

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07D403/10

[12] 发明专利申请公开说明书

C07D417/10 C07D277/18

C07D233/48 C07D239/14

A01N 43/66 A01N 43/78

A01N 43/80 A01N 43/50

A01N 43/54



[21] 申请号 01816601.6

[43] 公开日 2004 年 1 月 7 日

[11] 公开号 CN1466582A

[22] 申请日 2001.7.17 [21] 申请号 01816601.6

[30] 优先权

[32] 2000.7.29 [33] DE [31] 10037149.3

[86] 国际申请 PCT/EP01/08225 2001.7.17

[87] 国际公布 WO02/10155 德 2002.2.7

[85] 进入国家阶段日期 2003.3.31

[71] 申请人 拜尔农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

[72] 发明人 K. - H. 米勒 S. 赫尔曼恩

D. 霍伊斯辰 S. 勒赫尔

H. - G. 施瓦尔兹 O. 沙尔纳

M. W. 德雷维斯 P. 达赫门

D. 福奇特 R. 庞茨恩

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

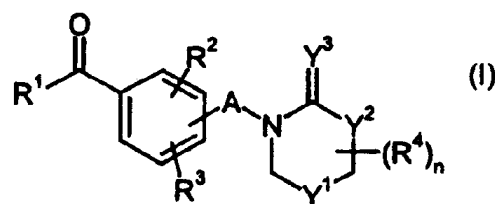
代理人 张元忠 邵 红

权利要求书 15 页 说明书 38 页

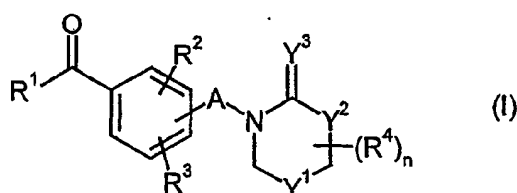
[54] 发明名称 取代的芳基酮和其作为除草剂的用途

[57] 摘要

本发明涉及新的式(I)的取代的芳基酮。本发明还涉及这些化合物的制备方法以及作为除草剂的用途。其中 n, A, R¹, R², R³, R⁴, Y¹, Y² 和 Y³ 如说明书中所述定义。

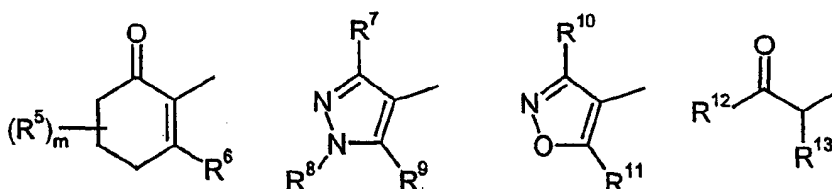


1. 式(I)化合物



5 其中

- n 代表 0, 1, 2, 3 或 4,
 A 代表烷二基(亚烷基),
 R^1 代表下列基团之一



10

其中

- m 代表 0-6,
 R^5 代表卤素或代表各自任选取代的烷基, 烷硫基或芳基或 - 当 m 代表 2 时 - 还任选与第二个 R^5 基团一起代表氧或烷二基(亚烷基),
 R^6 代表羟基, 甲酰氧基, 卤素, 或代表各自任选取代的烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基羧基, 烷氧基羧基, 烷基氨基羧基, 烷基磺酰氧基, 链烯氧基, 炔氧基, 芳氧基, 芳硫基, 芳基亚磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基羧基, 芳基羧基烷氧基, 芳基磺酰氧基, 芳基烷氧基, 芳基烷硫基, 芳烷基亚磺酰基或芳烷基磺酰基,
 R^7 代表氢, 氰基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素, 或代表各自任选取代的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷氧基羧基或环烷基,
 R^8 代表氢或代表各自任选取代的烷基, 烯基, 炔基, 环烷基, 环烷基

15

20

烷基,芳基或芳烷基,

R^9 代表羟基,甲酰氧基或代表各自任选取代的烷氧基,烷基羰氧基,烷氧基羰氧基,烷基氨基羰氧基,烷基磺酰氧基,烯氧基,炔氧基,芳基烷氧基,芳基羰氧基,芳基羰基烷氧基或芳基磺酰氧基,

- 5 R^{10} 代表氢,氰基,氨基甲酰基,硫代氨基甲酰基,卤素或代表各自任选取代的烷基,烷基羰基,烷氧基,烷氧基羰基,烷硫基,烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,

R^{11} 代表氢或代表各自任选取代的烷基或环烷基,

R^{12} 代表氢或代表各自任选取代的烷基或环烷基,和

- 10 R^{13} 代表氢,氰基,氨基甲酰基,卤素,或代表各自任选取代的烷基,烷氧基,烷氧基羰基,烷硫基,烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,

R^2 代表氢,硝基,氰基,羧基,氨基甲酰基,硫代氨基甲酰基,卤素或代表各自任选取代的烷基,烷氧基,烷硫基,烷基亚磺酰基,烷基磺酰基,烷基氨基,二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基,

- 15 R^3 代表氢,硝基,氰基,羧基,氨基甲酰基,硫代氨基甲酰基,卤素或代表各自任选取代的烷基,烷氧基,烷硫基,烷基亚磺酰基,烷基磺酰基,烷基氨基,二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基,和

R^4 代表任选取代的烷基,

- 20 Y^1 代表单键, O (氧), S (硫), N-Z 或任选取代的 (被 R^4 取代的) 烷二基,

Y^2 代表 S (硫) 或 N-Z,

Y^3 代表 N- Y^4 或 C (Y^4 , Y^5) 或 - 当 Y^1 代表 O (氧), S (硫) 或 N-Z 时 - 还代表 O (氧) 或 S (硫),

- 25 Y^4 代表氰基,硝基或代表各自任选取代的烷基羰基,烷基磺酰基,芳基羰基或芳基磺酰基,

Y^5 代表氢,氰基,硝基或代表各自任选取代的烷基羰基,烷基磺酰基,芳基羰基或芳基磺酰基,

Z 代表氢或代表各自任选取代的烷基,烯基或炔基,

- 30 还包括通式 (I) 化合物的所有可能的互变异构体和/或立体异构体和通式 (I) 化合物的盐和酸或碱的加合物。

2. 根据权利要求 1 的式 (I) 化合物,其特征在于

n 代表 0, 1, 2 或 3

A 代表 1-6 个碳原子的烷二基(亚烷基)

R^2 代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素或代表各自任选氰基-, 卤素-, C_1-C_4 -烷氧基-, C_1-C_4 -烷硫基-, C_1-C_4 -烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4 -烷基磺酰基-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基氨基, 二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基,

R^3 代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素或代表各自任选氰基-, 卤素-, C_1-C_4 -烷氧基-, C_1-C_4 -烷硫基-, C_1-C_4 -烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4 -烷基磺酰基-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基氨基, 二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基,

R^4 代表任选氰基-或卤素-取代的 1-6 个碳原子的烷基,

m 代表 0-4,

R^5 代表卤素, 代表各自任选卤素-取代的各自具有 1-6 个碳原子的烷基或烷硫基或代表苯基或 当 m 代表 2 时 还任选与第二个 R^5 基团一起代表氧或具有 3-5 个碳原子的烷二基(亚烷基),

R^6 代表羟基, 甲酰氧基, 卤素, 代表各自任选卤素-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基羧氧基, 烷氧基羧氧基, 烷基氨基羧氧基或烷基磺酰氧基, 代表各自任选卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的烯氧基或炔氧基, 代表各自任选硝基-, 氰基-, 卤素-, C_1-C_4 -烷基-, C_1-C_4 -卤代烷基-, C_1-C_4 -烷氧基-, C_1-C_4 -卤代烷氧基-, C_1-C_4 -烷硫基-, C_1-C_4 -卤代烷硫基-, C_1-C_4 -烷基亚磺酰基-, C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基-, C_1-C_4 -烷基磺酰基-或 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基部分具有 6 或 10 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的芳氧基, 芳硫基, 芳基亚磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基羧氧基, 芳基羧基烷氧基, 芳基磺酰氧基, 芳烷氧基, 芳烷硫基, 芳烷基亚磺酰基或芳烷基磺酰基,

R^7 代表氢, 氰基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素, 代表各自任选卤素取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷氧基羧基, 或代表任选氰基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷基-取代的 3-6 个碳原子的环烷基,

R^8 代表氢, 代表任选氰基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的 1-6 个碳

- 原子的烷基,代表各自任选氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的烯基或炔基,代表各自任选氰基-,卤素-或 C₁-C₄-烷基-取代的各自在环烷基部分具有 3-6 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基,或代表各自任选硝基-,氰基-,卤素-, C₁-C₄-烷基-, C₁-C₄-卤代烷基-, C₁-C₄-烷氧基-, C₁-C₄-卤代烷氧基-, C₁-C₄-烷基硫基-, C₁-C₄-卤代烷基硫基-, C₁-C₄-烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-烷基磺酰基-或 C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基部分具有 6 或 10 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的芳基或芳烷基,
- 5
- 10 R⁹ 代表羟基,甲酰氧基,代表各自任选氰基-,卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷氧基,烷基羰氧基,烷氧基羰氧基,烷基氨基羰氧基或烷基磺酰氧基,代表各自任选氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的烯氧基或炔氧基,或代表各自任选硝基-,氰基-,卤素-, C₁-C₄-烷基-, C₁-C₄-卤代烷基-, C₁-C₄-烷氧基-, C₁-C₄-卤代烷氧基-, C₁-C₄-烷基硫基-, C₁-C₄-卤代烷基硫基-, C₁-C₄-烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-烷基磺酰基-或 C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-取代的在芳基部分具有 6 或 10 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的芳烷氧基,芳基羰氧基,芳基羰基烷氧基或芳基磺酰氧基,
- 15
- 20 R¹⁰ 代表氢,氰基,氨基甲酰基,硫代氨基甲酰基,卤素,或代表各自任选氰基-,卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基,烷基羰基,烷氧基,烷氧基羰基,烷基硫基,烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,
- 25 R¹¹ 代表氢,代表任选氰基-,卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的 1-6 个碳原子的烷基或代表任选氰基-,卤素-或 C₁-C₄-烷基-取代的 3-6 个碳原子的环烷基,
- 30 R¹² 代表氢,代表任选氰基-,卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的 1-6 个碳原子的烷基或代表任选氰基-,卤素-或 C₁-C₄-烷基-取代的 3-6 个碳原子的环烷基,
- R¹³ 代表氢,氰基,氨基甲酰基,卤素,或代表任选各自被氰基-,卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基,烷氧基,烷氧基羰基,烷基硫基,烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,

Y^1 代表单键, O(氧), S(硫), N-Z 或任选取代的(被 R^4 取代的)1-4 个碳原子的烷二基,

Y^4 代表氰基, 硝基, 代表各自任选卤素-取代的各自具有至多 6 个碳原子的烷基羰基或烷基磺酰基, 或代表各自任选硝基-, 氰基-, 卤素-, C_1-C_4 -烷基-, C_1-C_4 -卤代烷基-, C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷氧基-取代的各自具有 6 或 10 个碳原子的芳基羰基或芳基磺酰基,

Y^5 代表氢, 氰基, 硝基, 代表各自任选卤素-取代的各自具有至多 6 个碳原子的烷基羰基或烷基磺酰基, 或代表各自任选硝基-, 氰基-, 卤素-, C_1-C_4 -烷基-, C_1-C_4 -卤代烷基-, C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷氧基-取代的各自具有 6 或 10 个碳原子的芳基羰基或芳基磺酰基,

Z 代表氢, 代表任选氰基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的 1-6 个碳原子的烷基, 或代表各自任选氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的烯基或炔基。

3. 根据权利要求 1 或 2 的式(I)化合物, 其特征在于
n 代表 0, 1 或 2,

A 代表亚甲基, 乙烷-1, 1-二基(亚乙基), 乙烷-1, 2-二基(二亚甲基), 丙烷-1, 1-二基(亚丙基), 丙烷-1, 2-二基, 丙烷-1, 3-二基(三亚甲基), 丁烷-1, 2-二基, 丁烷-1, 3-二基或丁烷-1, 4-二基,

R^2 代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 碘, 或代表各自任选氰基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-, 乙氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 甲基氨基, 乙基氨基, 正或异丙基氨基, 正-, 异-, 仲或叔丁基氨基, 二甲基氨基, 二乙基氨基, 二甲基氨基磺酰基或二乙基氨基磺酰基,

R^3 代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 碘, 或代表各自任选氰基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-, 乙氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基,

正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 甲基氨基, 乙基氨基, 正或异丙基氨基, 正-, 异-, 仲或叔丁基氨基, 二甲基氨基, 二乙基氨基, 二甲基氨基磺酰基或二乙基氨基磺酰基,

- 5 R^4 代表甲基, 乙基, 正或异丙基, 氟甲基, 二氟甲基, 氟甲基, 二氟甲基, 三氟甲基, 氟二氟甲基或氟二氟甲基,

m 代表 0, 1, 2 或 3,

- R^5 代表氟, 氯, 溴, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 10 异-, 仲或叔丁硫基, 或代表苯基或 当 m 代表 2 时 如适合还可与第二个 R^5 基团一起代表氧, 丙烷-1, 3-二基或丁烷-1, 4-二基,

- R^6 代表羟基, 甲酰氧基, 氟, 氯, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 15 基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 乙酰氧基, 丙酰氧基, 正或异丁酰氧基, 甲氧基羰氧基, 乙氧基羰氧基, 正或异丙氧基羰氧基, 甲基氨基羰氧基, 乙基氨基羰氧基, 正或异丙基氨基羰氧基, 甲基磺酰氧基, 乙基磺酰氧基, 正或异丙基磺酰氧基, 代表各自任选氟-, 氯-或溴-取代的丙烯氧基, 丁烯氧基, 丙炔氧基或丁炔氧基, 20 基, 代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基-, 二氟甲氧基-, 三氟甲氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 正或异丙硫基-, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基-, 二氟甲硫基-, 三氟甲硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 正或异丙基亚磺酰基-, 三氟甲 25 基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-, 乙基磺酰基-, 正或异丙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯氧基, 苯硫基, 苯基亚磺酰基, 苯基磺酰基, 苯基羰氧基, 苯基羰基甲氧基, 苯基磺酰氧基, 苯基甲氧基, 苯基甲硫基, 苯基甲基亚磺酰基或苯基甲基磺酰基,

- R^7 代表氢, 氟基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁 30 基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺

酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-取代的环丙基, 环丁基, 环戊基或环己基,

- 5 R^8 代表氢, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-或溴-取代的丙烯基, 丁烯基, 丙炔基或丁炔基, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-取代的环丙基, 环丁基, 环戊基, 环己基, 环丙基甲基, 环丁基甲基, 环戊基甲基或环己基甲基或代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基-, 二氟甲氧基-, 三氟甲氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 正或异丙硫基-, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基-, 二氟甲硫基-, 三氟甲硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 正或异丙基亚磺酰基-, 三氟甲基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-, 乙基磺酰基-, 正或异丙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基, 苄基或苯乙基,
- 10
- 15

- R^9 代表羟基, 甲酰氧基, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-取代的甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 乙酰氧基, 丙酰氧基, 正或异丁酰氧基, 甲氧基羰氧基, 乙氧基羰氧基, 正或异丙氧基羰氧基, 甲基氨基羰氧基, 乙基氨基羰氧基, 正或异丙基氨基羰氧基, 甲基磺酰氧基, 乙基磺酰氧基, 正或异丙基磺酰氧基, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-或溴-取代的丙烯氧基, 丁烯氧基, 丙炔氧基或丁炔氧基, 或代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基-, 二氟甲氧基-, 三氟甲氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 正或异丙硫基-, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基-, 二氟甲硫基-, 三氟甲硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 正或异丙基亚磺酰基-, 三氟甲基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-, 乙基磺酰基-, 正或异丙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基甲氧基, 苯基羰氧基, 苯基羰基甲氧基或苯基磺酰氧基,
- 20
- 25
- 30

R^{10} 代表氢, 氟基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异

丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 乙酰基, 丙酰基, 正或异丁酰基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基,

5 R^{11} 代表氢, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲基-或乙基-取代的环丙基, 环丁基, 环戊基或环己基,

10 R^{12} 代表氢, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲基-或乙基-取代的环丙基, 环丁基, 环戊基或环己基,

R^{13} 代表氢, 氟基, 氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基,

15 Y^1 代表单键, O(氧), S(硫), N-Z, 亚甲基或二亚甲基(乙烷-1, 2-二基),

20 Y^4 代表氟基, 硝基, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的乙酰基, 丙酰基, 正或异丁酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 或代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯甲酰基或苯基磺酰基,

25 Y^5 代表氢, 氟基, 硝基, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的乙酰基, 丙酰基, 正或异丁酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 或代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯甲酰基或苯基磺酰基,

30 Z 代表氢, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-或溴-取代的丙烯基, 丁烯基, 丙炔基或丁炔基,

4. 根据权利要求 1 至 3 中任一项的式 (I) 化合物, 其特征在于

n 代表 0,

A 代表亚甲基或乙烷-1, 2-二基(二亚甲基),

5 R^2 代表氢, 硝基, 氰基, 氟, 氯, 溴, 碘, 甲基, 乙基, 正或异丙基, 二氟甲基, 三氟甲基, 二氯甲基, 三氯甲基, 甲氧基甲基, 甲硫基甲基, 甲基亚磺酰基甲基, 甲基磺酰基甲基, 甲氧基, 乙氧基, 二氟甲氧基, 三氟甲氧基, 甲硫基, 乙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基或二甲基氨基磺酰基,

10 R^3 代表氢, 硝基, 氰基, 氟, 氯, 溴, 碘, 甲基, 乙基, 二氟甲基, 三氟甲基, 二氯甲基, 三氯甲基, 甲氧基甲基, 甲硫基甲基, 甲基亚磺酰基甲基, 甲基磺酰基甲基, 甲氧基, 乙氧基, 二氟甲氧基, 三氟甲氧基, 甲硫基, 乙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基或二甲基氨基磺酰基,

m 代表 0, 1 或 2,

15 R^5 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 或代表苯基或 当 m 代表 2 时 如适合还可与第二个 R^5 基团一起代表丙烷-1, 3-二基或丁烷-1, 4-二基,

20 R^6 代表羟基, 代表甲酰氧基, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 乙酰氧基, 丙酰氧基, 正或异丁酰氧基, 甲氧基羰氧基, 乙氧基羰氧基, 正或异丙氧基羰氧基, 甲基氨基羰氧基, 乙基氨基羰氧基, 正或异丙基氨基羰氧基, 甲基磺酰氧基, 乙基磺酰氧基, 正或异丙基磺酰氧基, 代表各自任选氟-或氯-取代的丙烯氧基, 丁烯氧基, 丙炔氧基或丁炔氧基, 代表各自任选硝基-, 氰基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯氧基, 苯硫基, 苯基亚磺酰基, 苯基磺酰基, 苯基羰氧基, 苯基羰基甲氧基, 苯基磺酰氧基, 苯基甲氧基, 苯基甲硫基, 苯甲基亚磺酰基或苯甲基磺酰基,

30 R^7 代表氢, 氰基, 氟, 氯, 溴, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基

磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 或代表任选氟基-, 氯-, 溴-或甲基-取代的环丙基,

5 R^8 代表氢, 代表各自任选氟基-, 氯-, 溴-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 代表各自任选氟-或氯-取代的丙烯基, 丁烯基, 丙炔基或丁炔基, 代表各自任选氟-, 氯-, 甲
基-或乙基-取代的环丙基, 或代表各自任选氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-,
正或异丙基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 二氟甲氧
基-或三氟甲氧基-取代的苯基或苄基,

10 R^9 代表羟基, 代表甲酰氧基, 代表各自任选氟基-, 氯-, 溴-, 甲氧基
-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-取代的甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 乙
氧基, 丙酰氧基, 正或异丁酰氧基, 甲氧基羰氧基, 乙氧基羰氧基, 正或
异丙氧基羰氧基, 甲基氨基羰氧基, 乙基氨基羰氧基, 正或异丙基氨基
羰氧基, 甲基磺酰氧基, 乙基磺酰氧基, 正或异丙基磺酰氧基, 代表各自
15 任选氟-或氯-取代的丙烯氧基, 丁烯氧基, 丙炔氧基或丁炔氧基, 或代
表各自任选硝基-, 氟基-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 三
氟甲基-, 甲氧基, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 二氟甲氧基-或三氟甲氧基
-取代的苯基甲氧基, 苯基羰氧基, 苯基羰基甲氧基或苯基磺酰氧基,

20 R^{10} 代表氢, 氟基, 氯, 氯, 溴, 或代表各自任选氟-, 氯-, 甲氧基-或
乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 乙酰基, 丙酰基, 正或异丁酰基,
甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧
基羰基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基,
甲基磺酰基或乙基磺酰基,

25 R^{11} 代表氢, 代表各自任选氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基,
乙基, 正或异丙基, 或代表任选氟-, 氯-, 甲基-或乙基-取代的环丙基,
 R^{12} 代表氢, 代表各自任选氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基,
乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 或代表任选氟基-, 氯-, 氯-,
甲基-或乙基-取代的环丙基,

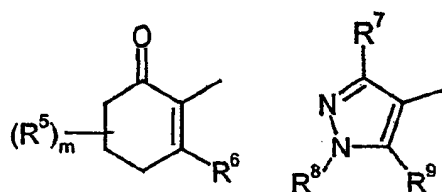
30 R^{13} 代表氢, 氟基, 氯, 氯, 溴, 或代表各自任选氟-, 氯-, 甲氧基-或
乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基,
甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异
丙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰
基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基,

Y^1 代表单键, O (氧), CH_2 (亚甲基) 或 N-Z,

Y^3 代表 N- Y^4 或 当 Y^1 代表 O (氧), S (硫) 或 N-Z 时 还代表 O (氧) 或 S (硫), 以及

Z 代表氢, 甲基, 乙基, 正或异丙基。

- 5 5. 根据权利要求 1 至 4 中任一项的式 (I) 化合物, 其特征在于
 R^1 代表下列基团之一

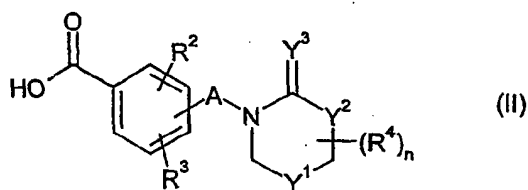


- 10 6. 根据权利要求 1 至 5 中任一项的式 (I) 化合物, 其特征在于
 Y^3 代表 N-CN 或 当 Y^1 代表 O, S 或 N-Z 时 还代表 O (氧)。

7. 根据权利要求 1 至 6 中任一项的式 (I) 化合物, 其特征在于
 Y^3 代表 N-CN。

8. 式 (I) 化合物的制备方法, 其特征在于

- 15 (a) 如适合存在脱水剂, 如适合存在一种或多种反应助剂, 以及如
 适合存在一种或多种稀释剂的条件下
 将式 (II) 的取代的苯甲酸或它的活性衍生物,



其中

- 20 n, A, R^2 , R^3 , R^4 , Y^1 , Y^2 和 Y^3 如权利要求 1 所述定义,
 与通式 (III) 化合物反应获得



其中

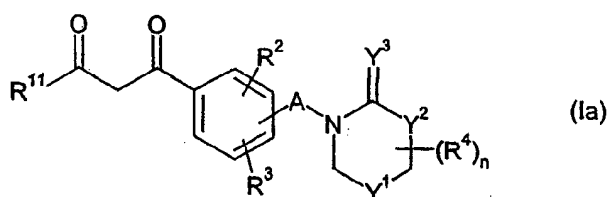
R^1 如权利要求 1 所述定义,

或

(b) 如适合存在一种或多种反应助剂和如适合存在一种或多种稀

5 释剂的条件下

将通式 (I a) 的取代苯甲酰酮



其中

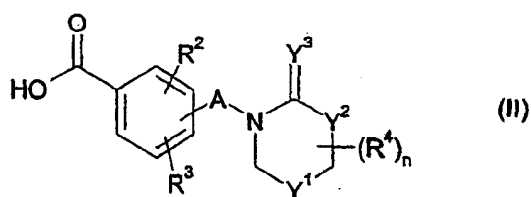
10 $n, A, R^2, R^3, R^4, R^{11}, Y^1, Y^2$ 和 Y^3 如权利要求 1 所述定义,

与原甲酸酯或与 N,N-二甲基甲酰胺缩醛或与氰基甲酸酯或与二硫化碳和烷基化剂一起反应, 然后与羟基胺或其酸加合物反应获得

和, 如适合, 在方法 (a) 或 (b) 完成之后, 将如上所述制备的通式 (I) 化合物进行取代, 氧化或还原反应和/或通过常规方法将通式 (I) 化合

15 物转化为盐类化合物。

9. 式 (II) 化合物



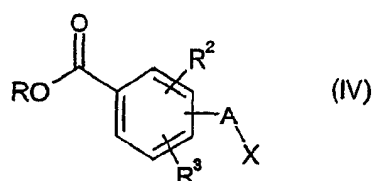
其中

20 $n, A, R^2, R^3, R^4, Y^1, Y^2$ 和 Y^3 如权利要求 1 所述定义。

10. 权利要求 9 的式 (II) 化合物的制备方法, 其特征在于

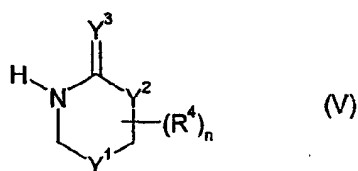
(α) 在 0℃ 至 100℃, 如适合存在酸性接受体和如适合存在稀释剂的条件下,

将通式 (IV) 的卤代烷基苯甲酸酯



其中

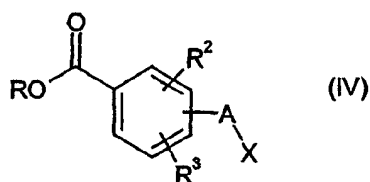
- 5 A, R² 和 R³ 如权利要求 1 所述定义,
 R 代表烷基, 和
 X 代表卤素或烷基磺酰氧基,
 与通式 (V) 化合物反应获得



10 其中

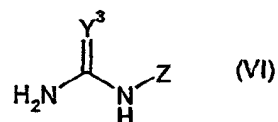
- n, R⁴, Y¹, Y² 和 Y³ 如权利要求 1 所述定义,
 或
 当在式 (II) 化合物, 其中 Y¹ 代表 O (氧) 或 N-Z 和 Y² 代表 N-Z 的情
 况下

15 (β) 在 0℃ 至 100℃, 如适合存在酸性接受体和如适合存在稀释剂
 条件下,
 第一步将通式 (IV) 的卤代烷基苯甲酸酯



20 其中

A, R, R², R³ 和 X 如权利要求 1 和 10 所述定义
与通式 (VI) 化合物反应

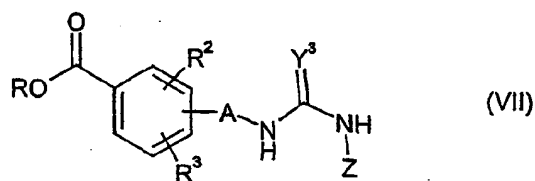


5 其中

Y³ 和 Z 如权利要求 1 所述定义,
并在 0℃ 至 150℃, 如适合存在反应助剂和如适合存在一种或多种
稀释剂的条件下,

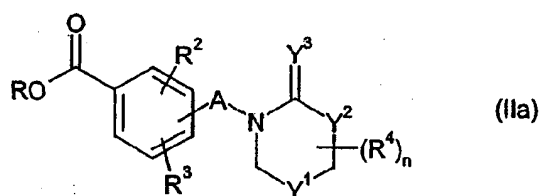
将这里生成的通式 (VII) 的脲烷基苯甲酸酯

10



其中

A, R, R², R³, Y³ 和 Z 如权利要求 1 所述定义,
与甲醛或低聚甲醛反应, 并且如适合还可与通式 H₂N-Z 的胺反应,
15 和, 如适合, 将根据两种不同的方法 (α) 或 (β) 获得的通式 (II a)
的取代的苯甲酸酯



其中

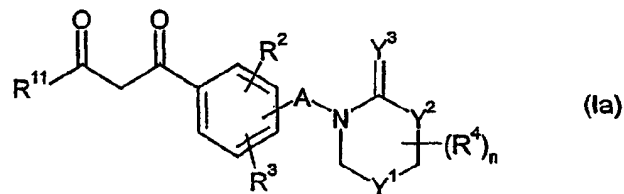
20 n, A, R², R³, R⁴, Y¹, Y² 和 Y³ 如权利要求 1 所述定义,
以及

R 代表烷基,

通过常规方法水解,和在 0℃至 100℃,如适合存在一种或多种稀释剂的条件下反应。

11. 式 (I a) 化合物

5



其中

n , A, R^2 , R^3 , R^4 , R^{11} , Y^1 , Y^2 和 Y^3 如权利要求 1 所述定义。

12. 除草组合物,其特征在于含有至少一种权利要求 1 的式 (I) 化合物。

13. 一种或多种权利要求 1 的式 (I) 化合物防治杂草的应用。

14. 防治杂草的方法,其特征在于将至少一种权利要求 1 的式 (I) 化合物施用至杂草和/或它们的生长环境。

15. 权利要求 12 的组合物防治杂草的应用。

取代的芳基酮和其作为除草剂的用途

本发明涉及新的取代的芳基酮, 它们的制备方法和其作为除草剂
5 的用途。

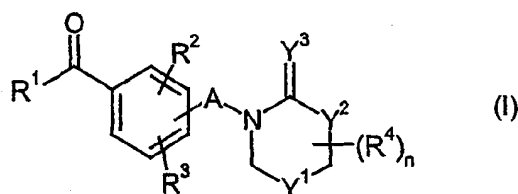
已知某些取代的芳基酮具有除草活性(参见

EP-A-090 262, EP-A-135 191, EP-A-186 118, EP-A-186 119, EP-A-186 120, EP-A-319 075, EP-A-352 543, EP-A-418 175, EP-A-487 357, EP-A-527 036, EP-A-527 037, EP-A-560 483, EP-A-609 797, EP-A-609 798, EP-A-625 505, EP-A-625 508, EP-A-636 622, US-A-5 804 532, US-A-5 834 402, US-A-5 846 906, US-A-5 863 865, WO-A-96/26192, WO-A-96/26193, WO-A-96/26200, WO-A-96/26206, WO-A-97/27187, WO-A-97/35850, WO-A-97/41105, WO-A-97/41116, WO-A-97/41117, WO-A-97/41118, WO-A-97/43270, WO-A-97/46530, WO-A-98/28981, WO-A-98/31681, WO-A-98/31682, WO-A-99/03856, WO-A-99/07688, WO-A-99/10327, WO-A-99/10328, WO-A-00/05221

)。然而, 这些化合物的效果不能在所有方面都令人满意。

现已发现新的式(I)的取代的芳基酮

10



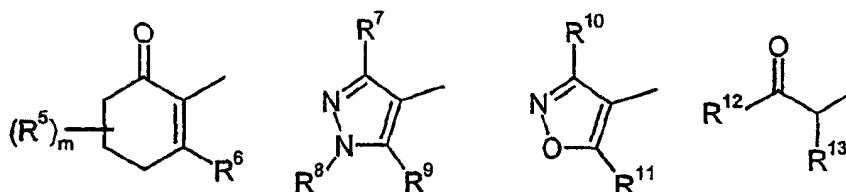
其中

n 代表 0, 1, 2, 3 或 4,

A 代表烷二基(亚烷基),

15

R¹ 代表下列基团之一



其中

m 代表 0-6,

R^5 代表卤素或代表各自任选取代的烷基, 烷硫基或芳基或 - 当 m 代表 2 时 - 还任选与第二个 R^5 基团一起代表氧或烷二基(亚烷基),

5 R^6 代表羟基, 甲酰氧基, 卤素, 或代表各自任选取代的烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基羰氧基, 烷氧基羰氧基, 烷基氨基羰氧基, 烷基磺酰氧基, 烯氧基, 炔氧基, 芳氧基, 芳硫基, 芳基亚磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基羰氧基, 芳基羰基烷氧基, 芳基磺酰氧基, 芳基烷氧基, 芳基烷硫基, 芳烷基亚磺酰基或芳烷基磺酰基,

10 R^7 代表氢, 氰基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素, 或代表各自任选取代的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷氧基羰基或环烷基,

R^8 代表氢或代表各自任选取代的烷基, 烯基, 炔基, 环烷基, 环烷基烷基, 芳基或芳烷基,

15 R^9 代表羟基, 甲酰氧基或代表各自任选取代的烷氧基, 烷基羰氧基, 烷氧基羰氧基, 烷基氨基羰氧基, 烷基磺酰氧基, 烯氧基, 炔氧基, 芳基烷氧基, 芳基羰氧基, 芳基羰基烷氧基或芳基磺酰氧基,

R^{10} 代表氢, 氰基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素或代表各自任选取代的烷基, 烷基羰基, 烷氧基, 烷氧基羰基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,

R^{11} 代表氢或代表各自任选取代的烷基或环烷基,

R^{12} 代表氢或代表各自任选取代的烷基或环烷基, 和

R^{13} 代表氢, 氰基, 氨基甲酰基, 卤素, 或代表各自任选取代的烷基, 烷氧基, 烷氧基羰基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,

25 R^1 代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素或代表各自任选取代的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基氨基, 二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基,

R^3 代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素或代表各自任选取代的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基氨基, 二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基, 和

R^4 代表任选取代的烷基,

Y^1 代表单键, O(氧), S(硫), N-Z 或任选取代的(被 R^4 取代的)烷二

基,

Y^2 代表 S(硫)或 N-Z,

Y^3 代表 N- Y^4 或 C(Y^4 , Y^5) 或 - 当 Y^1 代表 O(氧), S(硫)或 N-Z 时 - 还代表 O(氧)或 S(硫),

5 Y^4 代表氰基, 硝基或代表各自任选取代的烷基羰基, 烷基磺酰基, 芳基羰基或芳基磺酰基,

Y^5 代表氢, 氰基, 硝基或代表各自任选取代的烷基羰基, 烷基磺酰基, 芳基羰基或芳基磺酰基,

Z 代表氢或代表各自任选取代的烷基, 烯基或炔基,

10 还包括通式(I)化合物的所有可能的互变异构体和/或立体异构体和通式(I)化合物的盐和酸或碱的加合物。

上述定义中, 烃链如烷基或烷二基 - 还可如烷氧基一样, 与杂原子连接 - 它们各自可以为直链或支链。

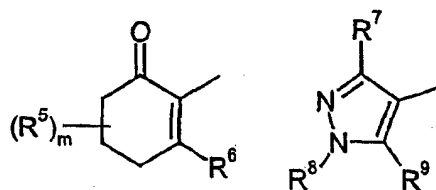
当通式化合物可以存在各种立体异构体时, 本发明还包括各种情
15 况下可能的立体异构体。

上下文中所述结构式中给出的基团的优选取代基和优选范围定义如下。

n 优选代表 0, 1, 2 或 3

A 优选代表 1-6 个碳原子的烷二基(亚烷基)

20 R^1 优选代表下列基团之一



R^2 优选代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素或代表各自任选氰基-, 卤素-, C_1 - C_4 -烷氧基-, C_1 - C_4 -烷硫基-, C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基-或 C_1 - C_4 -烷基磺酰基-取代的各自在烷基部分具有 1-6
25 个碳原子的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基氨基, 二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基,

R^3 优选代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤

素或代表各自任选氰基-, 卤素-, C₁-C₄-烷氧基-, C₁-C₄-烷硫基-, C₁-C₄-烷基亚磺酰基-或 C₁-C₄-烷基磺酰基-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基氨基, 二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基,

- 5 R⁴ 优选代表任选氰基-或卤素-取代的 1-6 个碳原子的烷基,
m 优选代表 0-4,

R⁵ 优选代表卤素, 代表各自任选卤素-取代的各自具有 1-6 个碳原子的烷基或烷硫基或代表苯基或 当 m 代表 2 时 还任选与第二个 R⁵ 基团一起代表氧或具有 3-5 个碳原子的烷二基(亚烷基),

- 10 R⁶ 优选代表羟基, 甲酰氧基, 卤素, 代表各自任选卤素-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷基羰氧基, 烷氧基羰氧基, 烷基氨基羰氧基或烷基磺酰氧基, 代表各自任选卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的烯氧基或炔氧基, 代表各自任选硝基-, 氰基-, 卤素-, C₁-C₄-烷基-, C₁-C₄-卤代烷基-, C₁-C₄-烷氧基-, C₁-C₄-卤代烷氧基-, C₁-C₄-烷硫基-, C₁-C₄-卤代烷硫基-, C₁-C₄-烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-烷基磺酰基-或 C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基部分具有 6 或 10 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的芳氧基, 芳硫基, 芳基亚磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基羰氧基, 芳基羰基烷氧基, 芳基磺酰氧基, 芳烷氧基, 芳烷硫基, 芳烷基亚磺酰基或芳烷基磺酰基,
- 15 C₁-C₄-烷氧基-, C₁-C₄-卤代烷氧基-, C₁-C₄-烷硫基-, C₁-C₄-卤代烷硫基-, C₁-C₄-烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-烷基磺酰基-或 C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基部分具有 6 或 10 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的芳氧基, 芳硫基, 芳基亚磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基羰氧基, 芳基羰基烷氧基, 芳基磺酰氧基, 芳烷氧基, 芳烷硫基, 芳烷基亚磺酰基或芳烷基磺酰基,
- 20 R⁷ 优选代表氢, 氰基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素, 代表各自任选卤素取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 烷氧基羰基, 或代表任选氰基-, 卤素-或 C₁-C₄-烷基-取代的 3-6 个碳原子的环烷基,

- 25 R⁸ 优选代表氢, 代表任选氰基-, 卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的 1-6 个碳原子的烷基, 代表各自任选氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的烯基或炔基, 代表各自任选氰基-, 卤素-或 C₁-C₄-烷基-取代的各自在环烷基部分具有 3-6 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基, 或代表各自任选硝基-, 氰基-, 卤素-, C₁-C₄-烷基-, C₁-C₄-卤代烷基-, C₁-C₄-烷氧基-, C₁-C₄-卤代烷氧基-, C₁-C₄-烷硫基-, C₁-C₄-卤代烷硫基-, C₁-C₄-烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-, C₁-C₄-烷基磺酰基-或 C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-取代
- 30

的各自在芳基部分具有 6 或 10 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的芳基或芳烷基,

- 5 R^9 优选代表羟基, 甲酰氧基, 代表各自任选氟基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷氧基, 烷基羰氧基, 烷氧基羰氧基, 烷基氨基羰氧基或烷基磺酰氧基, 代表各自任选氟基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的烯氧基或炔氧基, 或代表各自任选硝基-, 氟基-, 卤素-, C_1-C_4 -烷基-, C_1-C_4 -卤代烷基-, C_1-C_4 -烷氧基-, C_1-C_4 -卤代烷氧基-, C_1-C_4 -烷硫基-, C_1-C_4 -卤代烷硫基-, C_1-C_4 -烷基亚磺酰基-, C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基-, C_1-C_4 -烷基磺酰基-或
- 10 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基-取代的在芳基部分具有 6 或 10 个碳原子和如适合烷基部分具有 1-4 个碳原子的芳烷氧基, 芳基羰氧基, 芳基羰基烷氧基或芳基磺酰氧基,

- R^{10} 优选代表氢, 氟基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 卤素, 或代表各自任选氟基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的各自在烷基部分具有 1-
- 15 6 个碳原子的烷基, 烷基羰基, 烷氧基, 烷氧基羰基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,

R^{11} 优选代表氢, 代表任选氟基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的 1-6 个碳原子的烷基或代表任选氟基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷基-取代的 3-6 个碳原子的环烷基,

- 20 R^{12} 优选代表氢, 代表任选氟基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的 1-6 个碳原子的烷基或代表任选氟基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷基-取代的 3-6 个碳原子的环烷基,

- R^{13} 优选代表氢, 氟基, 氨基甲酰基, 卤素, 或代表任选各自被氟基-, 卤素-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的各自在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基,
- 25 烷氧基, 烷氧基羰基, 烷硫基, 烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,

Y^1 优选代表单键, O(氧), S(硫), N-Z 或任选取代的(被 R^4 取代的) 1-4 个碳原子的烷二基,

Y^3 优选代表 N- Y^4 或 当 Y^1 代表 O(氧), S(硫)或 N-Z 时 还代表 O(氧)或 S(硫),

- 30 Y^4 优选代表氟基, 硝基, 代表各自任选卤素-取代的各自具有至多 6 个碳原子的烷基羰基或烷基磺酰基, 或代表各自任选硝基-, 氟基-, 卤素-, C_1-C_4 -烷基-, C_1-C_4 -卤代烷基-, C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷氧基

基-取代的各自具有 6 或 10 个碳原子的芳基羰基或芳基磺酰基,

Y⁵ 优选代表氢, 氰基, 硝基, 代表各自任选卤素-取代的各自具有至多 6 个碳原子的烷基羰基或烷基磺酰基, 或代表各自任选硝基-, 氰基-, 卤素-, C₁-C₄-烷基-, C₁-C₄-卤代烷基-, C₁-C₄-烷氧基-或 C₁-C₄-卤代烷氧基-取代的各自具有 6 或 10 个碳原子的芳基羰基或芳基磺酰基,

Z 优选代表氢, 代表任选氰基-, 卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的 1-6 个碳原子的烷基, 或代表各自任选氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的烯基或炔基,

n 特别优选代表 0, 1 或 2

10 A 特别优选代表亚甲基, 乙烷-1, 1-二基(亚乙基), 乙烷-1, 2-二基(二亚甲基), 丙烷-1, 1-二基(亚丙基), 丙烷-1, 2-二基, 丙烷-1, 3-二基(三亚甲基), 丁烷-1, 2-二基, 丁烷-1, 3-二基或丁烷-1, 4-二基,

R² 特别优选代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 碘, 或代表各自任选氰基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-, 乙氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 甲基氨基, 乙基氨基, 正或异丙基氨基, 正-, 异-, 仲或叔丁基氨基, 二甲基氨基, 二乙基氨基, 二甲基氨基磺酰基或二乙基氨基磺酰基,

R³ 特别优选代表氢, 硝基, 氰基, 羧基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 碘, 或代表各自任选氰基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-, 乙氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 甲基氨基, 乙基氨基, 正或异丙基氨基, 正-, 异-, 仲或叔丁基氨基, 二甲基氨基, 二乙基氨基, 二甲基氨基磺酰基或二乙基氨基磺酰基,

30 R⁴ 特别优选代表甲基, 乙基, 正或异丙基, 氟甲基, 二氟甲基, 氟甲基, 二氟甲基, 三氟甲基, 氯二氟甲基或氟二氯甲基,

m 特别优选代表 0, 1, 2 或 3,

R⁵ 特别优选代表氟, 氯, 溴, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 或代表苯基或 当 m 代表 2 时 如适合还可与第二个 R⁵ 基团一起代表氧, 丙烷-1, 3-二基或丁烷-1, 4-二基,

R⁶ 特别优选代表羟基, 甲酰氧基, 氟, 氯, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 乙基磺酰基, 丙基磺酰基, 正或异丁基磺酰基, 甲氧基羰氧基, 乙氧基羰氧基, 正或异丙氧基羰氧基, 甲基氨基羰氧基, 乙基氨基羰氧基, 正或异丙基氨基羰氧基, 甲基磺酰氧基, 乙基磺酰氧基, 正或异丙基磺酰氧基, 代表各自任选氟-, 氯-或溴-取代的丙烯氧基, 丁烯氧基, 丙炔氧基或丁炔氧基, 代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基-, 二氟甲氧基-, 三氟甲氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 正或异丙硫基-, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基-, 二氟甲硫基-, 三氟甲硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 正或异丙基亚磺酰基-, 三氟甲基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-, 乙基磺酰基-, 正或异丙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯氧基, 苯硫基, 苯基亚磺酰基, 苯基磺酰基, 苯基羰氧基, 苯基羰基甲氧基, 苯基磺酰氧基, 苯基甲氧基, 苯基甲硫基, 苯基甲基亚磺酰基或苯基甲基磺酰基,

R⁷ 特别优选代表氢, 氟基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-取代的环丙基, 环丁基, 环戊基或环己基,

R⁸ 特别优选代表氢, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 代表各自任

- 选氟基-, 氟-, 氯-或溴-取代的丙烯基, 丁烯基, 丙炔基或丁炔基, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-取代的环丙基, 环丁基, 环戊基, 环己基, 环丙基甲基, 环丁基甲基, 环戊基甲基或环己基甲基或代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基-, 二氟甲氧基-, 三氟甲氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 正或异丙硫基-, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基-, 二氟甲硫基-, 三氟甲硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 正或异丙基亚磺酰基-, 三氟甲基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-, 乙基磺酰基-, 正或异丙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基, 苄基或苯乙基,

- R^9 特别优选代表羟基, 甲酰氧基, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-取代的甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 乙酰氧基, 丙酰氧基, 正或异丁酰氧基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 甲基氨基羰基, 乙基氨基羰基, 正或异丙基氨基羰基, 甲基磺酰氧基, 乙基磺酰氧基, 正或异丙基磺酰氧基, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-或溴-取代的丙烯氧基, 丁烯氧基, 丙炔氧基或丁炔氧基, 或代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基-, 二氟甲氧基-, 三氟甲氧基-, 甲硫基-, 乙硫基-, 正或异丙硫基-, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基-, 二氟甲硫基-, 三氟甲硫基-, 甲基亚磺酰基-, 乙基亚磺酰基-, 正或异丙基亚磺酰基-, 三氟甲基亚磺酰基-, 甲基磺酰基-, 乙基磺酰基-, 正或异丙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基甲氧基, 苯基羰基, 苯基羰基甲氧基或苯基磺酰氧基,

- R^{10} 特别优选代表氢, 氟基, 氨基甲酰基, 硫代氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 乙酰基, 丙酰基, 正或异丁酰基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基,

R^{11} 特别优选代表氢, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙

氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲基-或乙基-取代的环丙基, 环丁基, 环戊基或环己基,

- 5 R^{12} 特别优选代表氢, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲基-或乙基-取代的环丙基, 环丁基, 环戊基或环己基,

- 10 R^{13} 特别优选代表氢, 氟基, 氨基甲酰基, 氟, 氯, 溴, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 正-, 异-, 仲或叔丁氧基, 甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 正或异丙氧基羰基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 正-, 异-, 仲或叔丁硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基,

- 15 Y^1 特别优选代表单键, O(氧), S(硫), N-Z, 亚甲基或二亚甲基(乙烷-1, 2-二基),

Y^3 特别优选代表 N-CN 或 当 Y^1 代表 O(氧)或 N-Z 时 还代表 O(氧),

- 20 Y^4 特别优选代表氟基, 硝基, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的乙酰基, 丙酰基, 正或异丁酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 或代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯甲酰基或苯基磺酰基,

- 25 Y^5 特别优选代表氢, 氟基, 硝基, 代表各自任选氟-和/或氯-取代的乙酰基, 丙酰基, 正或异丁酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 或代表各自任选硝基-, 氟基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 正-, 异-, 仲或叔丁基-, 三氟甲基-, 甲氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯甲酰基或苯基磺酰基,

- 30 Z 特别优选代表氢, 代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-, 甲氧基-或乙氧基-取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 正-, 异-, 仲或叔丁基, 或代表各自任选氟基-, 氟-, 氯-或溴-取代的丙烯基, 丁烯基, 丙炔基或丁炔基,

n 更特别优选代表 0,

A 更特别优选代表亚甲基或乙烷-1, 2-二基(二亚甲基),

R² 更特别优选代表氢, 硝基, 氰基, 氟, 氯, 溴, 碘, 甲基, 乙基, 正或
异丙基, 二氟甲基, 三氟甲基, 二氯甲基, 三氯甲基, 甲氧基甲基, 甲硫基
甲基, 甲基亚磺酰基甲基, 甲基磺酰基甲基, 甲氧基, 乙氧基, 二氟甲氧
5 基, 三氟甲氧基, 甲硫基, 乙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 甲基磺
酰基, 乙基磺酰基或二甲基氨基磺酰基,

R³ 更特别优选代表氢, 硝基, 氰基, 氟, 氯, 溴, 碘, 甲基, 乙基, 二氟
甲基, 三氟甲基, 二氯甲基, 三氯甲基, 甲氧基甲基, 甲硫基甲基, 甲基亚
磺酰基甲基, 甲基磺酰基甲基, 甲氧基, 乙氧基, 二氟甲氧基, 三氟甲氧
10 基, 甲硫基, 乙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺
酰基或二甲基氨基磺酰基,

m 更特别优选代表 0, 1 或 2,

R⁵ 更特别优选代表各自任选氟-和/或氯-取代的甲基, 乙基, 正或
异丙基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基, 或代表苯基或 当 m 代表 2
15 时 如适合还可与第二个 R⁵ 基团一起代表丙烷-1, 3-二基或丁烷-1, 4-
二基,

R⁶ 更特别优选代表羟基, 代表甲酰氧基, 代表各自任选氟-和/或氯-
取代的甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 甲硫基, 乙硫基, 正或异丙硫基,
甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 乙酰氧基, 丙
20 酰氧基, 正或异丁酰氧基, 甲氧基羰氧基, 乙氧基羰氧基, 正或异丙氧基
羰氧基, 甲基氨基羰氧基, 乙基氨基羰氧基, 正或异丙基氨基羰氧基, 甲
基磺酰氧基, 乙基磺酰氧基, 正或异丙基磺酰氧基, 代表各自任选氟-或
氯-取代的丙烯氧基, 丁烯氧基, 丙炔氧基或丁炔氧基, 代表各自任选硝
基-, 氰基-, 氟-, 氯-, 溴-, 甲基-, 乙基-, 正或异丙基-, 三氟甲基-, 甲
25 氧基-, 乙氧基-, 正或异丙氧基-, 二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯
氧基, 苯硫基, 苯基亚磺酰基, 苯基磺酰基, 苯基羰氧基, 苯基羰基甲氧
基, 苯基磺酰氧基, 苯基甲氧基, 苯基甲硫基, 苯甲基亚磺酰基或苯甲基
磺酰基,

R⁷ 更特别优选代表氢, 氰基, 氟, 氯, 溴, 代表各自任选氟-和/或氯-
30 取代的甲基, 乙基, 正或异丙基, 甲氧基, 乙氧基, 正或异丙氧基, 甲硫基,
乙硫基, 正或异丙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺
酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基, 甲氧基羰基, 乙氧

基羰基,正或异丙氧基羰基,或代表任选氟基-,氟-,氯-或甲基-取代的环丙基,

5 R^8 更特别优选代表氢,代表各自任选氟基-,氟-,氯-,甲氧基-或乙氧基-取代的甲基,乙基,正或异丙基,正-,异-,仲或叔丁基,代表各自任选氟-或氯-取代的丙烯基,丁烯基,丙炔基或丁炔基,代表各自任选氟-,氯-,甲基-或乙基-取代的环丙基,或代表各自任选氟-,氯-,溴-,甲基-,乙基-,正或异丙基-,三氟甲基-,甲氧基-,乙氧基-,正或异丙氧基-,二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯基或苄基,

10 R^9 更特别优选代表羟基,代表甲酰氧基,代表各自任选氟基-,氟-,氯-,甲氧基-,乙氧基-,正或异丙氧基-取代的甲氧基,乙氧基,正或异丙氧基,乙酰氧基,丙酰氧基,正或异丁酰氧基,甲氧基羰氧基,乙氧基羰氧基,正或异丙氧基羰氧基,甲基氨基羰氧基,乙基氨基羰氧基,正或异丙基氨基羰氧基,甲基磺酰氧基,乙基磺酰氧基,正或异丙基磺酰氧基,代表各自任选氟-或氯-取代的丙烯氧基,丁烯氧基,丙炔氧基或丁炔氧基,或代表各自任选硝基-,氟基-,氟-,氯-,溴-,甲基-,乙基-,正或异丙基-,三氟甲基-,甲氧基,乙氧基-,正或异丙氧基-,二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯基甲氧基,苯基羰氧基,苯基羰基甲氧基或苯基磺酰氧基,

20 R^{10} 更特别优选代表氢,氟基,氟,氯,溴,或代表各自任选氟-,氯-,甲氧基-或乙氧基-取代的甲基,乙基,正或异丙基,乙酰基,丙酰基,正或异丁酰基,甲氧基,乙氧基,正或异丙氧基,甲氧基羰基,乙氧基羰基,正或异丙氧基羰基,甲硫基,乙硫基,正或异丙硫基,甲基亚磺酰基,乙基亚磺酰基,甲基磺酰基或乙基磺酰基,

25 R^{11} 更特别优选代表氢,代表各自任选氟-,氯-,甲氧基-或乙氧基-取代的甲基,乙基,正或异丙基,或代表任选氟-,氯-,甲基-或乙基-取代的环丙基,

R^{12} 更特别优选代表氢,代表各自任选氟-,氯-,甲氧基-或乙氧基-取代的甲基,乙基,正或异丙基,正-,异-,仲或叔丁基,或代表任选氟基-,氟-,氯-,甲基-或乙基-取代的环丙基,

30 R^{13} 更特别优选代表氢,氟基,氟,氯,溴,或代表各自任选氟-,氯-,甲氧基-或乙氧基-取代的甲基,乙基,正或异丙基,甲氧基,乙氧基,正或异丙氧基,甲氧基羰基,乙氧基羰基,正或异丙氧基羰基,甲硫基,乙

硫基, 正或异丙硫基, 甲基亚磺酰基, 乙基亚磺酰基, 正或异丙基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 正或异丙基磺酰基,

Y^1 更特别优选代表单键, O(氧), CH_2 (亚甲基) 或 N-Z,

Y^3 更特别优选代表 N-CN,

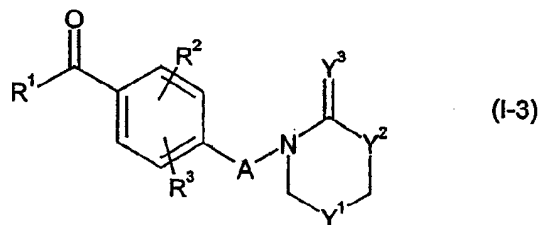
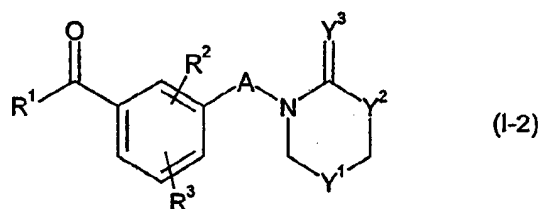
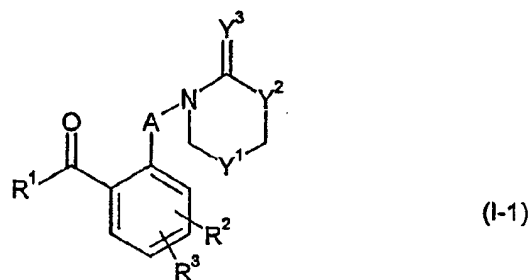
5 Z 更特别优选代表氢, 甲基, 乙基, 正或异丙基,

本发明优选的式(I)化合物是包括由作为优选的上述定义组合的那些化合物。

本发明特别优选的式(I)化合物是包括由上述特别优选定义组合的那些化合物。

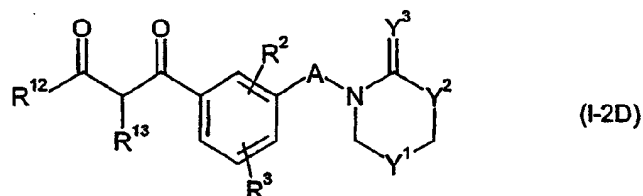
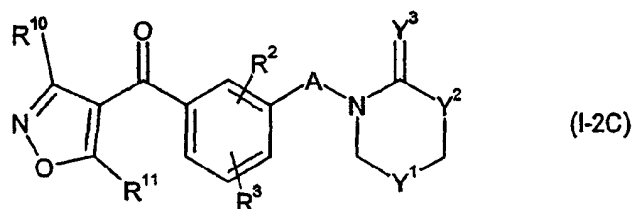
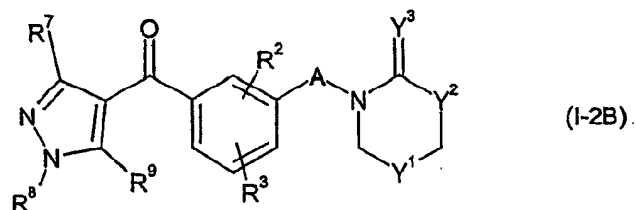
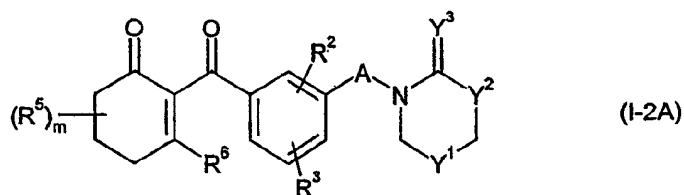
10 本发明更特别优选的式(I)化合物是包括由上述更特别优选定义组合的那些化合物。

特别优选式(I-1)至式(I-3)化合物:



15 其中 A, R^1 , R^2 , R^3 , Y^1 , Y^2 和 Y^3 各自代表作为更特别优选的上述定义。

特别优选的另一些化合物是下列通式(I-2A)至(I-2D)化合物:



其中 m , A , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , Y^1 , Y^2 和 Y^3 各自代表作为
5 更特别优选的上述定义。

更特别优选那些式 (I-2A) 至 (I-2D) 化合物: 其中 Y^1 代表单键或亚甲基, 和 Y^3 代表 $N-CN$ 。

上述一般或优选基团定义既适用于式 (I) 的终产物, 也相应地适用于各自制备所需的起始物或中间体。这些基团的定义可互相任意组
10 合, 即也包括所给优选范围之间的任意组合。

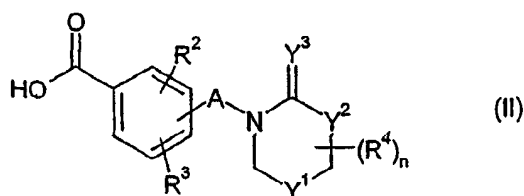
新的式 (I) 的取代的芳基酮的特点是表现出很高且具有选择性的除草活性。

新的式 (I) 的取代的芳基酮可通过如下方法制备

(a) 如适合存在脱水剂, 如适合存在一种或多种反应助剂, 和如适合存在一种或多种稀释剂的情况下

将式(II)的取代的苯甲酸或它的活性衍生物, 例如相应的酰基氯化物, 酸氰化物 (Säurecyanide) 或酯

5



其中

$n, A, R^2, R^3, R^4, Y^1, Y^2$ 和 Y^3 如上所述定义,
与通式(III)化合物反应获得

10



其中

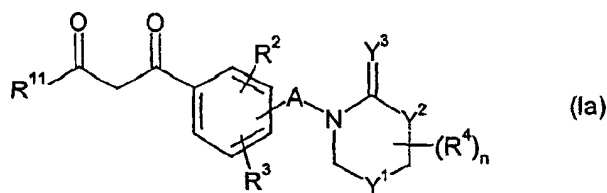
R^1 如上所述定义,

或

(b) 如适合存在一种或多种反应助剂和如适合存在一种或多种稀释剂的情况下

15

将通式(I a)的取代苯甲酰酮



其中

20

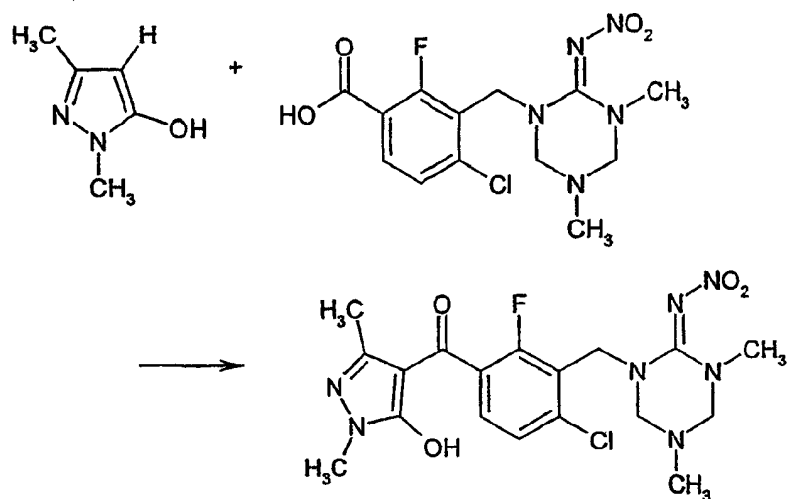
$n, A, R^2, R^3, R^4, R^{11}, Y^1, Y^2$ 和 Y^3 如上所述定义,

与原甲酸酯或与 N,N-二甲基甲酰胺缩醛或与氰基甲酸酯或与二硫化碳和烷基化剂一起反应, 然后与羟基胺或其酸加合物反应获得,

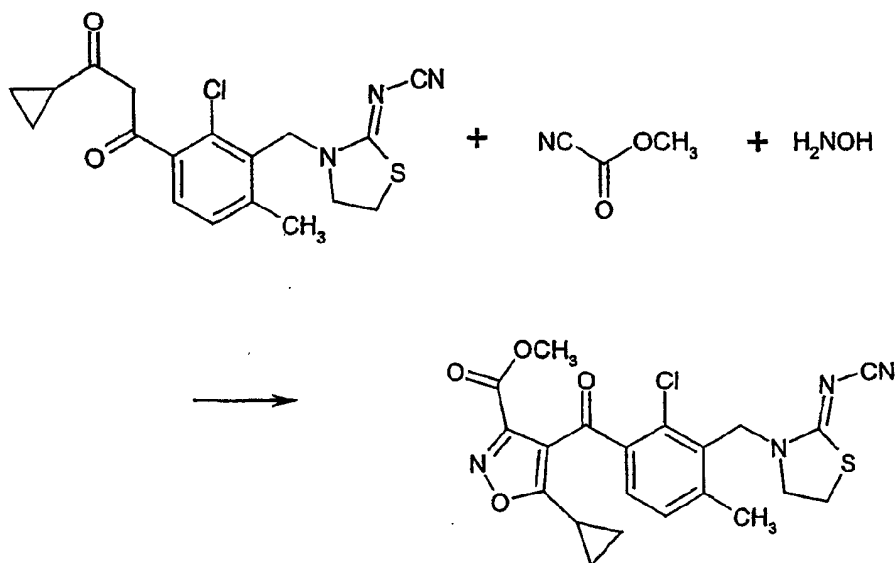
并且, 如适合, 在本发明方法(a)或(b)完成之后, 通过常规方法将

在取代基定义范围内的如此制备的通式(I)化合物进行取代, 氧化或还原反应, 和/或通过常规方法将通式(I)化合物转化为盐类化合物。

如果,例如,使用 4-氯-2-氟-3-[(3,5-二甲基-2-硝基亚氨基四氢-1,3,5-三嗪-1(2H)-基)甲基]苯甲酸和 1,3-二甲基-5-羟基吡唑作为起始物时,本发明方法(a)的反应过程可通过下述反应路线图表示:



如果,例如,使用 3-[2-氯-3-(3-环丙基-3-氧代丙酰基)-6-甲基苄基]-1,3-噻唑烷-2-亚基氨脒,氰基甲酸甲酯和羟基胺作为起始物时, 10 本发明方法 (b) 的反应过程可通过下述反应路线图表示:



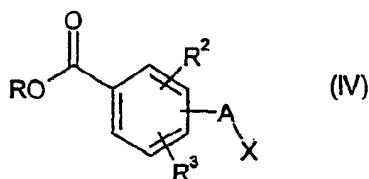
用于制备通式(I)化合物的本发明方法(a)中用作起始物的取代的苯甲酸通常如式(II)一般地定义。在通式(II)中 n , A , R^2 , R^3 , R^4 , Y^1 , Y^2 和 Y^3 的定义优选在描述本发明通式(I)化合物时作为优选, 特别优选或更特别优选列出的 n , A , R^2 , R^3 , R^4 , Y^1 , Y^2 和 Y^3 的上述那些定义。

- 5 通式(II)起始物 以及上面提及的它们的活性衍生物 目前还没有文献报道; 作为新物质, 它们也是本申请的主题。

新的通式(II)的取代的苯甲酸 或它们的衍生物, 如它们的酯, 特别是甲酯和乙酯 可由下述方法制备

- (α) 在 0°C 至 100°C , 如适合存在酸性接受体, 如, 例如碳酸钾或氢化钠, 如适合存在稀释剂, 如, 例如丙酮或四氢呋喃的条件下(参看制备实施例),

将通式(IV)的卤代烷基苯甲酸酯



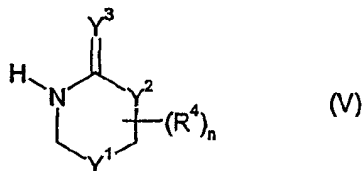
- 15 其中

A , R^2 和 R^3 如上所述定义,

R 代表烷基, 特别是甲基或乙基, 和

X 代表卤素, 特别是氟, 氯或溴, 或烷基磺酰氧基, 特别是甲基磺酰氧基或乙基磺酰氧基,

- 20 与通式(V)化合物反应获得



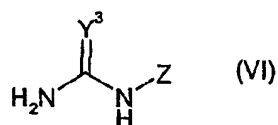
其中

n , R^4 , Y^1 , Y^2 和 Y^3 如上所述定义,

或

- 当制备式(II)化合物, 其中 Y^1 代表 O(氧) 或 N-Z 以及 Y^2 代表 N-Z 时 -

- (β) 在 0℃ 至 100℃, 如适合存在酸性接受体, 如, 例如碳酸钾或
 5 氢化钠, 如适合存在稀释剂, 如, 例如丙酮或四氢呋喃的条件下,
 第一步将上述通式(IV)的卤代烷基苯甲酸酯与通式(VI)化合物反
 应

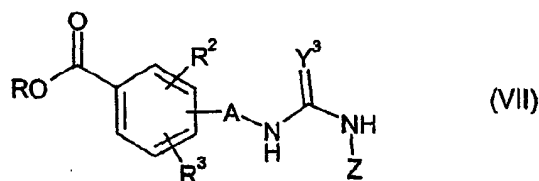


10 其中

Y^3 和 Z 如上所述定义,

并在 0℃ 至 150℃, 如适合存在反应助剂, 如, 例如三乙胺, 和如适
 合存在一种或多种稀释剂, 如, 例如甲苯或 1, 4-二噁烷的条件下,
 将这里生成的通式(VII)的脲烷基苯甲酸酯

15

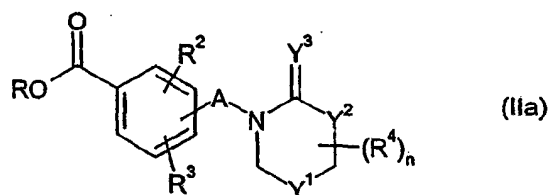


其中

A, R, R^2 , R^3 , Y^3 和 Z 如上所述定义,

- 与甲醛或低聚甲醛反应, 和如适合与通式 H_2N-Z 的胺反应 (参见
 20 Bull. Chem. Soc. Japan 62 (1989), 3721-3733, EP-A-428 941, EP-A-
 580 553),

和, 如适合, 将两种不同的方法(α)或(β)制备获得的通式(II a)
 的取代的苯甲酸酯



其中

$n, A, R, R^2, R^3, R^4, Y^1, Y^2$ 和 Y^3 如上所述定义,

- 5 通过常规方法水解, 即在 0°C 至 100°C , 存在碱, 如, 例如氢氧化钾或氢氧化钠, 和如适合存在一种或多种稀释剂如, 例如 1, 4-二噁烷, 环己烷和 2-甲氧基乙醇, 的条件下与水反应 (参见制备实施例)。

在制备通式 (I) 化合物的本发明方法 (a) 中也用作起始物的化合物通常如式 (III) 所定义。在通式 (III) 中 R^1 的定义优选在描述本发明通式 (I) 化合物时上述作为优选, 特别优选或更特别优选而列出的那些 R^1 的定义。

通式 (III) 的起始物是已知的有机化合物。

在制备通式 (I) 化合物的本发明方法 (b) 中用作起始物的取代的苯甲酰酮通常如式 (I a) 所示定义。在通式 (I a) 中

15 $n, A, R^2, R^3, R^4, R^{11}, Y^1, Y^2$ 和 Y^3 的定义优选在描述本发明通式 (I) 化合物时作为优选, 特别优选或更特别优选列出的 $n, A, R^2, R^3, R^4, R^{11}, Y^1, Y^2$ 和 Y^3 的上述那些定义。

本发明通式 (I a) 起始物是新化合物; 它们可通过本发明方法 (a) 制备获得。

- 20 用于制备新的通式 (I) 的取代的芳基酮的本发明方法 (a) 是在如适合使用脱水剂的条件下进行。适用于上述目的的脱水剂是普通的适于结合水的那些化学物质。

可作为它们的实例列举的是二环己基碳二亚胺和碳酸二咪唑 (Carbonyl-bis-imidazol)。

- 25 特别适合的脱水剂是二环己基碳二亚胺。

本发明方法 (a) 和 (b) 优选在使用一种或多种反应助剂的条件下进行。适用于本发明方法 (a) 和 (b) 的反应助剂一般是常用的无机或有机

碱或酸性接受体。它们优选包括碱金属或碱土金属的乙酸盐, 氯化物, 碳酸盐, 碳酸氢盐, 氢化物, 氢氧化物或醇盐, 如, 例如乙酸钠, 乙酸钾或乙酸钙, 氨基锂, 氨基钠, 氨基钾或氨基钙, 碳酸钠, 碳酸钾或碳酸钙, 碳酸氢钠, 碳酸氢钾或碳酸氢钙, 氢化锂, 氢化钠, 氢化钾或氢化钙, 氢氧化锂, 氢氧化钠, 氢氧化钾或氢氧化钙, 甲醇, 乙醇, 正或异丙醇, 正-, 异-, 仲或叔丁醇的钠或钾盐; 还包括碱性有机氮化合物如, 例如三甲胺, 三乙胺, 三丙胺, 三丁胺, 乙基二异丙胺, N, N-二甲基环己胺, 二环己胺, 乙基二环己胺, N, N-二甲基苄胺, N, N-二甲基苄基胺, 吡啶, 2-甲基-, 3-甲基-, 4-甲基-, 2, 4-二甲基-, 2, 6-二甲基-, 3, 4-二甲基-和 3, 5-二甲基吡啶, 5-乙基-2-甲基吡啶, 4-二甲基氨基吡啶, N-甲基哌啶, 1, 4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷(DABCO), 1, 5-二氮杂二环[4.3.0]-壬-5-烯(DBN)或 1, 8-二氮杂二环[5.4.0]-十一碳-7-烯(DBU)。

适用于本发明方法(a)和(b)的其它反应助剂还包括相转移催化剂。这些催化剂的实例包括:

15 溴化四丁基铵、氯化四丁基铵、氯化四辛基铵、硫酸氢四丁基铵、氯化甲基三辛基铵、氯化十六烷基三甲基铵、溴化十六烷基三甲基铵、氯化苄基三甲基铵、氯化苄基三乙基铵、氢氧化苄基三甲基铵、氢氧化苄基三乙基铵、氯化苄基三丁基铵、溴化苄基三丁基铵、溴化四丁基磷、氯化四丁基磷、溴化三丁基十六烷基磷、氯化丁基三苯基磷、溴化乙基三辛基磷、溴化四苯基磷。

用于制备通式(I)化合物的本发明方法优选在使用稀释剂的条件下进行。除水外, 适用于本发明方法(a)和(b)的稀释剂特别是惰性有机溶剂。这些有机溶剂特别包括脂族的、脂环族的或芳族的、任选卤代的烃, 如, 例如汽油、苯、甲苯、二甲苯、氯苯、二氯苯、石油醚、己烷、环己烷、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳; 醚类如乙醚、二异丙醚、二噁烷、四氢呋喃或乙二醇二甲醚或乙二醇二乙醚; 酮类, 如丙酮、丁酮或甲基异丁酮; 腈, 如乙腈、丙腈或丁腈; 酰胺, 如 N, N-二甲基甲酰胺、N, N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺; 酯类, 如乙酸甲酯或乙酸乙酯; 亚砷, 如二甲基亚砷; 醇类, 如甲醇、乙醇、正或异丙醇、乙二醇单甲醚、乙二醇单乙醚、二乙二醇单甲醚、二乙二醇单乙醚, 它们与水的混合物或纯水。

在本发明方法(a)和(b)中, 反应温度可在较宽的范围内变化。一般,

本发明方法在 0℃ 至 150℃, 优选 10℃ 至 120℃ 下进行。

通常本发明方法在大气压下进行。然而, 本发明方法也可以在升压或减压 - 一般在 0.1bar 至 10bar 条件下进行。

当采用本发明制备方法时, 起始物通常使用近似等摩尔量。然而, 还可以较大过量地使用其中一种组分。通常, 反应在存在反应助剂条件下在适合的稀释剂中进行, 并且通常将反应混合物在所需温度下搅拌数小时。通过常规方法进行处理(参见制备实施例)。

本发明活性化合物可用作脱叶剂, 干燥剂, 除草剂, 特别是用作除杂草剂。从广义上讲, 杂草应理解为生长在不适合场所的所有植物。本发明物质是否用作灭生性或选择性除草剂基本上是根据其使用量而确定的。

本发明活性化合物可用于, 例如下述植物:

双子叶杂草属: 苘麻属, 苋属, 豚草属, 单花葵属, 春黄菊属, Aphanes, 滨藜属, 雏菊属, 鬼针草属, 荠菜属, 飞廉属, 决明属, 矢车菊属, 藜属, 蓟属, 旋花属, 曼陀罗属, 金钱草, 刺酸模属, 糖芥属, 大戟属, 鼬瓣花属, 牛膝菊属, 猪殃殃属, 木槿属, 番薯属, 地肤属, 野芝麻属, 独行菜属, 母草属, 母菊属, 薄荷属, 山旋属, Mullugo, 勿忘草属, 罂粟属, 牵牛属, 车前属, 蓼属, 马齿苋属, 毛茛属, 萝卜属, 菜属, 水松叶属, 酸模属, 猪毛菜属, 千里光属, 田菁属, 黄花稔属, 欧白芥属, 茄属, 苦苣菜属, 尖瓣花属, 繁缕属, 蒲公英属, 遏蓝菜属, 车轴草属, 荨麻属, 婆婆纳属, 堇菜属, 苍耳属。

双子叶作物属: 花生属, 甜菜属, 芸苔属, 黄瓜属, 南瓜属, 向日葵属, 胡萝卜属, 大豆属, 棉属, 甘薯属, 莴苣属, 亚麻属, 番茄属, 烟草属, 菜豆属, 豌豆属, 茄属, 巢菜属。

单子叶杂草属: 山羊草属, 冰草属, 翦股颖属, 看麦娘属, 假翦股颖属, 燕麦属, 臂形草属, 雀麦属, 蒺藜草属, 鸭跖草属, 狗牙根属, 莎草属, 龙爪茅属, 马唐属, 稗属, 荩茅属, 蟋蟀草属, 画眉草属, 野黍属, 羊茅属, 飘拂草属, 异蕊花属, 白茅属, 鸭嘴草属, 千金子属, 毒麦属, 雨久花属, 黍属, 雀稗属, 草属, 梯牧草属, 早熟禾属, 筒轴茅属, 慈菇属, 草属, 狗尾草属, 高粱属。

单子叶作物属: 葱属, 凤梨属, 天门冬属, 燕麦属, 大麦属, 稻属, 黍属, 甘蔗属, 黑麦属, 高粱属, 黑小麦, 小麦属, 玉米属。

然而,本发明活性化合物的应用丝毫不限制于上述属,还可以同样的方式扩展至其它植物。

根据其浓度,本发明活性化合物适合于灭生性地防治杂草,例如在工业区和铁轨周围以及有或没有树木生长的道路或广场。同样,本发明
5 活性化合物还可用于防治多年生作物中的杂草以及可选择性地防治一年生作物中的杂草,其中所述多年生作物,例如包括森林,观赏树木,果园,葡萄园,柑桔园,坚果园,香蕉园,咖啡园,茶园,橡胶园,油棕园,可可种植园,浆果种植园和啤酒花栽培区,草皮和草坪和牧草。

当应用于土壤和植物的地上部分时,本发明式(I)化合物表现出
10 很强的除草活性且作用谱广。在某种程度上,它们还适于通过苗前或苗后方法选择性地防除单子叶和双子叶作物中的单子叶和双子叶杂草。

本发明活性化合物在特定的浓度或施用量条件下还可用于防治动物害虫以及真菌或细菌植物病害。如适合,还可以作为合成其它活性化合物的中间体或前体。

15 根据本发明,可以处理所有植物和植物的各部分。这里,本发明中植物可以理解为表示所有植物以及植物群落,如需要和不需要的野生植物或作物(包括自然长出的作物)。作物可以通过常规植物育种和优化方法或通过生物技术和遗传工程方法或上述方法的结合获得的植物,包括转基因植物和包括获得或没有获得植物品种权保护的植物栽培品种。植物的各部分可理解为表示所有地上和地下部分和植物器官,如茎、叶、花和根,可提及的实例包括叶片、针叶、枝条、树干、
20 花、子实体、果实和种子,以及根、块茎和根状茎。植物的各部分还包括已收获的材料,以及无性和有性繁殖材料,例如插条、块茎、根状茎、压条和种子。

25 如上所述,根据本发明可以处理所有植物以及它们的各部分。在优选实施方案中,处理野生植物(杂草,有害植物)和/或通过常规生物育种方法如,例如杂交或原生质体融合获得的植物物种和植物品种(作物)以及它们的各部分。在另一优选实施方案中,处理的植物是通过遗传工程方法,如适合结合常规育种方法获得的转基因植物和植物品种(遗传
30 修饰生物体)及它们的各部分。对于术语“各部分”或“植物的各部分”上面已进行了说明。

植物品种表示通过常规植物育种, 诱变或重组DNA技术获得的具有某种特性(“性状”)的作物。它们可以是品种, 生物型和基因型。

本发明处理的转基因(通过遗传工程方法获得的)植物或植物品种包括那些通过遗传修饰获得遗传物质的所有植物, 其中所述遗传物质赋予这些植物特别有价值的特性(“性状”)。上述特性的实例包括植物的长势更好, 提高了对高温或低温的耐受性, 增强了对旱或盐水和/或土壤盐度的耐受能力, 提高开花率, 易于收获, 加速成熟, 更高的产量, 品质更优和/或收获产品具有更高的营养价值, 更好的可储藏性能和/或收获产品的加工性能。上述特性中另一些和特别优选的实例是提高植物对动物以及微生物害虫的防御能力, 如抗昆虫, 螨, 植物病原真菌, 细菌和/或病毒, 以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受能力。可提及的转基因植物的实例包括重要的经济作物, 如禾谷类(包括水稻), 玉米, 大豆, 马铃薯, 棉花, 甜菜, 油菜, 栽培草, 如高尔夫草皮和草坪, 果树(苹果, 梨, 柑桔和葡萄)以及种植园作物, 如油棕和橡胶树, 其中特别优选禾谷类作物(包括水稻), 玉米, 大豆, 马铃薯, 棉花, 甜菜和油菜。特别优选的特性(“性状”)是通过在植物体内生成毒素来提高植物对昆虫的防御能力, 特别是通过来源于苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)的遗传物质(例如通过基因CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb和CryIF及其组合)在植物体(下文称作“Bt 植物”)内产生的那些毒素。还特别优选的特性(“性状”)是通过系统获得抗性(SAR), 系统素, 植物抗毒素, 激卫素, 以及抗性基因及相应的表达蛋白和毒素来提高植物对真菌, 细菌和病毒的抗性。另一些特别优选的特性(“性状”)是提高植物对某些除草活性物质和几类活性物质的耐受性, 如草甘膦或草铵膦/膦基麦黄酮(Phosphinothricin)(例如“PAT”基因), ALS抑制剂, 如咪唑啉酮, 磺酰脲等, PPO抑制剂(例如带有Acuron基因的植物), 4-HPD抑制剂如异噁唑(例如异噁氟草), ACCase抑制剂如稀禾啉和溴苯腈。

在转基因植物中, 各自赋予上述所需特性(“性状”)的基因还可以互相组合。可提及的“Bt 植物”的实例包括玉米品种, 棉花品种, 大豆品种和马铃薯品种, 它们都是市场上可以买得到的并且商品名为YIELD GARD®(例如玉米, 棉花, 大豆), KnockOut®(例如玉米), StarLink®

(例如玉米), Bollgard® (棉花), Nucoton® (棉花)和NewLeaf® (马铃薯)。可提及的耐除草剂植物的实例包括玉米品种, 棉花品种, 大豆品种, 禾谷类作物品种包括水稻品种, 甜菜品种和油菜品种, 它们都是市场上可以买得到的且商品名为Roundup Ready® (耐草甘膦的植物品种, 例如玉米, 棉花, 大豆, 甜菜, 油菜), Liberty Link® (耐草铵膦的植物品种, 例如油菜, 玉米, 甜菜), IMI® (耐咪唑啉酮的植物品种)以及STS® (耐磺酰脲的植物品种, 例如玉米)。可提及的抗除草剂植物(通过除草剂耐受性的常规育种方法获得的植物)包括商品名为Clearfield® (例如玉米, 水稻)的市售植物品种。

当然, 上面的描述同样也适用于具有这些遗传特性(“性状”)或未来需要开发的性状的植物, 未来将开发或未来将要投放市场的那些植物品种,。

根据植物物种和/或植物品种, 它们的生长场所和生长条件(土壤, 气候, 植物营养生长期, 肥料), 本发明处理方法还可以获得超加合(“增效”)活性。因此, 例如, 可以减少施用量和/或扩大活性谱和/或提高本发明使用的化合物和组合物的活性-还包括与其它农药活性物质结合的情况—作物的植物长势更佳, 增强作物对高或低温的耐受性, 提高作物对旱或盐水和/或土壤盐度的耐受能力, 提高开花率, 更易于收获, 加速成熟, 更高的产量, 品质更优和/或收获产品具有更高的营养价值, 更好的储藏性能和/或收获产品的加工性能, 上述这些方面都超出了实际预期的效果。

本发明特别优选使用本发明通式 I 化合物或活性物质的混合物来处理上述植物, 这种处理除了对杂草植物好的防除之外还具有与上述植物或植物品种的上述增效作用。活性化合物或混合物的上述优选范围也适用于这些植物的处理。特别优选使用本发明特别所述的化合物或混合物来处理植物。

使用活性物质对植物和植物各部分进行的处理是通过常规处理方法直接施用或将活性物质施用于它们的周围环境、生境或贮藏区进行处理, 例如通过浸渍、喷雾、熏蒸、弥雾、撒播、刷涂以及当处理繁殖材料, 特别是种子时还可以采用一层或多层包衣方式。

可将活性物质转化成常规制剂,如液剂,乳剂,可湿性粉剂,悬浮剂,粉剂,细粉剂,糊剂,可溶粉剂,颗粒剂,胶悬剂/乳油,活性物质浸渍的天然和合成材料,和聚合物包封的微胶囊。

5 这些制剂是通过已知方法制备的,例如通过将活性物质与填充剂,即液体溶剂和/或固体载体混合而制备的,如适合制剂中可使用表面活性剂,即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。

在使用水作为填充剂的情况下,例如,还可使用有机溶剂作为助溶剂。适合的液体溶剂主要有:芳族化合物,如二甲苯,甲苯或烷基萘,氯代芳族化合物和氯代脂肪烃,如氯苯,二氯乙烷(Chlorethylene)或二氯甲烷,脂肪烃,如环己烷或链烷烃,例如石油馏份,矿物油和植物油,醇类,如丁醇或乙二醇及其醚和酯,酮类,如丙酮,甲基乙基酮,甲基异丁基酮或环己酮,强极性溶剂,如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷,以及水。

15 适合的固体载体有:例如,铵盐和天然矿物粉末,如高岭土,矾土,滑石,白垩,石英,硅镁土,蒙脱土或硅藻土和合成矿物粉末,如高分散二氧化硅,氧化铝和硅酸盐;适合颗粒剂的固体载体有:例如粉碎和分级的天然岩石,如方解石,大理石,浮石,海泡石,白云石以及无机和有机粉末的合成颗粒,以及有机材料颗粒,如锯末,坚果壳,玉米穗茎和烟草茎;适合的乳化剂和/或发泡剂有:例如非离子和阴离子乳化剂,如聚氧乙烯脂肪酸酯,聚氧乙烯脂肪醇醚,例如烷基芳基聚乙二醇醚,烷基磺酸盐,烷基硫酸盐,芳基磺酸盐以及蛋白水解产物;适合的分散剂有:例如亚硫酸化木素废液和甲基纤维素。

20 制剂中还可使用粘着剂,如羧甲基纤维素,粉末、颗粒或胶乳状天然和合成聚合物,如阿拉伯树胶,聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯,以及天然磷脂,如脑磷脂和卵磷脂,和合成磷脂。其它的添加剂可以是矿物油和植物油。

可以使用的着色剂,如无机颜料,例如氧化铁,氧化钛,普鲁士兰以及有机染料,如茜素染料,偶氮染料和金属酞菁染料和痕量营养物,如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

30 制剂中通常含有0.1-95%重量,优选0.5-90%重量的活性物质。

本发明活性物质可以其本身或制剂形式使用,还可与已知除草剂和/或与用以改进作物耐受性的物质(“安全剂”)一起使用防治杂草,这

里现混现用制剂或桶混制剂是可能的。还可与包括一种或多种已知除草剂和安全剂的除草组合物混合使用。

适用于所述混合物的已知除草剂,例如是

- 乙草胺、三氯羧草醚、苯草醚、甲草胺、禾草灭、莠灭净、
- 5 Amicarbazone、先甲草胺、酰嘧磺隆、莎稗磷、磺草灵、莠去津、唑啉炔草、四唑嘧磺隆、Beflubutamid、草除灵、呋草黄、苄嘧磺隆、噻草平、Benzfendizone、Benzobicyclon、吡草酮、新燕灵、双丙氨
- 10 腓、甲羧除草醚、双草醚、溴丁酰草胺、溴酚脞、溴苯腓、丁草胺、Butafenacil(-烯丙酯)、丁氧环酮、丁草敌、苯酮唑、酞脞草、双酰
- 草胺、氟酮唑草、甲氧除草醚、草灭畏、氟草敏、氟嘧磺隆、草枯醚、
- 15 氟磺隆、绿麦隆、Cinidon(-乙酯)、环庚草醚、醚黄隆、Clefoxydim、烯草酮、炔草酸、异恶草松、氟甲酰草胺、二氟吡啶酸、Clopyrasulfuron(-甲酯)、唑嘧磺胺盐、Cumyluron、氟草津、Cybutryne、环草敌、环丙嘧磺隆、噻草酮、氟氟草酯、2,4-滴、2,4-
- 20 滴丁酸、甜菜安、燕麦敌、麦草畏、精2,4-滴丙酸、禾草灵、唑嘧磺胺、乙酰甲草胺、野燕枯、吡氟酰草胺、二氟吡隆、恶唑隆、啉草丹、二甲草胺、异戊乙净、二甲吩草胺、Dimexyflam、敌乐胺、双苯酰草胺、敌草快、氟硫草啶、敌草隆、杀草隆、Epoprodan、扑草灭(EPTC)、戊草丹、乙丁烯氟灵、胺苯磺隆、乙氧呋草黄、Ethoxyfen、乙氧嘧磺隆、乙苯酰草、精恶唑禾草灵、Fentrazamide、麦草氟异丙酯、麦草
- 25 氟异丙酯-L、麦草氟甲酯、啶嘧磺隆、Florasulam、精吡氟禾草灵、Fluazolate、Flucarbazone(-钠盐)、flufenacet、氟唑啉草、氟烯草酸、丙炔氟草胺、Flumipropyn、氟草隆、氟咯草酮、乙羧氟草醚、氟胺草唑、Flupropacil、Flurpysulfuron(-甲酯,-钠盐)、茚丁酯、
- 30 氟啶草酮、氟氟吡氧乙酸(-丁氧丙酯,-甲基庚基酯)、氟嘧醇、呋草酮、达草氟、噻唑草酰胺、氟磺胺草醚、Foramsulfuron、草铵腓、草甘腓异丙胺盐、氟硝磺酰胺、氟吡乙禾灵、精氟吡甲禾灵、环嗪酮、咪草酯、Imazamethapyr、咪草啶酸、Imazapic、咪唑烟酸、咪唑喹啉酸、咪唑乙烟酸、咪吡嘧磺隆、Iodosulfuron(-甲酯,钠盐)、碘苯腓、异丙乐灵、异丙隆、异恶隆、异噁草胺、Isoxachlortole、异噁氟草、异恶草醚、乳氟禾草灵、环草啶、利谷隆、2甲4氯、2甲4氯丙酸、苯噻酰草胺、Mesotrione、苯噻草酮、吡唑草胺、甲基苯噻隆、吡喃隆、

- 溴谷隆、(α -)异丙甲草胺、磺草唑胺、甲氧隆、噻草酮、甲磺隆、禾草敌、绿谷隆、蒸丙胺、敌草胺、草不隆、烟嘧磺隆、氟草敏、坪草丹、氯磺乐灵、炔丙噁唑草、恶草灵、环丙氧磺隆、氯噁嗪草、乙氧氟草醚、百草枯、壬酸、二甲戊灵、Pendralin、戊噁唑草、甜菜宁、
- 5 Picolinafon、啶草磷、丙草胺、氟噻磺隆、Profluazol、扑草净、毒草胺、敌稗、恶草酸、异丙草胺、Propoxycarbazone(-钠盐)、炔苯酰草胺、苄草丹、氟磺隆、氟唑草酯、Pyrazogyl、吡唑特、吡嘧磺隆、苄草唑、Pyribenzoxim、稗草丹、吡草特、Pyridatol、Pyriftalid、肟啶草、噻草硫醚、二氯喹啉酸、氯甲喹啉酸、灭藻醌、精喹禾灵、
- 10 喹禾糖酯、砒嘧磺隆、稀禾啉、西玛津、西草净、磺草酮、甲磺草胺、甲嘧磺隆、草硫磷、乙黄隆、牧草胺、丁噻隆、Tepaloxymid、特丁津、特丁净、噻吩草胺、Thiafluamide、噻唑烟酸、噻二唑胺、噻吩磺隆、禾草丹、仲草丹、三甲苯草酮、野麦畏、醚苯磺隆、苯磺隆、三氯吡氧乙酸、灭草环、氟乐灵、Trifloxysulfuron、氟胺磺隆和
- 15 Tritosulfuron.

还可与其它已知活性物质,如杀真菌剂,杀虫剂,杀螨剂,杀线虫剂,保护植物免受鸟取食的物质,植物营养剂和土壤结构改良剂混合使用。

- 20 本发明活性物质可以其本身,其制剂形式,或进一步稀释制备的应用形式使用,如混悬液,悬浮液,乳液,粉剂,糊剂和颗粒剂。通过常规方式施用,例如灌溉,喷雾,弥雾,撒播。

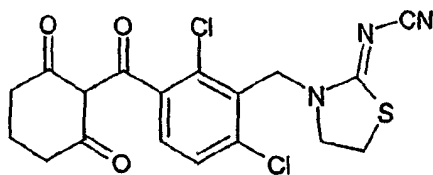
可在植物苗前或苗后施用本发明活性物质。还可以在播种前将活性物质混入土壤。

- 25 活性物质的施用量可在较宽的范围内变化。这主要根据所需效果的性质而确定。通常,施用量为每公顷土壤面积使用 1g 至 10kg 活性物质,优选每公顷 5g 至 5kg 活性物质。

本发明活性物质的制备和应用将通过下述实施例的描述变得更加清楚。

30 制备实施例

实施例 1

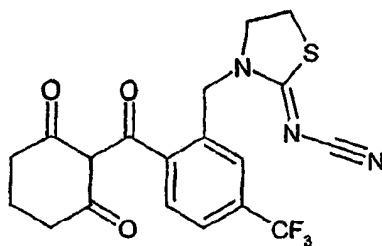


(方法(a))

将 1.7g (5mmol) 的 2,4-二氯-3-[(2-氰基亚氨基-1,3-噻唑烷-3-基)-甲基]苯甲酸, 0.7g (5mmol) 环己烷-1,3-二酮, 1.3g (6mmol) 二环己基碳二亚胺和 100ml 乙腈的混合物在室温(约 20℃)下搅拌 60 小时。在加入 1.5g (15mmol) 三乙胺和 0.9g (10mmol) 丙酮合氰化氢后, 再将反应混合物在室温下搅拌 20 小时, 然后减压浓缩。将剩余物置入二氯甲烷中并用水洗涤。然后将有机相与 100ml 水混合并加入碳酸钾调至 pH=11。分离水相并与 100ml 二氯甲烷混合。然后用 1N 盐酸酸化, 并分离有机相, 用水和用饱和的氯化钠水溶液洗涤, 硫酸钠干燥并过滤。减压浓缩滤液, 剩余物用乙醚/异丙醇溶解, 将所得结晶状产物抽吸过滤分离。

获得 0.5g (理论值的 24%) 3-[2,6-二氯-3-[(2,6-二氧代环己基)羰基]苄基]-1,3-噻唑烷-2-亚基氨脒, 熔点为 154℃。

实施例 2



20 (方法(a))

将 4.0g (12.2mmol) 2-[(2-氰基亚氨基-1,3-噻唑烷-3-基)甲基]-4-三氟甲基苯甲酸, 1.36g (12.2mmol) 环己烷-1,3-二酮, 3.0g (18mmol) 二环己基碳二亚胺和 100ml 乙腈的混合物在室温(约

- 20℃)下搅拌20小时。在加入3.4ml(24.4mmol)三乙胺和0.65ml(12mmol)三甲基甲硅烷基氟化物后,再将反应混合物在室温下搅拌2小时,然后减压浓缩。将剩余物置入10%的碳酸钠水溶液中并过滤。滤液与乙醚一起振荡,然后将水相用2N盐酸酸化,随后与二氯甲烷一起振荡。将二氯甲烷相用硫酸钠干燥并过滤。减压浓缩滤液,剩余物通过乙醚/石油醚结晶,并抽吸过滤分离产物。

获得3.76g(理论值的73%)3-[2-[(2,6-二氧代环己基)羰基]-5-三氟甲基-苄基]-1,3-噻唑烷-2-亚基氨脒。

LogP(pH=2.3):2.54。

- 10 类似实施例1和2并根据本发明制备方法的一般性描述还可以制备例如下表1中所列的通式(I)化合物和式(I-1),(I-2)或(I-3)化合物。

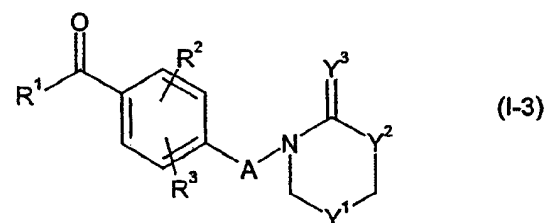
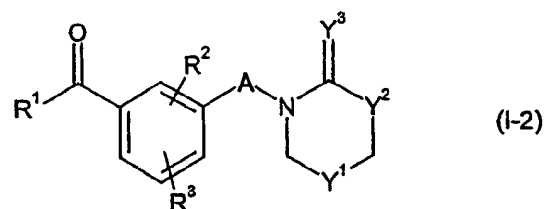
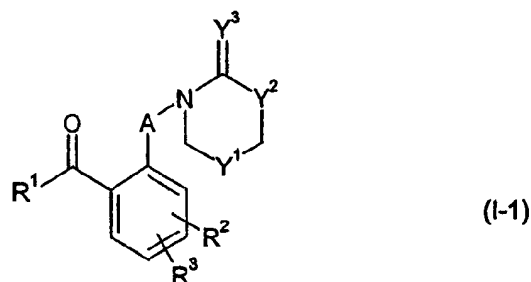
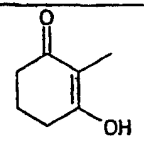
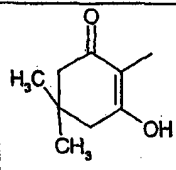
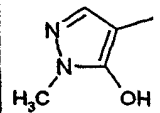
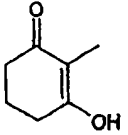
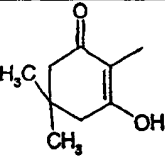
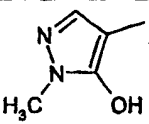
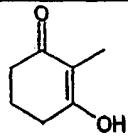
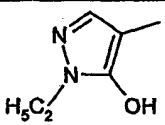
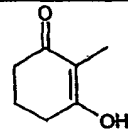
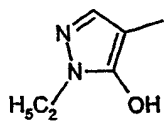
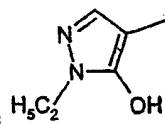
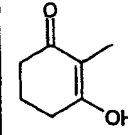
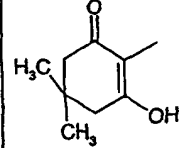
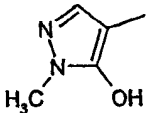
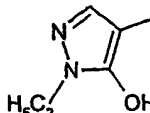
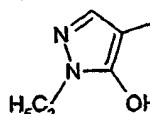
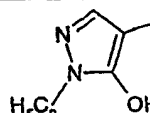
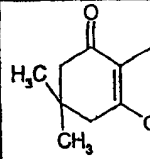
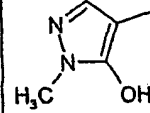
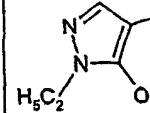
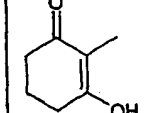
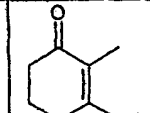
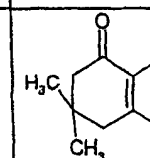
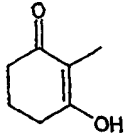
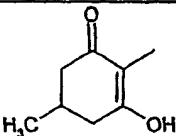
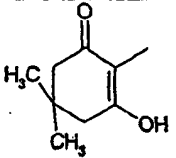
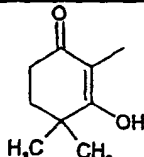
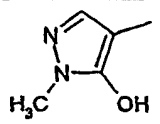
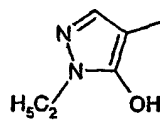
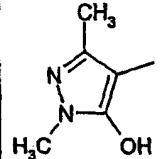
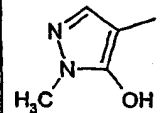
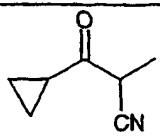


表 1: 式(I)化合物的实施例

实施例 序号	(位置) A	R ¹	(位置) R ²	(位置) R ³	Y ¹	Y ²	Y ³	结构式 物理 数据
3	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-CH ₃	N-CN	(I-2)
4	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-CH ₃	N-CN	(I-2)
5	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-CH ₃	N-CN	(I-2)

实施例 序号	(位置) A	R ¹	(位置) R ²	(位置) R ³	Y ¹	Y ²	Y ³	结构式 物理 数据
6	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	CH ₂	N-CH ₃	N-CN	(I-2)
7	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	CH ₂	N-CH ₃	N-CN	(I-2)
8	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	CH ₂	N-CH ₃	N-CN	(I-2)
9	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) OCH ₃	-	S	N-CN	(I-2)
10	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	S	N-CN	(I-2) 熔点: 148°C
11	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	-	S	N-CN	(I-2) 熔点: 208°C
12	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	-	S	N-CN	(I-2) 熔点: 190°C
13	(2) CH ₂		-	(4) CF ₃	-	S	N-CN	(I-1)
14	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-C ₂ H ₅	N-CN	(I-2) logP = 2.37 ^{a)}
15	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-C ₂ H ₅	N-CN	(I-2) logP = 2.92 ^{a)}

实施例 序号	(位置) A	R ¹	(位置) R ²	(位置) R ³	Y ¹	Y ²	Y ³	结构式 物理 数据
16	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-C ₂ H ₅	N-CN	(I-2)
17	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-C ₂ H ₅	N-CN	(I-2)
18	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-CH ₃	N-CN	(I-2)
19	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	CH ₂	N-CH ₃	N-CN	(I-2)
20	(4) CH ₂		(2) NO ₂	-	-	N-CH ₃	N-CN	(I-3) logP = 2.40 ^{a)}
21	(4) CH ₂		(2) NO ₂	-	-	N-CH ₃	N-CN	(I-3)
22	(4) CH ₂		(2) NO ₂	-	-	N-CH ₃	N-CN	(I-3)
23	(4) CH ₂		(2) NO ₂	-	-	N-CH ₃	N-CN	(I-3)
24	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-C ₃ H _{7-i}	N-CN	(I-2)
25	(3) CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	-	N-C ₃ H _{7-i}	N-CN	(I-2) logP = 3.16 ^{a)}

实施 例 序号	(位置) A	R ¹	(位置) R ²	(位置) R ³	Y ¹	Y ²	Y ³	结构式 物理 数据
26	(2) CH ₂		-	(4) Br	-	S	N-CN	(I-1) logP = 2.36 ^{a)}
27	(2) CH ₂		-	(4) Br	-	S	N-CN	(I-1) logP = 2.65 ^{a)}
28	(2) CH ₂		-	(4) Br	-	S	N-CN	(I-1) logP = 2.87 ^{a)}
29	(2) CH ₂		-	(4) Br	-	S	N-CN	(I-1) logP = 2.95 ^{a)}
30	(2) CH ₂		-	(4) Br	-	S	N-CN	(I-1) logP = 2.24 ^{a)}
31	(2) CH ₂		-	(4) Br	-	S	N-CN	(I-1) logP = 2.46 ^{a)}
32	(2) CH ₂		-	(4) Br	-	S	N-CN	(I-1) logP = 2.38 ^{a)}
33	(2) CH ₂		-	(4) CF ₃	CH ₂	N-CH ₃	N-CN	(I-1) logP = 1.68 ^{a)}
34	(2) CH ₂		-	(4) CN	-	S	N-CN	(I-1) logP = 1.83 ^{a)}

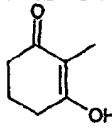
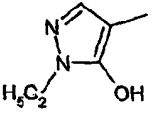
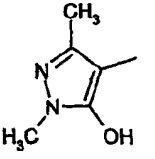
实施 例 序号	(位置) A	R ¹	(位置) R ²	(位置) R ³	Y ¹	Y ²	Y ³	结构式 物理 数据
35	(2) CH ₂		-	(4) CN	-	S	N-CN	(I-1) logP = 1.82 ^{a)}
36	(2) CH ₂		-	(4) CN	-	S	N-CN	(I-1)
37	(2) CH ₂		-	(4) CN	-	S	N-CN	(I-1) logP = 1.02 ^{a)}

表 1 中给出的 logP 值是根据 EEC Directive 79/831 Annex V. A8 通过 HPLC (高效液相色谱) 使用反相柱 (C 18), 温度: 43℃ 条件下确定的。

5 (a) 在酸性范围内用于测定的洗脱液: 0.1% 含水磷酸, 乙腈; 10% 乙腈至 90% 乙腈的线性梯度-对应的测试结果在表 1 中以 ^{a)} 标记。

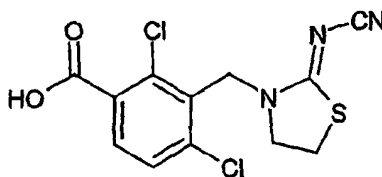
(b) 在中性范围内用于测定的洗脱液: 0.01 摩尔水的磷酸盐缓冲液, 乙腈; 10% 乙腈至 90% 乙腈的线性梯度-对应的测试结果在表 1 中以 ^{b)} 标记。

10 使用具有已知 logP 值的无支链的烷-2-酮 (3-16 个碳原子) 进行校准 (根据两个连续的链烷酮之间线性内插的保留时间测定 logP 值)。

根据 200nm-400nm 的 UV 光谱的色谱信号最大值确定 λ 最大值。

式 (II) 的起始物:

15 实施例 (II-1)

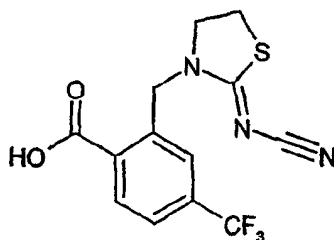


将 8.0g (23mmol) 2,4-二氯-3-[(2-氰基亚氨基-1,3-噻唑烷-3-基)甲基]苯甲酸甲酯, 0.9g (22.5mmol) 氢氧化钠, 80ml 1,4-二噁烷和 80ml 水的混合物加热至沸腾 5 分钟, 然后室温 (约 20℃) 下搅拌 60 分钟。随后减压浓缩至约一半体积, 然后用 100ml 水稀释并用 2N 盐酸酸化同时剧烈搅拌, 将所得结晶状产物抽吸过滤分离。

获得 5.0g (理论值的 66%) 的 2,4-二氯-3-[(2-氰基亚氨基-1,3-噻唑烷-3-基)-甲基]苯甲酸, 熔点为 208℃。

实施例 (II-2)

10



将 1.0g (2.9mmol) 2-[(2-氰基亚氨基-1,3-噻唑烷-3-基)-甲基]-4-三氟甲基苯甲酸甲酯, 0.17g (3.7mmol) 氢氧化钾, 5ml 2-甲氧基乙醇和 20ml 环己烷的混合物在室温 (约 20℃) 下搅拌 2 小时, 然后减压浓缩。将剩余物置入水中并用 2N 盐酸酸化, 将所得结晶状产物通过抽吸过滤分离。

获得 0.76g (理论值的 80%) 的 2-[(2-氰基亚氨基-1,3-噻唑烷-3-基)甲基]-4-三氟甲基苯甲酸。

LogP (pH=2.3): 2.01.

20 类似制备实施例 (II-1) 和 (II-2), 例如, 还可以制备下表 2 中所列的那些通式 (II) 化合物或通式 (IIb) 化合物

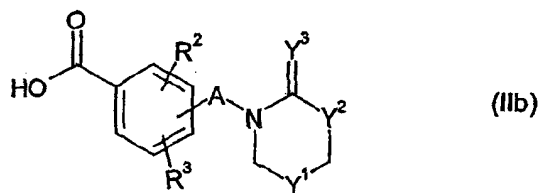
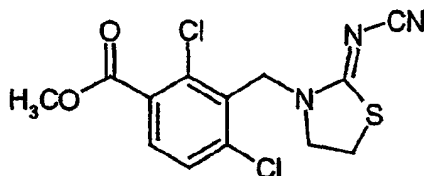


表 2: 式(II b)化合物的实施例

实施例 序号	(位置) A	(位置) R ²	(位置) R ³	Y ¹	Y ²	Y ³	物理数据
II-3	(3) CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	-	S	N-CN	熔点: 196°C
II-4	(3) CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	-	N-CH ₃	N-CN	
II-5	(3) CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	CH ₂	N-CH ₃	N-CN	
II-6	(3) CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	-	N-C ₂ H ₅	N-CN	
II-7	(3) CH ₂	(2) OCH ₃	(4) Cl	-	S	N-CN	

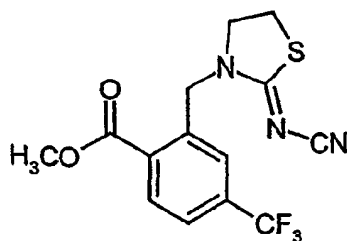
式(II a)的起始物:

5 实施例(II a-1)



- 将 7.0g (55mmol) 的 1,3-噻唑烷-2-亚氨基脒预先加入 100ml 四氢呋喃中,与 1.4g (55mmol) 的氯化钠(纯度 95%)混合,在室温(约 20℃)搅拌直至气体产生停止。然后向其中逐滴加入 15g (50mmol) 3-溴甲基-2,4-二氯苯甲酸甲酯的 40ml 四氢呋喃的溶液,将反应混合物在室温下搅拌 2 小时。然后减压浓缩,将剩余物置入二氯甲烷中,用弱酸性水和用饱和氯化钠水溶液洗涤,用硫酸钠干燥并过滤。减压浓缩滤液,将剩余物用乙醚溶解,然后通过抽吸过滤分离结晶状产物。
- 15 获得 14.4g (理论值的 76%) 的 2,4-二氯-3-[(2-氰基亚氨基-1,3-噻唑烷-3-基)-甲基]苯甲酸甲酯,熔点为 158℃。

实施例 (II a-2)



- 将 20.9g (70mmol) 2-溴甲基-4-三氟甲基苯甲酸甲酯, 8.95g (70mmol) 1,3-噻唑烷-2-亚基氨脒, 19g (140mmol) 碳酸钾, 50ml 丙酮和 200ml 乙腈的混合物加热至沸腾回流 4 小时, 然后减压浓缩。将剩余物置入水中并与二氯甲烷一起振荡。将有机相用硫酸钠干燥并过滤。减压浓缩滤液, 将剩余物用石油醚溶解, 然后通过抽吸过滤分离结晶状产物。
- 10 获得 18g (理论值的 74.5%) 的 2-[(2-氰基亚氨基-1,3-噻唑烷-3-基)甲基]-4-三氟甲基苯甲酸甲酯。

LogP (pH=2.3): 2.53。

类似实施例 (II a-1) 和 (II a-2), 例如, 还可以制备下表 3 中所列的那些通式 (II a) 化合物或通式 (II c) 化合物

15

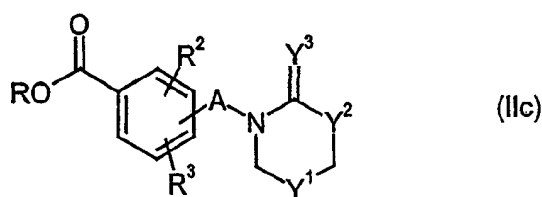


表 3: 式 (II c) 化合物的实例

实施例 序号	(位置) A	R	(位置) R ²	(位置) R ³	Y ¹	Y ²	Y ³	物理数据
IIa-3	(3) CH ₂	CH ₃	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	-	S	N-CN	熔点: 190°C
IIa-4	(3) CH ₂	CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	-	N-CH ₃	N-CH ₃	
IIa-5	(3) CH ₂	CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	CH ₂	N-CH ₃	N-CN	
IIa-6	(3) CH ₂	CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	-	N-C ₂ H ₅	N-CN	
IIa-7	(4) CH ₂	CH ₃	(2) NO ₂	-	-	N-CH ₃	N-CN	
IIa-8	(3) CH ₂	CH ₃	(2) OCH ₃	(4) Cl	-	S	N-CN	
IIa-9	(2) CH ₂	CH ₃	(4) CF ₃	-	CH ₂	N-CH ₃	N-CN	logP = 2.20 ^{a)}

应用实施例

5 实施例A

苗前处理试验

溶剂: 5 重量份丙酮

乳化剂: 1 重量份烷芳基聚乙二醇醚

10 为制备适合的活性物质制剂, 将 1 重量份的活性物质与上述量的溶剂混合, 加入上述量的乳化剂, 然后将浓缩物用水稀释至所需浓度。

将测试植物种子播种在正常土中。24 小时后, 将活性物质制剂喷雾至土壤, 以这样的一种方式使每单位面积上各自获得所需施用量的活性物质。选择喷雾液中活性物质的浓度以使所需施用量的活性物质各自以每公顷 1000 升水施用。

15 三周后, 与未处理对照植株的发育情况比较来评价植物的伤害程度, 以%伤害表示。下列数字表示:

0% = 没有活性(如同未处理对照)

100% = 全部杀死

在该试验中,例如,制备实施例1,2,10,11和13化合物表现出很强的除杂草活性,并在某些情况下,作物,例如玉米也具有很好的耐受性。

5 实施例B

苗后处理试验

溶剂: 5 重量份丙酮

乳化剂: 1 重量份烷芳基聚乙二醇醚

为制备适合的活性物质制剂,将1重量份的活性物质与上述量的溶
10 剂混合,加入上述量的乳化剂,然后将浓缩物用水稀释至所需浓度。

将长至 5-15cm 高的测试植物用活性物质制剂喷雾,以这样的一种方式使每单位面积上各自施用所需施用量的活性化合物。选择适当的喷雾液浓度以使所需施用量的活性物质各自以 1000 升水/公顷施用。

三周后,与未处理对照植株的发育情况比较来评价植物的伤害程
15 度,以%伤害表示。下列数字表示:

0% = 没有活性(如同未处理对照)

100% = 全部杀死

在该试验中,例如,制备实施例1,10和11化合物表现出很强的除杂草活性,并在某些情况下,作物例如玉米和小麦也具有很好的耐受性。