(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国 际 局

(43) 国际公布日
2012 年 5 月 24 日 (24.05.2012)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2012/065573 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 295/03 (2006.01)	*A01N 43/40* (2006.01)
C07D 295/116 (2006.01)	*A01N 43/44* (2006.01)
C07D 295/12 (2006.01)	*A01N 43/46* (2006.01)
C07D 241/04 (2006.01)	*A01N 43/60* (2006.01)
C07D 241/06 (2006.01)	*A01N 43/84* (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)	*A01P 13/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2011/082436

(22) 国际申请日: 2011 年 11 月 18 日 (18.11.2011)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201010554434.8 2010 年 11 月 19 日 (19.11.2010) CN

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): **中国中化股份有限公司 (SINOCHEM CORPORATION)** [CN/CN]; 中国北京市西城区复兴门内大街 28 号, Beijing 100031 (CN)。 **沈阳化工研究院有限公司 (SHENYANG RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.)** [CN/CN]; 中国辽宁省沈阳市铁西区沈辽东路 8 号, Liaoning 110021 (CN)。

(72) 发明人; 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): **刘长令 (LIU, Changling)** [CN/CN]; 中国辽宁省沈阳市铁西区沈辽东路 8 号, Liaoning 110021 (CN)。 **李慧超 (LI, Huichao)** [CN/CN]; 中国辽宁省沈阳市铁西区沈辽东路 8 号, Liaoning 110021 (CN)。 **王正航 (WANG, Zhenghang)** [CN/CN]; 中国辽宁省沈阳市铁西区沈辽东路 8 号, Liaoning 110021 (CN)。 **徐英 (XU, Ying)** [CN/CN]; 中国辽宁省沈阳市铁西区沈辽东路 8 号, Liaoning 110021 (CN)。 **马宏娟 (MA, Hongjuan)** [CN/CN]; 中国辽宁省沈阳市铁西区沈辽东路 8 号, Liaoning 110021 (CN)。 **崔东亮 (CUI, Dongliang)** [CN/CN]; 中国辽宁省沈阳市铁西区沈辽东路 8 号, Liaoning 110021 (CN)。

(74) 代理人: **沈阳科苑专利商标代理有限公司 (SHENYANG PATENT & TRADEMARK AGENCY ACADEMIA SINICA)**; 中国辽宁省沈阳市和平区三好街 24 号, Liaoning 110004 (CN)。

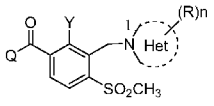
(81) 指定国 (除另有指明，要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW。

(84) 指定国 (除另有指明，要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT,

[见续页]

(54) Title: NITROGEN HETEROCYCLIC SUBSTITUTED BENZOYL COMPOUND AND USE THEREOF

(54) 发明名称 : 含氮杂环取代的苯甲酰基类化合物及其用途



(I)

(57) Abstract: A nitrogen heterocyclic substituted benzoyl compound or a stereoisomer thereof, as represented by Formula (I): See the description for the definition of each of the substituents in the formula. The compound represented by Formula (I) has herbicidal activity, is capable of controlling effectively weeds such as barnyard grass, crabgrass, black nightshade, velvetleaf, setaria, and zinnia, and can be used agriculturally as a herbicide.

(57) 摘要:

一种含氮杂环取代的苯甲酰基类化合物或其立体异构体，如通式 I 所示：

式中各取代基定义见说明书。

通式 I 化合物具有除草活性，可以有效地控制稗草、马唐、龙葵、苘麻、狗尾草、百日草等杂草，在农业上用作除草剂。

WO 2012/065573 A1

RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。

含氮杂环取代的苯甲酰基类化合物及其用途

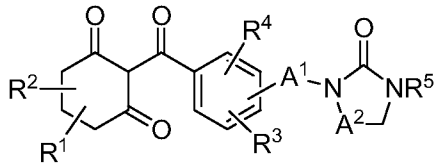
技术领域

本发明属于农用除草剂领域。具体涉及一种含氮杂环取代的苯甲酰基类化合物及其用途。

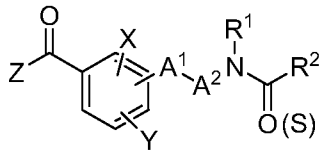
背景技术

关于苯甲酰基类化合物作为除草剂的报道有很多，例如专利DE10301110、WO2001032636、WO2001010850、DE19921732、WO9907688、JP10265432对此类化合物用作除草剂或植物生长调节剂的用途均有揭示。

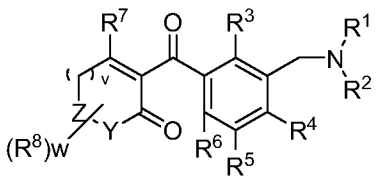
另外，在专利DE19962923中报道了如下通式所示的苯环上带有含氮取代基的苯甲酰基类化合物用作除草剂：

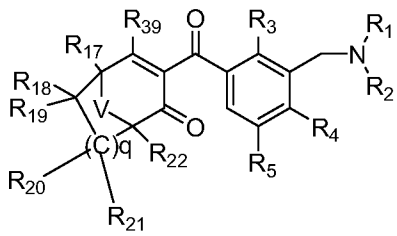


在专利WO2002090336中报道了如下通式所示的苯环上带有含氮侧链的苯甲酰基类化合物用作除草剂：



尽管在专利WO2000021924A1、WO2000037437A1等分别提及如下通式化合物，但其中没有R_1和R_2与N可以组成环的化合物：





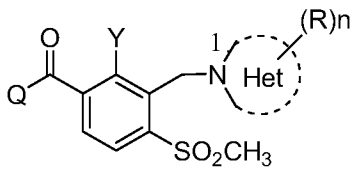
现代农业生产的发展需要不断开发新的除草化合物。现有技术中，如本发明通式 **I** 所示的3-位带有含氮杂环亚甲基取代基的苯甲酰基类化合物及其用途未见报道。

发明内容

为了满足农业上对除草剂不断提出的新要求，本发明提供了一种结构新颖的含氮杂环取代的苯甲酰基化合物，该类化合物作为除草剂可有效控制稗草、马唐、龙葵、苘麻、狗尾草、百日草等杂草。

本发明的技术方案如下：

本发明提供一种含氮杂环取代的苯甲酰基类化合物，如通式 **I** 所示：



I

式中：

Het 选自三至八元杂环，该环上除含有 C 和 1-位上的 N 原子外，还含有 0-3 个以下原子或基团作为环的组成部分：O、NR_1、S、SO、SO_2、C=O、$C=NR_1$ 或 $C=NOR_1$，且 C=O、$C=NR_1$

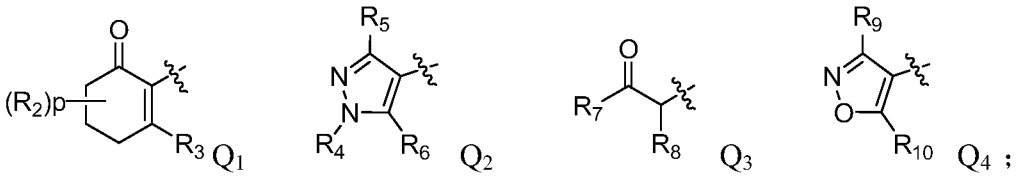
或 C=NOR$_1$ 不在 2-位；

Y 选自氟、氯、溴、碘或硝基；

R 选自卤素、氰基、羟基、羧基、氨基、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷氨基、C_2-C_6 烯氧基、卤代 C_2-C_6 烯氧基、C_2-C_6 烯氨基、卤代 C_2-C_6 烯氨基、C_1-C_6 烷基羰基、卤代 C_1-C_6 烷基羰基、C_1-C_6 烷氧基羰基、C_1-C_6 烷氨基羰基、C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷基羰基氧基 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷氧基羰基 C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷基羰基氧基、卤代 C_1-C_6 烷基羰基氧基、C_1-C_6 烷基羰基氨基、C_1-C_6 烷基磺酰基氧基、C_1-C_6 烷基磺酰基氨基、C_1-C_6 烷基羰基 C_1-C_6 烷氧基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的芳基、杂芳基、芳氧基、杂芳基氧基、芳基羰基氧基、芳基磺酰基氧基、芳甲基氧基、杂芳基甲基氧基、芳基羰基氨基、芳基磺酰基氨基、芳甲基氨基或杂芳基甲基氨基：卤素、硝基、氰基、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_6 烷基羰基；n=0-4；

R_1 选自氢、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_2-C_6 烯基、卤代 C_2-C_6 烯基、C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷基羰基、卤代 C_1-C_6 烷基羰基、C_1-C_6 烷基磺酰基、C_1-C_6 烷氧基羰基、C_1-C_6 烷氨基羰基、C_1-C_6 烷基羰基 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氧基羰基 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氨基羰基 C_1-C_6 烷基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的芳基、杂芳基、芳基羰基、杂芳基羰基、芳基磺酰基、芳甲基或杂芳基甲基：卤素、硝基、氰基、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_6 烷基羰基；

Q 选自 Q_1-Q_4 所示的基团之一：



其中：

R_2 选自 C_1-C_6 烷基、C_3-C_6 环烷基、C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷基羰基、C_1-C_6 烷氧基羰基、C_1-C_6 烷硫基、芳基或卤代芳基，p=0-6；

当 p=2 时，位于不同 C 原子上的两个 R_2 可以连接成 CH_2；或者当 p=2 时，位于同 C 或不同 C 原子上的两个 R_2 可以连接成如下基团：$(CH_2)_2$、$(CH_2)_3$、$(CH_2)_4$、$(CH_2)_5$、$(CH_2)_6$、O、$O(CH_2)_2O$、$O(CH_2)_3O$、$O(CH_2)_4O$、$S(CH_2)_2S$ 或 $S(CH_2)_3S$；

R_3、R_6 选自羟基、卤素、C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷基羰基氧基、C_1-C_6 烷硫基、C_1-C_6 烷基磺酰基氧基、C_2-C_6 烯氧基、卤代 C_2-C_6 烯氧基、C_2-C_6 炔氧基、C_1-C_6 烷氧基羰基 C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷氨基羰基 C_1-C_6 烷氧基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的芳氧基、芳硫基、芳甲基氧基、芳基羰基氧基、芳基磺酰基氧基、杂芳基氧基或芳基羰基甲基氧基：卤素、硝基、氰基、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氧基或卤代 C_1-C_6 烷氧基；

R_4 选自氢、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_3-C_6 环烷基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的芳基、芳甲基或杂芳基：卤素、硝基、氰基、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氧基或卤代 C_1-C_6 烷氧基；

R_5、R_9 选自氢、卤素、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_3-C_6 环烷基、C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷基羰基、C_1-C_6 烷氧基羰基、C_1-C_6 烷硫基、C_1-C_6 烷基磺酰基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的芳基：卤素、硝基、氰基、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_1-C_6 烷氧基或卤代 C_1-C_6 烷氧基；

R_7 选自氢、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_3-C_6 环烷基、芳基或卤代芳基；

R_8 选自氢、卤素、氰基、氨基甲酰基、C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、C_3-C_6 环烷基、C_1-C_6

烷氧基、C_1-C_6烷氧基羰基、C_1-C_6烷硫基或C_1-C_6烷基磺酰基；

R_{10}选自羟基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷基羰基氧基或C_1-C_6烷基磺酰基氧基；

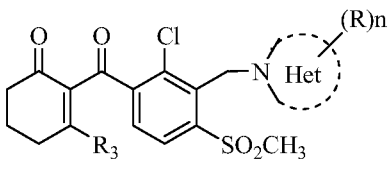
或其盐。

上面给出的通式化合物的定义中，汇集所用术语定义如下：

卤（素）：指氟、氯、溴或碘。烷基：直链或支链烷基，例如甲基、乙基、丙基、异丙基或叔丁基等。环烷基：取代或未取代的环状烷基，例如环丙基、环戊基或环已基。取代基如甲基、卤素等。卤代烷基：直链或支链烷基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。例如，氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基或三氟甲基等。烷基磺酰基：指的是直链或支链烷基经磺酰基（$-SO_2-$）连接到结构上，如甲基磺酰基等。烷氧基：直链或支链烷基经氧原子连接到结构上。卤代烷氧基：直链或支链烷氧基，在这些烷氧基上的氢原子可部分或全部被卤素所取代。例如，氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、三氟乙氧基等。烷硫基：直链或支链烷基经硫原子连接到结构上。卤代烷硫基：直链或支链烷硫基，在这些烷硫基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。例如，氯甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基等。烷氨基：直链或支链烷基经氮原子连接到结构上，如$-NHCH_3$、$-NHCH_2CH_3$、$-N(CH_3)_2$等。卤代烷氨基：直链或支链烷氨基，烷基上的氢原子可部分或全部被卤素所取代。烷基羰基：烷基经羰基连接到结构上，如$-COCH_3$、$-COCH_2CH_3$等。卤代烷基羰基：烷基羰基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，如$-COCF_3$等。烷氧基羰基：烷氧基经羰基连接到结构上。如$-CO_2CH_3$、$-CO_2CH_3CH_2$等。烷氨基羰基：烷氨基经羰基连接到结构上。如$-CONHCH_3$、$-CON(CH_3)_2$等。烷基羰基氨基：烷基羰基经氮原子连接到结构上，如$-NHCOCH_3$、$-NHCOCH_2CH_3$等。烷基磺酰基氧基：烷基磺酰基经氧原子连接到结构上，如$-OSO_2CH_3$、$-OSO_2CH_2CH_3$等。烷基磺酰基氨基：烷基磺酰基经氮原子连接到结构上，如$-NHSO_2CH_3$、$-NHSO_2CH_2CH_3$等。烯基：直链或支链烯类，例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基和不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。烯基还包括多烯类，如 1,2-丙二烯基和 2,4-己二烯基。卤代烯基：直链或支链烯基，在这些烯基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烯氧基：直链或支链烯基，经氧原子连接到结构上。卤代烯氧基：直链或支链烯氧基，在这些烯氧基上的氢原子可部分或全部被卤素所取代。烯氨基：直链或支链烯基，经氮原子键连到结构上。卤代烯氨基：直链或支链烯氨基，在这些烯氧基上的氢原子可部分或全部被卤素所取代。炔氧基：直链或支链炔基，经氧原子连接到结构上。芳基以及芳氧基、芳基羰基和芳甲基等中的芳基部分包括苯基或萘基等。芳氧基：芳基经氧原子连接到结构上，如苯氧基、萘氧基等。杂芳基是含 1 个或多个 N、O、S 杂原子的五元环或六元芳环。例如呋喃基、吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基、三嗪基、喹啉基等。杂芳基氧基：杂芳基经氧原子连接到结构上，如吡啶-2-基氧基、吡啶-3-基氧基或嘧啶-2-基氧基等。所述的盐包括通式 I 化合物杂环 1-位上的 N 原子与酸（如盐酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、草酸、苯磺酸、柠檬酸或苹果酸等）反应形成的盐，还包括其烯醇式的羟基与碱（如三乙胺、锂、钠、钾等）反应形成的盐。

在本发明的化合物中，由于构型不同可以形成立体异构体（分别以R和S来表示不同的构型），本发明包括R型异构体和S型异构体及其任何比例的混合物；由于酮/烯醇互变可以存在多种互变异构体，本发明包括所有互变异构体及其任何比例的混合物。

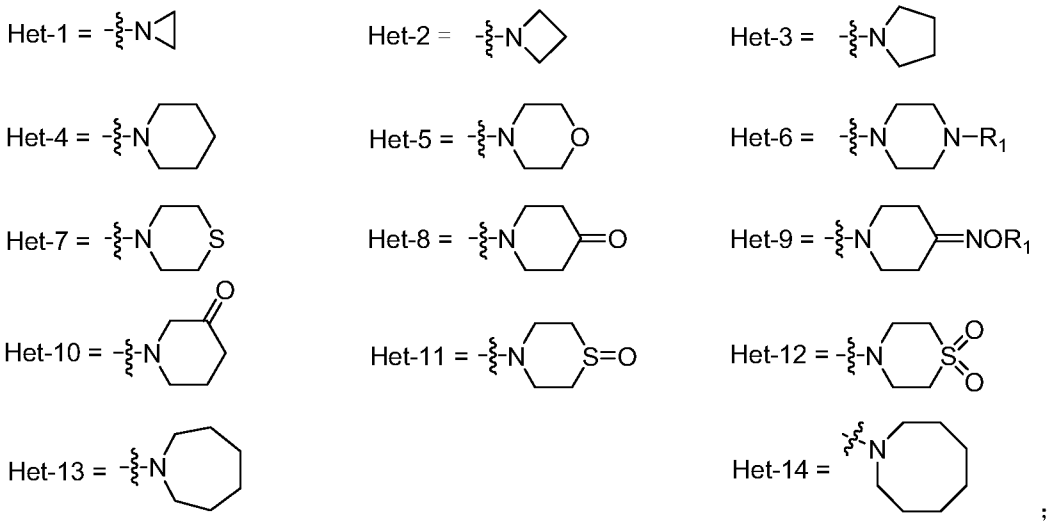
本发明较为优选的技术方案为，通式 **I** 所示的含氮杂环取代的苯甲酰基类化合物或其立体异构体中 Q 选自 Q_1 且 p=0 的化合物，如通式 **I-1** 所示：



I-1

式中：

Het 选自 Het-1 至 Het-14 所示的基团之一：



;

R 选自氟、氯、溴、氰基、羟基、羧基、氨基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷氨基、C_2-C_4 烯氧基、卤代 C_2-C_4 烯氧基、C_2-C_4 烯氨基、卤代 C_2-C_4 烯氨基、C_1-C_3 烷基羰基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基、C_1-C_3 烷氧基羰基、C_1-C_3 烷氨基羰基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷基羰基氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷氧基羰基 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷基羰基氧基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基氧基、C_1-C_3 烷基羰基氨基、C_1-C_3 烷基磺酰基氧基、C_1-C_3 烷基磺酰基氨基、C_1-C_3 烷基羰基 C_1-C_3 烷氧基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯基、吡啶基、苯氧基、吡啶基氧基、苯甲酰基氧基、苯磺酰基氧基、苄氧基、吡啶基甲基氧基、苯甲酰基氨基、苯磺酰基氨基、苄基氨基或吡啶基甲基氨基：氟、氯、溴、硝基、氰基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 烷基羰基；n=0-4；

R_1 选自氢、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_2-C_4 烯基、卤代 C_2-C_4 烯基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷基羰基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基、C_1-C_3 烷基磺酰基、C_1-C_3 烷氧基羰基、C_1-C_3 烷氨基羰基、C_1-C_3 烷基羰基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基羰基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氨基羰基 C_1-C_3 烷基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯基、吡啶基、苯甲酰基、吡啶甲酰基、苯磺酰基、苄基或吡啶甲基：氟、氯、溴、硝基、氰基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 烷基羰基；

R_3 选自羟基、氯、溴、C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷基羰基氧基、C_1-C_3 烷硫基、C_1-C_3 烷基磺酰基氧基、C_1-C_3 烷氧基羰基 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷氨基羰基 C_1-C_3 烷氧基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯氧基、苯硫基、苄基氧基、苯甲酰基氧基、苯磺酰基氧基、吡啶氧基或苯甲酰基甲基氧基：氟、氯、溴、硝基、氰基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基或卤代 C_1-C_3 烷氧基；

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

进一步优选的化合物为：通式 I-1 中

Het 选自 Het-4 至 Het-8 所示的基团之一；

R 选自氟、氯、溴、氰基、羟基、羧基、氨基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷氨基、C_1-C_3 烷氧基羰基、C_1-C_3 烷氨基羰基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷基羰基氧基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基氧基、C_1-C_3 烷基羰基氨基、C_1-C_3 烷基磺酰基氧基、C_1-C_3 烷基磺酰基氨基、未取代的或被 1-3 个独

立选自以下基团取代的苯氧基或吡啶基氧基：氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基或甲酰基；n=0-4；

R_1 选自氢、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷基羰基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基、C_1-C_3 烷基磺酰基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯基或吡啶基：氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基或甲酰基；

R_3 选自羟基、氯、溴、C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷基羰基氧基、C_1-C_3 烷硫基、C_1-C_3 烷基磺酰基氧基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯氧基或苯硫基：氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基或三氟甲氧基；

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

更进一步优选的化合物为：通式 I-1 中

Het 选自 Het-4 至 Het-6 所示的基团之一；

R 选自氟、氯、溴、氰基、甲基、甲氧基、甲氨基、甲氧基羰基、甲氨基羰基、乙酰基氧基、乙酰基氨基、苯氧基、吡啶基氧基、2-氯-4-三氟甲基苯基氧基或 3-氯-5-三氟甲基-吡啶-2-基氧基，n=0-2；

R_1 选自甲基、乙酰基、苯基、吡啶基、2-氯-4-三氟甲基苯基或 3-氯-5-三氟甲基-吡啶-2-基；

R_3 选自羟基；

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

再进一步优选的化合物为：通式 I-1 中

Het 选自 Het-4 至 Het-6 所示的基团之一；

R 选自甲基或 3-氯-5-三氟甲基-吡啶-2-基氧基，n=0-2；

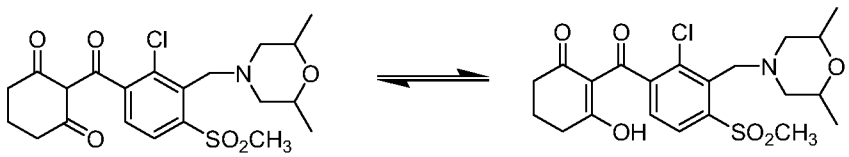
R_1 选自 3-氯-5-三氟甲基-吡啶-2-基；

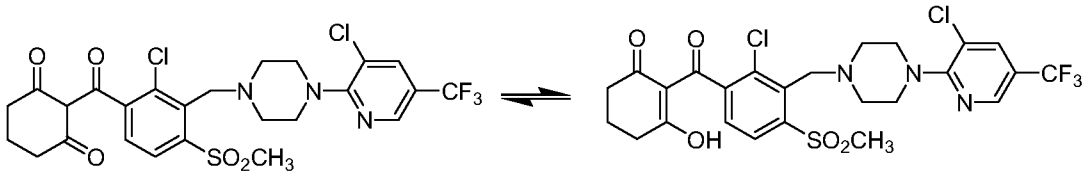
R_3 选自羟基；

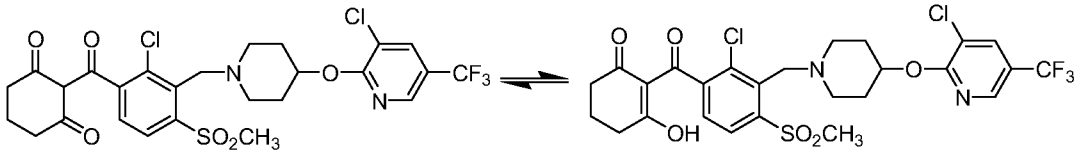
或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

最为优选的化合物的具体结构为：







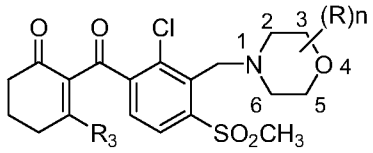


;

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

本发明中通式Ⅰ化合物中部分优选化合物可以用表**1**-表**7**中列出的具体化合物来说明，但这些具体化合物并不限定本发明。

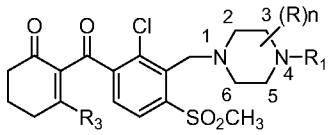
表**1**

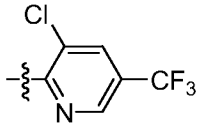


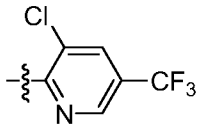
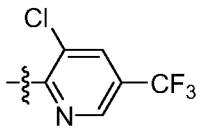
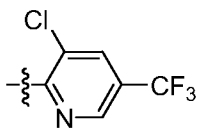
序号	R_3	(R)n	序号	R_3	(R)n
I-1-1	OH	/	I-1-14	OCH_3	3,5-2CH_3
I-1-2	OH	2-CH_3	I-1-15	$OCOCH_3$	/
I-1-3	OH	3-CH_3	I-1-16	$OCOCH_3$	3,5-2CH_3
I-1-4	OH	3,5-2CH_3	I-1-17	OSO_2CH_3	/
I-1-5	OH	2-CH_2OCH_3	I-1-18	OSO_2CH_3	3,5-2CH_3
I-1-6	OH	3-CH_2OCH_3	I-1-19	OSO_2Ph	/
I-1-7	OH	2-$(CH_2)_2OCH_3$	I-1-20	OSO_2Ph-4-CH_3	/
I-1-8	OH	3-$(CH_2)_2OCH_3$	I-1-21	OCH_2COPh	/
I-1-9	OH	2-$CONHCH_3$	I-1-22	OCH_2COPh-4-CH_3	/
I-1-10	OH	3-$CONHCH_3$	I-1-23	OCH_2COPh-4-Cl	/
I-1-11	OH	2-$CH_2CONHCH_3$	I-1-24	OCH_2COPh-2,4-2Cl	/
I-1-12	OH	3-$CH_2CONHCH_3$	I-1-25	ONa	/
I-1-13	OCH_3	/	I-1-26	OK	/

注：“/”表示无取代基，下同。

表 **2**



序号	R_3	R_1	(R)n
I-1-27	OH		/
I-1-28	OH	CH_3	/
I-1-29	OH	$COCH_3$	/
I-1-30	OH	COC_2H_5	/
I-1-31	OH	SO_2CH_3	/
I-1-32	OH	Ph-2-NO_2	/

I-1-33	OH	Ph-4-NO_2	/
I-1-34	OH	Ph-2-CF_3	/
I-1-35	OH	Ph-4-CF_3	/
I-1-36	OH	Ph-2-Cl-4-NO_2	/
I-1-37	OH	Ph-2-Cl-4-CF_3	/
I-1-38	OH	COPh	/
I-1-39	OH	COPh-4-Cl	/
I-1-40	OH	CH_2Ph	/
I-1-41	OH	CH_2Ph-4-Cl	/
I-1-42	OH	CH_3	2-CH_3
I-1-43	OH	$COCH_3$	2-CH_3
I-1-44	OH	SO_2CH_3	2-CH_3
I-1-45	OH	Ph-2-Cl-4-NO_2	2-CH_3
I-1-46	OH	Ph-2-Cl-4-CF_3	2-CH_3
I-1-47	OH		2-CH_3
I-1-48	OH	COPh	2-CH_3
I-1-49	OH	CH_2Ph	2-CH_3
I-1-50	OH	CH_3	3-CH_3
I-1-51	OH	$COCH_3$	3-CH_3
I-1-52	OH	SO_2CH_3	3-CH_3
I-1-53	OH	Ph-2-Cl-4-NO_2	3-CH_3
I-1-54	OH	Ph-2-Cl-4-CF_3	3-CH_3
I-1-55	OH		3-CH_3
I-1-56	OH	COPh	3-CH_3
I-1-57	OH	CH_2Ph	3-CH_3
I-1-58	OH	CH_3	2,6-2CH_3
I-1-59	OH	$COCH_3$	2,6-2CH_3
I-1-60	OH	SO_2CH_3	2,6-2CH_3
I-1-61	OH	Ph-2-Cl-4-NO_2	2,6-2CH_3
I-1-62	OH	Ph-2-Cl-4-CF_3	2,6-2CH_3
I-1-63	OH		2,6-2CH_3
I-1-64	OH	COPh	2,6-2CH_3
I-1-65	OH	CH_2Ph	2,6-2CH_3
I-1-66	OH	CH_3	3,5-2CH_3
I-1-67	OH	$COCH_3$	3,5-2CH_3

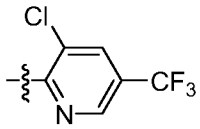
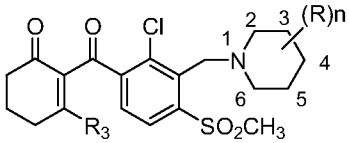
I-1-68	OH	SO_2CH_3	3,5-2CH_3
I-1-69	OH	Ph-2-Cl-4-NO_2	3,5-2CH_3
I-1-70	OH	Ph-2-Cl-4-CF_3	3,5-2CH_3
I-1-71	OH		3,5-2CH_3
I-1-72	OH	COPh	3,5-2CH_3
I-1-73	OH	CH_2Ph	3,5-2CH_3
I-1-74	OCH_3	CH_3	/
I-1-75	OCH_3	$COCH_3$	/
I-1-76	OCH_3	SO_2CH_3	/
I-1-77	$OCOCH_3$	CH_3	/
I-1-78	$OCOCH_3$	$COCH_3$	/
I-1-79	$OCOCH_3$	SO_2CH_3	/
I-1-80	OSO_2CH_3	CH_3	/
I-1-81	OSO_2CH_3	$COCH_3$	/
I-1-82	OSO_2CH_3	SO_2CH_3	/
I-1-83	OSO_2Ph	$COCH_3$	/
I-1-84	OSO_2Ph-4-CH_3	$COCH_3$	/
I-1-85	OCH_2COPh	$COCH_3$	/
I-1-86	OCH_2COPh-4-CH_3	$COCH_3$	/
I-1-87	ONa	$COCH_3$	/
I-1-88	OK	$COCH_3$	/

表 **3**



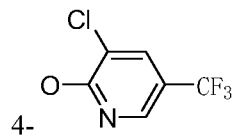
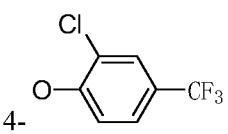
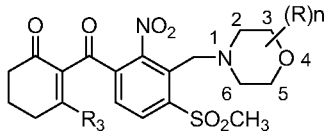
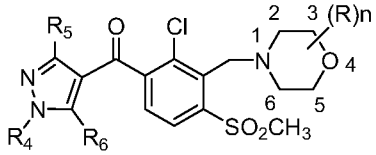
序号	R_3	(R)n	序号	R_3	(R)n
I-1-89	OH	/	I-1-99	OH	2-$NHCOCH_3$
I-1-90	OH	2-CH_3	I-1-100	OH	3-$NHCOCH_3$
I-1-91	OH	3-CH_3	I-1-101	OH	4-$NHCOCH_3$
I-1-92	OH	4-CH_3	I-1-102	OH	2-$CONHCH_3$
I-1-93	OH	3,5-2CH_3	I-1-103	OH	3-$CONHCH_3$
I-1-94	OH	2-OCH_3	I-1-104	OH	4-$CONHCH_3$
I-1-95	OH	3-OCH_3	I-1-105	OH	2-$CONHC_2H_5$
I-1-96	OH	4-OCH_3	I-1-106	OH	3-$CONHC_2H_5$
I-1-97	OH	4-$NHCH_3$	I-1-107	OH	4-$CONHC_2H_5$
I-1-98	OH		I-1-108	OH	

表 4



序号	R_3	(R)n	序号	R_3	(R)n
I-1-109	OH	/	I-1-122	OCH_3	3,5-2CH_3
I-1-110	OH	2-CH_3	I-1-123	$OCOCH_3$	/
I-1-111	OH	3-CH_3	I-1-124	$OCOCH_3$	3,5-2CH_3
I-1-112	OH	3,5-2CH_3	I-1-125	OSO_2CH_3	/
I-1-113	OH	2-CH_2OCH_3	I-1-126	OSO_2CH_3	3,5-2CH_3
I-1-114	OH	3-CH_2OCH_3	I-1-127	OSO_2Ph	/
I-1-115	OH	2-$(CH_2)_2OCH_3$	I-1-128	OSO_2Ph-4-CH_3	/
I-1-116	OH	3-$(CH_2)_2OCH_3$	I-1-129	OCH_2COPh	/
I-1-117	OH	2-$CONHCH_3$	I-1-130	OCH_2COPh-4-CH_3	/
I-1-118	OH	3-$CONHCH_3$	I-1-131	OCH_2COPh-4-Cl	/
I-1-119	OH	2-$CH_2CONHCH_3$	I-1-132	OCH_2COPh-2,4-2Cl	/
I-1-120	OH	3-$CH_2CONHCH_3$	I-1-133	ONa	/
I-1-121	OCH_3	/	I-1-134	OK	/

表 5



序号	R_4	R_5	R_6	(R)n
I-2-1	CH_3	H	OH	/
I-2-2	CH_3	H	OH	3,5-2CH_3
I-2-3	CH_3	CH_3	OH	/
I-2-4	CH_3	CH_3	OH	3,5-2CH_3
I-2-5	C_2H_5	H	OH	/
I-2-6	C_2H_5	H	OH	3,5-2CH_3
I-2-7	C_2H_5	CH_3	OH	/
I-2-8	C_2H_5	CH_3	OH	3,5-2CH_3
I-2-9	CH_3	H	OSO_2Ph	/
I-2-10	CH_3	CH_3	OSO_2Ph	/
I-2-11	C_2H_5	H	OSO_2Ph	/
I-2-12	C_2H_5	CH_3	OSO_2Ph	/
I-2-13	CH_3	H	OSO_2Ph-4-CH_3	/
I-2-14	CH_3	CH_3	OSO_2Ph-4-CH_3	/
I-2-15	C_2H_5	H	OSO_2Ph-4-CH_3	/
I-2-16	C_2H_5	CH_3	OSO_2Ph-4-CH_3	/
I-2-17	CH_3	H	OCH_2COPh	/
I-2-18	CH_3	CH_3	OCH_2COPh	/

I-2-19	C_2H_5	H	OCH_2COPh	/
I-2-20	C_2H_5	CH_3	OCH_2COPh	/
I-2-21	CH_3	H	OCH_2COPh-4-CH_3	/
I-2-22	CH_3	CH_3	OCH_2COPh-4-Cl	/
I-2-23	C_2H_5	H	OCH_2COPh-2,4-2Cl	/
I-2-24	C_2H_5	CH_3	OCH_2COPh-4-CH_3	/

表 **6**

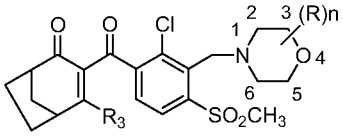


表**6**中化合物I-3-1至I-3-26各取代基分别同于表**1**中化合物I-1-1至I-1-26的各取代基。

表 **7**

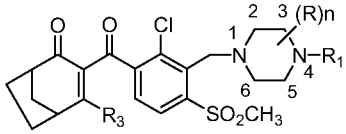


表 **7** 中化合物 I-3-27 至 I-3-88 各取代基分别同于表 **2** 中 I-1-27 至 I-1-88 的各取代基。

本发明通式 **I** 化合物可按照以下方法制备：

当 Q 选自 Q_2 或 Q_4 时，通式 I 化合物可参照专利 WO2002090336、US4885022、US6037312 等方法制备；

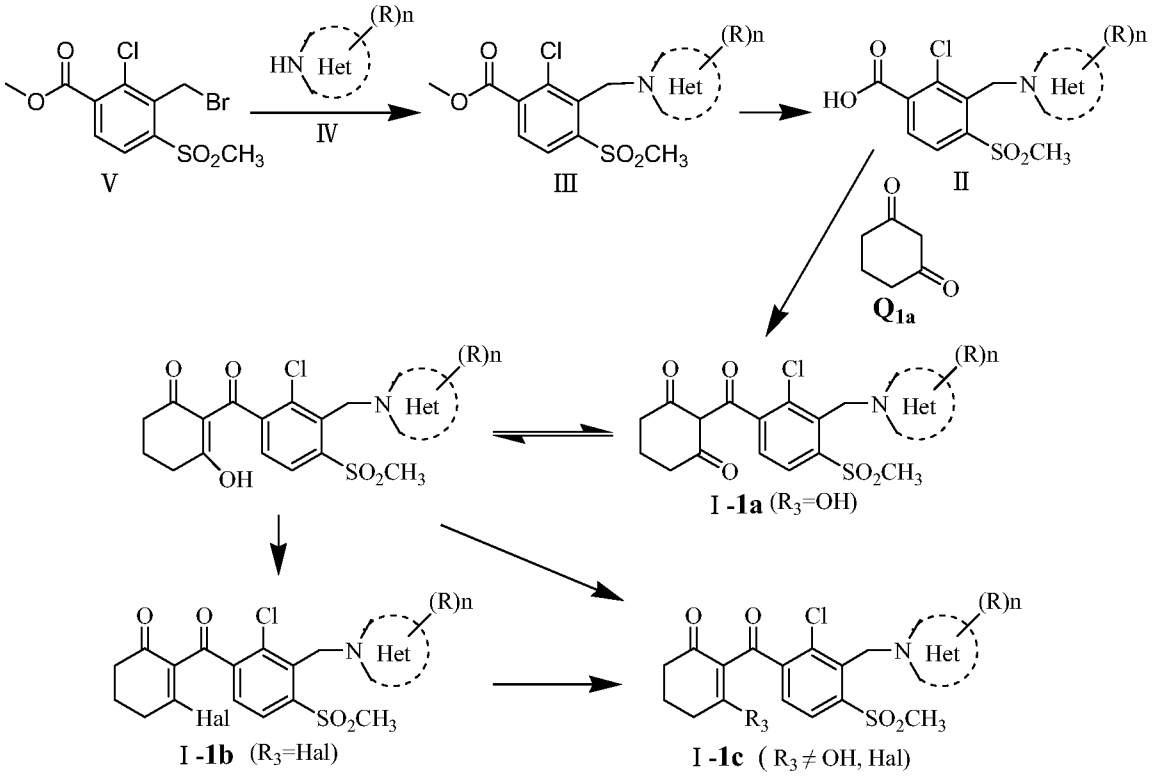
当 Q 选自 Q_3 时，通式 I 化合物可参照专利 EP496630、US4741769 中的方法制备。

当 Q 选自 Q_1 时，即本发明优选的通式 **I-1** 化合物，可按照以下方法制备：

首先，由中间体Ⅴ与中间体Ⅳ在碱性条件下反应制得通式Ⅲ化合物，通式Ⅲ化合物在氢氧化钠水溶液存在下水解得到通式Ⅱ所示的取代苯甲酸，再由通式Ⅱ所示的取代苯甲酸或其相应的衍生物（如相应的酰卤、酰氰或酯）与 1,3-环已二酮（$\mathbf{Q_{1a}}$）、在脱水剂及一种或多种催化剂存在下反应制得 R_3=OH 的通式 **I-1a** 化合物（酮式或烯醇式）；然后，通式 **I-1a** 化合物再与卤化剂反应得 R_3=Hal 的通式 **I-1b** 化合物；通式 **I-1c** 化合物（$R_3 \neq$OH 或 Hal）的制备因 R_3 的不同分两种情况：

第一种情况：当 R_3 为 C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷硫基、C_2-C_6 烯氧基、卤代 C_2-C_6 烯氧基、C_2-C_6 炔氧基、C_1-C_6 烷氧基羰基 C_1-C_6 烷氧基、C_1-C_6 烷氨基羰基 C_1-C_6 烷氧基，及取代或未取代芳氧基、芳硫基、芳甲基氧基或杂芳基氧基时，将通式 **I-1b** 在有碱或无碱的情况下与含羟基或巯基的化合物反应制得；

第二种情况：当 R_3 为 C_1-C_6 烷基羰基氧基、C_1-C_6 烷基磺酰基氧基，及取代或未取代的芳基羰基氧基、芳基磺酰基氧基或芳基羰基甲氧基时，将通式 **I-1a** 化合物与卤代物（如酰卤、磺酰氯等）在碱性条件下反应可直接制得。



上述反应式中 Hal 为卤素，其他各基团定义同前，

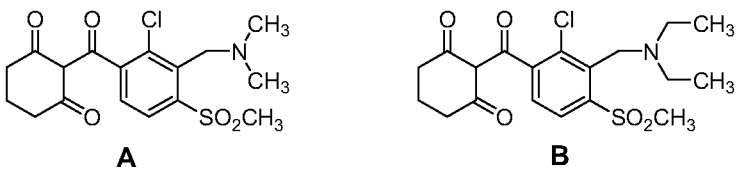
上述各步反应均在适宜的溶剂中进行，适宜的溶剂可选自如四氢呋喃、二氯甲烷、氯仿、乙腈、甲苯、二甲苯、苯、丙酮或丁酮等。反应温度可在室温至溶剂沸点温度之间，通常为室温。反应时间为 30 分钟至 20 小时，通常 1~10 小时。

上述反应中涉及的适宜的脱水剂可选二环已基碳二亚胺（DCC），也可选自其他试剂如 1-(3-二甲氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺（EDC）或 *N,N'*-羰基二咪唑（CDI）等。适宜的催化剂选自如氰化钠、氰化钾、丙酮氰醇或氰基三甲基硅烷等。适宜的卤化剂可选草酰氯或草酰溴等。适宜的碱可选自三乙胺、碳酸钠、碳酸钾、氢氧化钠或氢氧化钾等。

原料 **Q_{1a}** 即 1,3-环已二酮有市售。原料Ⅱ可以按照 US6376429 的方法自制。

本发明所述的通式 **I** 化合物的盐可以包括无机盐（如盐酸盐、磷酸盐、钠盐、钾盐等）或有机盐（如甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸、苯磺酸盐、草酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐等）。由通式 **I** 化合物制备上述盐可以采用本领域的技术人员公知的方法。

生物活性筛选测试表明本发明的通式 **I** 化合物具有很好的除草活性。尤其是通式 **I-1** 化合物与 3-位带有链状含氮取代基的苯甲酰基类化合物相比，除草活性更为优异。发明人根据专利 WO2000021924、WO2000037437 报道的相关化合物合成了两个与本发明化合物结构更为相近、但 3-位带有链状含氮取代基的苯甲酰基类化合物（代号化合物 A 和 B）作为对照化合物，进行除草活性效果测试。试验结果进一步证明了本发明的化合物更具优势。对照化合物 A 和 B 的结构如下：



本发明的化合物可以有效地控制稗草、马唐、苘麻等杂草，在低剂量下就可以获得很好的效果。因此本发明还包括通式 **I** 化合物用于控制杂草的用途。同时，本发明的通式 **I** 化合物对玉米具有很好的安全性，因此优选用于控制玉米田的杂草。

本发明还提供了一种除草组合物，该组合物中含有作为活性组分的通式 I 化合物，组合物中作为活性组分的通式I化合物的重量百分含量为0.1-99%。因此本发明还包括该组合物用于控制杂草的用途，特别优选该组合物用于控制玉米田杂草的用途。

本发明的组合物可以采用本领域的技术人员公知的方法制备。这种组合物可以含本发明的单一化合物或几种化合物的混合物。

本发明组合物中的载体系满足下述条件的物质：它与活性成分配制后便于施用于待处理的位点，例如可以是植物、种子或土壤；或者有利于贮存、运输或操作。载体可以是固体或液体，包括通常为气体但已压缩成液体的物质，通常在配制除草组合物中所用的载体均可使用。

合适的固体载体包括天然和合成的粘土和硅酸盐，例如硅藻土、滑石、硅镁土、硅酸铝(高岭土)、蒙脱石和云母；碳酸钙；硫酸钙；硫酸铵；合成的氧化硅和合成硅酸钙或硅酸铝；元素如碳和硫；天然的和合成的树脂如苯并呋喃树脂，聚氯乙烯和苯乙烯聚合物和共聚物；固体多氯苯酚；沥青；蜡如蜂蜡，石蜡。

合适的液体载体包括水；醇如异丙醇和乙醇；酮如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丙基酮、环已基酮；醚；芳烃如苯、甲苯、二甲苯；石油馏分如煤油和矿物油；氯代烃如四氯化碳、全氯乙烯和三氯乙烯。通常，这些液体的混合物也是合适的。

组合物通常加工成浓缩物的形式并以此用于运输，在施用之前由使用者将其稀释。少量的表面活性剂载体的存在有助于稀释过程。这样，按照本发明的组合物中至少有一种载体优选是表面活性剂。例如组合物可含有至少两种载体，其中至少一种是表面活性剂。

表面活性剂可以是乳化剂、分散剂或润湿剂；它可以是非离子的或离子的表面活性剂。合适的表面活性剂的例子包括聚丙烯酸和木质素磺酸的钠盐或钙盐；分子中含至少 12 个碳原子的脂肪酸或脂肪胺或酰胺与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物。甘醇、山梨醇、蔗糖或季戊四醇脂肪酸酯及这些酯与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物；脂肪醇或烷基苯酚如对辛基苯酚或对辛基甲苯酚与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物；这些缩合产物的硫酸盐和磺酸盐；在分子中至少含有 10 个碳原子的硫酸或磺酸酯的碱金属或碱土金属盐，优选钠盐，例如硫酸月桂酸酯钠，硫酸仲烷基酯钠，磺化蓖麻油钠盐，磺酸烷基芳基酯钠，如十二烷基苯磺酸钠盐。

本发明的组合物的实例是可湿性粉剂、粉剂、颗粒剂、水剂、可乳化的浓缩剂、乳剂、气雾剂和烟雾剂。可湿性粉剂通常含 25-75%重量活性成分，且通常除固体惰性载体之外，还含有 3-10%重量的分散剂，且若需要可加入 0-10%重量的稳定剂和/或其它添加剂如渗透剂或粘着剂。粉剂通常可为具有与可湿性粉剂相似的组成但没有分散剂的粉剂浓缩剂，再进一步用固体载体稀释，得到通常含 0.5-10%重量活性组分的组合物。粒剂通常制备成具有 10 至 100 目(1.676-0.152 mm)大小，且可用成团或注入技术制备。通常粒剂含 0.5-75%重量的活性成分和 0-10%重量添加剂如稳定剂、表面活性剂、缓释改良剂。可乳化浓缩剂除溶剂外，当需要时通常含有共溶剂，1-50%W/V 活性成分，2-20%W/V 乳化剂和 0-20%W/V 其它添加剂如稳定剂、渗透剂和腐蚀抑制剂。悬浮浓缩剂通常含有 10-75%重量的活性成分、0.5-15%重量的分散剂、0.1-10%重量的其它添加剂如消泡剂、腐蚀抑制剂、稳定剂、渗透剂和粘着剂。

水分散剂和乳剂，例如通过用水稀释按照本发明的可湿性粉剂或浓缩物得到的组合物，也列入本发明范围。所说的乳剂可具有油包水或水包油两个类型。

通过在组合物中加入其它的一种或多种除草剂，使其能比单独的通式 **I** 化合物具有更广谱的活性。此外，其它除草剂可对通式 **I** 化合物的除草活性具有增效作用，也可将通式 **I** 化合物与其它除草剂混用，混剂中有效成分的含量变化范围很大，混剂中有效成分含量一般在1%-95%，较适宜的含量在 5%-60%。

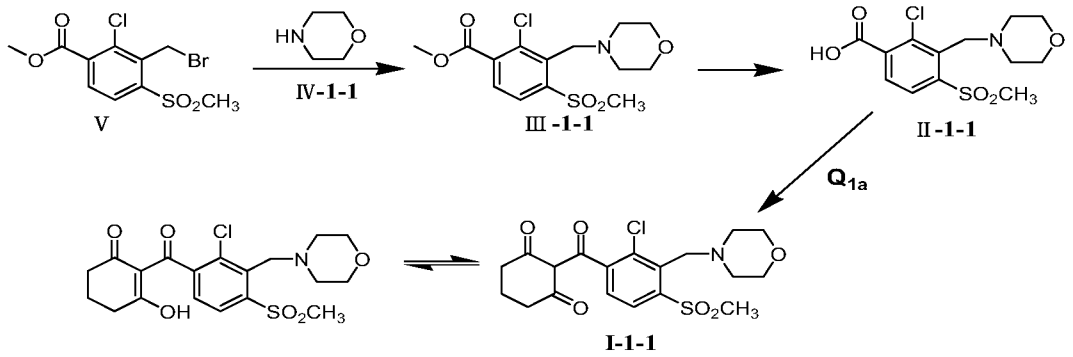
可以采用本领域的技术人员公知的施药方式施用含有本发明通式 **I** 化合物作为活性组分的组合物，达到控制杂草的目的。

具体实施方式

以下具体实施例用来进一步说明本发明，但本发明绝非限于这些例子。（除另有注明外，所用原料均有市售）

合成实施例

实施例 1　化合物 **I-1-1** 的制备

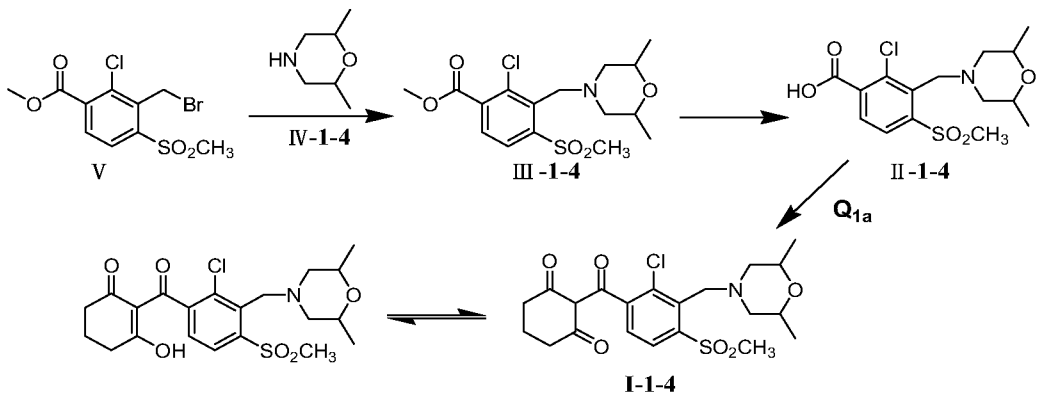


吗啉Ⅳ-**1-1** 0.28g（3.22mmol）和碳酸钾 0.44g（3.22mmol）于反应瓶中，加 20mL 乙腈搅拌 20min，加入中间体Ⅴ 1.0g（2.93mmol，按照专利 US6376429 中的方法自制），室温下反应 5h，TLC 监测反应完毕，过滤，滤液减压脱溶，柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚（沸程 60-90°C），体积比为 1:3)纯化得中间体Ⅲ-**1-1**，白色固体 0.78g，熔点 118-120°C。^{1}H-NMR (300MHz，内标 TMS，溶剂 $CDCl_3$) δ(ppm): 2.64 (t, 4H), 3.58 (s, 3H), 3.65 (t, 4H), 3.98 (s, 3H), 4.33 (s, 2H), 7.71 (d, 1H), 8.16 (d, 1H)。

将中间体Ⅲ-**1-1** 0.5g（1.44mmol）溶于 10mL 甲醇中，加入 0.12g（3mmol）氢氧化钠的 5mL 水溶液，室温搅拌 3h，TLC 监测无原料剩余，用盐酸调至中性，减压脱溶、干燥、得中间体Ⅱ-**1-1** 粗产物，不必提纯，直接用于下一步反应。

向上述中间体Ⅱ-**1-1** 粗产物中加入 1,3-环己二酮 Q_{1a} 0.16g（1.44mmol）和 20mL 乙腈，搅拌下加入 DCC 0.37 g（1.8mmol），室温下反应 10h，然后加入三乙胺 0.29g（2.88mmol）和两滴丙酮氰醇，继续室温下反应 3h，过滤，滤液减压脱溶，残留物中加入 10mL 水和 0.5g 盐酸，乙酸乙酯萃取 3 次，水相用氢氧化钠调至中性，乙酸乙酯萃取，有机相干燥、脱溶，得黄色粘稠物，加石油醚研磨出现固体，过滤得化合物 **I-1-1**，黄色固体 0.23g。^{1}H-NMR (300MHz，内标 TMS，溶剂 $CDCl_3$) δ(ppm): 2.07 (m, 2H), 2.43 (t, 2H), 2.64 (t, 4H), 2.82 (t, 2H), 3.59 (s, 3H), 3.66 (t, 4H), 4.28 (s, 2H)，7.23 (d, 1H), 8.15 (d, 1H)。

实施例 2　化合物 **I-1-4** 的制备

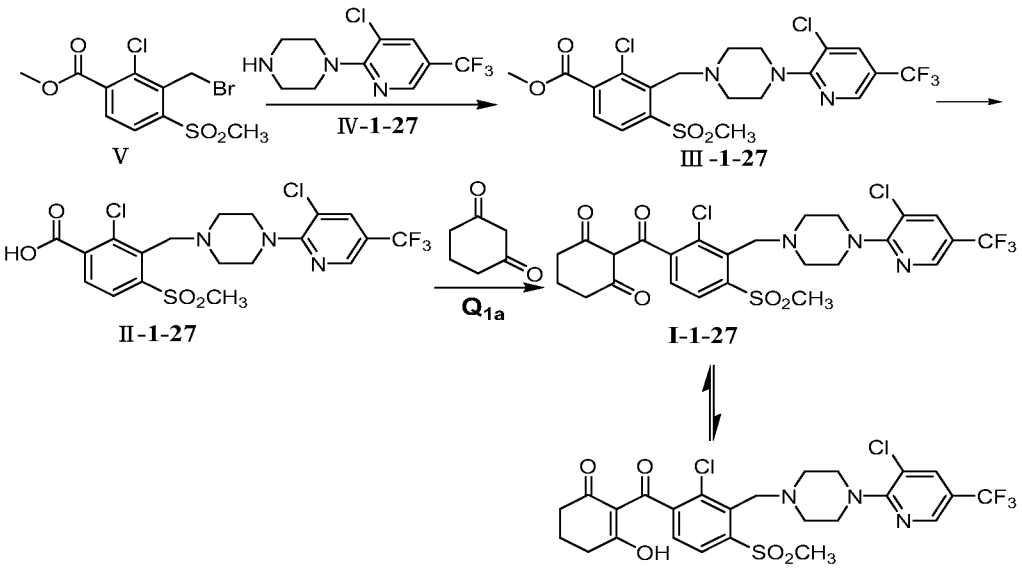


按照实施例 1 所述的方法，由中间体Ⅳ-**1-4** 0.92g（8.0mmol）和中间体Ⅴ 2.5g（7.31mmol）制得中间体Ⅲ-**1-4**，无色油状物 2.3g。^{1}H-NMR (300MHz，内标 TMS，溶剂 $CDCl_3$) δ(ppm): 1.16(d, 6H), 2.02-2.15 (m, 2H), 2.73-2.77 (m, 2H), 3.52-3.58 (m, 5H), 3.98 (s, 3H), 4.29 (s, 2H), 7.72 (d, 1H), 8.16 (d, 1H)。

按照实施例 1 所述方法，由中间体Ⅲ-**1-4** 1.0g（2.66mmol）水解后得到的酸Ⅱ-**1-4** 与 1,3-

环已二酮 0.3g（2.66mmol）反应，制得化合物 **I-1-4**，无色油状物 0.64g。^{1}H-NMR (300MHz，内标 TMS，溶剂 $CDCl_3$) δ(ppm): 1.17(d, 6H), 1.96-2.10 (m, 4H), 2.41-2.43 (m, 2H), 2.80-2.84 (m, 4H), 3.53-3.57 (m, 5H), 4.25 (s, 2H)，7.25 (d, 1H), 8.16 (d, 1H)，16.78 (s, 1H)。

实施例 3　化合物 **I-1-27** 的制备

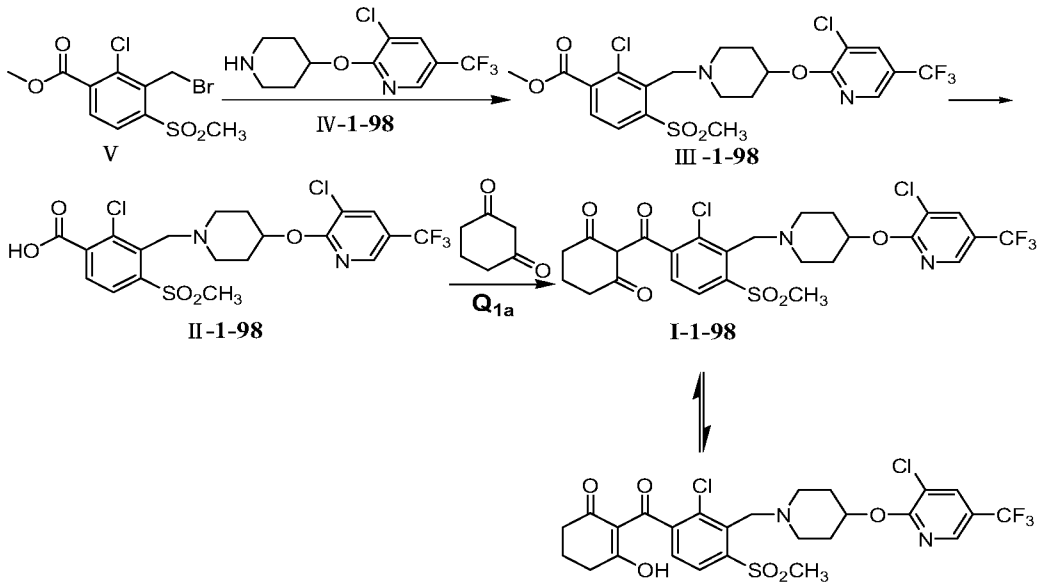


中间体**Ⅳ-1-27** 可以用哌嗪和 2,3-二氯-5-三氟甲基吡啶采用专利 EP370560 的方法制备。

按照实施例 1 所述方法，中间体**Ⅳ-1-27** 0.78g（2.93mmol）与中间体V 1.0g（2.93mmol）反应制得中间体**Ⅲ-1-27**，白色固体 1.3g，熔点 131-133°C。^{1}H-NMR (300MHz，内标 TMS，溶剂 $CDCl_3$) δ(ppm): 2.80 (t, 4H), 3.44 (t, 4H), 3.58 (s, 3H), 3.99 (s, 3H), 4.40 (s, 2H), 7.73 (d, 1H), 7.77 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.38 (s, 1H)。

按照实施例 1 所述方法，将中间体**Ⅲ-1-27** 0.5g（0.95mmol）水解后得到的酸**Ⅱ-1-27** 与 1,3-环已二酮 0.11g（0.95mmol）反应制得化合物 **I-1-27**，黄色固体 0.11g。^{1}H-NMR (300MHz，内标 TMS，溶剂 $CDCl_3$) δ(ppm): 2.08 (m, 2H), 2.45 (t, 2H), 2.86 (m, 6H), 3.44 (t, 4H), 3.52 (s, 3H), 4.41 (s, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.76 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.38 (s, 1H)。

实施例 4　化合物 **I-1-98** 的制备



中间体**Ⅳ-1-98** 可以参照专利 WO2005095362 中介绍的方法用 4-羟基哌啶和 2,3-二氯-5-三氟甲基吡啶进行制备。

按照实施例 1 所述方法，中间体Ⅳ-**1-98** 1.23g（4.38mmol）与中间体Ⅴ 1.5g（4.38mmol）反应制得中间体Ⅲ-**1-98**，白色固体 1.32g，熔点 140-142°C。^{1}H-NMR (300MHz，内标 TMS，溶剂 $CDCl_3$) δ(ppm): 1.75-1.83 (m, 2H), 1.95-2.05 (bs, 2H), 2.54-2.60 (m, 2H), 2.88-2.95 (m, 2H), 3.61 (s, 3H), 3.98 (s, 3H), 4.35 (s, 2H), 5.18-5.25 (m, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 8.17 (d, 1H), 8.29 (s, 1H)。

按照实施例 1 所述方法，中间体Ⅲ-**1-98** 0.58g（1.07mmol）水解后得到的酸Ⅱ-**1-98** 与 1,3-环已二酮 0.11g（1.07mmol）反应制得化合物 **I-1-98**，白色固体 0.10g。^{1}H-NMR (300MHz，内标 TMS，溶剂 $CDCl_3$) δ(ppm): 1.78-1.92 (bs, 2H), 2.00-2.10 (m, 2H), 2.39-2.45 (m, 2H), 2.59-2.70 (bs, 2H), 2.78-2.85 (m, 2H), 2.90-3.15 (bs, 2H), 3.60 (s, 3H), 4.35 (s, 2H), 5.25 (s, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.3 (d, 1H), 8.15 (d, 1H), 8.29 (s, 1H)。

制剂实施例

配方中活性组分折百后计量加入，所有百分含量均为重量百分含量。

实施例 5　35%乳油

化合物 **I-1-1**	35%
亚磷酸	10%
乙氧基化甘油三酸酯	15%
环已酮	补足至 100%

将亚磷酸溶解在环已酮中，再加入化合物 **I-1-1** 和乙氧基化甘油三酸酯，得到透明的溶液。

实施例 6　60%可湿性粉剂

化合物 **I-1-4**	60%
十二烷基萘磺酸钠	2%
木质素磺酸钠	9%
高岭土	补足至 100%

将化合物 **I-1-4**、十二烷基萘磺酸钠、木质素磺酸钠及高岭土（均为固体）混合在一起，在粉碎机中粉碎，直到颗粒达到标准。

实施例 7　30%含水悬浮液

化合物 **I-1-1**	30%
十二烷基萘磺酸钠	4%
半纤维素	2%
环氧丙烷	8%
水	补足至 100%

将化合物 **I-1-1** 与应加水量的 80%及十二烷基萘磺酸钠在球磨机中（1mm 珠）中一起粉碎。半纤维素和环氧丙烷溶解在其余 20%的水中，然后搅拌加入上述组分。

实施例 8　40%悬浮剂

化合物 **I-1-27**	40%
乙二醇	10%
壬基苯酚聚乙二醇醚	6%
木质素磺酸钠	10%
羧甲基纤维素	1%
37%甲醛水溶液	0.2%
75%硅油水乳液	0.8%
水	补足至 100%

将化合物 **I-1-27** 及其他组分充分混合，由此得到的悬浮剂，用水稀释所得悬浮剂可得到任何所需浓度的稀释液。

生物活性测定

实施例 9　室内除草活性测定

待测化合物原药用少量丙酮溶解，再用含有0.1%吐温80的水稀释至所需的浓度。将定量的杂草种子分别播于直径为7cm的装有营养土的纸杯中，播后覆土1cm，镇压、淋水后在温室培养，出苗后间苗、定植（禾本科杂草10-20株/杯，阔叶杂草2-4株/杯），待禾本科杂草2-3叶期，阔叶杂草长至2-4真叶期，按试验设计剂量用履带式作物喷雾机（英国Engineer Research Ltd. 设计生产）进行茎叶喷雾处理（喷雾压力1.95kg/cm^2，喷液量50mL/m^2，履带速度1.48km/h）。试验设3次重复。待药液自然风干后，置于温室内按常规方法管理，定期观察试材的生长发育情况，并根据实际情况，于处理后定期目测调查供试药剂对杂草的防除效果。防除效果分级标准：0为无效，100%为将杂草完全杀死或严重抑制。

部分化合物的活性数据见表7—表11。

部分化合物对马唐的活性数据见表 7。

表 7

供试药剂	剂量(g a.i./ha)	对马唐防效（%）
化合物 **I-1-1**	40	100
	20	100
	10	90
化合物 **I-1-27**	40	80
	20	80
	10	75

化合物 **I-1-1** 与对照药剂磺草酮（15%水剂，沈阳科创化学品有限公司生产，下同）的活性数据见表 8。

表 8

供试药剂	剂量（g a.i./ha）	防效（%）			
		稗草	狗尾草	苘麻	百日草
化合物 **I-1-1**	300	75	98	90	100
	150	70	90	70	100
	75	60	65	55	100
	37.5	35	30	45	95
磺草酮	300	60	30	100	100
	150	50	20	98	100
	75	30	15	95	100
	37.5	10	10	60	95

化合物 I-1-1 与对照药剂甲基磺草酮（95%原药，自制，下同）的活性数据见表 9。

表 9

供试药剂	剂量 (g a.i./ha)	防效（%）				
		稗草	反枝苋	马齿苋	鸭跖草	龙葵
化合物 I-1-1	150	95	55	5	80	100
	120	90	55	5	70	100
	90	80	50	0	55	100
	60	75	35	0	55	100
	30	60	25	0	50	100
	15	15	20	0	45	95
甲基磺草酮	150	95	85	5	85	100
	120	90	50	0	70	100
	90	65	50	0	70	100
	60	65	45	0	65	100
	30	45	20	0	60	100
	15	20	20	0	60	98

化合物 I-1-1 对藜、苍耳、鳢肠的活性数据见表 10。

表 10

供试杂草	防效（%）				
	15(g a.i./ha)	30(g a.i./ha)	60(g a.i./ha)	90(g a.i./ha)	120(g a.i./ha)
藜	30	30	50	60	70
苍　耳	40	70	75	85	95
鳢　肠	20	25	40	50	70

部分化合物与对照化合物 A 和 B 对稗草和金色狗尾草的活性数据见表 11。

表 11

供试药剂	剂量 (g a.i./ha)	防效（%）	
		稗草	金色狗尾草
化合物 I-1-1	300	100	95
	150	100	75
	75	75	35
化合物 I-1-4	300	95	55
	150	95	45
	75	70	25
对照 A	300	35	45
	150	25	40
	75	5	20
对照 B	300	20	30
	150	10	30
	75	10	30

实施例10　室内安全性测定

待测化合物原药用少量丙酮溶解，再用含有0.1%吐温80的水稀释至所需的浓度。将定量的玉米、水稻、小麦、大豆和棉花的种子分别播于直径为7cm的装有营养土的纸杯中，播后覆土1 cm，镇压、淋水后在温室培养，出苗后间苗、定植（1-2株/杯），待生长到2-4叶期，按试验设计剂量用履带式作物喷雾机（英国Engineer Research Ltd.设计生产）进行茎叶喷雾处理（喷雾压力1.95kg/cm^2，喷液量50 mL/m^2，履带速度1.48km/h），试验设3次重复。待药液自然风干后，放于温室内按常规方法管理，观察作物生长发育情况，定期目测调查供试药剂对作物的安全性。安全性分级标准：0表示对作物无任何损伤，100%为将作物完全杀死或严重抑制，化合物**I-1-1**与对照化合物磺草酮的对比试验结果见表12，化合物**I-1-1**与对照化合物甲基磺草酮的对比试验结果见表13。

表 12

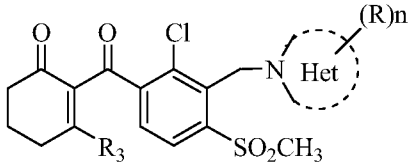
供试药剂	剂量(ga.i./ha)	安全性（%）	
		玉米（苗后）	水稻（直播）
化合物 **I-1-1**	300	5	85
	150	2	75
	75	0	55
	37.5	0	30
	18.8	0	15
磺草酮	300	5	60
	150	0	45
	75	0	25
	37.5	0	10
	18.8	0	5

表 13

供试药剂	剂量 (g a.i./ha)	安全性（%）			
		玉米	小麦	大豆	棉花
化合物 **I-1-1**	240	5	60	80	35
	180	2	55	75	30
	150	2	45	75	25
	120	0	35	65	25
	90	0	30	55	20
	60	0	15	45	20
甲基磺草酮	240	5	80	80	80
	180	2	65	75	70
	150	0	65	55	65
	120	0	55	50	60
	90	0	55	45	45
	60	0	20	40	15

权 利 要 求 书

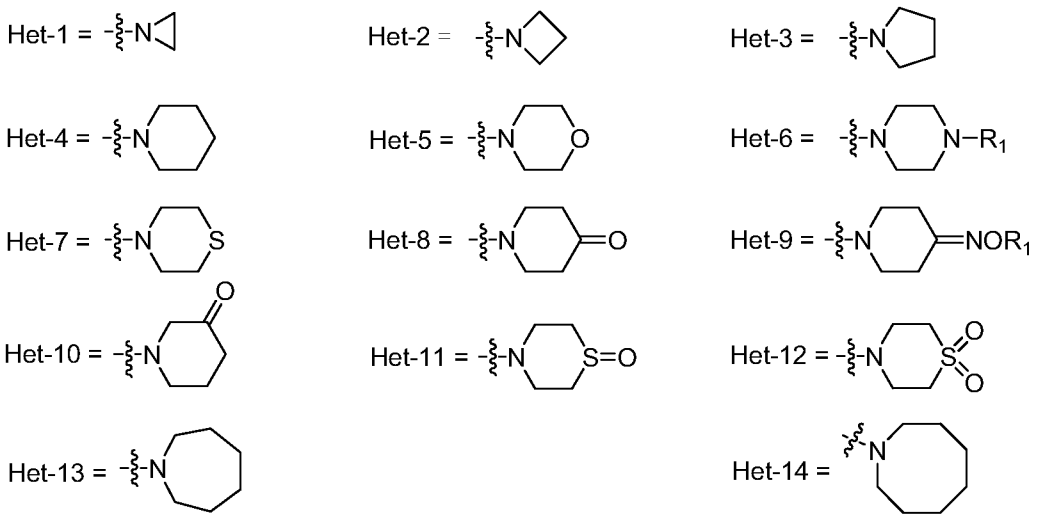
1、一种含氮杂环取代的苯甲酰基类化合物或其立体异构体，如通式 **I-1** 所示：



I-1

式中：

Het 选自 Het-1 至 Het-14 所示的基团之一：



；

R 选自氟、氯、溴、氰基、羟基、羧基、氨基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷氨基、C_2-C_4 烯氧基、卤代 C_2-C_4 烯氧基、C_2-C_4 烯氨基、卤代 C_2-C_4 烯氨基、C_1-C_3 烷基羰基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基、C_1-C_3 烷氧基羰基、C_1-C_3 烷氨基羰基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷基羰基氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷氧基羰基 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷基羰基氧基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基氧基、C_1-C_3 烷基羰基氨基、C_1-C_3 烷基磺酰基氧基、C_1-C_3 烷基磺酰基氨基、C_1-C_3 烷基羰基 C_1-C_3 烷氧基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯基、吡啶基、苯氧基、吡啶基氧基、苯甲酰基氧基、苯磺酰基氧基、苄氧基、吡啶基甲基氧基、苯甲酰基氨基、苯磺酰基氨基、苄基氨基或吡啶基甲基氨基：氟、氯、溴、硝基、氰基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 烷基羰基；n=0-4；

R_1 选自氢、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_2-C_4 烯基、卤代 C_2-C_4 烯基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷基羰基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基、C_1-C_3 烷基磺酰基、C_1-C_3 烷氧基羰基、C_1-C_3 烷氨基羰基、C_1-C_3 烷基羰基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基羰基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氨基羰基 C_1-C_3 烷基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯基、吡啶基、苯甲酰基、吡啶甲酰基、苯磺酰基、苄基或吡啶甲基：氟、氯、溴、硝基、氰基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 烷基羰基；

R_3 选自羟基、氯、溴、C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷基羰基氧基、C_1-C_3 烷硫基、C_1-C_3 烷基磺酰基氧基、C_1-C_3 烷氧基羰基 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷氨基羰基 C_1-C_3 烷氧基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯氧基、苯硫基、苄基氧基、苯甲酰基氧基、苯磺酰基氧基、吡啶氧基或苯甲酰基甲基氧基：氟、氯、溴、硝基、氰基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3

烷氧基或卤代 C_1-C_3 烷氧基；

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

2、根据权利要求 1 所述的化合物，其特征在于：通式 **I-1** 中

Het 选自 Het-4 至 Het-8 所示的基团之一；

R 选自氟、氯、溴、氰基、羟基、羧基、氨基、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷氨基、C_1-C_3 烷氧基羰基、C_1-C_3 烷氨基羰基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷基羰基氧基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基氧基、C_1-C_3 烷基羰基氨基、C_1-C_3 烷基磺酰基氧基、C_1-C_3 烷基磺酰基氨基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯氧基或吡啶基氧基：氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基或甲酰基；n=0-4；

R_1 选自氢、C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、C_1-C_3 烷基羰基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基、C_1-C_3 烷基磺酰基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯基或吡啶基：氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基或甲酰基；

R_3 选自羟基、氯、溴、C_1-C_3 烷氧基、C_1-C_3 烷基羰基氧基、C_1-C_3 烷硫基、C_1-C_3 烷基磺酰基氧基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团取代的苯氧基或苯硫基：氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基或三氟甲氧基；

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

3、根据权利要求 2 所述的化合物，其特征在于：通式 **I-1** 中

Het 选自 Het-4 至 Het-6 所示的基团之一；

R 选自氟、氯、溴、氰基、甲基、甲氧基、甲氨基、甲氧基羰基、甲氨基羰基、乙酰基氧基、乙酰基氨基、苯氧基、吡啶基氧基、2-氯-4-三氟甲基苯基氧基或 3-氯-5-三氟甲基-吡啶-2-基氧基，n=0-2；

R_1 选自甲基、乙酰基、苯基、吡啶基、2-氯-4-三氟甲基苯基或 3-氯-5-三氟甲基-吡啶-2-基；

R_3 选自羟基；

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

4、根据权利要求 3 所述的化合物，其特征在于：通式 **I-1** 中

Het 选自 Het-4 至 Het-6 所示的基团之一；

R 选自甲基或 3-氯-5-三氟甲基-吡啶-2-基氧基，n=0-2；

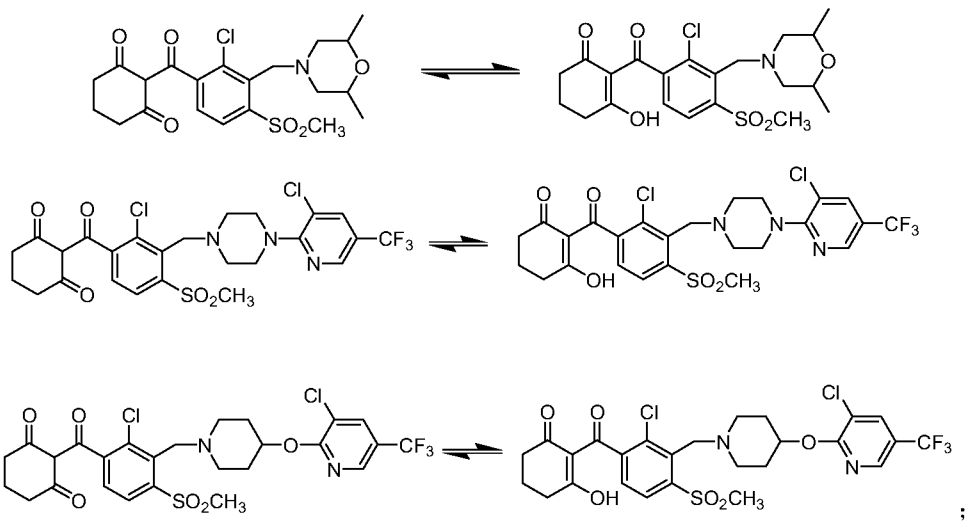
R_1 选自 3-氯-5-三氟甲基-吡啶-2-基；

R_3 选自羟基；

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

5、根据权利要求 4 所述的化合物，其特征在于：化合物的具体结构为





;

或其钠盐、钾盐、盐酸盐、磷酸盐、甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、草酸盐、苯磺酸盐、柠檬酸盐或苹果酸盐。

6、一种根据权利要求 1 所述的通式 **I** 化合物用于控制杂草的用途。

7、一种根据权利要求 6 所述的用途，其特征在于：用于控制玉米田杂草的用途。

8、一种除草组合物，其特征在于：含有权利要求 1 所述的通式 **I** 化合物作为活性组分，组合物中的活性组分的重量百分含量为 0.1-99%。

9、一种根据权利要求 8 所述的除草组合物用于控制杂草的用途。

10、一种根据权利要求 9 所述的用途，其特征在于：用于控制玉米田杂草的用途。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/CN2011/082436

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

See the extra sheet

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC: C07D A01N A01P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

Database: WPI, EPODOC, CPRS, CNKI, REGISTRY, CAPLUS, MARPAT
Search terms: herbicid+, weedicid+, benzoyl

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CN1416422A(BAYER AG et al.) 07 May 2003(07.05.2003), the whole document, especially the claims, page 69, line 12-page 70, line 2, page 71, lines 1-4, 30-31, page 98, lines 29-31 of the description, example 8	1-10
X	CN1323292A(AVENTIS CROPSCIENCE GMBH) 21 Nov. 2001(21.11.2001), the whole document, especially the claims, page 28, page 31, lines 19-21, page 34, lines 12-13 of the description	1-10
X	CN1466582A(BAYER CROPSCIENCE AG) 07 Jan. 2004(07.01.2004), the whole document, especially the claims, page 20, line 8-page 24, line 30, page 38, lines 1-3, 18-19 of the description	1-10
X	CN1630643A(BAYER AG) 22 Jun. 2005(22.06.2005), the whole document, especially the claims, page 11, line 32-page 14, line 21 of the description	1-10

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&"document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
08 Dec. 2011(08.12.2011)	23 Feb. 2012(23.02.2012)

Name and mailing address of the ISA
State Intellectual Property Office of the P. R. China
No. 6, Xitucheng Road, Jimenqiao
Haidian District, Beijing 100088, China
Facsimile No. (86-10)62019451

Authorized officer
LI, Xueying
Telephone No. (86-10)62084376

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2011/082436

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
CN1416422 A	07.05.2003	DE10028687A1	13.09.2001
		WO0166527A1	13.09.2001
		AU5825501A	17.09.2001
		EP1263738A1	11.12.2002
		KR20020079876A	19.10.2002
		BR0109054A	03.06.2003
		JP2003525929A	02.09.2003
		US2004002599A1	01.01.2004
		MXPA02008696A	01.04.2003
		INMUM200100194A	04.03.2005
		US6969697B2	29.11.2005
		MX236988B	18.05.2006
		CN1268615C	09.08.2006
		AU2001258255B2	24.08.2006
		EP1263738B1	27.06.2007
		DE50112662G	09.08.2007
		KR100730004 B1	20.06.2007
		IN208422B	31.08.2007
CN1323292 A	21.11.2001	DE19846792A1	13.04.2000
		WO0021924A1	20.04.2000
		AU5861699A	01.05.2000
		EP1117639A1	25.07.2001
		BR9914390A	07.08.2001
		CZ20011292A3	12.09.2001
		SK4722001A3	03.12.2001
		ZA200102862A	30.01.2002
		KR20010085908A	07.09.2001
		HU0103959A2	28.02.2002
		US6376429B1	23.04.2002
		MXPA01003652A	01.07.2001
		JP2002527418A	27.08.2002
		AU759279B	10.04.2003
		RU2237660C2	10.10.2004
		MX219760B	07.04.2004

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2011/082436

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
CN1323292 A	21.11.2001	EP1117639B1	15.12.2004
		DE59911289G	20.01.2005
		ES2235511T3	01.07.2005
		INCHENP200100489E	04.03.2005
		PH1199902547B1	11.02.2004
		IL142417A	11.06.2006
		CN1269800C	16.08.2006
		TW253445B1	21.04.2006
		KR100687993B1	27.02.2007
		CA2346796C	27.01.2009
		IN213045B	28.03.2008
		SK286797B6	07.05.2009
		CZ301408B6	17.02.2010
		BR9914390B1	19.10.2010
CN1466582A	07.01.2004	DE10037149A1	07.02.2002
		WO0210155A1	07.02.2002
		AU8198501A	13.02.2002
		BR0112844A	22.04.2003
		EP1322639A1	02.07.2003
		KR20030039362A	17.05.2003
		JP2004505076A	19.02.2004
		US2004097376A1	20.05.2004
		MXPA03000773A	01.12.2004
		INMUM200100675A	04.03.2005
CN1630643 A	22.06.2005	DE19962923A1	05.07.2001
		WO0147894A1	05.07.2001
		AU3157601A	09.07.2001
		EP1244634A1	02.10.2002
		BR0017044A	07.01.2003
		KR20020065903A	14.08.2002
		US2003119674A1	26.06.2003
		JP2003527351A	16.09.2003
		MXPA02006244A	01.01.2003
		EP1244634B1	17.03.2004
		DE50005743G	22.04.2004

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2011/082436

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
CN1630643 A	22.06.2005	ES2214344T3	16.09.2004
		US6825183B2	30.11.2004
		US2005054534A1	10.03.2005
		INMUM200001142A	04.03.2005
		MX224641B	03.12.2004
		US7244692B2	17.07.2007

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/CN2011/082436

CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D295/03 (2006.01)i
C07D295/116 (2006.01)i
C07D295/12 (2006.01)i
C07D241/04 (2006.01)i
C07D241/06 (2006.01)i
A01N43/36 (2006.01)i
A01N43/40 (2006.01)i
A01N43/44 (2006.01)i
A01N43/46 (2006.01)i
A01N43/60 (2006.01)i
A01N43/84 (2006.01)i
A01P13/00 (2006.01)i

国际检索报告

国际申请号
PCT/CN2011/082436

A. 主题的分类

参见附加页

按照国际专利分类(IPC)或者同时按照国家分类和 IPC 两种分类

B. 检索领域

检索的最低限度文献(标明分类系统和分类号)

IPC: C07D A01N A01P

包含在检索领域中的除最低限度文献以外的检索文献

在国际检索时查阅的电子数据库(数据库的名称，和使用的检索词（如使用）)

数据库：WPI, EPODOC, CPRS, CNKI, REGISTRY, CAPLUS, MARPAT

检索词：除草，苯甲酰，herbicid+, weedicid+, benzoyl

C. 相关文件

类　型*	引用文件，必要时，指明相关段落	相关的权利要求
X	CN1416422A（拜尔公司等）07.5 月 2003（07.05.2003），全文，尤其是权利要求书、说明书第 69 页第 12 行-第 70 页第 2 行、第 71 页第 1-4 行、30-31 行、第 98 页 29-31 行、实施例 8	1-10
X	CN1323292A（阿温提斯作物科学有限公司）21.11 月 2001（21.11.2001），全文，尤其是权利要求书、说明书第 28 页、第 31 页第 19-21 行、第 34 页第 12-13 行	1-10
X	CN1466582A（拜尔农作物科学股份公司）07.1 月 2004（07.01.2004），全文，尤其是权利要求书、说明书第 20 页第 8 行-第 24 页第 30 行、说明书第 38 页第 1-3、18-19 行	1-10
X	CN1630643A（拜尔公司）22.6 月 2005（22.06.2005），全文，尤其是权利要求书、说明书第 11 页第 32 行-第 14 页 21 行	1-10

☐ 其余文件在 C 栏的续页中列出。　　☒ 见同族专利附件。

* 引用文件的具体类型：

"A" 认为不特别相关的表示了现有技术一般状态的文件

"E" 在国际申请日的当天或之后公布的在先申请或专利

"L" 可能对优先权要求构成怀疑的文件，或为确定另一篇引用文件的公布日而引用的或者因其他特殊理由而引用的文件（如具体说明的）

"O" 涉及口头公开、使用、展览或其他方式公开的文件

"P" 公布日先于国际申请日但迟于所要求的优先权日的文件

"T" 在申请日或优先权日之后公布，与申请不相抵触，但为了理解发明之理论或原理的在后文件

"X" 特别相关的文件，单独考虑该文件，认定要求保护的发明不是新颖的或不具有创造性

"Y" 特别相关的文件，当该文件与另一篇或者多篇该类文件结合并且这种结合对于本领域技术人员为显而易见时，要求保护的发明不具有创造性

"&" 同族专利的文件

国际检索实际完成的日期	国际检索报告邮寄日期
08.12 月 2011(08.12.2011)	**23.2 月 2012 (23.02.2012)**
ISA/CN 的名称和邮寄地址： 中华人民共和国国家知识产权局 中国北京市海淀区蓟门桥西土城路 6 号 100088 传真号：　(86-10)62019451	受权官员 李雪莹 电话号码：(86-10) **62084376**

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号
PCT/CN2011/082436

检索报告中引用的专利文件	公布日期	同族专利	公布日期
CN1416422 A	07.05.2003	DE10028687A1	13.09.2001
		WO0166527A1	13.09.2001
		AU5825501A	17.09.2001
		EP1263738A1	11.12.2002
		KR20020079876A	19.10.2002
		BR0109054A	03.06.2003
		JP2003525929A	02.09.2003
		US2004002599A1	01.01.2004
		MXPA02008696A	01.04.2003
		INMUM200100194A	04.03.2005
		US6969697B2	29.11.2005
		MX236988B	18.05.2006
		CN1268615C	09.08.2006
		AU2001258255B2	24.08.2006
		EP1263738B1	27.06.2007
		DE50112662G	09.08.2007
		KR100730004 B1	20.06.2007
		IN208422B	31.08.2007
CN1323292 A	21.11.2001	DE19846792A1	13.04.2000
		WO0021924A1	20.04.2000
		AU5861699A	01.05.2000
		EP1117639A1	25.07.2001
		BR9914390A	07.08.2001
		CZ20011292A3	12.09.2001
		SK4722001A3	03.12.2001
		ZA200102862A	30.01.2002
		KR20010085908A	07.09.2001
		HU0103959A2	28.02.2002
		US6376429B1	23.04.2002
		MXPA01003652A	01.07.2001
		JP2002527418A	27.08.2002
		AU759279B	10.04.2003
		RU2237660C2	10.10.2004
		MX219760B	07.04.2004
		EP1117639B1	15.12.2004
		DE59911289G	20.01.2005
		ES2235511T3	01.07.2005

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号
PCT/CN2011/082436

检索报告中引用的专利文件	公布日期	同族专利	公布日期
CN1323292 A	21.11.2001	INCHENP200100489E	04.03.2005
		PH1199902547B1	11.02.2004
		IL142417A	11.06.2006
		CN1269800C	16.08.2006
		TW253445B1	21.04.2006
		KR100687993B1	27.02.2007
		CA2346796C	27.01.2009
		IN213045B	28.03.2008
		SK286797B6	07.05.2009
		CZ301408B6	17.02.2010
		BR9914390B1	19.10.2010
CN1466582A	07.01.2004	DE10037149A1	07.02.2002
		WO0210155A1	07.02.2002
		AU8198501A	13.02.2002
		BR0112844A	22.04.2003
		EP1322639A1	02.07.2003
		KR20030039362A	17.05.2003
		JP2004505076A	19.02.2004
		US2004097376A1	20.05.2004
		MXPA03000773A	01.12.2004
		INMUM200100675A	04.03.2005
CN1630643 A	22.06.2005	DE19962923A1	05.07.2001
		WO0147894A1	05.07.2001
		AU3157601A	09.07.2001
		EP1244634A1	02.10.2002
		BR0017044A	07.01.2003
		KR20020065903A	14.08.2002
		US2003119674A1	26.06.2003
		JP2003527351A	16.09.2003
		MXPA02006244A	01.01.2003
		EP1244634B1	17.03.2004
		DE50005743G	22.04.2004
		ES2214344T3	16.09.2004
		US6825183B2	30.11.2004
		US2005054534A1	10.03.2005
		INMUM200001142A	04.03.2005
		MX224641B	03.12.2004
		US7244692B2	17.07.2007

主题的分类

C07D295/03 (2006.01)i

C07D295/116 (2006.01)i

C07D295/12 (2006.01)i

C07D241/04 (2006.01)i

C07D241/06 (2006.01)i

A01N43/36 (2006.01)i

A01N43/40 (2006.01)i

A01N43/44 (2006.01)i

A01N43/46 (2006.01)i

A01N43/60 (2006.01)i

A01N43/84 (2006.01)i

A01P13/00 (2006.01)i