



[12] 发明专利申请公开说明书

[21]申请号 95105092.3

[51]Int.Cl⁶

C07C251 / 58

[43]公开日 1996 年 1 月 10 日

[22]申请日 95.5.5

[30]优先权

[32]94.5.5 [33]DE[31]P4415871.8

[71]申请人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72]发明人 U·米利茨 A·哈罗伊斯

H·科尼格 H·沃尔特

K-O·韦斯特伦 M·格伯

[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 侯天军

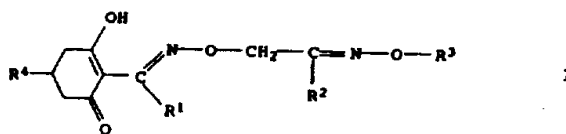
A01N 35 / 10

权利要求书 4 页 说明书 81 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 O-(脞基)乙基环己烯酮脞醚及其作为除草剂的用途

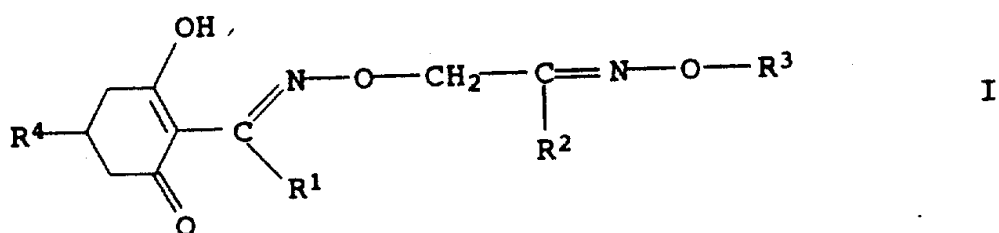
[57]摘要

本发明公开了式 I 所示 O-(脞基)乙基环己烯酮脞醚及它们的可农用盐和酯, 它们可有效地用作除草剂。式中各基团定义详见说明书。



权 利 要 求 书

1. 式 I 所示 O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚以及它们的可农用盐和它们与 C₁—C₁₀ 羧酸或无机酸形成的可农用酯



式中：

R¹ 为 C₁—C₆ 烷基；

R² 为 C₁—C₆ 烷基；

R³ 为：苯基，该苯基可以是未取代的，或者带有 1—3 个选自硝基、氰基、卤原子、C₁—C₄ 烷基和 C₁—C₄ 卤烷基的取代基；C₁—C₄ 烷基，C₃—C₄ 链烯基或 C₃—C₄ 链炔基，如需要，这些基团可带有 1 个选自卤原子、C₁—C₃ 烷基、苯基或苯氧基的取代基，如需要，该苯基可带有 1—3 个选自硝基、氰基、卤原子、C₁—C₄ 烷基、C₁—C₄ 卤烷基、苯基或苯氧基的取代基，该苯氧基可带有 1—3 个选自硝基、氰基、卤原子、C₁—C₄ 烷基或 C₁—C₄ 卤烷基的取代基；

R⁴ 表示：

- (C_1-C_4) 烷氧基— (C_1-C_6) 烷基或者 (C_1-C_4) 烷硫基— (C_1-C_6) 烷基;
- 苯硫基— (C_1-C_6) 烷基, 如需要, 苯环上可带有 1—3 个选自卤原子和 C_1-C_4 卤烷基的取代基;
- $N-(C_1-C_4)$ 烷磺酰基— $N-(C_1-C_4)$ 烷基) 氨基甲基;
- C_3-C_7 环烷基或 C_5-C_7 环烯基, 这些基团可以是未取代的, 或者带有 1—3 个选自羟基、卤原子、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基和 C_1-C_4 卤烷基的取代基;
- 含有 1 个或 2 个氧和/或硫杂原子的 5 元饱和杂环, 它可以是未取代的, 或者带有 1—3 个选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基和 C_1-C_4 卤烷基的取代基;
- 具有 1 个或 2 个非邻位氧和/或硫杂原子的 6 元或 7 元杂环, 它可以是饱和的或者单或双不饱和的, 杂环可以是未取代的, 或者带有 1—3 个选自羟基、卤原子、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基和 C_1-C_4 卤烷基的取代基;
- 含有 1 个或 2 个氮原子和 1 个氧原子或硫原子的 5 元杂芳环, 该杂芳环可以是未取代的, 或者带有 1—3 个选自卤原子、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 链烯基氧基和 (C_1-C_4) 烷氧基— (C_1-C_4) 烷基的取代基;
- 苯基或吡啶基, 这些基团可以是未取代的, 或者带有 1—3 个

选自卤原子、硝基、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 卤烷基、 C_3-C_6 链烯基氧基、 C_3-C_6 链炔基氧基和— NR^aR^b 的取代基，在式— NR^aR^b 中： R^a 为氢、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 链烯基或 C_3-C_6 链炔基， R^b 为氢、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_1-C_6 酰基或苯甲酰基，如需要，该苯甲酰基可带有1—3个选自硝基、氰基、卤原子、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基和 C_1-C_4 卤烷基的取代基。

2. 权利要求1的式I所示O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚和/或它们的可农用盐和/或它们与 C_1-C_{10} 羧酸或无机酸形成的酯作为除草剂的应用。

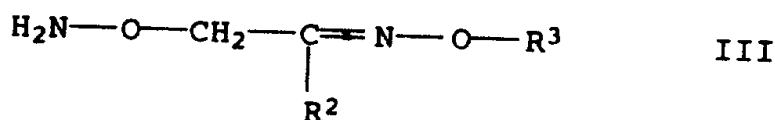
3. 一种除草剂组合物，它含有除草有效量的至少一种权利要求1的式I所示O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚和/或它们的可农用盐和/或它们与 C_1-C_{10} 羧酸或无机酸形成的酯以及至少一种液体和/或固体载体以及—如需要—至少一种助剂。

4. 可有效除草的组合物的制备方法，它包括将除草有效量的权利要求1的式I所示O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚和/或它们的可农用盐和/或它们与 C_1-C_{10} 羧酸或无机酸形成的酯与至少一种液体和/或固体载体和—如需要—至少一种助剂混合。

5. 控制不希望的植物生长的方法，它包括使除草有效量的权利要求1的式I所示O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚和/或它们的可农用盐和/或它们与 C_1-C_{10} 羧酸或无机酸形成的酯作用于植物上、它

们的生长环境中或种子上。

6. 式 III 所示 O—(肟基)乙基羟胺化合物及该化合物与无机酸形成的铵盐,



其中:

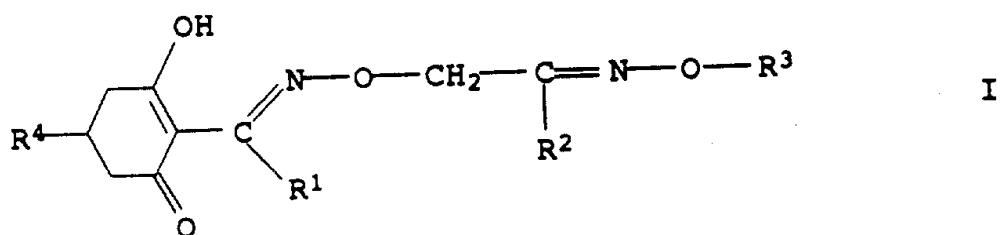
R^2 为 C_1-C_6 烷基;

R^3 为: 苯基, 它可以是未取代的, 或者带有 1—3 个选自硝基、氟基、卤原子、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤烷基的取代基; C_1-C_4 烷基, C_3-C_4 链烯基或 C_3-C_4 链炔基, 如需要, 这些基团可带有 1 个选自卤原子、 C_1-C_3 烷基、苯基或苯氧基的取代基, 该苯基可以是未取代的, 或者带有 1—3 个选自硝基、氟基、卤原子、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤烷基、苯基和苯氧基的取代基, 如需要, 该苯氧基可以带有 1—3 个选自硝基、氟基、卤原子、 C_1-C_4 烷基和 C_1-C_4 卤烷基的取代基。

说 明 书

O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚 及其作为除草剂的用途

本发明涉及式 I 所示新颖 O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚, 以及它们的可农用盐和它们与 C₁—C₁₀ 羧酸或无机酸形成的可农用酯



式中:

R¹ 为 C₁—C₆ 烷基;

R² 为 C₁—C₆ 烷基;

R³ 为: 苯基, 该苯基可以是未取代的, 或者带有 1—3 个选自硝基、氰基、卤原子、C₁—C₄ 烷基和 C₁—C₄ 卤烷基的取代基; C₁—C₄ 烷基, C₃—C₄ 链烯基或 C₃—C₄ 链炔基, 如需要, 这些基团可带有 1 个选自卤原子、C₁—C₃ 烷基、苯基或苯氧基的取代基, 如需要, 该苯基可带有 1—3 个选自硝基、氰基、卤原子、C₁—C₄ 烷基、C₁—C₄

卤烷基、苯基或苯氧基的取代基,该苯氧基可带有1—3个选自硝基、氟基、卤原子、 $C_1—C_4$ 烷基或 $C_1—C_4$ 卤烷基的取代基;

R^4 表示:

- ($C_1—C_4$)烷氧基—($C_1—C_6$)烷基或者($C_1—C_4$)烷硫基—($C_1—C_6$)烷基;

- 苯硫基—($C_1—C_6$)烷基,如需要,苯环上可带有1—3个选自卤原子和 $C_1—C_4$ 卤烷基的取代基;

- $N—(C_1—C_4$ 烷磺酰基)— $N—(C_1—C_4$ 烷基)氨基甲基;

- $C_3—C_7$ 环烷基或 $C_5—C_7$ 环烯基,这些基团可以是未取代的,或者带有1—3个选自羟基、卤原子、 $C_1—C_4$ 烷基、 $C_1—C_4$ 烷氧基、 $C_1—C_4$ 烷硫基和 $C_1—C_4$ 卤烷基的取代基;

- 含有1个或2个氧和/或硫杂原子的5元饱和杂环,它可以是未取代的,或者带有1—3个选自 $C_1—C_4$ 烷基、 $C_1—C_4$ 烷氧基、 $C_1—C_4$ 烷硫基和 $C_1—C_4$ 卤烷基的取代基;

- 具有1个或2个非邻位氧和/或硫杂原子的6元或7元杂环,它可以是饱和的或者单或双不饱和的,杂环可以是未取代的,或者带有1—3个选自羟基、卤原子、 $C_1—C_4$ 烷基、 $C_1—C_4$ 烷氧基、 $C_1—C_4$ 烷硫基和 $C_1—C_4$ 卤烷基的取代基;

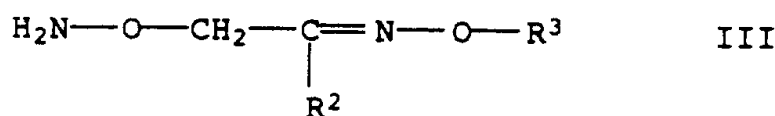
- 含有1个或2个氮原子和1个氧原子或硫原子的5元杂芳环,该杂芳环可以是未取代的,或者带有1—3个选自卤原子、氟基、 $C_1—C_4$ 烷基、 $C_1—C_4$ 烷氧基、 $C_1—C_4$ 烷硫基、 $C_1—C_4$ 卤烷基、 $C_2—$

C₆ 链烯基、C₂—C₆ 链烯基氧基和 (C₁—C₄) 烷氧基—(C₁—C₄) 烷基的取代基；

• 苯基或吡啶基，这些基团可以是未取代的，或者带有 1—3 个选自卤原子、硝基、氰基、C₁—C₄ 烷基、C₁—C₄ 烷氧基、C₁—C₄ 烷硫基、C₁—C₄ 卤烷基、C₃—C₆ 链烯基氧基、C₃—C₆ 链炔基氧基和—NR^aR^b 的取代基，在式—NR^aR^b 中：R^a 为氢、C₁—C₄ 烷基、C₃—C₆ 链烯基或 C₃—C₆ 链炔基，R^b 为氢、C₁—C₄ 烷基、C₃—C₆ 链烯基、C₃—C₆ 链炔基、C₁—C₆ 酰基或苯甲酰基，如需要，该苯甲酰基可带有 1—3 个选自硝基、氰基、卤原子、C₁—C₄ 烷基、C₁—C₄ 烷氧基、C₁—C₄ 烷硫基和 C₁—C₄ 卤烷基的取代基。

此外，本发明还涉及这些化合物作为除草剂的用途、含有这些化合物作活性物质的除草剂组合物、制备这些除草剂组合物的方法以及使用式 I 所示化合物控制不希望的植物生长的方法。

此外，本发明还涉及式 III 所示新颖 O—(脞基) 乙基羟胺类化合物以及它们与无机酸形成的式 III 所示化合物的铵盐，

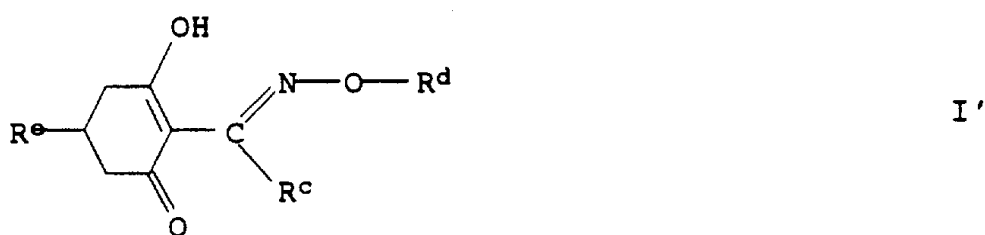


其中：

R² 为 C₁—C₆ 烷基；

R^3 为：苯基，它可以是未取代的，或者带有 1—3 个选自硝基、氟基、卤原子、 $C_1—C_4$ 烷基或 $C_1—C_4$ 卤烷基的取代基； $C_1—C_4$ 烷基， $C_3—C_4$ 链烯基或 $C_3—C_4$ 链炔基，如需要，这些基团可带有 1 个选自卤原子、 $C_1—C_3$ 烷基、苯基或苯氧基的取代基，该苯基可以是未取代的，或者带有 1—3 个选自硝基、氟基、卤原子、 $C_1—C_4$ 烷基、 $C_1—C_4$ 卤烷基、苯基和苯氧基的取代基，如需要，该苯氧基可以带有 1—3 个选自硝基、氟基、卤原子、 $C_1—C_4$ 烷基和 $C_1—C_4$ 卤烷基的取代基。

文献中公开了式 I' 所示可有效除草的环己烷二酮类化合物



式中， R^c 、 R^d 和 R^e 具有如下意义：

—US 4, 249, 937 中， R^c 为低级烷基， R^d 为烷基、链烯基， R^e 为 2—(4—氯苯硫基) 乙基；

—WO92/08696 中， R^c 为 $C_1—C_6$ 烷基， R^d 为苯甲基， R^e 为 N—甲磺酰基—N—甲基—氧甲基；

—WO93/10081 中， R^c 为 $C_1—C_6$ 烷基， R^d 为取代的 3—苯基丙烯基， R^e 为 $C_1—C_6$ 烷基；

—US 4, 440, 566 中, R^c 为 C_1-C_6 烷基, R^d 为苯甲基, R^e 为 2—乙硫基丙基;

—EP—A 238 021 和 EP—A 125 094 和, R^c 为 C_1-C_4 或 C_1-C_6 烷基, R^d 为苯甲基、丁—2—烯基, R^e 为取代的 5 元杂芳基;

—EP—A 80 301 中, R^c 为 C_1-C_6 烷基, R^d 为苯甲基、丁—2—烯基, R^e 为取代的苯基;

—DE—A 38 38 309 中, R^c 为 C_1-C_6 烷基, R^d 为取代的 4—苯基丁基或者 4—苯基丁烯基, R^e 为取代的 5—7 元杂环;

—EP—A 456 112 中, R^c 为 C_1-C_6 烷基, R^d 为取代的 3—苯氧基丙基或 2—苯氧基乙基, R^e 为取代的 5—7 元杂环;

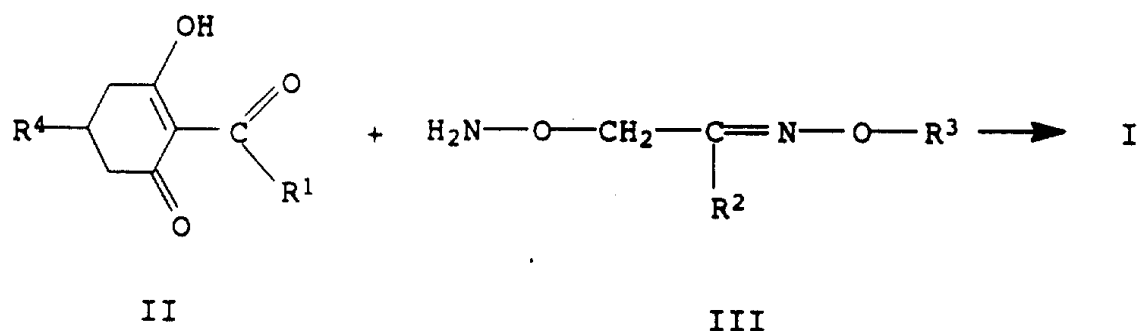
—WO/16, 063 中, R^c 为 C_1-C_6 烷基, R^d 为取代的 (苯亚甲基亚氨基氧基) 亚烷基, R^e 为取代的 5—7 元杂环。

由于这些已知化合物的除草性能、特别是它们在禾本科农作物中对莠草的选择性不总是完全令人满意, 因此本发明的目的是提供新颖的环己烯酮脞醚化合物, 与已知化合物相比, 它们可更好地专门控制诸如水稻和玉米的禾本科农作物中的莠草。

我们已经发现, 使用如上定义的式 I 所示 O—(脞基) 乙基环己烯酮脞醚、将它们用作除草剂、使用含有式 I 所示化合物的除草剂组合物可以达到上述目的, 还发明了这些组合物的制备方法以及使用式 I 所示化合物控制不希望的植物生长的方法。

式 I 所示 O—(脞基) 乙基环己烯酮脞醚可用各种方法制备, 优

选用已知的方法、由已公开的式 II 所示环己烯酮（例如参见 DE—A 38 38 309、EP—A 456 112、US 4, 249, 937 和 WO 92/08696）和式 III 所示的 O—（肟基）乙基羟胺制备：



优选使用式 III 所示羟胺的盐，特别是它的盐酸盐，该反应在惰性溶剂中异相进行，惰性溶剂例如有：二甲亚砜；醇，如甲醇、乙醇或异丙醇；芳烃，如苯或甲苯；氯代烃，如氯仿或 1, 2—二氯乙烷；脂肪烃，如己烷或环己烷；酯，如乙酸乙酯；或者醚，如二乙醚、二噁烷或四氢呋喃。

该反应在碱的存在下进行，基于铵化合物的量，碱的用量通常为约 0.5—2 摩尔当量。适宜的碱例如为碱金属或碱土金属的碳酸盐、碳酸氢盐、乙酸盐、醇盐或氧化物，特别是氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁或氧化钙。此外，还可使用如吡啶和叔胺（如三乙胺）的有机碱。

该反应优选在甲醇中、在碳酸氢钠存在下进行。

另一种可供选择的方法是不用碱、用游离的式 III 所示羟胺进行反应，例如以水溶液的形式进行反应，根据式 II 所示化合物使用的

溶剂，形成均相或两相反应混合物。

该方法的适宜溶剂例如有：醇，如甲醇、乙醇、异丙醇和环己醇；脂肪烃和芳烃，它们可以是氯代的，如己烷、环己烷、二氯甲烷、甲苯和二氯乙烷；酯，如乙酸乙酯；腈，如乙腈；以及环醚，如二噁烷和四氢呋喃。

一般情况下，式 II 所示环己烯酮和式 III 所示 O—(脞基)乙基羟胺或其盐的用量比约为化学计量，但有时，其中的某一组分过量至多约 10% 摩尔可能会更有利。

反应温度通过为 0°C 至反应混合物的沸点，优选为 20°C—80°C。

该反应可在几小时内完成。可用常规方式分离出产物，例如，将反应混合物浓缩，将得到的残余物在二氯甲烷与水之间分配，并减压蒸去溶剂。

对反应压力没有特别限制，因此，该反应通常在常压下进行，或者在具体的稀释剂自发形成的压力下进行。

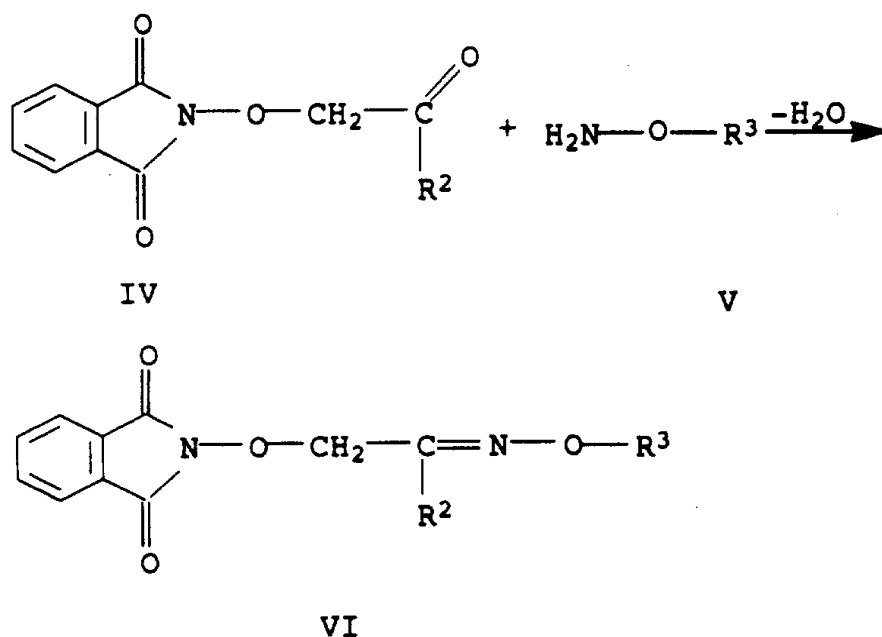
本发明式 I 所示环己烯醇酮脞醚可以以它们的可农用盐或以烯醇酯的形式存在，盐或酯的种类通常无关紧要。但是，这些碱应适于形成盐，这些酸应适于酯化，并且不能不利地影响式 I 所示化合物的除草效能。

在水溶液或如甲醇、乙醇、丙酮或甲苯的有机溶剂中，用钠或钾的氢氧化物或醇盐处理 3—羟基环己烯酮类化合物可以制得式 I 所示化合物的碱金属盐。

如锰、铜、锌、铁、钙、镁和钡盐的其它金属盐可用常规方法从钠盐制得，铵、磷、铈和氧化铈盐可借助于铵、磷、铈和氧化铈的氢氧化物制得。

同样地，式 I 所示化合物的酯也可用常规方式制得（例如参见 Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, 第 17 版, Berlin 1988, PP. 405—408）。

式 III 所示新颖 O—(脞基)乙基羟胺类化合物可由已知的前体、通过一系列已知的反应步骤制备。优选方法是，用已知的偶联酮的方法（例如参见 Houben—Weyl, Methoden der organischen Chemie [Methods of Organic Chemistry], Vol. E 14b, p. 369），使式 IV 所示 N—(2—氧代—1—烷氧基)邻苯二甲酰亚胺 {参见 Pharmazie 25, 400 (1970)} 与式 V 所示羟胺 (US 4, 249, 937、WO 92/08696、WO93/10081、US 4, 440, 566、EP—A 238 021、EP—A 080 301、DE—A 38 38 309、EP—A 456 112、WO 93/16033、WO 93/1602) 偶联脱水：



可用常规方法、例如用萃取或结晶方法从反应混合物中分离该方法制得的式 VI 所示酮肟醚衍生物。

在将它们转化成式 III 所示 O—(肟基)乙基羟胺类化合物之前，如需要，式 VI 所示酮肟醚衍生物可以中间贮存。

同样地，可以用已知的方法将式 VI 化合物转化成式 III 所示 O—(肟基)乙基羟胺类化合物（具有游离氨基）。为此，特别可参考 DE—A 36 15 973 及其中引用的公开出版物的内容。优选采用 DE—A 36 15 973 中所述的方法，即借助于乙醇胺释放出式 III 所示羟胺。但是，也可以借助于如无机碱水溶液或其它碱、胺、胍、羟胺或酸的水溶液，稀放出式 III 所示羟胺：



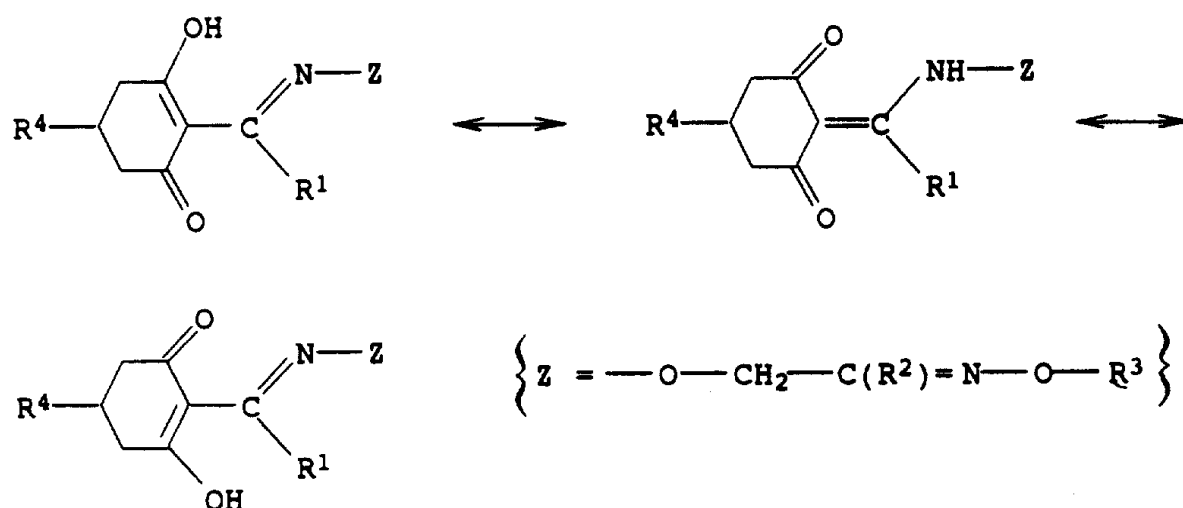
采用常规方法，例如通过萃取或结晶可从反应混合物中分离出式 III 所示 O—(肟基)乙基羟胺。为便于结晶，通常使用无机酸或有机酸将这些羟胺转化成它们的盐。为此，通常使用酸的稀溶液，通常使用化学计算量的酸和羟胺衍生物。

与式 III 所示 O—(肟基)乙基羟胺（具有游离氨基）一样，得

到的羟铵盐直接进一步转化成式 I 所示除草剂, 或者(如需要)贮存。

根据取代基 R^2 和 R^3 和种类, 在制备过程中可得到式 III 所示 O—(脞基) 乙基羟胺和式 I 所示 O—(脞基) 乙基环己烯酮脞醚的异构体混合物, 可以是 E/Z 异构体混合物和 (R/S) 对映体混合物或非对映体混合物。如需要, 可用常规方法, 例如通过层析或结晶将异构体混合物分离。

式 I 所示 O—(脞基) 乙基环己烯酮脞醚可以写成几种互变异构形式, 它们均在本发明范围内:



下列用于表示取代基的集合用语都表示一系列的具体基团:

— 卤原子,

— C_1-C_6 烷基, C_1-C_4 烷基, C_1-C_3 烷基, C_1-C_4 烷氧基,

C_1-C_4 烷硫基, C_1-C_4 烷磺酰基, C_1-C_4 卤烷基,

—— C_3-C_7 环烷基, C_5-C_7 环烯基,

—— C_2-C_6 链烯基, C_3-C_6 链烯基, C_3-C_4 链烯基, C_2-C_6 链烯基氧基,

—— C_3-C_6 链炔基, C_3-C_4 链炔基, C_3-C_6 链炔基氧基,

——N— (C_1-C_4 烷磺酰基) —N— (C_1-C_4 烷基) 氮甲基,

—— (C_1-C_4) 烷氧基— (C_1-C_4) 烷基, (C_1-C_4) 烷氧基— (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_4) 烷硫基— (C_1-C_6) 烷基,

—— C_1-C_6 酰基。

所有烷基、烷氧基、烷硫基、烷磺酰基、卤烷基、链烯基、链烯基氧基、链炔基、链炔基氧基和酰基都可以是直链或支链的。卤烷基可带有相同或不同的卤原子。

它们的具体含义例如为:

——卤原子: 氟, 氯, 溴, 碘;

—— C_1-C_6 烷基: 甲基, 乙基, 正丙基, 1—甲基乙基, 正丁基, 1—甲基丙基, 2—甲基丙基, 1, 1—二甲基乙基, 正戊基, 1—甲基丁基, 2—甲基丁基, 3—甲基丁基, 2, 2—二甲基丙基, 1—乙基丙基, 正己基, 1, 1—二甲基丙基, 1, 2—二甲基丙基, 1—甲基戊基, 2—甲基戊基, 3—甲基戊基, 4—甲基戊基, 1, 1—二甲基丁基, 1, 2—二甲基丁基, 1, 3—二甲基丁基, 2, 2—二甲基丁基, 2, 3—二甲基丁基, 3, 3—二甲基丁基, 1—乙基丁基, 2—乙基丁基, 1, 1,

2—三甲基丙基, 1, 2, 2—三甲基丙基, 1—乙基—1—甲基丙基, 1—乙基—2—甲基丙基;

—— C_1 — C_4 烷基: 甲基, 乙基, 正丙基, 1—甲基乙基, 正丁基, 1—甲基丙基, 2—甲基丙基, 1, 1—二甲基乙基;

—— C_1 — C_3 烷基: 甲基, 乙基, 正丙基, 1—甲基乙基;

—— C_1 — C_4 烷氧基: 甲氧基, 乙氧基, 正丙氧基, 1—甲基乙氧基, 正丁氧基, 1—甲基丙氧基, 2—甲基丙氧基, 1, 1—二甲基乙氧基;

—— C_1 — C_4 烷硫基: 甲硫基, 乙硫基, 正丙硫基, 1—甲基乙硫基, 正丁硫基, 1—甲基丙硫基, 2—甲基丙硫基, 1, 1—二甲基乙硫基;

—— C_1 — C_4 卤烷基: 部分或全部被氟、氯和/或溴取代的上述 C_1 — C_4 烷基, 即例如为氟甲基, 二氟甲基, 三氟甲基, 氯甲基, 二氯甲基, 三氯甲基, 氟氯甲基, 二氯一氟甲基, 一氯二氟甲基, 1—氟乙基, 2—氟乙基, 2, 2—二氟乙基, 2, 2, 2—三氟乙基, 2—氟—2—氟乙基, 2—氟—2, 2—二氟乙基, 2, 2—二氟—2—氟乙基, 2, 2, 2—三氟乙基, 五氟乙基, 3—氟丙基, 七氟丙基;

—— C_2 — C_6 链烯基: 乙烯基以及 C_3 — C_6 链烯基, 如: 1—丙烯基, 2—丙烯基, 1—甲基乙烯基, 1—丁烯基, 2—丁烯基, 3—丁烯基, 1—甲基—1—丙烯基, 1—甲基—2—丙烯基, 2—甲基—1—丙烯基, 2—甲基—2—丙烯基, 1—戊烯基, 2—戊烯基, 3—戊烯基, 4—戊

烯基, 1—甲基—1—丁烯基, 2—甲基—1—丁烯基, 3—甲基—1—
 丁烯基, 1—甲基—2—丁烯基, 2—甲基—2—丁烯基, 3—甲基—2—
 丁烯基, 1—甲基—3—丁烯基, 2—甲基—3—丁烯基, 3—甲基—3—
 丁烯基, 1, 1—二甲基—2—丙烯基, 1, 2—二甲基—1—丙烯基, 1,
 2—二甲基—2—丙烯基, 1—乙基—1—丙烯基, 1—乙基—2—丙烯
 基, 1—己烯基, 2—己烯基, 3—己烯基, 4—己烯基, 5—己烯基,
 1—甲基—1—戊烯基, 2—甲基—1—戊烯基, 3—甲基—1—戊烯基,
 4—甲基—1—戊烯基, 1—甲基—2—戊烯基, 2—甲基—2—戊烯基,
 3—甲基—2—戊烯基, 4—甲基—2—戊烯基, 1—甲基—3—戊烯基,
 2—甲基—3—戊烯基, 3—甲基—3—戊烯基, 4—甲基—3—戊烯基,
 4—甲基—4—戊烯基, 1, 1—二甲基—2—丁烯基, 1, 1—二甲基—
 3—丁烯基, 1, 2—二甲基—1—丁烯基, 1, 2—二甲基—2—丁烯基,
 1, 2—二甲基—3—丁烯基, 1, 3—二甲基—1—丁烯基, 1, 3—二
 甲基—2—丁烯基, 1, 3—二甲基—3—丁烯基, 2, 2—二甲基—3—
 丁烯基, 2, 3—二甲基—1—丁烯基, 2, 3—二甲基—2—丁烯基, 2,
 3—二甲基—3—丁烯基, 3, 3—二甲基—1—丁烯基, 1—乙基—1—
 丁烯基, 1—乙基—2—丁烯基, 1—乙基—3—丁烯基, 2—乙基—1—
 丁烯基, 2—乙基—2—丁烯基, 2—乙基—3—丁烯基, 1, 1, 2—三
 甲基—2—丙烯基, 1—乙基—1—甲基—2—丙烯基, 1—乙基—2—
 甲基—1—丙烯基, 1—乙基—2—甲基—2—丙烯基;

—— C_3-C_4 链烯基: 1—丙烯基, 2—丙烯基, 1—甲基乙烯基,

1—丁烯基, 2—丁烯基, 3—丁烯基, 1—甲基—1—丙烯基, 1—甲基—2—丙烯基, 2—甲基—1—丙烯基, 2—甲基—2—丙烯基;

—— $C_2—C_6$ 链烯基氧基: 乙烯基氧基和 $C_3—C_6$ 链烯氧基, 如 2—丙烯氧基, 2—丁烯氧基, 3—丁烯氧基, 1—甲基—2—丙烯氧基, 2—甲基—2—丙烯氧基, 2—戊烯氧基, 3—戊烯氧基, 4—戊烯氧基, 1—甲基—2—丁烯氧基, 2—甲基—2—丁烯氧基, 3—甲基—2—丁烯氧基, 1—甲基—3—丁烯氧基, 2—甲基—3—丁烯氧基, 3—甲基—3—丁烯氧基, 1, 1—二甲基—2—丙烯氧基, 1, 2—二甲基—2—丙烯氧基, 1—乙基—2—丙烯氧基, 2—己烯氧基, 3—己烯氧基, 4—己烯氧基, 5—己烯氧基, 1—甲基—2—戊烯氧基, 2—甲基—2—戊烯氧基, 3—甲基—2—戊烯氧基, 4—甲基—2—戊烯氧基, 1—甲基—3—戊烯氧基, 2—甲基—3—戊烯氧基, 3—甲基—3—戊烯氧基, 4—甲基—3—戊烯氧基, 1—甲基—4—戊烯氧基, 4—甲基—4—戊烯氧基, 1, 1—二甲基—2—丁烯氧基, 1, 2—二甲基—2—丁烯氧基, 1, 2—二甲基—3—丁烯氧基, 1, 3—二甲基—2—丁烯氧基, 1, 3—二甲基—3—丁烯氧基, 2, 2—二甲基—3—丁烯氧基, 2, 3—二甲基—2—丁烯氧基, 2, 3—二甲基—3—丁烯氧基, 1—乙基—2—丁烯氧基, 1—乙基—3—丁烯氧基, 2—乙基—2—丁烯氧基, 2—乙基—3—丁烯氧基, 1, 1, 2—三甲基—2—丙烯氧基, 1—乙基—1—甲基—2—丙烯氧基, 1—乙基—2—甲基—2—丙烯氧基;

—— $C_3—C_6$ 链炔基: 丙—1—炔—1—基, 丙—2—炔—3—基, 正

丁—1—炔—1—基, 正丁—1—炔—4—基, 正丁—2—炔—1—基, 正
 戊—1—炔—1—基, 正戊—1—炔—3—基, 正戊—1—炔—4—基, 正
 戊—1—炔—5—基, 正戊—2—炔—1—基, 正戊—2—炔—4—基, 正
 戊—2—炔—5—基, 3—甲基—丁—1—炔—1—基, 3—甲基—丁—
 1—炔—3—基, 3—甲基—丁—1—炔—4—基, 正己—1—炔—1—基,
 正己—1—炔—3—基, 正己—1—炔—4—基, 正己—1—炔—5—基,
 正己—1—炔—6—基, 正己—2—炔—1—基, 正己—2—炔—4—基,
 正己—2—炔—5—基, 正己—2—炔—6—基, 正己—3—炔—1—基,
 正己—3—炔—2—基, 3—甲基—戊—1—炔—1—基, 3—甲基—戊
 —1—炔—3—基, 3—甲基—戊—1—炔—4—基, 3—甲基—戊—1—
 炔—5—基, 4—甲基—戊—1—炔—1—基, 4—甲基—戊—2—炔—
 4—基, 4—甲基—戊—2—炔—5—基;

—— C_3 — C_4 链炔基: 丙—1—炔—1—基, 丙—2—炔—3—基, 正
 丁—1—炔—1—基, 正丁—1—炔—4—基, 正丁—2—炔—1—基;

—— C_3 — C_6 链炔基氧基: 丙—1—炔—1—基氧基, 丙—2—炔—
 3—基氧基, 正丁—1—炔—1—基氧基, 正丁—1—炔—4—基氧基,
 正丁—2—炔—1—基氧基, 正戊—1—炔—1—基氧基, 正戊—1—炔
 —3—基氧基, 正戊—1—炔—4—基氧基, 正戊—1—炔—5—基氧基,
 正戊—2—炔—1—基氧基, 正戊—2—炔—4—基氧基, 正戊—2—炔
 —5—基氧基, 3—甲基—丁—1—炔—1—基氧基, 3—甲基—丁—1—
 炔—3—基氧基, 3—甲基—丁—1—炔—4—基氧基, 正己—1—炔—

1—基氧基, 正己—1—炔—3—基氧基, 正己—1—炔—4—基氧基, 正己—1—炔—5—基氧基, 正己—1—炔—6—基氧基, 正己—2—炔—1—基氧基, 正己—2—炔—4—基氧基, 正己—2—炔—5—基氧基, 正己—2—炔—6—基氧基, 正己—3—炔—1—基氧基, 正己—3—炔—2—基氧基, 3—甲基—戊—1—炔—1—基氧基, 3—甲基—戊—1—炔—3—基氧基, 3—甲基—戊—1—炔—4—基氧基, 3—甲基—戊—1—炔—5—基氧基, 4—甲基—戊—1—炔—1—基氧基, 4—甲基—戊—2—炔—4—基氧基, 4—甲基—戊—2—炔—5—基氧基;

—— C_3 — C_7 环烷基: 环丙基, 环丁基, 环戊基, 环己基, 环庚基;

—— C_5 — C_7 环烯基; 例如环戊—1—烯基, 环戊—2—烯基, 环戊—3—烯基, 环己—1—烯基, 环己—2—烯基, 环己—3—烯基, 环庚—1—烯基, 环庚—2—烯基, 环庚—3—烯基, 环庚—4—烯基。

考虑到它们的除草活性, 特别优选其中的取代基具有如下意义的式 I 所示 O—(肟基) 乙基环己酮肟醚:

R^1 为乙基和丙基;

R^2 为甲基;

R^3 表示

• 未取代的或带有 1—3 个选自下列取代基的苯基

—硝基, 氰基;

—卤原子, 特别是氟、氯;

— C_1 — C_4 烷基，特别是甲基；

— C_1 — C_4 卤烷基，特别是三氟甲基；

• C_1 — C_4 烷基， C_3 — C_4 链烯基或 C_3 — C_4 链炔基，如需要，这些基团可带有 1 个选自下列的取代基

—卤原子，特别是氟、氯；

— C_1 — C_3 烷基，特别是甲基；

—未取代的或带有 1—3 个选自下列取代基的苯基

* 硝基，氰基；

* 卤原子，特别是氟、氯；

* C_1 — C_4 烷基，特别是甲基；

* C_1 — C_4 卤烷基，特别是三氟甲基；

* 苯基，苯氧基；

—未取代的或带有 1—3 个选自下列取代基的苯氧基

* 硝基，氰基；

* 卤原子，特别是氟、氯；

* C_1 — C_4 烷基，特别是甲基；

* C_1 — C_4 卤烷基，特别是三氟甲基；

R^4 表示

• 被 C_1 — C_4 烷氧基或 C_1 — C_4 烷硫基取代的如上所述 C_1 — C_6 烷基，该烷氧基特别是甲氧基、乙氧基、1—甲基乙氧基或 1, 1—二甲基乙氧基，该烷硫基特别是甲硫基或乙硫基，该 C_1 — C_4 烷氧基或

C_1 — C_4 烷硫基最好在 1—、2—或 3—位，特别优选 2—乙硫基丙基；

• 苯硫基—(C_1 — C_6) 烷基、特别是 2—(苯硫基) 乙基，其中，如需要，苯环上可带有 1—3 个卤原子（特别是氟和/或氯原子）和/或 C_1 — C_4 卤烷基（特别是三氟甲基）；

• N—(C_1 — C_4 烷磺酰基)—N—(C_1 — C_4 烷基) 氧甲基，特别是 N—甲磺酰基—N—甲基氧甲基或 N—乙磺酰基—N—甲基氧甲基；

• C_3 — C_7 环烷基或 C_5 — C_7 环烯基，如需要，它们可带有 1—3 个选自 C_1 — C_4 烷基、 C_1 — C_4 烷氧基、 C_1 — C_4 烷硫基和/或 C_1 — C_4 卤烷基的取代基，特别优选 1—甲硫基—1—环丙基；

• 5 元饱和杂环，如四氢呋喃基，四氢噻吩基、二氧戊环基、二硫戊环基和氧硫戊环基，特别是四氢呋喃基、四氢噻吩基和二氧戊环基，其中的杂环可以是未取代的或者带有 1—3 个选自 C_1 — C_4 烷基、 C_1 — C_4 烷氧基、 C_1 — C_4 烷硫基和 C_1 — C_4 卤烷基的取代基；

• 6 元或 7 元杂环，

a) 它可以是饱和的，例如四氢吡喃基、四氢噻喃基、氧杂庚环基、硫杂庚环基和二氧杂庚环—5—基，

b) 它可以是单或双不饱和的，例如二氢化吡喃—3—基、二氢化吡喃—4—基、二氢化噻喃—3—基和二氢化噻喃—4—基，

其中的杂环可以是未取代的或者带有 1—3 个选自羟基、卤原子、 C_1 — C_4 烷基、 C_1 — C_4 烷氧基、 C_1 — C_4 烷硫基和 C_1 — C_4 卤烷基的

取代基，

特别优选四氢吡喃—3—基、四氢吡喃—4—基和四氢噻喃—3—基；

• 5元杂芳环，如吡咯基、吡唑基、咪唑基、异噁唑基、噁唑基、异噻唑基、噻唑基、呋喃基、噻吩基、1, 2, 4—噁二唑基、1, 2, 4—噻二唑基、1, 3, 4—噁二唑—2—基和1, 3, 4—噻二唑—2—基，优选异噁唑基和呋喃基，其中该杂芳环可以是未取代的或带有1—3选自下列的取代基

— C_1 — C_4 烷基， C_1 — C_4 烷氧基， C_1 — C_4 烷硫基， C_1 — C_4 卤烷基，

—(C_1 — C_4) 烷氧基—(C_1 — C_4) 烷基，如甲氧甲基、2—甲氧乙基、2—甲氧丙基、3—甲氧丙基、2—甲氧基—1—甲基乙基、乙氧甲基、2—乙氧乙基、2—乙氧丙基、3—乙氧丙基、2—乙氧基—1—甲基乙基和1—乙氧基—1—甲基乙基，特别是甲氧乙基和乙氧乙基，

— C_2 — C_6 链烯基，如乙烯基和 C_3 — C_6 链烯基，

— C_2 — C_6 链烯基氧基，特别是1—甲基—乙烯—1—基氧基；

• 苯基或吡啶基，两者均可以是未取代的，或者带有1—3个选自下列的取代基

—1至3个 C_1 — C_4 烷基、 C_1 — C_4 烷氧基、 C_1 — C_4 烷硫基、 C_1 — C_4 卤烷基、 C_3 — C_6 链炔基氧基和

—式— NR^aR^b 所示基团，其中

* R^a 为：氢；C₁—C₄ 烷基，特别是甲基和乙基；C₃—C₆ 链烯基，特别是 2—丙烯基和 2—丁烯基；或者 C₃—C₆ 链炔基，特别是 2—丙炔基和 2—丁炔基；

* R^b 为：氢；C₁—C₄ 烷基，特别是甲基或乙基；C₃—C₆ 链烯基，特别是 2—丙烯基或 2—丁烯基；C₃—C₆ 链炔基，特别是 2—丙炔基或 2—丁炔基；C₁—C₆ 酰基，如乙酰基、丙酰基、正丁酰基、2—甲基丙酰基、戊酰基、2—甲基丁酰基、3—甲基丁酰基、2, 2—二甲基丙酰基、正己酰基、2—甲基戊酰基、3—甲基戊酰基、4—甲基戊酰基、2, 2—二甲基丁酰基、2, 3—二甲基丁酰基、3, 3—二甲基丁酰基和 2—乙基丁酰基，特别是乙酰基或丙酰基；或者是苯甲酰基，它可以是未取代的，或者带有 1—3 个选自硝基、氰基、卤原子（优选氟、氯和溴）、C₁—C₄ 烷基（优选甲基）、C₁—C₄ 烷氧基（优选甲氧基和乙氧基）、C₁—C₄ 烷硫基（优选甲硫基）和 C₁—C₄ 卤烷基（优选三氟甲基）的取代基。

式 I 所示 O—（肟基）乙基环己烯酮肟醚的适宜盐的是可农用盐，例如：碱金属盐，特别是钠盐或钾盐，碱土金属盐，特别是钙盐、镁盐或钡盐，锰盐，铜盐，锌盐或铁盐，以及铵盐、磷盐、铈盐或氧化铈盐，如铵盐、四烷基铵盐、苯甲基三烷基铵盐、三烷基铈盐或三烷基氧化铈盐。

可农用的酯优选 C₁—C₁₀ 脂肪酸的酯，特别是：C₂—C₇ 烷羧酸，如乙酸、丙酸、丁酸、1—甲基丙酸（异丁酸）、戊酸、1—甲基丁酸、

2—甲基丁酸、1, 1—二甲基丙酸、己酸、1—甲基戊酸、2—甲基戊酸、3—甲基戊酸、1, 1—二甲基丁酸、1, 2—二甲基丁酸、2, 2—二甲基丁酸、1—乙基丁酸、苯甲酸和被卤原子取代的苯甲酸、庚酸、1—甲基己酸、2—甲基己酸、3—甲基己酸、4—甲基己酸、1, 1—二甲基戊酸、1, 2—二甲基戊酸、1, 3—二甲基戊酸、2, 2—二甲基戊酸、2, 3—二甲基戊酸、3, 3—二甲基戊酸、1—乙基戊酸、2—乙基戊酸、1, 1, 2—三甲基丁酸、1, 2, 2—三甲基丁酸、1—乙基—1—甲基丁酸和 1—乙基—2—甲基丁酸。

式 I 所示 O—(肟基)乙环己烯酮肟醚、它们的盐和酯——无论是异构体混合物还是纯净的单一异构体——适宜用作除草剂，特别是用于除去禾本科植物草（禾本科）。它们一般是无害的，因而可用于阔叶植物和不属于禾本科的单子叶植物。本发明的一些式 I 所示化合物还可选择性地控制禾本科农作物中的杂草。

通常在低施用量下选择性地抑制如小麦、水稻、玉米、大豆和棉花的农作物中的阔叶草和禾本科草。

式 I 所示 O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚、它们的盐和酯，或含有它们的除草剂组合物可以以可直接喷洒水溶液、粉末、悬浮体、高浓度含水制剂、油状或其它悬浮体或分散体、乳液、油分散体、膏剂、撒粉组合物、撒播组合物或颗粒的形式通过喷洒、喷雾、撒粉、撒播或浇灌而施用。施用方式决定于意欲的用途，在每种情况下，应尽可能使本发明的活性化合物最均匀地分散。

式 I 所示化合物通常适于制备可直接喷洒溶液、乳液、膏剂或油分散体。适宜的惰性添加剂为：中至高沸点的矿物油（如煤油或柴油以及煤焦油），以及植物或动物油，脂肪烃、环烃和芳烃（如石蜡、四氢化萘、烷基化萘或其衍生物、烷基化苯或其衍生物），甲醇，乙醇，丙醇，丁醇，环己醇，环己酮或强极性溶剂，如 N—甲基吡咯烷酮或水。

向浓乳液、悬浮体、膏剂、可湿润粉末或水分散性颗粒中加入水，可以制得含水制剂。为制备乳液、膏剂或油分散体，借助于湿润剂、粘合剂、分散剂或乳化剂，可以在水中将原料本身或溶于油或溶剂中的原料均化。但是，也可以制得由活性物、湿润剂、粘合剂、分散剂或乳化剂组成的浓缩物，也可以制得还含有溶剂或油的浓缩物，这些浓缩物适于用水稀释。

适宜表面活性剂为：芳香磺酸的碱金属、碱土金属和铵盐，芳香磺酸例如为木素磺酸、苯酚磺酸、萘磺酸和二丁基萘磺酸，以及脂肪酸盐，烷基—和烷芳基磺酸盐，烷基—、月桂基醚和脂肪醇硫酸盐，以及硫酸根合十六、十七、十八烷醇的盐，脂肪醇乙二醇醚的盐，磺化萘及其衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物，聚氧乙烯辛酚醚，乙氧基化的异辛基、辛基—或壬基苯酚，烷基苯基或三丁基苯基聚乙二醇醚，烷芳基聚醚醇，异十三烷醇，脂肪醇/环氧乙烷缩合物，乙氧基化的蓖麻油，聚氧乙烯或聚氧丙烯烷基醚，月桂醇聚乙二醇醚乙酸酯，山梨醇酯，本素—亚硫酸

盐废液或甲基纤维素。

将活性物与固体载体混合或一起研磨，可以制得粉末、撒播和撒粉组合物。

将活性化合物结合到固体载体上，可以制得如包衣、浸透和均相颗粒的颗粒。固体载体为：矿物土，如硅酸、硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、石灰石、石灰、白垩、红玄武土、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙和硫酸镁、氧化镁；研磨的合成材料；化肥，如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲；以及植物产品，如谷物面粉、树皮粉、木材料和坚果壳粉、纤维素粉末；或其它固体载体。

配方中通常含有 0.01%—95% (重量)、优选 0.5%—90% (重量) 至少一种式 I 所示化合物。这里使用的活性化合物的纯度为 90%—100%，优选为 95%—100% (根据 NMR 谱)。

例如，可将本发明式 I 所示化合物按如下方法配成配方：

I. 将 20 重量份化合物 No. 3.05 溶于一混合物中，所述混合物由 80 重量份烷基化苯、10 重量份 8—10 摩尔环氧乙烷与 1 摩尔 N—单羟乙基油酰胺的加成产物、5 重量份十二烷基苯磺酸钙和 5 重量份 40 摩尔环氧乙烷与 1 摩尔蓖麻油的加成产物组成。将该溶液倒入 100,000 重量份水中并均匀分散，得到一种水分散体，它含有 0.02% (重量) 活性化合物。

II. 将 20 重量份化合物 No. 4.01 溶于一混合物中，该混合物由 40 重量份环己酮、30 重量份异丁醇、20 重量份 7 摩尔环氧乙烷与 1

摩尔异辛基苯酚的加成产物以及 10 重量份 40 摩尔环氧乙烷与 1 摩尔蓖麻油的加成产物组成。将该溶液倒入 100,000 重量份水中,并均匀分散,得到一水分散体,它含有 0.02% (重量) 活性化合物。

III. 将 20 重量份活性化合物 No. 4.03 溶于一混合物中,该混合物由 25 重量份环己酮、65 重量份沸程为 210°C—280°C 的矿物油和 10 重量份 40 摩尔环氧乙烷与 1 摩尔蓖麻油的加成产物组成。将该溶液倒入 100,000 重量份水中并均匀分散,得到一水分散体,它含有 0.02% (重量) 活性化合物。

IV. 将 20 重量份活性化合物 No. 15.09 与 3 重量份二异丁基萘— α —磺酸、17 重量份源于亚硫酸盐废液的木素磺酸钠和 60 重量份硅胶粉彻底混合,并在锤磨机中研磨。将该混合物均匀分散于 20,000 重量份水中,得到一种喷洒混合物,它含有 0.1% (重量) 活性化合物。

V. 将 3 重量份活性化合物 No. 9.04 与 97 重量份高岭土精粉混合。这样得到一种撒粉组合物,它含有 3% (重量) 活性化合物。

VI. 将 20 重量份活性化合物 No. 12.01 与 2 重量份十二烷基苯磺酸钙、8 重量份脂肪醇聚乙二醇醚、2 重量份苯酚/脲/甲醛缩聚物的钠盐和 68 重量份石蜡矿物油混合。得到一稳定的油状分散体。

除草剂组合物或活性化合物可于芽前或芽后施用。对于某些农作物,如果活性化合物对其可能有害,可用喷洒设备施用除草剂组合物,以尽可能地不施用到对活性化合物敏感的农作物的叶子上,使

活性化合物施用到生长在农作物下方的不希望的植物的叶子上，或施用到挖开的土壤表面上 (post-directed, lay-by)。

根据欲控制的目标植物、施用季节、需保护的植物及其生长期，活性化合物的施用量为 0.001—3.0kg/ha、优选为 0.01—1.0kg/ha 的至少一种式 I 所示活性物 (a. s.)。

考虑到施用方法的不同，式 I 所示 O—(脞基) 乙基环己烯酮脞醚或含有它们的组合物还可用于抑制其它农作物植物中的不希望的植物的生长。适宜农作物的示例为：

洋葱 *A. cepa*、菠萝 *A. comosus*、落花生 *A. hypogaea*、石刁柏 *A. officinalis*、甜菜 *B. vulgaris* spp. *altissima*、甜菜 *B. vulgaris* spp. *rapa*、芸苔 *B. hapus* var. *napus*、芸苔 *B. napus* var. *napobrassica*、芜菁 *B. rapa* var. *silvestris*、茶 *C. sinensis*、红花 *C. tinctorius*、山核桃 *C. illinoensis*、洋柠檬 *C. limon*、橙 *C. sinensis*、小粒咖啡 *C. arabia* (中粒咖啡 *C. canephora*、大粒咖啡 *C. liberica*)、胡瓜 *C. sativus*、狗芽根 *C. dactylon*、野胡萝卜 *D. carota*、油棕 *E. guineensis*、草莓 *F. vesca*、大豆 *G. max*、高地棉 *G. birsutum* (树棉 *G. arboreum*、草棉 *G. berbacum*、*G. vitifolium*)、向日葵 *H. annuus*、橡胶树 *H. brasiliensis*、大麦 *H. vulgare*、忽布 *H. lupulus*、番薯 *L. batatas*、胡桃 *J. regia*、兵豆 *L. culinaris*、亚麻 *L. usitatissimum*、番茄 *L. lycopersicum*、苹果属、木薯 *M. esculenta*、苜蓿 *M. sativa*、芭蕉属、烟草 *N. tabacum* (*N. rustica*)、油橄榄 *O. europaea*、稻 *O. sativa*、棉豆 *P. lunatus*、菜豆 *P. vulgaris*、云杉 *P.*

abies、松属、豌豆 *P. sativum*、樱桃 *P. avium*、桃 *P. persica*、梨 *L. communis*、茶藨子 *R. sylvestre*、蓖麻 *R. communis*、甘蔗 *S. officinarum*、黑麦 *S. cereale*、马铃薯 *S. tuberosum*、高粱 *S. bicolor* (高粱 *S. vulgare*)、可可 *T. cacao*、车轴草 *T. pratense*、小麦 *T. aestivum*、硬麦 *T. durum*、蚕豆 *V. faba*、葡萄 *V. vinifera*、玉蜀黍 *Z. mays*。

为了扩大作用谱和取得协同效果，式 I 所示 O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚与其它类除草或生长调节活性化合物的各种代表化合物混合和组合施用。例如，适当的混合物组分为二嗪、4H—3, 1—苯并噁嗪衍生物、苯并噻二嗪酮、2, 6—二硝基苯胺、N—苯基氨基甲酸酯、硫代氨基甲酸酯、卤代羧酸、三嗪、酰胺、脲、二苯基醚、三嗪酮、尿嘧啶、苯并咪唑衍生物、在 2—位带有如羧基或碳酰亚氨基的环己烷—1, 3—二酮衍生物、喹啉羧酸衍生物、咪唑啉酮、磺酰胺、磺酰基脲、芳氧基—和杂芳氧基苯氧基丙酸及其盐、酯和酰胺及其它。

另外，单独施用化合物 I 或与其它除草剂结合组合施用，还可以与其它作物保护剂如控制昆虫或植物病原真菌或细菌的试剂混合施用。与用于消除营养元素和微量元素缺乏的无机盐溶液的混溶性也是有意义的。还可加入非植物毒性油和油浓缩物。

制备例

2— [1— {2— [2— (4—氯苯氧基)乙基肟基]丙基肟基}丁

基]—3—羟基—5—(2H—四氢噻喃—3—基)—2—环己烯—1—酮
(化合物 No. 3.04)

在 25°C 下搅拌 1.00g (3.56mmol) 3—羟基—2—丁酰基—5—
(2H—四氢噻喃—3—基)—2—环己烯—1—酮、0.92g (3.56mmol)
O—{2—[2—(4—氯苯氧基)乙氧亚氨基]丙基}羟胺和 100ml 甲
醇的混合物 16 小时。减压浓缩反应混合物，然后按已知方式处理残
余物得到产品，收率：65%。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, 在 CDCl_3 中): δ [ppm] = 4.20 (m, 2H), 4.40 (m, 2H),
6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) *

前体:

O—{2—[2—(4—氯苯氧基)乙基肟基]丙基}羟胺

在 25°C 下搅拌 5.30g (24mmol) N—(2—氧代—1—丙氧基)邻
苯二甲酰亚胺 {参见. Pharmazie 25, (1970) 400}、4.50g
(24mmol) O—[2—(4—氯苯氧基)乙基]羟胺 (参见 EP—A
456112) 和 120ml 甲醇的混合物 16 小时，然后减压浓缩。残余油
(10g) 用 100ml 乙醇胺处理。40°C 下搅拌 4 小时后，将混合物搅入水
中，然后用二氯甲烷萃取 3 次。合并有机相后，用水洗，用硫酸钠
干燥并浓缩。收率：79%。

$^1\text{H-NMR}$ (200 MHz, 在 CDCl_3 中):

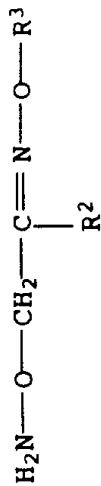
主异构体 (相对含量 : 80%): δ [ppm] = 1.35 (d, 3H), 1.80 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.65 (m, 1H), 5.45 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H).

次异构体 (相对含量 : 20%): δ [ppm] = 1.30 (d, 3H), 1.95 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.65 (m, 1H), 5.45 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H).

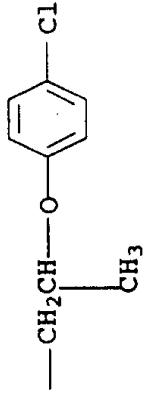
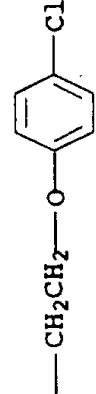
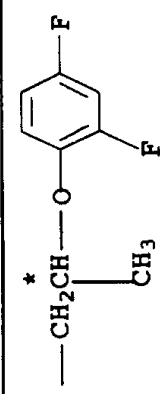
在下表 I 中列出了以同样方法制得的或可以制得的其它 O—(肟基) 乙基羟胺 III。表 2—24 中为本发明的 O—(肟基) 乙基环己烯酮肟醚 I。

*) 所选择代表信号。

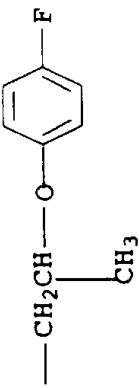

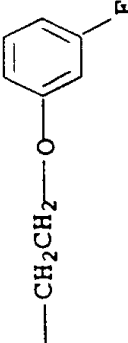
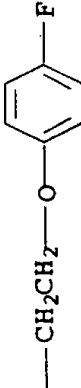
表 1

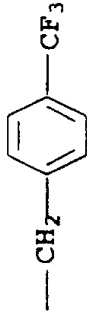
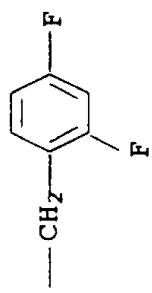
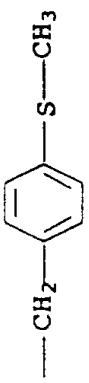
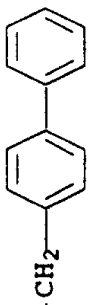
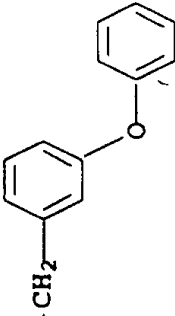


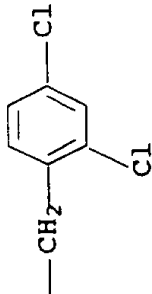
(III)

| No. | R ² | R ³ | 物理数据 (¹ H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|---|--|
| 1.01 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.35(d, 3H), 1.80(s, 3H), 4.00-4.30(m, 2H), 4.15(s, 2H), 4.65(m, 1H), 5.45(bs, 2H), 6.85(m, 2H), 7.20(m, 2H) 次异构体 : 1.30(d, 3H), 1.95(s, 3H), 4.00-4.30(m, 2H), 4.15(s, 2H), 4.65(m, 1H), 5.45(bs, 2H), 6.85(m, 2H), 7.20(m, 2H) |
| 1.02 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.90(s, 3H), 4.00-4.20(m, 3H), 4.15(s, 2H), 4.30-4.50(m, 2H), 5.50(bs, 2H), 6.85(m, 2H), 7.20(m, 2H) 次异构体 : 1.95(s, 3H), 4.00-4.20(m, 2H), 4.15(s, 2H), 4.30-4.50(m, 2H), 5.50(bs, 2H), 6.85(m, 2H), 7.20(m, 2H) |
| 1.03 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.35(d, 3H), 1.80(s, 3H), 4.00-4.30(m, 2H), 4.10(s, 2H), 4.55(m, 1H), 5.50(bs, 2H), 6.70-7.10(m, 3H) 次异构体 : 1.30(d, 3H), 1.95(s, 3H), 4.00-4.30(m, 2H), 4.10(s, 2H), 4.55(m, 1H), 5.50(bs, 2H), 6.70-7.10(m, 3H) [α] _D ²⁵ = -12.5 (c = 1.0; MeOH) |

* = R-构型

| No. | R ² | R ³ | 物理数据 (¹ H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|--|---|
| 1.04 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.35 (d, 3H), 1.80 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.10 (s, 2H), 4.60 (m, 1H), 5.50 (bs, 2H), 6.90 (m, 4H), 次异构体 : 1.30 (d, 3H), 1.80 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.10 (s, 2H), 4.60 (m, 1H), 5.50 (bs, 2H), 6.90 (m, 4H) |
| 1.05 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.90 (s, 3H), 4.20 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H), 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.55 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H) |
| 1.06 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.90 (s, 3H), 4.10-4.55 (m, 6H), 5.50 (bs, 2H), 6.70 (m, 3H), 7.20 (m, 1H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.10-4.55 (m, 6H), 5.50 (bs, 2H), 6.70 (m, 3H), 7.20 (m, 1H) |
| 1.07 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.90 (s, 3H), 4.00-4.20 (m, 2H), 4.20 (s, 2H), 4.30-4.50 (m, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.85-7.05 (m, 4H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.00-4.20 (m, 2H), 4.20 (s, 3H), 4.30-4.50 (m, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.85-7.05 (m, 4H) |

| No. | R ² | R ³ | 物理数据 (¹ H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|---|---|
| 1.08 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.20 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.55 (m, 2H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.75 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.55 (m, 2H) |
| 1.09 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.90 (s, 3H), 4.15 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 6.80 (m, 2H), 7.40 (m, 1H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.45 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 6.80 (m, 2H), 7.40 (m, 1H) |
| 1.10 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.90 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 4.20 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H), 7.20-7.30 (m, 4H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 5.50 (m, 2H), 7.20-7.30 (m, 1H) |
| 1.11 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.20 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 5.40 (bs, 2H), 7.20-7.70 (2m, 9H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.70 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 5.40 (bs, 2H), 7.2-7.70 (2m, 9H) |
| 1.12 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.15 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.40 (bs, 2H), 6.90-7.40 (2m, 9H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.65 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 5.40 (bs, 2H), 6.90-7.40 (2m, 9H) |

| No. | R ² | R ³ | 物理数据 (1H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|---|--|
| 1.13 | 甲基 |  | 主异构体 : 1.95(s,3H), 4.20(s,2H), 5.20 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.80 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H) |
| 1.14 | 甲基 | —CH ₂ CH ₃ | 1.30 (t, 3H), 1.90 (s, 3H), 4.10 (q, 2H), 4.15 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H) |
| 1.15 | 甲基 | —CH ₂ CH=CHCl | 主异构体 : 1.90 (s, 3H), 4.15 (s, 2H), 4.55 (d, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) 次异构体 : 1.95 (s, 3H), 4.45 (s, 2H), 4.50 (d, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |

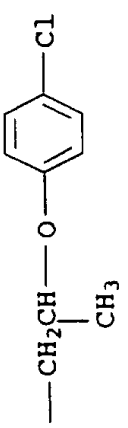
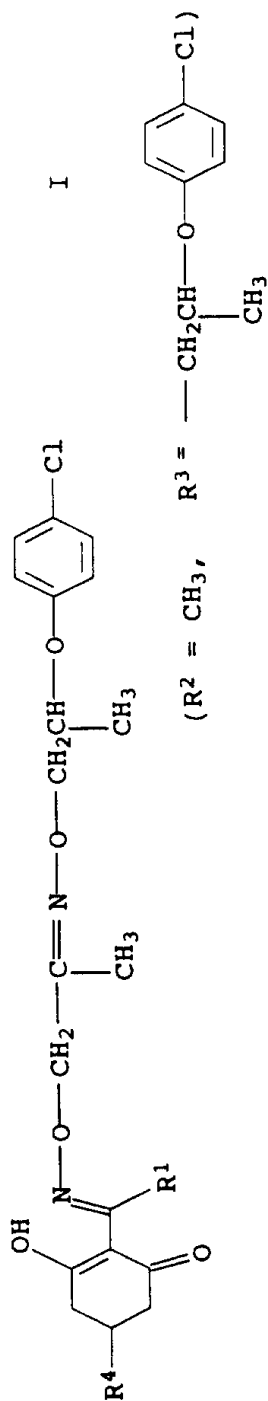
| No. | R ² | R ³ | 物理数据 (¹ H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|---|--|
| 1.16 | 正丁基 | —CH ₂ CH=CHCl | 主异构体 : 2.25 (t, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) 次异构体 : 2.35 (t, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 1.17 | 正丁基 |  | 2.25 (t, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |

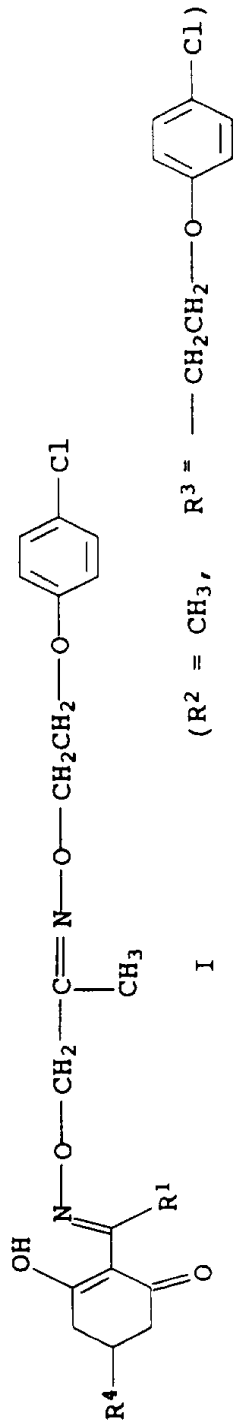
表 2



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (1H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|----------------|---|
| 2.01 | 乙基 | 2 H-四氢吡喃-3-基 | |
| 2.02 | 正丙基 | 2 H-四氢吡喃-3-基 | |
| 2.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 2.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.10-4.30 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 2.05 | 乙基 | 2 H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 4.10-4.30 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 2.06 | 正丙基 | 2 H-四氢吡喃-4-基 | |
| 2.07 | 乙基 | 2 H-四氢吡喃-4-基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|----------------|---|
| 2.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |
| 2.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.10-4.30 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 2.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 2.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 2.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 2.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)二氨基甲基 | |

表 3



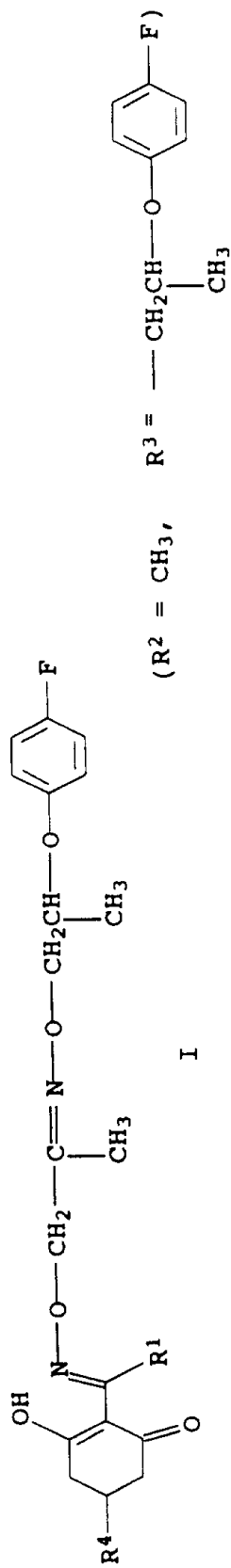
1 3 6 1

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|----------------|--|
| 3.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 3.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 3.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 3.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.20 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 3.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 4.20 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 3.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 3.07 | 乙基 | 2, 4, 6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [ppm]) |
|------|----------------|------------------|--|
| 3.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |
| 3.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.15 (m, 2H), 4.35 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 3.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 3.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 3.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 3.13 | 正丙基 | N-(乙磺基)-N-甲基氨基甲基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|-------------------|--|
| 4.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |
| 4.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.05-4.35 (m, 2H), 6.70-7.10 (m, 3H) [α] _D ²⁵ = -6.8 (c= 1.0; 甲醇) |
| 4.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 4.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 4.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噻唑-5-基 | |
| 4.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基甲基 | |

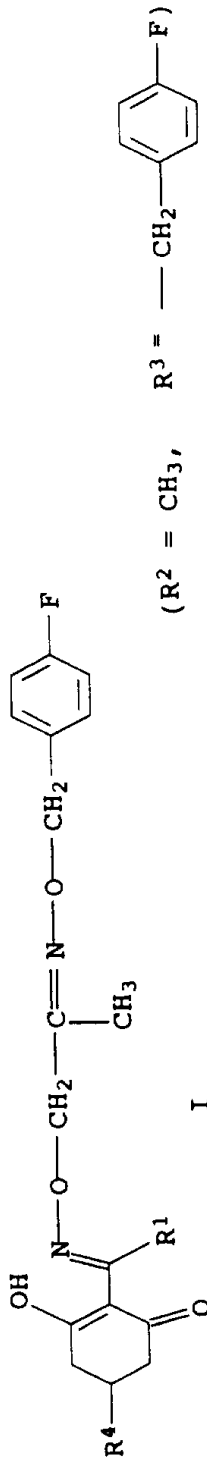
表 5



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|----------------|--|
| 5.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 5.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 5.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 5.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.10-4.30 (m, 2H), 6.85-7.00 (m, 4H) |
| 5.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 4.10-4.30 (m, 2H), 6.85-7.00 (m, 4H) |
| 5.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 5.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 5.08 | 乙基 | 1-甲基硫杂环丙-1-基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|-----------------------|--------------------------------------|
| 5.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.10-4.30 (m, 2H), 6.85-7.00 (m, 4H) |
| 5.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 5.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡啶-5-基 | |
| 5.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噻唑-5-基 | |
| 5.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基 氨基甲基 | |

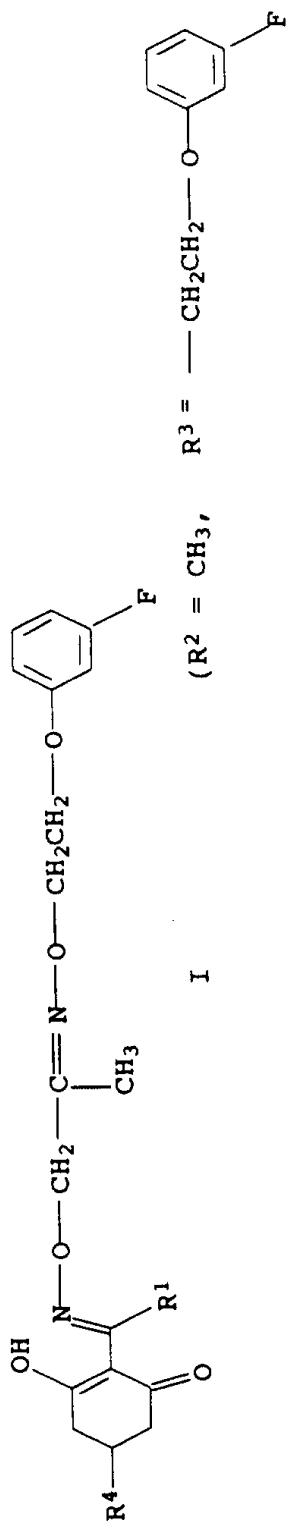
表 6



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|----------------|--|
| 6.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 6.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 6.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 6.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.50 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H) |
| 6.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.05 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H) |
| 6.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 6.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|-----------------------|--|
| 6.08 | 乙基 | 1-甲基硫环丙-1-基 | |
| 6.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.50(s,2H), 5.10(s,2H), 7.05(m,2H), 7.35(m,2H) |
| 6.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 6.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 6.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 6.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 甲基 | |

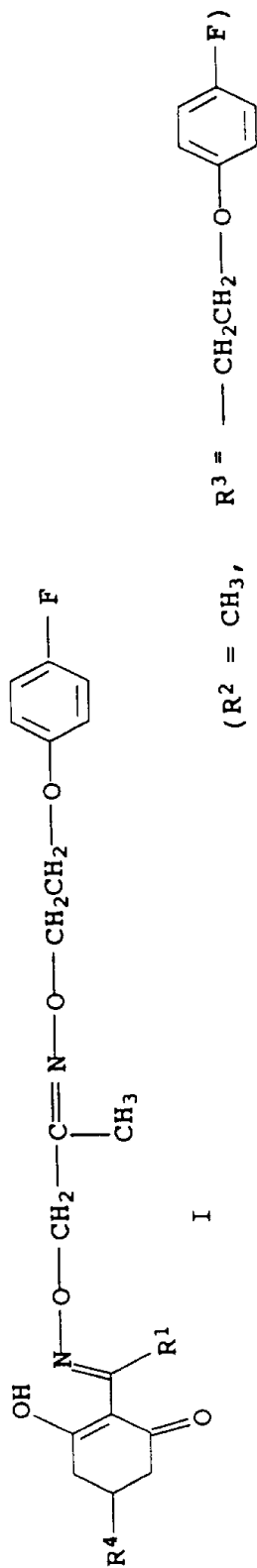
表 7



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (1H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|----------------|--|
| 7.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 4.15-4.25 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H) |
| 7.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 4.15-4.30 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.70-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H) |
| 7.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.15-4.25 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H) |
| 7.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.15-4.25 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H) |
| 7.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 4.15-4.25 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H) |
| 7.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 7.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|---------------------|--|
| 7.08 | 乙基 | 1-甲基硫基环丙-1-基 | |
| 7.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.10-4.25(m, 2H), 4.30-4.45(m, 2H), 6.65-6.80(m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H) |
| 7.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 7.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 7.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 7.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基 甲基 | |

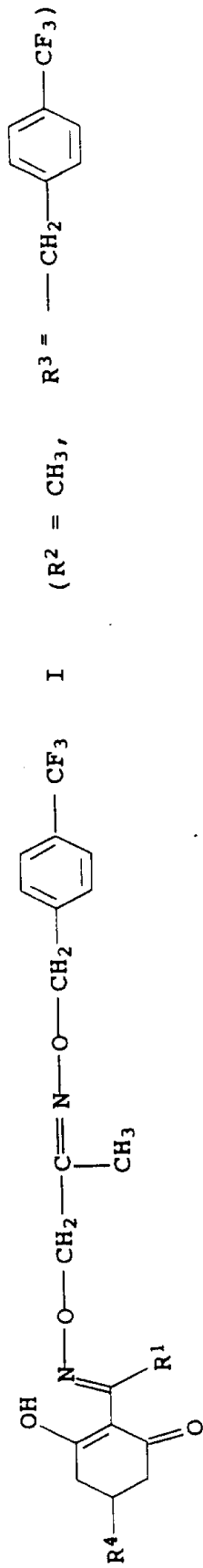
表 8



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (1H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|----------------|---|
| 8.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H) |
| 8.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H) |
| 8.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H) |
| 8.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H) |
| 8.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H) |
| 8.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 8.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|-----------------|---|
| 8.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |
| 8.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H) |
| 8.10 | 乙基 | 2-(4-氧苯硫基)乙基 | |
| 8.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 8.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 8.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 | |

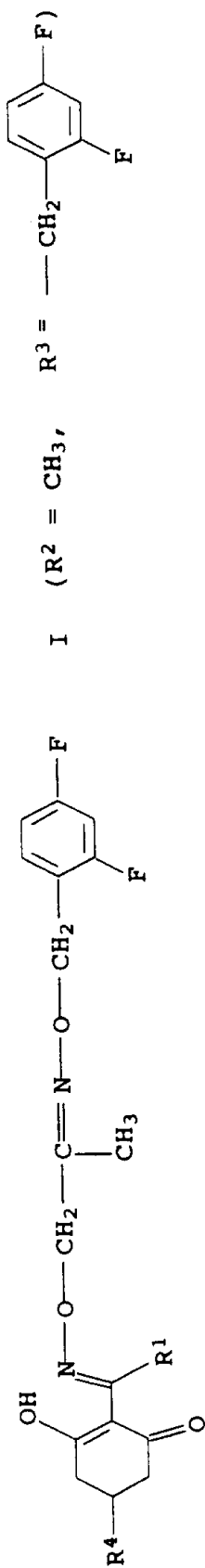
表 9



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|----------------|--|
| 9.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H) |
| 9.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H) |
| 9.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H) |
| 9.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H) |
| 9.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H) |
| 9.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 9.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (1H-NMR [in ppm]) |
|------|----------------|-----------------------|--|
| 9.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |
| 9.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H) |
| 9.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 9.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 9.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 9.13 | 正丙基 | N-(乙磷酰基)-N-甲基氨基 甲基 | |

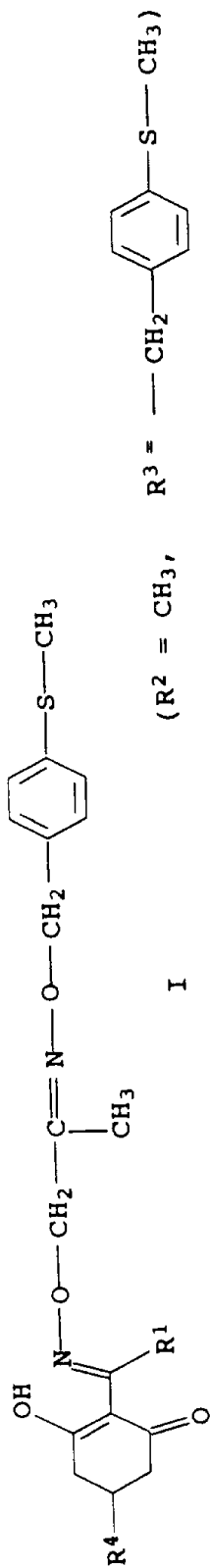
表 10



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (1H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|--|
| 10.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 1H) |
| 10.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 10.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 2H) |
| 10.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 1H) |
| 10.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 1H) |
| 10.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 10.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|-----------------|--|
| 10.08 | 乙基 | 1-甲基硫基环丙-1-基 | |
| 10.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 1H) |
| 10.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 10.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡啶-5-基 | |
| 10.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噻唑-5-基 | |
| 10.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 | |

表 11

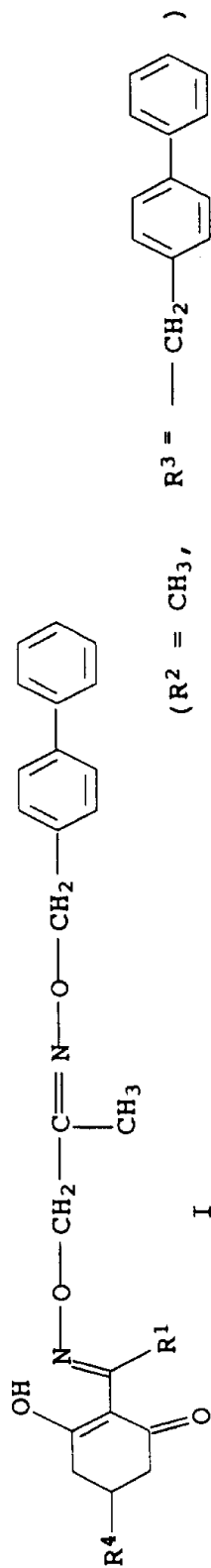


1 5 2 1

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|---|
| 11.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 11.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 11.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 11.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 11.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 11.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 11.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 11.08 | 乙基 | 1-甲基硫杂环丙-1-基 | |
| 11.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.30 (m, 4H) |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|---------------------|-------------------------------------|
| 11.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 11.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 11.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 11.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基 甲基 | |

表 12

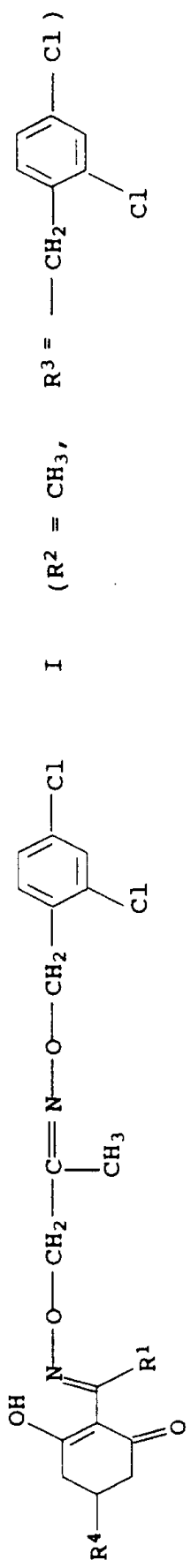


| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|--|
| 12.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.70 (3m, 9H) |
| 12.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 12.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.70 (3m, 9H) |
| 12.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.70 (3m, 9H) |
| 12.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 12.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 12.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 12.08 | 乙基 | 1-甲基硫环丙-1-基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|-----------------|--|
| 12.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.70 (3m, 9H) |
| 12.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 12.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 12.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 12.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|-----------------|---|
| 13.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |
| 13.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.50 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.90-7.40 (m, 9H) |
| 13.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 13.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 13.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噻唑-5-基 | |
| 13.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 | |

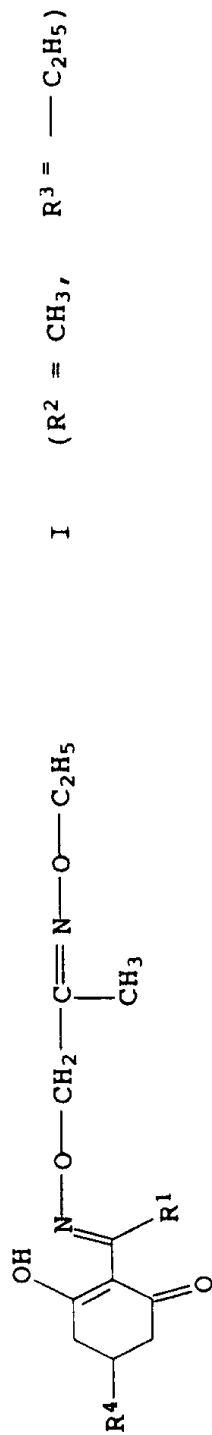
表 14



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|---|
| 14.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H) |
| 14.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 14.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H) |
| 14.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H) |
| 14.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H) |
| 14.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 14.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|-----------------|---|
| 14.08 | 乙基 | 1-甲基硫基环丙-1-基 | |
| 14.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H) |
| 14.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 14.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 14.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噻唑-5-基 | |
| 14.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 | |

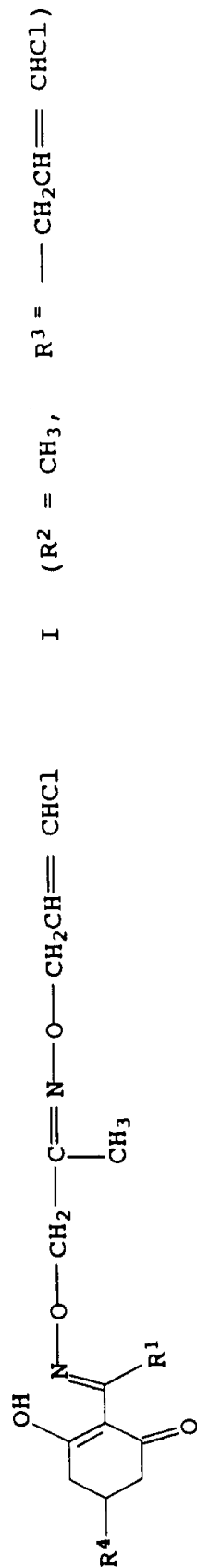
表 15



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|--|
| 15.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 1.90 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H) |
| 15.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 1.90 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H) |
| 15.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 1.90 (s, 3H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H) |
| 15.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 1.90 (s, 3H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H) |
| 15.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 1.90 (s, 3H), 4.00 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H) |
| 15.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 1.90 (s, 3H), 4.00 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H) |
| 15.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|-----------------------|--|
| 15.08 | 乙基 | 1-甲基环丙-1-基 | |
| 15.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 1.90 (s, 3H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H) |
| 15.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 15.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 15.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 15.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 甲基 | |

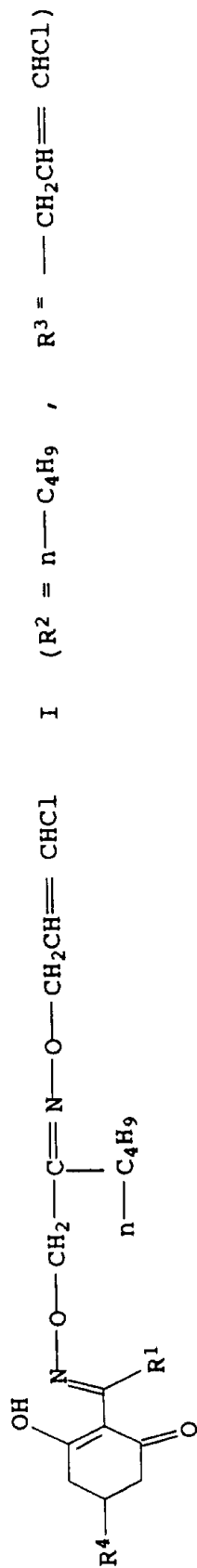
表 16



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (1H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|---|
| 16.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 1.90 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 16.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 1.90 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 4.50 (m, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 16.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 1.90 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 16.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 1.90 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 16.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 1.90 (s, 3H), 4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 16.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 1.90 (s, 3H), 4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 16.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|-----------------------|---|
| 16.08 | 乙基 | 1-甲基环丙-1-基 | |
| 16.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | 1.90 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 16.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 16.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 16.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噻唑-5-基 | |
| 16.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 甲基 | |

表 17

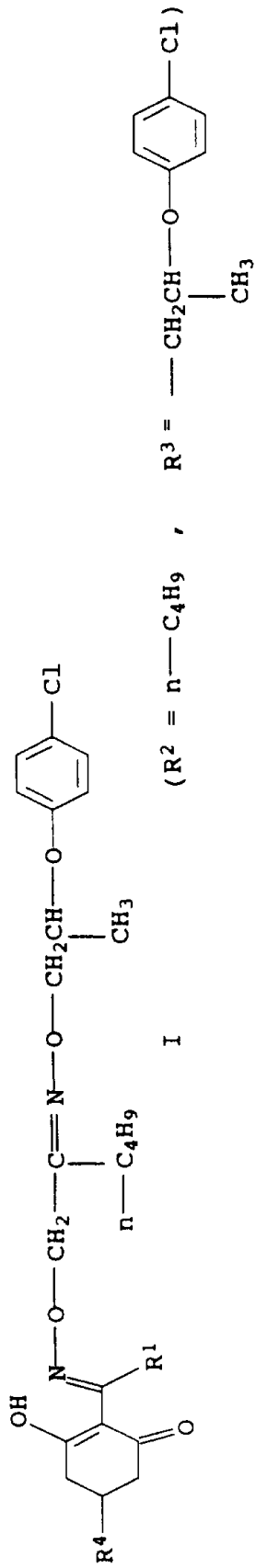


1 0 4 1

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------------|
| 17.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 17.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 17.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 17.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 17.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 17.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) |
| 17.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 17.08 | 乙基 | 1-甲基环丙基 | |
| 17.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|-----------------|-------------------------------------|
| 17.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 17.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 17.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 17.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 | |

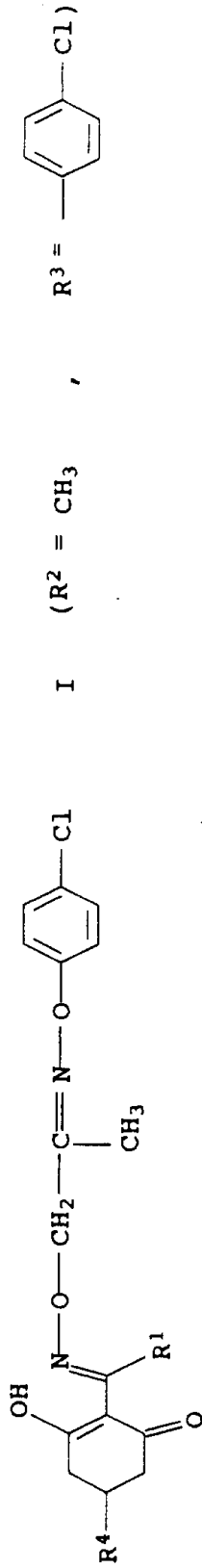
表 18



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|--|
| 18.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 18.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 3.90 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 18.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 18.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 18.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 18.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 4.00 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H) |
| 18.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 18.08 | 乙基 | 1-甲基硫杂环丙-1-基 | |
| 18.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|-----------------|-------------------------------------|
| 18.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 18.11 | 正丙基 | 1,3-二甲苯吡啶-5-基 | |
| 18.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噻唑-5-基 | |
| 18.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基氨基 | |

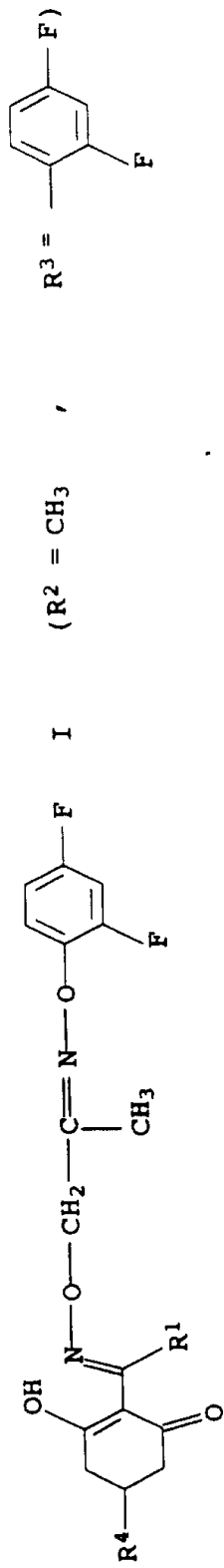
表 19



| No. | R^1 | R^4 | 物理数据 ($^1\text{H-NMR}$ [in ppm]) |
|-------|-------|--------------|--|
| 19.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 19.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 19.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 19.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 0.9-1.0 (m), 1.5-1.8 (m), 1.8-1.9 (m), 2.0-2.15 (m), 2.3-2.6 (m), 7.1-7.3 (m) |
| 19.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 19.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 19.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 19.08 | 乙基 | 1-甲基硫杂环丙-1-基 | |
| 19.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|---------------------|-------------------------------------|
| 19.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 19.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 19.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 19.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基 甲基 | |

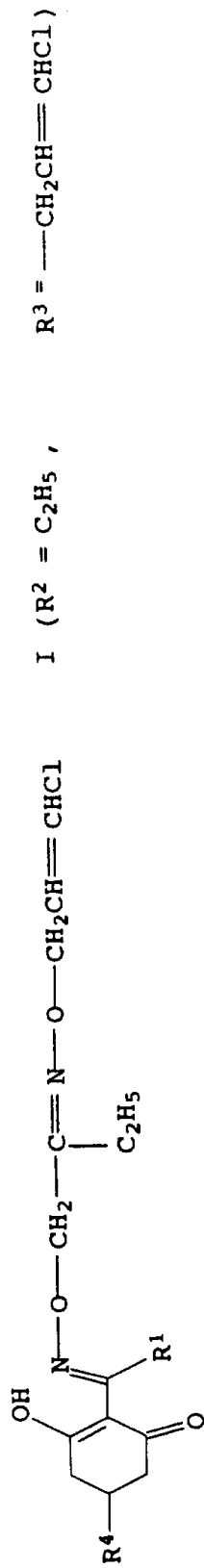
表 20



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------------|
| 20.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 20.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 20.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 20.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 20.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 20.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 20.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 20.08 | 乙基 | 1-甲基硫杂环丙-1-基 | |
| 20.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|---------------------|-------------------------------------|
| 20.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 20.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 20.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 20.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基 甲基 | |

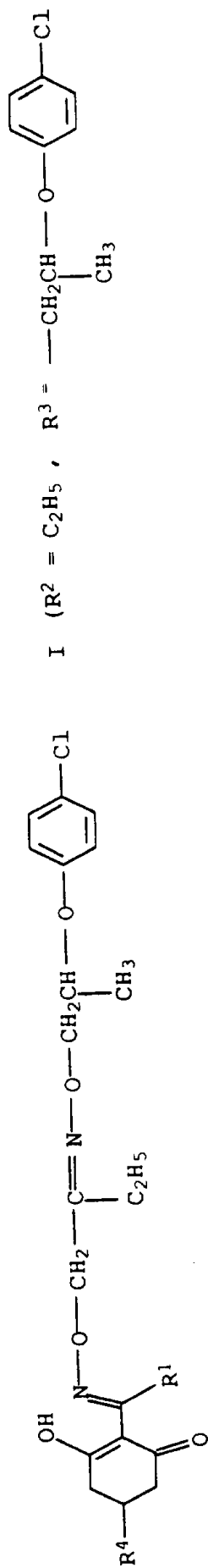
表 21



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|---|
| 21.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 21.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 21.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 21.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 1.0-1.1 (m), 4.45-4.55 (m), 6.0-6.1 (m), 6.3-6.4 (d) |
| 21.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 1.1 (m), 3.4 (m), 4.0 (m), 4.5-4.6 (m), 6.1 (m), 6.35 (d) |
| 21.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 21.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 21.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------------|
| 21.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | |
| 21.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 21.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡啶-5-基 | |
| 21.12 | 正丙基 | 3-异丙基噁唑啉-5-基 | |
| 21.13 | 正丙基 | N-(乙硫基)-N-甲基 | |

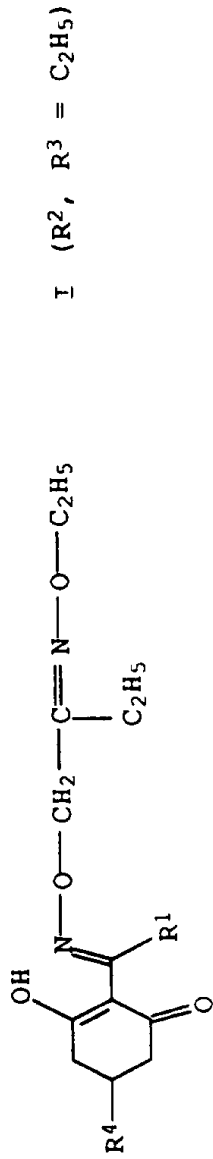
表 22



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|---|
| 22.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 1.1 (m), 1.3 (m), 3.2 (m), 3.35 (m), 3.85-4.0 (m), 6.8-7.25 (m) |
| 22.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | 1.1 (m), 1.6-2.6 (m), 2.8-2.9 (m), 4.0-4.7 (m), 6.8-7.3 (m) |
| 22.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 0.9-1.2 (m), 1.3-2.65 (m), 2.8-2.9 (m), 4.2-4.7 (m), 6.7-7.2 (m) |
| 22.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 1.0-1.15 (m), 1.3-1.5 (m), 1.6-1.7 (m), 1.8-1.9 (m), 2.15-2.6 (m), 2.8-2.9 (m), 3.3-3.4 (m), 3.9-4.7 (m), 6.8-7.2 (m) |
| 22.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 0.9-1.7 (m), 1.8-1.9 (m), 2.2-2.9 (m) |
| 22.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 22.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|---------------------|-------------------------------------|
| 22.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |
| 22.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | |
| 22.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 22.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 22.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 22.13 | 正丙基 | N-(乙磷酰基)-N-甲基 甲基 | |

表 23

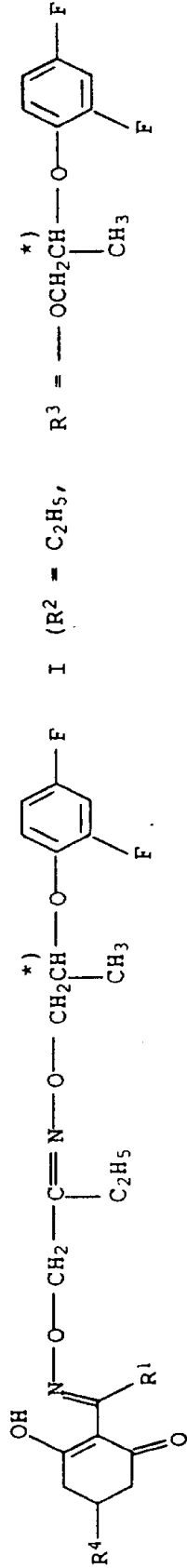


| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (1H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|---|
| 23.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 23.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 23.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | |
| 23.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 0.9-1.3 (m), 1.5-2.6 (m), 2.8-2.9 (m), 4.0-4.2 (m) |
| 23.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 1.1-1.5 (m), 1.6-1.7 (m), 1.8-2.0 (m), 2.2-2.6 (m), 2.8-2.9 (m), 3.3-3.4 (t), 4.0-4.2 (m) |
| 23.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 23.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |
| 23.08 | 乙基 | 1-甲基环丙基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|---------------------------|-------------------------------------|
| 23.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | |
| 23.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 23.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 23.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 23.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基 氨基 甲基 | |

表 24

*1) R-构型



| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|----------------|--|
| 24.01 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 24.02 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-3-基 | |
| 24.03 | 乙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 1.0-1.4 (m), 1.6-2.9 (m), 4.1-4.3 (m), 4.5-4.6 (m), 6.7-7.1 (m) |
| 24.04 | 正丙基 | 2H-四氢噻喃-3-基 | 0.9-1.2 (m), 1.3-1.4 (m), 1.5-2.9 (m), 4.1-4.3 (m), 4.5-4.65 (m), 6.7-7.0 |
| 24.05 | 乙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | 1.0-1.2 (m), 1.3-1.5 (m), 1.6-1.7 (m), 1.8-1.9 (m), 2.15-2.9 (m), 3.3-3.4 (t), 4.0-4.1 (m), 4.1-4.35 (m), 4.5-4.7 (m), 6.7-7.0 (m) |
| 24.06 | 正丙基 | 2H-四氢吡喃-4-基 | |
| 24.07 | 乙基 | 2,4,6-三甲苯基 | |

| No. | R ¹ | R ⁴ | 物理数据 (¹ H-NMR [in ppm]) |
|-------|----------------|---------------------|-------------------------------------|
| 24.08 | 乙基 | 1-甲硫基环丙-1-基 | |
| 24.09 | 正丙基 | 2-(乙硫基)丙-1-基 | |
| 24.10 | 乙基 | 2-(4-氟苯硫基)乙基 | |
| 24.11 | 正丙基 | 1,3-二甲基吡唑-5-基 | |
| 24.12 | 正丙基 | 3-异丙基异噁唑-5-基 | |
| 24.13 | 正丙基 | N-(乙磺酰基)-N-甲基 甲基 | |

应用实施例

用下列温室试验可证明式 I 所示 O—(肟基)乙基环己烯酮肟醚的除草活性:

使用的培养容器是含有以约 3.0% 腐殖土为基底的壤土的塑料花盆。试验植物的种子根据其种类分别撒种。

进行芽前处理时,撒种后直接用细分散喷嘴施用悬浮或乳化于水中的活性化合物。在花盆内浇少许水,以促进发芽和生长,然后用透明塑料膜盖上,直至植物生根。如果没有被活性化合物抑止,覆盖的薄膜能使试验植物均匀发芽。

进行芽后处理时,根据生长方式,先将试验植物培养至 3—15cm 的高度,然后用悬浮或乳化于水中的活性化合物处理。试验植物或者直接在同一培养容器中直接播种并培养,或者首先在一培养容器中培养种子植物、然后在处理前几天移植到试验培养容器中。芽后处理的施用量为 0.25 和 0.125kg/ha 活性物 (a. s.)。

根据植物品种的不同,将植物保持在 10—25℃ 或 20—35℃。试验时间为 2 至 4 周。此间护理植物并评价它们对活性物处理的反应。

分 0—100 等级进行评价。100 表示植物没有出芽或至少地面以上部分被完全破坏,0 表示没有损害或生长正常。

温室试验使用的植物包括以下品种:

| 植物名称 | 普通名 |
|-----------------|------|
| 稗 E. crus-gali | 稗子 |
| 粟 S. italica | 谷子 |
| 大狗尾草 S. faberii | 大狗尾草 |
| 狗尾草 S. viridis | 绿狗尾草 |
| 稻 O. sativa | 稻 |
| 小麦 T. aestivum | 冬小麦 |

结果表明，使用化合物 No. 3.05, 4.01, 4.03 和 9.04, 可以很好地控制作为试验农作物的小麦或水稻中的杂草。