,Cold Spring Harbor,NY,或者Winnacker“Gene und

Kclone[基因与克隆]”,VCH Weinheim第1版,1996。

[0147] 例如,具有降低的基因产物活性的植物细胞的产生可通过表达至少一种相应的反义RNA、正义RNA以实现共抑制效应或通过表达至少一种合理构造的核糖酶(其特异性切割上述基因产物的转录物)实现。为此,首先可使用包括基因产物的完整编码序列(包含任何可能存在的侧翼序列)的DNA分子,以及仅包含部分编码序列的DNA分子(在此情况下这些部分编码序列必须足够长以在细胞中具有反义效应)。也可使用与基因产物编码序列高度同源但并不与其完全相同的DNA序列。

[0148] 当在植物中表达核酸分子时,合成的蛋白质可定位所述植物细胞的任何所需的区室中。然而,为实现在特定区室中的定位,可例如连接编码区与确保在特定区室中定位的DNA序列。这类序列对所属领域的技术人员是已知的(参见,例如,Braun等人EMBO J.11 (1992),3219-3227;Wolter等人Proc.Natl.Acad.Sci.USA 85 (1988),846-850; Sonnewald等人Plant J.1 (1991),95-106)。所述核酸分子也可在植物细胞的细胞器中表达。

[0149] 可通过已知技术再生转基因植物细胞以产生完整植株。原则上,转基因植物可为任何所需植物物种的植物,即,可为单子叶植物,也可为双子叶植物。

[0150] 因此,可通过过度表达、阻抑(suppression)或抑制(inhibition)同源(=天然)基因或基因序列或表达异源(=外源)基因或基因序列而获得性能改变的转基因植物。

[0151] 本发明的化合物可优先用于对以下物质具有抗性的转基因作物:生长调节剂(例如麦草畏(dicamba))或抑制必需植物酶(例如乙酰乳酸合成酶(ALS)、EPSP合成酶、谷氨酰胺合成酶(GS)或羟基苯丙酮二加氧酶(HPPD))的除草剂或选自磺脲类、草甘膦类、草铵膦类或苯甲酰基异恶唑类的除草剂和类似活性成分。

[0152] 当本发明活性成分用于转基因作物时,不仅可起到在其他作物中观察到的对有害植物的作用,而且也可起到通常针对特定转基因作物应用的特异性作用,例如改变的或特别拓宽的可防治的杂草谱、改变的施用时可用的施用率、优先地与除草剂(转基因作物对其有抗性)的好的结合性,以及对转基因作物植物的生长和产率的影响。

[0153] 因此,本发明还提供本发明化合物作为除草剂用于防治转基因作物植物中有害植物的用途。

[0154] 在本发明的一个优选实施方案中,通式(I)的化合物也可用于防治例如选自以下的那些有害植物,例如剪股颖属、看麦娘属、阿披拉草属、燕麦属、臂形草属、雀麦属、蒺藜草属、马唐属、稗草属、蟋蟀草属、野黍属(Eriochloa)、千金子属、黑麦草属、露籽草属(Ottochloa)、黍属、狼尾草属(Pennisetum)、鵝草属、早熟禾属、筒轴茅属、狗尾草属和/或高粱属杂草;特别是看麦娘属、阿披拉草属、燕麦属、臂形草属、雀麦属、马唐属、稗草属、野黍属、黑麦草属、黍属、鵝草属、早熟禾属、狗尾草属和/或高粱属杂草,

[0155] -其对一种或多种抑制酶乙酰基-CoA-羧化酶(ACCase)的除草剂具有抗性。ACCase抑制性的除草剂尤其包括唑啉草酯(pinoxaden)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、精恶唑禾草灵(fenoxaprop-P-ethyl)、禾草灵(diclofop-methyl)、精吡氟禾草灵(fluazifop-P-butyl)、高效氟吡甲禾灵(haloxyfop-P-methyl)、精喹禾灵(quinalofop-P-ethyl)、喔草酯(propaquizafo)、氰氟草酯(cyhalofop-butyl)、烯草酮(clethodim)、稀禾定(sethoxydim)、环杀草(cycloxydim)、肟草酮(tralkoxydim)或丁苯草酮(butroxydim);

[0156] -和/或对草甘膦有抗性,

[0157] -和/或对一种或多种抑制乙酰乳酸合成酶(ALS)的除草剂具有抗性,例如,一种或多种磺脲除草剂(例如碘甲磺隆(iodosulphurone-methyl)、甲磺胺磺隆(mesosulphurone-methyl)、苯磺隆(tribenuron-methyl)、醚苯磺隆(triasulphurone)、氟磺隆(prosulphurone)、磺酰磺隆(sulphosulphurone)、吡嘧磺隆乙酯(pyrazosulphurone-ethyl)、苄嘧磺隆(bensulphurone-methyl)、烟嘧磺隆(nicosulphurone)、啶嘧磺隆(flazasulphurone)、优芬磺隆(iofensulphurone)、甲磺隆(metsulphurone-methyl),或在“农药手册(The Pesticide Manual)”,第15版(2009)或第16版(2012),C.D.S.Tomlin, British Crop Protection Council中公开的任何其他磺酰脲),和/或一种或多种三唑并嘧啶类除草剂(例如双氟磺草胺(florasulam)、甲氧磺草胺(pyroxsulam)或五氟磺草胺(penoxsulam))和/或一种或多种嘧啶基(硫代或氧代)苯甲酸盐除草剂(例如双草醚(bispyribac-sodium)或环酯草醚(pyriflatalid))和/或一种或多种磺酰胺基-羧基三唑啉酮除草剂(例如甲基噻烯卡巴腙(thien carbazole-methyl)、丙苯磺隆(propoxycarbazone-sodium)或氟酮磺隆(propoxycarbazone-sodium))和/或咪唑啉酮除草剂(例如甲氧咪草烟(imazamox))。

[0158] 对ACCase和/或ALS抑制剂和/或草甘膦有抗性的有害禾本科草的具体实例特别包括,大穗看麦娘(Alopecurus myosuroides)、阿披拉草(Apera spica-venti)、野燕麦(Avena fatua)、不实野燕麦(Avena sterilis)、伏生臂形草(Brachiaria decumbens)、巴拉草(Brachiaria plantaginea)、Digitaria horizontalis、Digitaria insularis、马唐(Digitaria sanguinalis)、光头稗(Echinochloa colona)、稗草(Echinochloa crus-galli)、牛筋草(Eleusine indica)、多花黑麦草(Lolium multiflorum)、硬直黑麦草(Lolium rigidum)、黑麦草(Lolium perenne)、小子鹤草(Phalaris minor)、奇异鹤草(Phalaris paradoxa)、狗尾草(Setaria viridis)、大狗尾草(Setaria faberi)或金狗尾草(Setaria glauca)。

[0159] 在本发明的一个特别优选的实施方案中,本发明的通式(I)的化合物可用于抵抗以下有害植物

[0160] -其对一种或多种ACCase抑制性的除草剂(例如选自上表的)有抗性或实际上至少部分基于有害植物中ACCase靶位点处的一个或多个氨基酸的突变(例如取代)(参见,例如S.B.Powles and Qin Yu, “Evolution in Action: Plants Resistant to Herbicides”, Annu.Rev.Plant Biol., 2010, 61, p.317-347);和/或

[0161] -其对草甘膦有抗性,且实际上至少部分基于在草甘膦针对的所述杂草中EPSPS靶位点处的一个或多个氨基酸的突变(例如取代);和/或

[0162] -其对一种或多种ALS-抑制性的除草剂(例如选自上述ALS-抑制性的除草剂列表的)有抗性且实际上至少部分基于在所述杂草中的ALS靶位点处一个或多个氨基酸的突变(例如取代)(参见,例如,S.B.Powles and Qin Yu, “Evolution in Action: Plants Resistant to Herbicides”, Annu.Rev.Plant Biol., 2010, 61, p.317-347);和/或

[0163] -其对一种或多种ACCase抑制性的除草剂(例如选自上表)和/或对草甘膦和/或对一种或多种ALS-抑制性的除草剂(例如选自上表)有抗性且实际上至少部分基于代谢诱导的除草剂抗性,例如至少部分基于细胞色素P450-介导的新陈代谢(参见,例如,S.B.Powles and Qin Yu, “Evolution in Action: Plants Resistant to Herbicides”,

Annu. Rev. Plant Biol., 2010, 61, p. 317-347)。

[0164] 本发明的化合物相对于现有技术化合物(例如WO 2015/040114 中的化合物41.03)显示出优异的性能(也参见表9和表10中的对比数据)。

[0165] 本发明的化合物可以以常规制剂中的可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、可喷雾溶液剂、撒粉产品(dusting product)或颗粒剂的形式使用。因此,本发明也提供包含本发明化合物的除草剂组合物和植物生长调节组合物。

[0166] 根据预先给出的生物学和/或化学物理参数,可以以多种方法配制本发明的化合物。可能的制剂包括,例如:可湿性粉剂(WP)、水-溶性粉剂(SP)、水-溶性浓缩剂、可乳化浓缩剂(EC)、乳剂(EW) 如水包油型乳剂和油包水型乳剂、可喷雾溶液剂、悬浮浓缩剂(SC)、基于油或水的分散剂、油混溶性溶液剂、微囊悬浮剂(CS)、撒粉产品(DP)、拌种剂、用于撒播和土壤施用的颗粒剂、微颗粒形式的颗粒剂(GR)、可喷洒颗粒剂、吸收和吸附颗粒剂、水分散性颗粒剂(WG)、水溶性颗粒剂(SG)、ULV制剂、微胶囊剂和蜡剂。各制剂类型原则上是已知并在例如以下文献中有记载:Winnacker Küchler, "Chemische Technologie[化学工艺]", Volume 7, C.Hanser Verlag Munich, 第四版, 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973, K.Martens, "Spray Drying" Handbook, 第三版, 1979, G.Goodwin Ltd.London。

[0167] 所需的制剂助剂(如惰性材料、表面活性剂、溶剂和其他添加剂) 同样是已知的并在例如以下文献中有记载:Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 第二版, Darland Books, Caldwell N.J.; H.v.Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 第二版, J.Wiley&Sons, N.Y.; C.Marsden, "Solvents Guide", 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", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964, **Schönfeldt**,

Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte [表面活性环氧乙烷加合物], Wiss.Verlagsgesell., Stuttgart 1976, Winnacker Küchler, "Chemische Technologie[化学工艺]", Volume 7, C.Hanser Verlag Munich, 第四版, 1986。

[0168] 在这些制剂的基础上,也可制备与其他农药活性物质(例如杀虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂)以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物,例如以成品制剂或作为桶混物(tankmix)的方式制备。合适的安全剂为例如吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)、解毒喹(cloquintocet-mexyl)和烯丙酰草胺(dichlormid)。

[0169] 可湿性粉剂是在水中均匀分散的制剂,其除活性成分之外,还包含除稀释剂或惰性物质之外的离子和/或非-离子类型表面活性剂(润湿剂、分散剂),例如聚乙氧基化烷基酚类、聚乙氧基化脂肪醇类、聚乙氧基化脂肪胺类、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基苯磺酸盐、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基甲基牛磺酸钠。为制备所述可湿性粉剂,在例如常规设备如锤式研磨机、鼓风式研磨机和喷气式研磨机中细磨除草活性成分,并同时或随后与制剂助剂混合。

[0170] 可乳化浓缩剂通过将活性成分溶于有机溶剂(例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或相对高沸点的芳族化合物或烃类)或有机溶剂的混合物中并添加一种或多种离子

和/或非离子表面活性剂(乳化剂)制备。可使用的乳化剂的实例为:烷基芳基磺酸钙如十二烷基苯磺酸钙或非-离子乳化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、环氧丙烷-环氧乙烷的缩合产物、烷基聚醚、失水山梨糖醇酯如失水山梨糖醇脂肪酸酯或聚氧乙烯失水山梨糖醇酯如聚氧乙烯失水山梨糖醇脂肪酸酯。

[0171] 撒粉剂通过将活性成分与细分散的固体物质(例如滑石,天然黏土如高岭土、膨润土和叶腊石,或硅藻土)一起研磨获得。

[0172] 悬浮浓缩剂可为水基或油基的。其可借助标准市售的珠磨机并任选地添加例如已在上文中针对其他类型制剂所列的表面活性剂通过例如湿式研磨法来制备。

[0173] 乳剂,例如水包油乳剂(EW),可使用含水有机溶剂和任选地例如已在上文中针对其他类型制剂所列的表面活性剂,借助例如搅拌器、胶体磨机和/或静态混合器制备。

[0174] 颗粒剂可通过将活性成分喷雾到吸附性颗粒状惰性物质上制备或借助胶黏剂(例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油)将活性成分浓缩物施用于载体(例如砂、高岭石或颗粒状惰性材料)表面制备。也可将合适的活性成分以常规用于制备肥料颗粒的方法——如果需要与肥料相混合——成粒。

[0175] 水分散性颗粒通常通过常规方法如喷雾-干燥法、流化床造粒法、盘式造粒法制备,用高速混合机混合并在无固体惰性材料的情况下挤出。

[0176] 对于盘式颗粒、流化床颗粒、挤出机颗粒和喷雾颗粒的制备,参见例如在“Spray Drying Handbook”,第三,1979,G.Goodwin Ltd., London, J.E.Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967,第147页及后文,“Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”第五版McGraw Hill, New York 1973,第857页中的方法。

[0177] 有关作物保护组合物制剂的其他细节,参见例如,G.C.Klingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961,第81-96页和J.D.Freyer, S.A.Evans, “Weed Control Handbook”, 第五版Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968,第101-103页。

[0178] 所述农用化学品制剂通常包含0.1至99重量%、特别是0.1至95重量%的本发明化合物。

[0179] 在可湿性粉剂中,活性成分浓度为例如约10至90重量%,补足至100%的余量由常规制剂组分构成。在可乳化浓缩剂情况下,活性成分浓度可为约1至90重量%、优选5至80重量%。撒粉型制剂包含1至30重量%活性成分、优选至多5至20重量%活性成分,可喷雾溶液剂包含约0.05至80重量%、优选2至50重量%活性成分。在水分散性颗粒剂的情况下,活性成分含量部分取决于活性化合物是以液体还是固体形式存在以及所使用的制粒助剂、填充剂等。在水分散性颗粒剂的情况下,活性成分的含量例如在1重量%至95重量%之间,优选在10重量%至80重量%之间。

[0180] 此外,所述的活性成分制剂任选地包含各种常规的粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂(frost protection agents)和溶剂、填料、载体和染料、消泡剂、蒸发抑制剂和影响pH和粘度的试剂。

[0181] 基于所述制剂,也可制备与其他农药活性物质(例如杀虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂)以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物,例如以成品制剂或桶混物的形式制备。

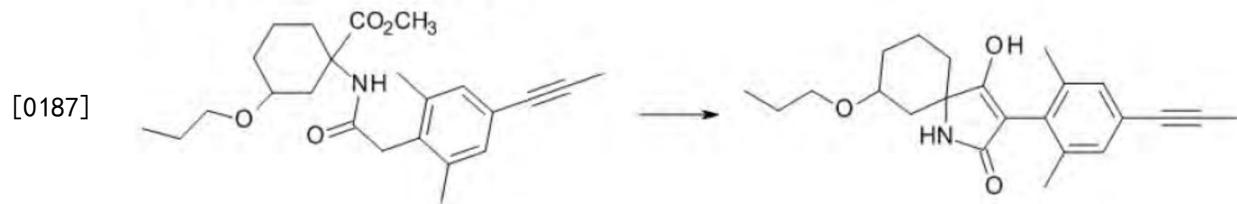
[0182] 为进行施用,如果合适,用常规方法稀释市售形式的制剂,例如在可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、分散剂和水分散性颗粒剂的情况下,用水稀释。撒粉型制剂、土壤施用的颗粒剂或撒播用颗粒剂和可喷雾溶液剂通常在施用前不用其他惰性物质进一步稀释。

[0183] 式(I)的化合物需要的施用率随外界条件变化,包括温度、湿度和使用的除草剂类型。施用率可在宽范围内变化,例如在0.001至 1.0kg/ha或以上的活性物质之间,但优选在0.005至750g/ha之间。

[0184] 下述实施例进一步阐明了本发明。

[0185] A. 化学实施例

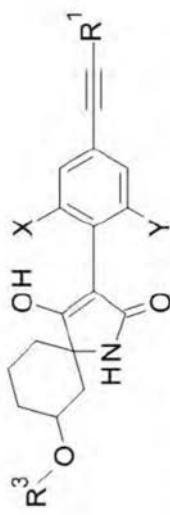
[0186] 实施例D3:3-[2,6-二甲基-4-(丙-1-炔-1-基)苯基]-4-羟基-7-丙氧基-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮



[0188] 在室温下将1.50g (3.75mmol) 1-({[2,6-二甲基-4-(丙-1-炔-1-基)苯基]乙酰基}氨基)-3-丙氧基环己烷甲酸甲酯于10mL DMF中经30 分钟滴加至1.05g (9.2mmol) 叔-丁醇钾于5mL DMF中的溶液中并在该温度搅拌过夜。将混合物添加至冰水中,用2N盐酸酸化至pH 为1并将沉淀出的沉淀物抽吸过滤。干燥后,获得1.18g (86%) 熔点为219°C的无色晶体形式的标题化合物。

表 7：实施例编号 D1-D14
以类似于实施例 D3 的方法并且根据有关所述制备方法的一般细节，可获得下列本发明化合物：

[0189]



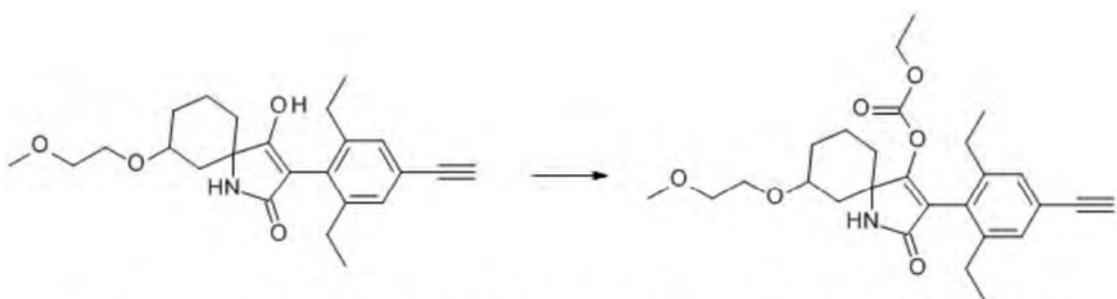
实施例编 号	R ³	X	Y	R ¹	¹ H-NMR [400 MHz, δ-ppm, d ₆ -DMSO] 或 熔点 [°C]
D1	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	熔点 235°C
D2	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	熔点 285°C
D3	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	CH ₃	熔点 219°C
D4	n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	H	熔点 135-136°C
D5	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	$\delta = 1.01$ (mc, 6H), 1.55-1.80 (m, 4H), 2.02 (s, 3H), 2.37 (mc, 4H), 3.25 (s, 3H), 3.41 (mc, 2H), 3.48-3.61 (m, 3H), 7.05 (s, 2H)
D6	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	$\delta = 1.08$ (mc, 1H) 1.30 (mc, 1H), 1.58-1.82 (m, 4H), 2.02 (mc, 9H), 3.24 (s, 3H), 3.41 (mc, 2H), 3.52 (mc, 2H), 3.57 (mc, 1H), 7.05 (s, 2H)
D7	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	
D8	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	$\delta = 1.00$ (mc, 3H), 2.05 (s, 3H), 2.40 (mc, 2H), 3.25 (s, 3H), 3.40 (mc, 2H), 3.47-3.62 (m, 3H), 7.05 (s, 1H), 7.07 (s, 1H)

实施例编 号	R ³	X	Y	R ¹	¹ H-NMR [400 MHz, δ-ppm, d ₆ -DMSO] 或熔点[℃]
D9	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	δ = 1.02 (mc, 3H), 1.60-1.88 (m, 5H), 2.05 和 2.08 (各 s, Σ3H), 2.43 (mc, 2H), 3.22 (s, 3H), 3.40-3.62 (m, 3H), 4.08 (s, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.16 (s, 1H)
D10	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	δ = 1.05 (mc, 6H), 2.40 (mc, 4H), 3.24 (s, 3H), 3.41 (mc, 2H), 3.45-3.65 (m, 3H), 4.09 (s, 1H), 7.15 (s, 2H)
D11	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	δ = 0.86 (t, 3H), 1.02 (t, 3H), 1.09 (mc, 1H), 1.29 (mc, 1H), 1.48 (quint., 2H), 2.02 (s, 3H), 2.40 (mc, 2H), 3.55 (mc, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.07 (s, 1H)
D12	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	
D13	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	δ = 1.31 (mc, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 3.25 (s, 3H), 3.40 (mc, 2H), 3.52 (mc, 2H), 3.59 (mc, 1H), 4.09 (s, 1H), 7.15 (s, 2H)
D14	n-C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	H	

[0190]

[0191] 实施例P7:3-(4-乙炔基-2,6-二乙基苯基)-4-羟基-7-(2-甲氧基乙氧基)-1-氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮

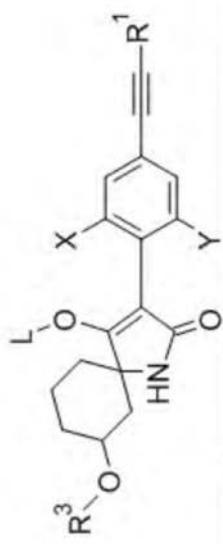
[0192]



[0193] 首先向176mg (0.44mmol) 3- (4-乙炔基-2,6-二乙基苯基) -4-羟基 -8-甲氧基-1- 氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮中加入于8mL二氯甲烷中的0.5 mL三乙胺并使所述混合物在40 °C搅拌10分钟。然后缓慢滴加于3 mL二氯甲烷中的58mg (0.53mmol) 氯甲酸乙酯且使所述混合物在室温下搅拌3小时。用10mL碳酸氢钠溶液和10mL水洗涤后, 干燥(硫酸镁) 并蒸馏出所述溶剂, 通过柱层析法在硅胶上(乙酸乙酯 / 正庚烷) 提纯粗产品。由此可获得70mg (33%) 无色固体形式的标题化合物。

表 8：实施例编号 P1-P23

以类似于实施例 P7 的方法并且根据有关所述制备方法的一般细节，可获得下列本发明化合物：



实施例编 号	R ³	X	Y	R ¹	L	¹ H-NMR [400 MHz, δ-ppm, CDCl ₃] 或 熔点 [°C]
P1	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	
P2	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	
P3	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	COiPr	熔点 206°C
P4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	熔点 202°C
P5	n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	H	CO ₂ C ₂ H ₅	熔点 173°C
P6	n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	H	COiPr	熔点 208°C
P7	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CO ₂ C ₂ H ₅	δ = 1.15 (mc, 9H), 1.80 (mc, 2H), 1.99 (mc, 2H), 2.20 (mc, 2H), 2.52 (mc, 4H), 3.05 (s, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.46 (mc, 1H), 3.52 (mc, 2H), 4.02 (q, 2H), 7.23 (s, 2H)
P8	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	COiPr	δ = 0.98 (d, 3H), 1.18 (mc, 6H), 2.45-2.60 (m, 5H), 3.04 (s, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.48 (mc, 1H), 3.51 (mc, 2H), 3.56-3.70 (m, 2H), 7.22 (s, 2H)
P9	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	CO ₂ C ₂ H ₅	δ = 1.10-1.19 (mc, 6H), 1.72-1.88 (m, 2H), 1.90-2.05 (m, 2H), 2.50 (mc, 2H), 3.38 (s, 3H), 3.52 (mc, 2H), 4.01 (q, 2H)
P10	-CH ₂ CH ₂ O CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	COiPr	δ = 0.98 (mc, 6H), 1.15 (mc, 3H), 1.90-2.05 (m, 2H), 2.19 和 2.22 (各 s, Σ 3H), 2.50 (mc, 3H), 3.02 (s, 1H), 3.39 (s, 3H), 3.40-3.72 (m, 5H)
P11	CH ₂ CH ₂ OC	CH ₃	CH ₃	H	CO ₂ C ₂ H ₅	δ = 1.12 (t, 3H), 1.80 (mc, 2H), 1.99 (mc, 2H), 2.19 (s, 3H),

[0194]

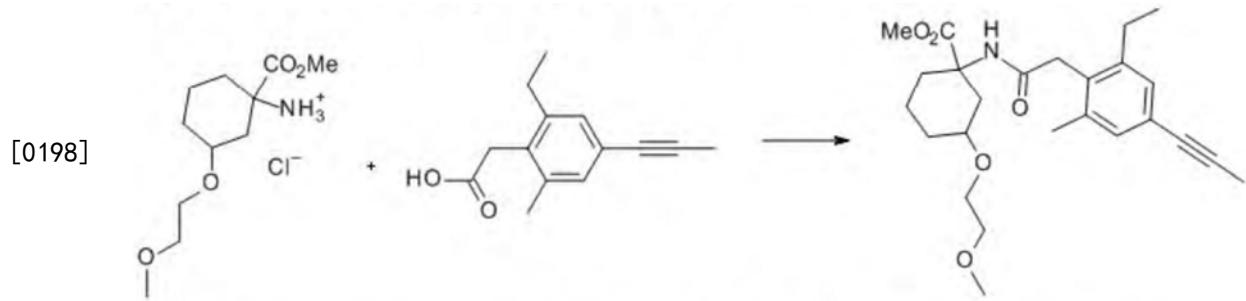
[0195]

实施例编 号	R ³	X	Y	R ¹	L	¹ H-NMR [400 MHz, δ-ppm, CDCl ₃]或溶剂 [°C]
	H ₃					2.21 (s, 3H), 3.02 (s, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.48 (mc, 1H), 3.51 (mc, 2H), 3.63 (mc, 2H), 4.02 (q, 2H), 7.22 (s, 1H), 7.24 (s, 1H)
P12	CH ₂ CH ₂ OC H ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	COiPr		δ = 0.97 (d, 6H), 1.12 (mc, 6H), 2.05 (s, 3H), 2.49 (mc, 2H), 3.38 (s, 3H), 3.45 (mc, 1H), 3.52 (mc, 2H), 3.48-3.70 (m, 2H), 7.12 (s, 2H)
P13	CH ₂ CH ₂ OC H ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CO ₂ C ₂ H ₅		δ = 1.10-1.18 (mc, 6H), 2.02 (s, 3H), 2.48 (mc, 2H), 3.38 (s, 3H), 4.02 (q, 2H), 7.10 (mc, 2H)
P14	CH ₂ CH ₂ OC H ₃	CH ₃	CH ₃	CO ₂ iPr		δ = 1.08 (mc, 6H), 2.00 (s, 3H), 2.18 (mc, 6H), 3.47 (s, 3H), 3.43 (mc, 1H), 3.51 mc, 2H), 3.62 (mc, 2H), 4.62 (mc, 1H), 7.07 (s, 2H)
P15	CH ₂ CH ₂ OC H ₃	CH ₃	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅		δ = 1.12 (t, 3H), 2.02 (s, 3H), 2.18 (mc, 6H), 3.38 (s, 3H), 3.43 (mc, 1H), 3.51 (mc, 2H), 3.62 (mc, 2H), 4.00 (q, 2H), 7.08 (s, 2H)
P16	CH ₂ CH ₂ OC H ₃	CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃		δ = 1.23 (mc, 2H), 1.48 (mc, 2H), 1.79 (mc, 2H), 1.99 (mc, 2H), 2.02 (s, 3H), 2.18 (mc, 6H), 3.38 (s, 3H), 3.47 (mc, 1H), 3.51 (mc, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.55-3.70 (m, 2H), 7.08 (s, 2H)
P17	CH ₂ CH ₂ OC H ₃	CH ₃	H	COiPr		δ = 1.00 (d, 6H), 1.91-2.05 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.52 (hept, 1H), 3.01 (s, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.45 (mc, 1H), 3.51 (mc, 2H), 3.63 (mc, 2H), 7.18 (s, 2H)
P18	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃		
P19	n-C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	CO ₂ C ₂ H ₅		
P20	n-C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	CO ₂ C ₂ H ₅		
P21	n-C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	COiPr		δ = 0.89-1.02 (m, 6H), 1.12 (mc, 3H), 2.02 (s, 3H), 2.18 #p 2.20 (# s, Σ3H), 2.40-2.58 (m, 2H), 3.35-3.49 (m, 2H), 7.09 (s, 1H), 7.11 (s, 1H)
P22	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CO ₂ C ₂ H ₅		
P23	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	CH ₃	COiPr		

[0196] 制备实施例(起始材料)

[0197] 实施例G24:1-({[2-乙基-6-甲基-4-(丙-1-炔-1-基)苯基]乙酰基}氨基)-3-(2-

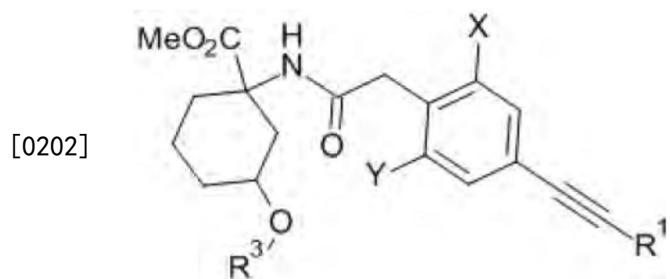
甲氧基乙氧基)环己烷甲酸甲酯



[0199] 将1.00g (4.6mmol) 2-乙基-6-甲基-4-丙炔基苯乙酸溶于25mL 二氯甲烷中并与一滴DMF混合。添加1.25g (9.88mmol) 乙二酰氯且所述混合物在回流条件下加热至沸腾直至气体停止蒸出。然后,将反应溶液浓缩,再次分别与30mL二氯甲烷混合两次并再次浓缩以最终获得于4mL二氯甲烷中的残余物(溶液1)。将1.33g (5mmol) 顺-3-甲氧基乙氧基-1-(甲氧基羰基)环己烷氯化铵和1g三乙胺溶于20 mL二氯甲烷中并且经90分钟滴加溶液1。搅拌18小时后,将所述混合物与50mL水混合,并将有机相分离出,浓缩并通过柱层析法(硅胶,梯度乙酸乙酯/正-庚烷)纯化。该方法产生1.71g (87%) 所需前体。

[0200] 表9:实施例编号G1-G30

[0201] 以类似于实施例G24的方法并且根据有关所述制备方法的一般细节,可获得下列化合物:



[0203]

实施例编 号	R ³	X	Y	R ¹	¹ H-NMR (400 MHz, δ ppm, CDCl ₃)或熔点
G1	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	
G2	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
G3	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	
G4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	
G5	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	
G6	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	
G7	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	
G8	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	H	
G9	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	
G10	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	熔点 158°C
G11	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	
G12	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	
G13	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	
G14	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
G15	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	
G16	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	CH ₃	熔点 145°C
G17	n-C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	
G18	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	
G19	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	
G20	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
G21	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	
G22	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	$\delta = 1.22$ (mc, 6H), 2.62 (mc, 2H), 3.35 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 7.20 (s, 2H)
G23	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	$\delta = 2.01$ (s, 3H), 2.33 (s, 6H), 3.47 (s, 3H), 3.53-3.70 (m, 3H), 3.70 (s, 2H), 7.07 (s, 2H)
G24	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	$\delta = 1.21$ (t, 3H), 2.05 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.52 (q, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.48 (mc, 4H), 3.62 (s, 2H), 7.17 (s, 1H), 7.19 (s, 1H)

[0204]

实施例编 号	R ³	X	Y	R ¹	¹ H-NMR (400 MHz, δ ppm, CDCl ₃)或熔点
G25	n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	H	熔点 154-155°C
G26	n-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
G27	n-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	
G28	n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	CH ₃	
G29	n-C ₄ H ₉	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	
G30	n-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	

[0205] B. 制剂实施例

[0206] a) 通过混合10重量份式(I)的化合物和/或其盐和90重量份的作为惰性物质的滑石并在冲击式磨机中粉碎所述混合物可获得撒粉产品。

[0207] b) 通过混合25重量份式(I)的化合物和/或其盐、64重量份作为惰性物质的含高岭土的石英、作为润湿剂和分散剂的10重量份木素磺酸钾和1重量份油酰基甲基牛磺酸钠，并在销盘式研磨机中研磨所述混合物，获得易分散于水中的可湿性粉剂。

[0208] c) 通过混合20重量份式(I)的化合物和/或其盐和6重量份烷基酚聚乙二醇醚(**⑧Triton X 207**)、3重量份异十三醇聚乙二醇醚(8 EO)和71重量份石蜡基矿物油(沸程例如约255°C至277°C以上)并在研磨式球磨机中研磨至细度低于5微米，获得易分散于水中的分散浓缩剂。

[0209] d) 由15重量份式(I)的化合物和/或其盐、75重量份的作为溶剂的环己酮和10重量份的作为乳化剂的乙氧基化壬基苯酚，获得可乳化浓缩剂。

[0210] e) 通过下述方法可获得水分散性颗粒剂：混合以下组分

[0211] 75重量份式(I)的化合物和/或其盐，

[0212] 10重量份木素磺酸钙，

[0213] 5重量份月桂基硫酸钠，

[0214] 3重量份聚乙烯醇和

[0215] 7重量份高岭土，

[0216] 在销盘式研磨机中研磨所述混合物，并在流化床中通过喷雾施用作为造粒液体的水使所述粉末成粒。

[0217] f) 也可通过下述方法获得水分散性颗粒剂：在胶体磨机中均质化和预粉碎以下组分

[0218] 25重量份式(I)的化合物和/或其盐，

[0219] 5重量份2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠，

[0220] 2重量份油酰基甲基牛磺酸钠，

[0221] 1重量份聚乙烯醇，

[0222] 17重量份碳酸钙和

[0223] 50重量份水，

[0224] 然后在珠磨机中研磨所述混合物并在喷雾塔中借助单相喷嘴使所得的悬浮液雾化和干燥。

[0225] C. 生物学数据

[0226] 1. 出苗前除草效果

[0227] 将单子叶和双子叶杂草植物和作物植物的种子置于装有沙壤土的木质纤维花盆中并用土壤覆盖。然后，在600至800L/ha(换算的)的水施用率下，将配制为可湿性粉剂(WP)形式或作为可乳化浓缩剂(EC)的本发明的化合物在添加0.2%润湿剂的情况下以水性悬浮液或乳液的形式施用至所述覆盖土壤的表面。

[0228] 经所述处理后，将所述花盆放置在温室中并保持在对所述试验植物而言良好的生长条件下。在3周测试周期后，通过与未经处理的对照组比较可目测评估对所述试验植物的损害(除草活性以百分比(%)计：100%活性=所述植物已死亡，0%活性=与对照植物相似)。

[0229] 不想要的植物/杂草：

[0230] ALOMY: 大穗看麦娘

SETVI: 狗尾草

- [0231] AMARE:反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) AVEFA:野燕麦
 [0232] CYPES:油莎草 (*Cyperus esculentus*) ECHCG:稗草
 [0233] LOLMU:多花黑麦草 STEME:繁缕 (*Stellaria media*)
 [0234] VERPE:阿拉伯婆婆纳 (*Veronica persica*) VIOTR:三色堇 (*Viola tricolor*)
 [0235] POLCO:卷茎蓼 (*Polygonum convolvulus*)
 [0236] 表10:出苗前效果

实施例编 号	剂量[g 活性物 质/ha]	对以下植物的除草效果[%]					
		ALOMY	AVEFA	CYPES	ECHCG	LOLMU	SETRI
[0237]	D1	320	100	100		100	100
		80	100	80		100	100
	D2	320	100	100		100	100
		80	100	80		100	100

对以下植物的除草效果[%]

实施例编 号	剂量[g 活性物 质/ha]	ALOMY	AVEFA	CYPES	ECHCG	LOLMU	SETVI
D3	320	100	100		100	100	100
	80	100	80		100	100	100
D4	320			100	100	80	80
	80						
D5	320	100	100		100	100	100
	80	100	100		100	100	100
D6	320	100	100	90	100	100	100
	80	100	100		100	100	100
D7	320	100	100		100	100	100
	80	100			100	100	100
D8	320	100	100	100	100	100	100
	80	100	100		100	100	100
D10	320	100	100		100		100
	80	90	90		100		100
P1	320	100	100	100	100	100	100
	80	100	80	100	100	100	100
P2	320	100	100		100	100	100
	80	100	100		100	100	100
P3	320	100	80		100	100	100
	80	90			100	100	100
P4	320	100	100		100	100	100
	80	100	100		100	100	100
P5	320	100	80		100	100	100
	80	80			90	90	90
P6	320	80			90	100	100
	80						
P12	320	100	100		100	100	100

[0238]

		对以下植物的除草效果[%]					
实施例编 号	剂量[g 活性物 质/ha]	ALOMY	AVEFA	CYPES	ECHCG	LOLMU	SETVI
[0239] P13	80	100	100		100	100	100
	320	100	100	90	100	100	100
	80	100	100		100	100	100
P14	320	100	100		100	100	100
	80	100	100		100	100	100
P15	320	100	100		100	100	100
	80	100	100		100	100	100
P16	320	100	100		100	100	
	80	100	100		100	100	

[0240] 如表10结果所示,本发明化合物对广谱的禾本科杂草和杂草具有良好的出苗前除草效力。例如,化合物D1-D8、D10、P1-P6和 P12-P16,在320g活性物质/ha的施用率时分别对大穗看麦娘、野燕麦、稗草、多花黑麦草和狗尾草示出80% -100%的效果。因此,本发明化合物适于通过出苗前方法防治不想要的植物生长。

[0241] 2. 出苗后除草效果

[0242] 将单子叶和双子叶杂草植物和作物植物的种子置于装有沙壤土的木质纤维花盆中,用土壤覆盖并在良好生长条件下在温室中培育。播种2至3周后,在单叶期处理所述试验植物。然后在600至800L/ha (换算的) 的水施用率下,将配制为可湿性粉剂(WP) 形式或作为可乳化浓缩剂(EC) 的本发明的化合物,在添加0.2%的湿润剂的情况下,以水性悬浮液或乳液的形式喷洒至植物的绿色部位上。在所述试验植物已在温室中最佳生长条件下放置约3周后,与未经处理的对照组比较可目测评估所述制剂的功效(除草功效以百分比(%)计: 100%活性=所述植物已死亡,0%活性=与对照植物相似)。

[0243] 表11:出苗后效果

[0244]

		对以下植物的除草效果[%]						
实施例编 号	剂量 [g 活性物质 /ha]	ALOMY	AVEFA	ECHCG	LOLMU	SETVI	AMARE	POLCO
D1	80	100		100	90	100		
	20	80		100		90		
D2	80	90		100	100	90		
	20			90				
D3	80		90	100	100	100	90	
	20			100	80	80		
D5	80	100	100	100	100	100		
	20	100	100	100	100	100		
D6	80	100	100	100	100	100	80	80
	20	100	100	100	100	100	80	
D7	80	100	100	100	100	100		
	20	100	100	100	100	100		
D8	80	100	100	100	100	100		
	20	100	100	100	100	100		
D10	80	90	90	90				
	20	90	80	90				
P1	80					100		
	20							
P2	80			80				
	20							
P3	80			90				
	20							
P4	80	100	100	100	100	100	80	
	20			100	100	100		
P12	80	100	100	100	100	100		
	20	100	100	100	100	100		
P13	80	100	100	100	100	100		
	20	100	100	100	100	100		
P14	80	100	90	100	100	100		

[0245]

实施例编 号	剂量 [g 活性物质 /ha]	对以下植物的除草效果[%]						
		ALOMY	AVEFA	ECHCG	LOLMU	SETVI	AMARE	POLCO
	20	100	90	100	100	90		
P15	80	100	100	100	100	100	80	80
	20	100	100	100	100	100	80	
P16	80	100	100	100	100	100	80	
	20	100	100	100	100	100	80	

[0246] 如表11结果所示,本发明化合物对广谱的禾本科杂草和杂草具有良好的出苗后除草效力。例如,化合物D1-D8、D10、P1-P4和 P12-P16,在80g/ha的施用率时分别对大穗看麦娘、野燕麦、稗草、多花黑麦草和狗尾草示出80%-100%的效果。因此,本发明化合物适于通过出苗后方法防治不想要的植物生长。