



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 03802204.4

[43] 公开日 2005 年 5 月 11 日

[11] 公开号 CN 1615310A

[22] 申请日 2003.1.21 [21] 申请号 03802204.4

[30] 优先权

[32] 2002.1.22 [33] CH [31] 0119/2002

[86] 国际申请 PCT/EP2003/000555 2003.1.21

[87] 国际公布 WO2003/062244 英 2003.7.31

[85] 进入国家阶段日期 2004.7.13

[71] 申请人 辛根塔参与股份公司

地址 瑞士巴塞尔

[72] 发明人 A·A·弗里德曼 A·斯托勒

S·文德博恩

[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

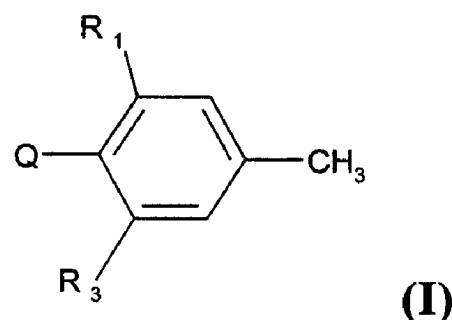
代理人 张 敏

权利要求书 9 页 说明书 73 页

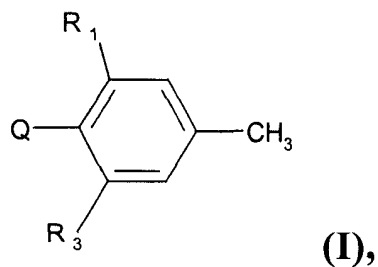
[54] 发明名称 可用作除草剂的苯基取代的杂环化
合物

[57] 摘要

下式化合物，其中各取代基是如权利要求 1 所定义的，以及这类化合物的农业上可接受的盐、异构体和对映体适合用作除草剂。



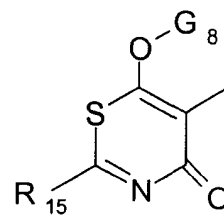
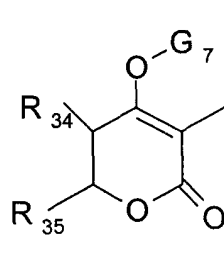
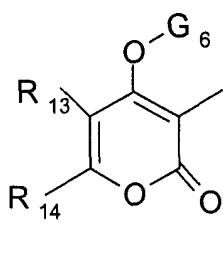
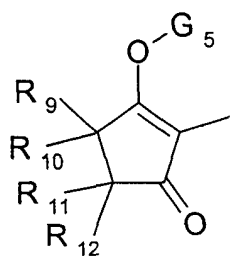
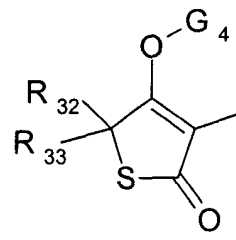
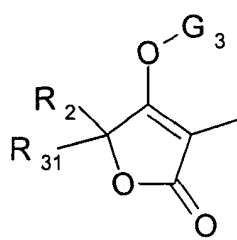
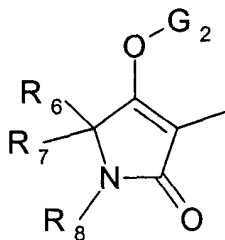
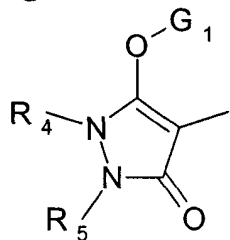
1、式 I 化合物

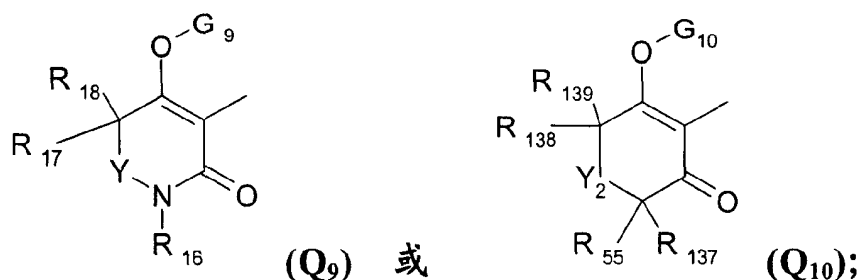


其中

R_1 和 R_3 彼此独立地是乙基、卤代乙基、乙炔基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 C_1 - C_2 烷基羰基、 C_1 - C_2 羟基烷基或 C_1 - C_2 烷氧基羰基；

Q 是下列基团





R_4 和 R_5 彼此独立地是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基、 C_2 - C_{10} -N-烷氧基-亚氨基烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基羰基烷基、 C_1 - C_{10} 氨基烷基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基氨基烷基、 C_1 - C_{10} 氰基烷基、 C_4 - C_{10} 环烷基烷基、 C_1 - C_{10} 苯基烷基、 C_1 - C_{10} 杂芳基烷基、 C_1 - C_{10} 苯氧基烷基、 C_1 - C_{10} 杂芳氧基烷基、 C_1 - C_{10} 亚烷基氨基氧基烷基、 C_1 - C_{10} 硝基烷基、 C_1 - C_{10} 三烷基甲硅烷基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基氨基羰基烷基、 C_2 - C_{10} 二烷基氨基羰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基氨基羰基氧基烷基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基羰基氨基烷基、 C_1 - C_{10} -N-烷氧基羰基-N-烷基氨基-烷基、 C_1 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；或者

R_4 和 R_5 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子，并且可以另外含有稠合或螺环连接的由 2 至 6 个碳原子组成的亚烷基或亚烯基链，该链进而可以含有一个或两个选自氧和硫的杂原子，该环有可能被苯基或苄基取代，二者各自进而可以被卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、羟基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷氧基- C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基或硝基取代；

R_2 、 R_6 和 R_{32} 彼此独立地是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；

R_7 、 R_{31} 和 R_{33} 彼此独立地是氢、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基或 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基；

R_8 是氢、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；或者

R_6 和 R_7 、或者 R_2 和 R_{31} 、或者 R_{32} 和 R_{33} 与它们所键合的原子一起构成饱和的 3-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；或者

R_6 和 R_8 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 和 R_{12} 彼此独立地是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} -炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；或者

R_9 和 R_{11} 、或者 R_9 和 R_{10} 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{34} 和 R_{35} 彼此独立地是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} -炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；或者

R_{13} 和 R_{14} 、或者 R_{34} 和 R_{35} 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{15} 是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基羰基烷基、 C_1 - C_{10} 氨基烷基、 C_3 - C_{10} 二

烷基氨基烷基、 C_2-C_{10} 烷基氨基烷基、 C_1-C_{10} 氰基烷基、 C_4-C_{10} 环烷基烷基、 C_1-C_{10} 苯基烷基、 C_1-C_{10} 杂芳基烷基、 C_1-C_{10} 苯氧基烷基、 C_1-C_{10} 杂芳氧基烷基、 C_1-C_{10} 硝基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；

R_{16} 是 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烯氧基烷基、 C_3-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；

R_{17} 是 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烯氧基烷基、 C_3-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；

R_{18} 是氢、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 烷基或 C_1-C_{10} 烷氧基烷基；或者

R_{17} 和 R_{18} 与它们所键合的原子一起构成 3-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

Y 是氧、硫、 $C-R_{19}$ 或 $N-R_{36}$ ；

R_{19} 和 R_{36} 彼此独立地是 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、苯基或杂芳基；或者

R_{18} 和 R_{19} 、或者 R_{18} 和 R_{36} 与它们所键合的原子一起构成饱和的 5-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 和 G_{10} 彼此独立地是 $-C(X_1)-R_{20}$ 、 $-C(X_2)-X_3-R_{21}$ 、 $-C(X_4)-N(R_{22})-R_{23}$ 、 $-SO_2-R_{24}$ 、 $-S(R_{200})_3$ 、 $-N(R_{300})_4$ 、 $-P(R_{400})_4$ 、 $-P(X_5)(R_{25})-R_{26}$ 或 $-CH_2-X_6-R_{27}$ ；

X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 和 X_6 彼此独立地是氧或硫；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{24} 、 R_{27} 和至少一个取代基 R_{200} 、至少一个取代基 R_{300} 、至少一个取代基 R_{400} 、取代基 R_{22} 和 R_{23} 中至少一个和取代基 R_{25} 和 R_{26} 中至少一个各自是 C_9-C_{32} 烷基、被一个或多个 C_1-C_8 烷基取代的 C_9-C_{32} 烷基、 C_9-C_{32} 烯基或者被一个或多个 C_1-C_8 烷基取代的 C_9-C_{32}

烯基,

其余一个或多个取代基 R_{200} 是或者另外是 C_1 - C_8 烷基、 C_3 - C_8 环烷基、苯基或者被烷基、卤素、烷氧基、硫代烷基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、氰基或硝基取代的苯基, 或者两个取代基 R_{200} 与它们所键合的硫原子一起构成 5-至 8-元环, 它可以被氧、氮或硫原子中断,

其余一个或多个取代基 R_{300} 是或者另外是氢、 C_1 - C_8 烷基、 C_3 - C_8 环烷基、苯基或者被烷基、卤素、烷氧基、硫代烷基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、氰基或硝基取代的苯基, 或者两个取代基 R_{300} 与它们所键合的氮原子一起构成 5-至 8-元环, 它可以被氧、氮或硫原子中断,

其余一个或多个取代基 R_{400} 是或者另外是 C_1 - C_8 烷基、苯基或者被烷基、卤素、烷氧基、硫代烷基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、氰基或硝基取代的苯基, 或者两个取代基 R_{400} 与它们所键合的磷原子一起构成 5-至 8-元环, 它可以被氧、氮或硫原子中断,

R_{22} 和 R_{23} 另外彼此独立地是氢、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_1 - C_{10} 氰基烷基、 C_1 - C_{10} 硝基烷基、 C_1 - C_{10} 氨基烷基、 C_1 - C_5 烷基氨基- C_1 - C_5 烷基、 C_2 - C_8 二烷基氨基- C_1 - C_5 烷基、 C_3 - C_7 环烷基- C_1 - C_5 烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_4 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_4 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基-烷基、 C_1 - C_5 烷基亚硫酰基- C_1 - C_5 烷基、 C_1 - C_5 烷基磺酰基- C_1 - C_5 烷基、 C_2 - C_8 亚烷基氨基-氧基- C_1 - C_5 烷基、 C_1 - C_5 烷基羰基- C_1 - C_5 烷基、 C_1 - C_5 烷氧基羰基- C_1 - C_5 烷基、 C_1 - C_5 氨基-羰基- C_1 - C_5 烷基、 C_2 - C_8 二烷基氨基羰基- C_1 - C_5 烷基、 C_1 - C_5 烷基羰基氨基- C_1 - C_5 烷基、 C_1 - C_5 烷基羰基-(C_2 - C_5 烷基)-氨基烷基、 C_3 - C_6 三烷基甲硅烷基- C_1 - C_5 烷基、苯基- C_1 - C_5 烷基、杂芳基- C_1 - C_5 烷基、苯氧基- C_1 - C_5 烷基、杂芳氧基- C_1 - C_5 烷基、 C_2 - C_5 烯基、 C_2 - C_5 卤代烯基、 C_3 - C_8 环烷基、苯基或者被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基、杂芳基或杂芳基氨基或者被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3

卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的杂芳基或杂芳基氨基、二杂芳基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二杂芳基氨基、苯基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基氨基、二苯基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二苯基氨基、 C_3-C_7 环烷基氨基、二- C_3-C_7 环烷基氨基或 C_3-C_7 环烷氧基；

R_{25} 和 R_{26} 另外是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_1-C_{10} 氰基烷基、 C_1-C_{10} 硝基烷基、 C_1-C_{10} 氨基烷基、 C_1-C_5 烷基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 二烷基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7 环烷基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 烯氧基烷基、 C_4-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_1-C_5 烷基亚硫酰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺酰基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亚烷基氨基-氧基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 氨基-羰基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 二烷基氨基-羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基-(C_2-C_5 烷基)-氨基烷基、 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基- C_1-C_5 烷基、苯基- C_1-C_5 烷基、杂芳基- C_1-C_5 烷基、苯氧基- C_1-C_5 烷基、杂芳氧基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_5 烯基、 C_2-C_5 卤代烯基、 C_3-C_8 环烷基、苯基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基、杂芳基或杂芳基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二杂芳基氨基、苯基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基氨基、二苯基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二苯基氨基、 C_3-C_7 环烷基氨基、二- C_3-C_7 环烷基氨基、 C_3-C_7 环烷氧基、 C_1-C_{10} 烷氧基、 C_1-C_{10} 卤代烷氧基、 C_1-C_5 烷基氨基、 C_2-C_8 -二烷基氨基、苄氧基或苯

氧基,该苄基和苯基有可能进而被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代;

Y_2 是氧、硫、 $C-R_{140}-R_{141}$ 或 $N-R_{142}$;

R_{55} 是 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烯氧基烷基、 C_3-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基;

R_{137} 是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基或 C_1-C_{10} 烷氧基烷基;或者

R_{55} 和 R_{137} 与它们所键合的原子一起构成 3-至 7-元环,它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_{138} 和 R_{139} 彼此独立地是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基或 C_2-C_{10} 烷氧基烷基;以及

R_{140} 和 R_{141} 彼此独立地是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基或 C_1-C_{10} 烷氧基烷基;或者

R_{55} 和 $C-R_{140}$ 与它们所键合的原子一起构成饱和或不饱和的 3-至 7-元环,它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_{142} 是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烯氧基烷基、 C_3-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基;或者

R_{55} 和 $N-R_{142}$ 与它们所键合的原子一起构成饱和或不饱和的 3-至 7-元环,它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子;

或这样一种化合物的农学上可接受的盐、异构体或对映体。

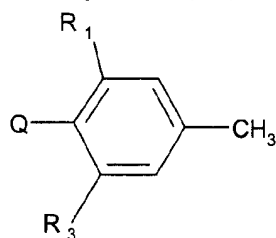
2、根据权利要求 1 的化合物,其中 Q 是 Q_1 。

3、根据权利要求 1 的化合物,其中 R_{20} 、 R_{21} 、 R_{24} 、 R_{27} 和至少一个取代基 R_{200} 、至少一个取代基 R_{300} 、至少一个取代基 R_{400} 、取代基

R_{22} 和 R_{23} 中至少一个和取代基 R_{25} 和 R_{26} 中至少一个各自是不分支的 C_9-C_{25} 烷基、在羰基 α -位被一个或多个 C_1-C_4 烷基取代的不分支的 C_9-C_{25} 烷基、不分支的 C_9-C_{25} 烯基或者在羰基 α -位被一个或多个 C_1-C_4 烷基取代的不分支的 C_9-C_{25} 烯基。

4、根据权利要求 3 的化合物，其中该烯基和 C_1-C_4 烷基-取代的烯基具有顺式构型的单一双键。

5、根据权利要求 1 的式 I 化合物的制备方法，该方法包含在惰性溶剂和碱的存在下，使式 II 化合物



(II),

其中 R_1 和 R_3 是如式 I 中所定义的， Q 是 Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 、 Q_5 、 Q_6 、 Q_7 、 Q_8 、 Q_9 或 Q_{10} ，其中取代基 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 和 G_{10} 是氢，

与式 III 化合物反应，

Hal-G (III),

其中 Hal 是氯、溴或碘， G 是 $-C(X_1)-R_{20}$ 、 $-C(X_2)-X_3-R_{21}$ 、 $-C(X_4)-N(R_{22})-R_{23}$ 、 $-SO_2-R_{24}$ 、 $-S(R_{200})_3$ 、 $-N(R_{300})_4$ 、 $-P(R_{400})_4$ 、 $-P(X_5)(R_{25})-R_{26}$ 或 $-CH_2-X_6-R_{27}$ ，其中 X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 与 X_6 和 R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{23} 、 R_{24} 、 R_{200} 、 R_{300} 、 R_{400} 、 R_{25} 、 R_{26} 与 R_{27} 定义同上。

6、除草与植物生长抑制组合物，该组合物在惰性载体上包含除草有效量的式 I 化合物。

7、除草与植物生长抑制组合物，该组合物在惰性载体上包含除草

有效量的式 I 化合物和除草剂拮抗作用有效量的安全剂。

8、除草与植物生长抑制组合物，该组合物在惰性载体上包含除草有效量的式 I 化合物和协同作用有效量的组合除草剂。

9、控制不需要的植物生长的方法，该方法包含向植物或其生长场所施用除草有效量的式 I 化合物或包含这样一种化合物的组合物。

10、抑制植物生长的方法，该方法包含向植物或其生长场所施用除草有效量的式 I 化合物或包含这样一种化合物的组合物。

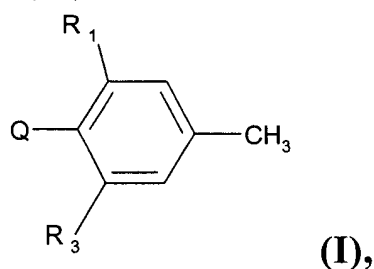
可用作除草剂的苯基取代的杂环化合物

本发明涉及新颖的、有除草活性的苯基取代的杂环化合物，涉及它们的制备方法，涉及包含这些化合物的组合物，还涉及它们在控制杂草中的用途，尤其是有用植物作物，或者在抑制植物生长中的用途。

具有除草作用的 3-羟基-4-芳基-5-氧代-吡唑啉衍生物例如描述在 WO 01/17972 中。

现已发现新颖的杂环化合物，它们被苯基取代，并且具有除草和生长抑制性质。

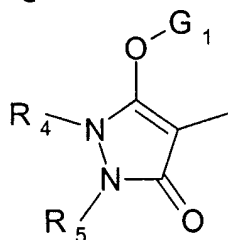
本发明因此涉及式 I 化合物



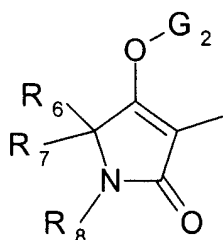
其中

R_1 和 R_3 彼此独立地是乙基、卤代乙基、乙炔基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 C_1 - C_2 烷基羰基、 C_1 - C_2 羟基烷基或 C_1 - C_2 烷氧基羰基；

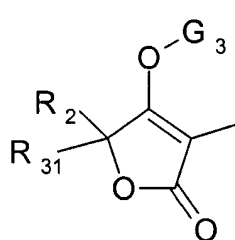
Q 是下列基团



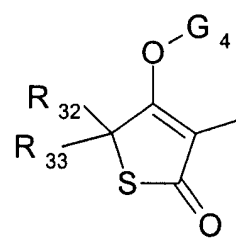
(Q₁),



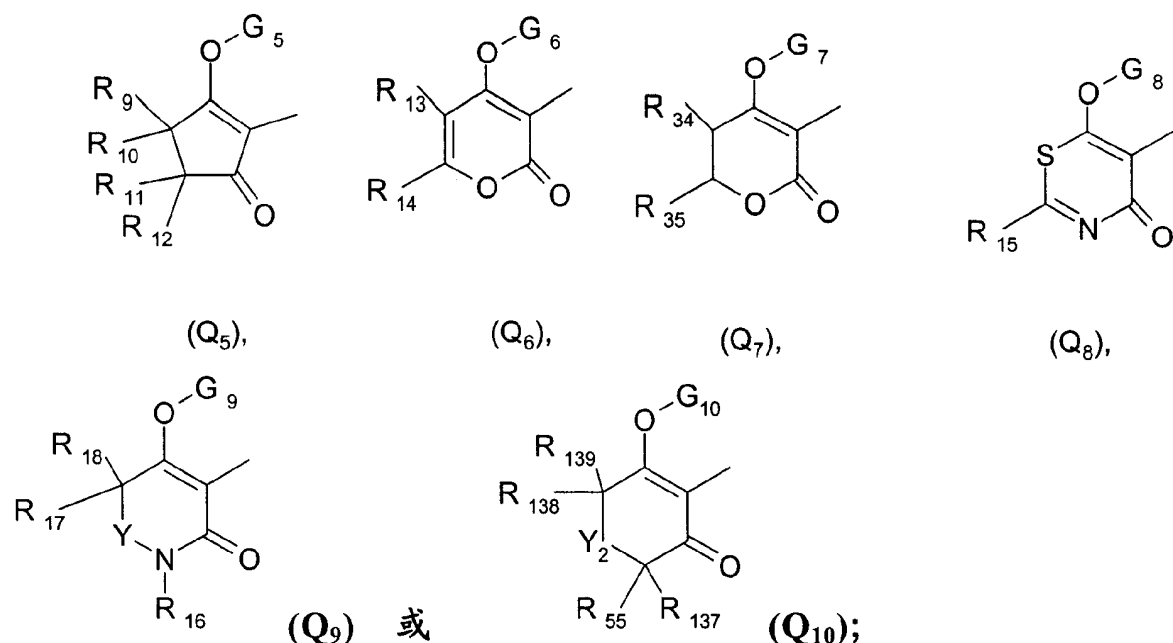
(Q₂),



(Q₃),



(Q₄),



R_4 和 R_5 彼此独立地是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基、 C_2 - C_{10} -N-烷氧基-亚氨基烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基羰基烷基、 C_1 - C_{10} 氨基烷基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基氨基烷基、 C_1 - C_{10} 氰基烷基、 C_4 - C_{10} 环烷基烷基、 C_1 - C_{10} 苯基烷基、 C_1 - C_{10} 杂芳基烷基、 C_1 - C_{10} 苯氧基烷基、 C_1 - C_{10} 杂芳氧基烷基、 C_1 - C_{10} 亚烷基氨基氧基烷基、 C_1 - C_{10} 硝基烷基、 C_1 - C_{10} 三烷基甲硅烷基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基氨基羰基烷基、 C_2 - C_{10} 二烷基氨基羰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基氨基羰基氧基烷基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基羰基氨基烷基、 C_1 - C_{10} -N-烷氧基羰基-N-烷基氨基-烷基、 C_1 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；或者

R_4 和 R_5 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子，并且可以另外含有稠合或螺环连接的由 2 至 6 个碳原子组成的亚烷基或亚烯基链，该链进而可以含有一个或两个选自氧和硫的杂原子，该环有可能被苯基或苄基取代，二者各自进而可以被卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷

基、羟基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷氧基- C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基或硝基取代;

R_2 、 R_6 和 R_{32} 彼此独立地是 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烯氧基烷基、 C_3-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基;

R_7 、 R_{31} 和 R_{33} 彼此独立地是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基或 C_2-C_{10} 烷氧基烷基;

R_8 是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烯氧基烷基、 C_3-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基;或者

R_6 和 R_7 、或者 R_2 和 R_{31} 、或者 R_{32} 和 R_{33} 与它们所键合的原子一起构成饱和的 3-至 7-元环,它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子;或者

R_6 和 R_8 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环,它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 和 R_{12} 彼此独立地是 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烯氧基烷基、 C_3-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基;或者

R_9 和 R_{11} 、或者 R_9 和 R_{10} 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环,它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{34} 和 R_{35} 彼此独立地是 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烯氧基烷基、 C_3-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2-C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基

基；或者

R_{13} 和 R_{14} 、或者 R_{34} 和 R_{35} 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{15} 是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基羰基烷基、 C_1 - C_{10} 氨基烷基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基氨基烷基、 C_1 - C_{10} 氰基烷基、 C_4 - C_{10} 环烷基烷基、 C_1 - C_{10} 苯基烷基、 C_1 - C_{10} 杂芳基烷基、 C_1 - C_{10} 苯氧基烷基、 C_1 - C_{10} 杂芳氧基烷基、 C_1 - C_{10} 硝基烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；

R_{16} 是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；

R_{17} 是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烯氧基烷基、 C_3 - C_{10} 炔氧基烷基、 C_2 - C_{10} 烷硫基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基、 C_3 - C_{10} 环烷基、芳基或杂芳基；

R_{18} 是氢、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 烷基或 C_1 - C_{10} 烷氧基烷基；或者

R_{17} 和 R_{18} 与它们所键合的原子一起构成 3-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

Y 是氧、硫、C- R_{19} 或 N- R_{36} ；

R_{19} 和 R_{36} 彼此独立地是 C_1 - C_{10} 烷基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、苯基或杂芳基；或者

R_{18} 和 R_{19} 、或者 R_{18} 和 R_{36} 与它们所键合的原子一起构成饱和的 5-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 和 G_{10} 彼此独立地是

$-\text{C}(\text{X}_1)-\text{R}_{20}$ 、 $-\text{C}(\text{X}_2)-\text{X}_3-\text{R}_{21}$ 、 $-\text{C}(\text{X}_4)-\text{N}(\text{R}_{22})-\text{R}_{23}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{R}_{24}$ 、 $-\text{S}(\text{R}_{200})_3$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{300})_4$ 、 $-\text{P}(\text{R}_{400})_4$ 、 $-\text{P}(\text{X}_5)(\text{R}_{25})-\text{R}_{26}$ 或 $-\text{CH}_2-\text{X}_6-\text{R}_{27}$;

X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 和 X_6 彼此独立地是氧或硫;

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{24} 、 R_{27} 和至少一个取代基 R_{200} 、至少一个取代基 R_{300} 、至少一个取代基 R_{400} 、取代基 R_{22} 和 R_{23} 中至少一个和取代基 R_{25} 和 R_{26} 中至少一个各自是 C_9-C_{32} 烷基、被一个或多个 C_1-C_8 烷基取代的 C_9-C_{32} 烷基、 C_9-C_{32} 烯基或者被一个或多个 C_1-C_8 烷基取代的 C_9-C_{32} 烯基,

其余一个或多个取代基 R_{200} 是或者另外是 C_1-C_8 烷基、 C_3-C_8 环烷基、苯基或者被烷基、卤素、烷氧基、硫代烷基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、氰基或硝基取代的苯基,或者两个取代基 R_{200} 与它们所键合的硫原子一起构成 5-至 8-元环,它可以被氧、氮或硫原子中断,

其余一个或多个取代基 R_{300} 是或者另外是氢、 C_1-C_8 烷基、 C_3-C_8 环烷基、苯基或者被烷基、卤素、烷氧基、硫代烷基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、氰基或硝基取代的苯基,或者两个取代基 R_{300} 与它们所键合的氮原子一起构成 5-至 8-元环,它可以被氧、氮或硫原子中断,

其余一个或多个取代基 R_{400} 是或者另外是 C_1-C_8 烷基、苯基或者被烷基、卤素、烷氧基、硫代烷基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、氰基或硝基取代的苯基,或者两个取代基 R_{400} 与它们所键合的磷原子一起构成 5-至 8-元环,它可以被氧、氮或硫原子中断,

R_{22} 和 R_{23} 另外彼此独立地是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_1-C_{10} 氰基烷基、 C_1-C_{10} 硝基烷基、 C_1-C_{10} 氨基烷基、 C_1-C_5 烷基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 二烷基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7 环烷基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 烯氧基烷基、 C_4-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基-烷基、 C_1-C_5 烷基亚硫酰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺酰基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亚烷基氨基-氧基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5

氨基-羰基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 二烷基氨基羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基-(C_2-C_5 烷基)-氨基烷基、 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基- C_1-C_5 烷基、苯基- C_1-C_5 烷基、杂芳基- C_1-C_5 烷基、苯氧基- C_1-C_5 烷基、杂芳氧基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_5 烯基、 C_2-C_5 卤代烯基、 C_3-C_8 环烷基、苯基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基、杂芳基或杂芳基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的杂芳基或杂芳基氨基、二杂芳基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二杂芳基氨基、苯基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基氨基、二苯基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二苯基氨基、 C_3-C_7 环烷基氨基、二- C_3-C_7 环烷基氨基或 C_3-C_7 环烷氧基；

R_{25} 和 R_{26} 另外是氢、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_1-C_{10} 氰基烷基、 C_1-C_{10} 硝基烷基、 C_1-C_{10} 氨基烷基、 C_1-C_5 烷基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 二烷基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7 环烷基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_{10} 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 烯氧基烷基、 C_4-C_{10} 炔氧基烷基、 C_2-C_{10} 烷硫基烷基、 C_1-C_5 烷基亚硫酰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺酰基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亚烷基氨基-氧基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 氨基-羰基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 二烷基氨基-羰基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基氨基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基羰基-(C_2-C_5 烷基)-氨基烷基、 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基- C_1-C_5 烷基、苯基- C_1-C_5 烷基、杂芳基- C_1-C_5 烷基、苯氧基- C_1-C_5 烷基、杂芳氧基- C_1-C_5 烷基、 C_2-C_5 烯基、 C_2-C_5 卤代烯基、 C_3-C_8 环烷基、苯基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基、杂芳基或杂芳基氨基或者被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的杂芳基或杂芳基氨基、二杂芳基氨基或者被

C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 卤代烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二杂芳基氨基、苯基氨基或者被 C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 卤代烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基氨基、二苯基氨基或者被 C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 卤代烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二苯基氨基、C₃-C₇ 环烷基氨基、二-C₃-C₇ 环烷基氨基、C₃-C₇ 环烷氧基、C₁-C₁₀ 烷氧基、C₁-C₁₀ 卤代烷氧基、C₁-C₅ 烷基氨基、C₂-C₈-二烷基氨基、苄氧基或苯氧基，该苄基和苯基有可能进而被 C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 卤代烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代；

Y₂ 是氧、硫、C-R₁₄₀-R₁₄₁ 或 N-R₁₄₂；

R₅₅ 是 C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 烯基、C₂-C₁₀ 炔基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₂-C₁₀ 烷氧基烷基、C₃-C₁₀ 烯氧基烷基、C₃-C₁₀ 炔氧基烷基、C₂-C₁₀ 烷硫基烷基、C₂-C₁₀ 烷基亚磺酰基烷基、C₂-C₁₀ 烷基磺酰基烷基、C₂-C₁₀ 烷基羰基烷基、C₃-C₁₀ 环烷基、芳基或杂芳基；

R₁₃₇ 是氢、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 烯基、C₂-C₁₀ 炔基或 C₁-C₁₀ 烷氧基烷基；或者

R₅₅ 和 R₁₃₇ 与它们所键合的原子一起构成 3-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

R₁₃₈ 和 R₁₃₉ 彼此独立地是氢、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 烯基、C₂-C₁₀ 炔基或 C₂-C₁₀ 烷氧基烷基；和

R₁₄₀ 和 R₁₄₁ 彼此独立地是氢、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 烯基、C₂-C₁₀ 炔基或 C₁-C₁₀ 烷氧基烷基；或者

R₅₅ 和 C-R₁₄₀ 与它们所键合的原子一起构成饱和或不饱和的 3-至 7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

R₁₄₂ 是氢、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₂-C₁₀ 烷氧基烷基、C₃-C₁₀ 烯氧基烷基、C₃-C₁₀ 炔氧基烷基、C₂-C₁₀ 烷硫基烷基、C₂-C₁₀ 烷基亚磺酰基烷基、C₂-C₁₀ 烷基磺酰基烷基、C₃-C₁₀ 环烷基、芳基或杂芳基；或者

R₅₅ 和 N-R₁₄₂ 与它们所键合的原子一起构成饱和或不饱和的 3-至

7-元环，它可以含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子；

和这类化合物的农学上可接受的盐、异构体和对映体。

出现在取代基定义中的烷基可以是直链或支链的，例如是甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基，以及戊基、己基、庚基、辛基、壬基和癸基异构体。高级烷基基团、尤其是具有 11 至 25 个碳原子、优选 11、15、17、19 和 23 个碳原子的那些，优选地是不分支的。它们可以被一个或多个 C_1 - C_4 烷基取代，尤其是甲基、乙基或异丙基，优选地取代在与它们相邻的羰基 α -位。卤代烷基例如是氟代甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯代甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟乙基和 2,2,2-三氯乙基；优选三氯甲基、二氟氯代甲基、二氟甲基、三氟甲基和二氯氟代甲基。烷氧基烷基例如是甲氧基甲基、乙氧基甲基、丙氧基乙基、异丙氧基乙基、正丁氧基甲基、异丁氧基-正丁基、仲丁氧基甲基和叔丁氧基-异丙基，优选甲氧基甲基和乙氧基甲基。烷氧基、烯基、炔基、烷氧基烷基、烷硫基、烷基磺酰基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基、烷基氨基烷基、苯基烷基、硝基烷基、氨基烷基和 N-烷氧基羰基-N-烷基氨基烷基是从所述烷基基团衍生的。烯基和炔基可以是单-或多-不饱和的。烯基被理解为例如乙烯基、烯丙基、甲代烯丙基、1-甲基乙烯基或丁-2-烯-1-基。高级烯基基团、尤其是具有 11 至 25 个碳原子、优选 17 或 19 个碳原子的那些，优选地是不分支的。它们可以被一个或多个 C_1 - C_4 烷基取代，尤其是甲基、乙基或异丙基，优选地取代在与它们相邻的羰基 α -位。在烯基中特别优选含有顺式构型单一双键的那些。炔基例如是乙炔基、炔丙基、丁-2-炔-1-基、2-甲基丁炔-2-基或丁-3-炔-2-基。卤代烷基优选地具有 1 至 4 个碳原子的链长。卤代烷基例如是氟代甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯代甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟乙基和 2,2,2-三氯乙基；优选三氯甲基、二氟氯代甲基、二氟甲基、三氟甲基和二氯氟代甲基。作为卤代烯基，单-或多-卤代-取代的

烯基是适合的，卤素是氟、氯、溴或碘，尤其是氟或氯，例如 2,2-二氟-1-甲基乙烯基、3-氟丙烯基、3-氯丙烯基、3-溴丙烯基、2,3,3-三氟丙烯基、2,3,3-三氯丙烯基和 4,4,4-三氟丁-2-烯-1-基。在单-、二-或三-卤代-取代的 C_2-C_6 烯基中，优选具有 3 至 5 个碳原子的链长的那些。

烷氧基优选地具有 1 至 6 个碳原子的链长。烷氧基例如是甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基和叔丁氧基，以及戊氧基和己氧基异构体；优选甲氧基和乙氧基。烷基羰基优选地是乙酰基或丙酰基。烷氧基羰基例如是甲氧基羰基、乙氧基羰基、丙氧基羰基、异丙氧基羰基、正丁氧基羰基、异丁氧基羰基、仲丁氧基羰基或叔丁氧基羰基；优选甲氧基羰基或乙氧基羰基。

烷硫基优选地具有 1 至 4 个碳原子的链长。烷硫基例如是甲硫基、乙硫基、丙硫基、异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基，优选甲硫基和乙硫基。

烷基亚磺酰基例如是甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、丙基亚磺酰基、异丙基亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、异丁基亚磺酰基、仲丁基亚磺酰基或叔丁基亚磺酰基；优选甲基亚磺酰基或乙基亚磺酰基。

烷基磺酰基例如是甲基磺酰基、乙基磺酰基、丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、异丁基磺酰基、仲丁基磺酰基或叔丁基磺酰基；优选甲基磺酰基或乙基磺酰基。

烷基氨基例如是甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基、异丙基氨基或丁基氨基异构体。

二烷基氨基例如是二甲氨基、甲乙氨基、二乙氨基、正丙基甲基氨基、二丁氨基和二异丙氨基。

烷氧基烷基优选地具有 1 至 6 个碳原子。烷氧基烷基例如是甲氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、正丙氧基甲基、正丙氧基乙基、异丙氧基甲基或异丙氧基乙基。

烷硫基烷基例如是甲硫基甲基、甲硫基乙基、乙硫基甲基、乙硫基乙基、正丙硫基甲基、正丙硫基乙基、异丙硫基甲基、异丙硫基乙基、丁硫基甲基、丁硫基乙基或丁硫基丁基。

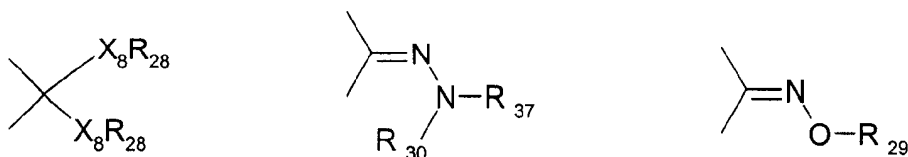
苯基可以是被取代的形式，在这种情况下取代基可以位于邻-、间-和/或对-位。优选的取代基位置是环附着位置的邻-位和对-位。

芳基例如是苯基或萘基。这些基团也可以是被取代基的，苯基、包括作为取代基、例如苯基烷基的一部分的苯基在内，当在定义中不是另有表示时，例如可以被卤素、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 烷基亚硫酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、羧基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、氨基、 C_1 - C_4 烷基氨基、 C_1 - C_4 二烷基氨基或 C_1 - C_4 烷基羰基氨基取代。

杂芳基通常是芳族杂环，优选地含有 1 至 3 个杂原子，例如氮、硫和氧。适合的杂环和杂芳族化合物的实例是：吡咯烷、哌啶、吡喃、二噁烷、氮杂环丁烷、氧杂环丁烷、吡啶、嘧啶、三嗪、噻唑、噻二唑、咪唑、噁唑、异噁唑、吡嗪、呋喃、吗啉、哌嗪、吡唑、苯并噁唑、苯并噻唑、喹喔啉和喹啉。这些杂环和杂芳族化合物例如可以进一步被卤素、烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、硝基、氰基、硫代烷基、烷基氨基或苯基取代。

在本发明的上下文中，3-至 7-元环被理解为这样的环系，除了碳原子和已经存在于取代基 Q 环中的任何杂原子以外，还可以含有一个或多个杂原子，例如氮、氧和/或硫。它们可以是饱和的或不饱和的。例如，在基团 Q_2 的情况下，可以由取代基 R_6 和 R_7 构成不饱和键。这类环系优选地含有 5 至 7 个环原子。

3-至 7-元环包括环烷基，例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基和环辛基，也可以被取代。适合的取代基是卤素、羟基、硝基、氰基、 C_1 - C_4 烷基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基羰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、酮基、 C_2 - C_4 烯氧基亚氨基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、或者下列 3 个基团之一



其中 X_8 是硫或氧, R_{28} 是 C_1 - C_4 烷氧基或者两个 R_{28} 与它们所键合的 $-X_8-C-X_8$ -桥一起构成 5-或 6-元环, 它可以被甲基、乙基、甲氧基或酮基取代,

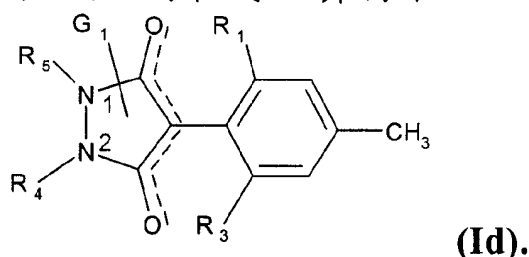
R_{29} 是 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_2 - C_4 烯基或 C_2 - C_4 卤代烯基,

R_{30} 和 R_{37} 彼此独立地是 C_1 - C_4 烷基、苯基或 C_2 - C_4 烯基, 或者 R_{30} 和 R_{37} 与它们所键合的氮原子一起构成 5-或 6-元环, 它可以含有选自氮、氧和硫的杂原子。

在取代基定义中, 碳原子数表示烷基、烯基和炔基以及从它们衍生的基团、例如卤代烷基或烯氧基中的碳原子总数。 C_2 - C_3 烷氧基烷基因此包括甲氧基甲基、甲氧基乙基和乙氧基甲基。 C_3 烷氧基羰基烷基包括甲氧基羰基乙基和乙氧基羰基甲基。

依赖于取代基的属性, 式 I 化合物还可以存在几何和/或旋光异构体和异构体混合物以及互变体和互变体混合物。本发明同样涉及这样的式 I 化合物。

例如, 当由 R_4 和 R_5 一起构成的环是不对称取代的、稠合或螺环连接的, 式 I 化合物例如可以存在式 Id 异构体



本发明还涉及式 I 化合物能够优选与胺、碱金属与碱土金属碱或季铵碱生成的盐。适合的成盐剂例如描述在 WO 98/41089 中。

本发明还涉及式 I 化合物能够与胺、碱金属与碱土金属碱或季铵碱生成的盐。在作为成盐剂的碱金属与碱土金属氢氧化物中，特别应当提到锂、钠、钾、镁和钙的氢氧化物，尤其是钠和钾的氢氧化物。

适合于铵盐生成的胺的实例包括氨以及伯、仲与叔 C_1 - C_{18} 烷基胺、 C_1 - C_4 羟基烷基胺和 C_2 - C_4 烷氧基烷基胺，例如甲胺、乙胺、正丙胺、异丙胺、四种丁胺异构体、正戊胺、异戊胺、己胺、庚胺、辛胺、壬胺、癸胺、十五烷基胺、十六烷基胺、十七烷基胺、十八烷基胺、甲基-乙基胺、甲基-异丙基胺、甲基-己基胺、甲基-壬基胺、甲基-十五烷基胺、甲基-十八烷基胺、乙基-丁基胺、乙基-庚基胺、乙基-辛基胺、己基-庚基胺、己基-辛基胺、二甲胺、二乙胺、二-正丙胺、二异丙胺、二-正丁胺、二-正戊胺、二异戊胺、二己胺、二庚胺、二辛胺、乙醇胺、正丙醇胺、异丙醇胺、N,N-二乙醇胺、N-乙基丙醇胺、N-丁基乙醇胺、烯丙胺、正丁烯基-2-胺、正戊烯基-2-胺、2,3-二甲基丁烯基-2-胺、二丁烯基-2-胺、正己烯基-2-胺、亚丙基二胺、三甲胺、三乙胺、三-正丙胺、三异丙胺、三-正丁胺、三异丁胺、三-仲丁胺、三-正戊胺、甲氧基乙基胺和乙氧基乙基胺；杂环胺，例如吡啶、喹啉、异喹啉、吗啉、哌啶、吡咯烷、二氢吡啶、奎宁环和氮杂茛；伯芳基胺，例如苯胺、甲氧基苯胺、乙氧基苯胺、邻-、间-与对-甲苯胺、苯二胺、联苯胺、萘胺和邻-、间-与对-氯苯胺；尤其是三乙胺、异丙胺和二异丙胺。

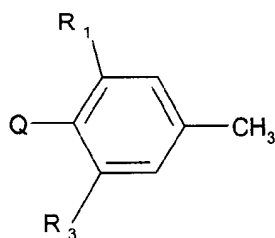
优选适合于成盐的季铵碱例如相当于式 $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$ ，其中 R_a 、 R_b 、 R_c 和 R_d 彼此独立地是 C_1 - C_4 烷基。其他适合的具有其他阴离子的四烷基铵碱例如可以借助阴离子交换反应获得。

在式 I 化合物中, 优选其中 Q 是 Q₁ 的那些。

进一步优选的式 I 化合物是这样的, 其中 R₄ 和 R₅ 彼此独立地是 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₄-C₆ 烯氧基烷基、C₄-C₆ 炔氧基烷基、C₂-C₆ 烷硫基烷基、C₂-C₆ 烷基亚硫酰基烷基、C₂-C₆ 烷基磺酰基烷基、C₂-C₆ 烷基羰基烷基、C₃-C₆-N-烷氧基-亚氨基烷基、C₃-C₆ 烷氧基羰基烷基、C₁-C₆ 氨基烷基、C₂-C₆ 二烷基氨基烷基、C₃-C₆ 烷基氨基烷基、C₁-C₆ 氰基烷基、C₄-C₈ 环烷基烷基、C₇-C₈ 苯基烷基、C₇-C₈ 杂芳基烷基、C₇-C₈ 苯氧基烷基、C₇-C₈ 杂芳氧基烷基、C₄-C₆ 亚烷基氨基氧基烷基、C₁-C₆ 硝基烷基、C₄-C₈ 三烷基甲硅烷基烷基、C₄-C₆ 烷基氨基羰基、C₃-C₆ 二烷基氨基羰基、C₄-C₈ 烷基氨基羰基氧基烷基、C₄-C₈ 二烷基氨基羰基氧基烷基、C₄-C₈ 烷氧基羰基氨基烷基、C₄-C₈-N-烷氧基羰基-N-烷基氨基-烷基、C₃-C₈ 环烷基、芳基或杂芳基, 或者 R₄ 和 R₅ 与它们所键合的原子一起构成 5-至 7-元环。

尤其优选的式 I 化合物是这样的, 其中 R₁ 和 R₃ 彼此独立地是乙基、卤代乙基、乙炔基、C₁-C₂ 烷氧基、C₁-C₂ 卤代烷氧基或 C₁-C₂ 烷基羰基; Q 是基团 Q₁, 其中 G₁ 是 -C(O)-R₂₀, 其中 R₂₀ 是 C₉-C₂₅ 烷基、被一个或多个 C₁-C₄ 烷基取代的 C₉-C₂₅ 烷基、C₉-C₂₅ 烯基或者被一个或多个 C₁-C₄ 烷基取代的 C₉-C₂₅ 烯基, R₄ 和 R₅ 与它们所键合的氮原子一起构成 5-至 7-元环, 它可以含有一个或两个选自氮、硫、以及尤其是氧的杂原子。

式 I 化合物可以按照本身已知的方法制备, 在惰性溶剂和碱的存在下, 使式 II 化合物



(II),

其中 R_1 和 R_3 是如式 I 所定义的, Q 是 Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 、 Q_5 、 Q_6 、 Q_7 、 Q_8 、 Q_9 或 Q_{10} , 其中取代基 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 和 G_{10} 是氢,

与式 III 化合物反应,



其中 Hal 是氯、溴或碘, G 是 $-\text{C}(\text{X}_1)-\text{R}_{20}$ 、 $-\text{C}(\text{X}_2)-\text{X}_3-\text{R}_{21}$ 、 $-\text{C}(\text{X}_4)-\text{N}(\text{R}_{22})-\text{R}_{23}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{R}_{24}$ 、 $-\text{S}(\text{R}_{200})_3$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{300})_4$ 、 $-\text{P}(\text{R}_{400})_4$ 、 $-\text{P}(\text{X}_5)(\text{R}_{25})-\text{R}_{26}$ 或 $-\text{CH}_2-\text{X}_6-\text{R}_{27}$, 其中 X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 与 X_6 和 R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{23} 、 R_{24} 、 R_{200} 、 R_{300} 、 R_{400} 、 R_{25} 、 R_{26} 与 R_{27} 定义同上。

式 II 化合物是已知的, 例如描述在 WO 01/17972 中。式 III 化合物也是已知的; 它们可以借助常规方法烷基化, 例如金属化反应。

适合的碱例如是胺, 例如三甲胺和三乙胺, 以及三-碱金属磷酸盐、碱金属与碱土金属氢化物、碱金属与碱土金属氨基化物或碱金属醇化物, 例如磷酸三钾、氯化钠、二异丙氨基化锂(LDA)、叔丁醇钠或叔丁醇钾。特别优选三甲胺。

在式 I 化合物的制备中, 还可以酌情使用增加酰卤活性的催化剂, 例如 4-N,N-二甲氨基吡啶。

适合的溶剂例如是芳族烃, 例如二甲苯或甲苯, 醚, 例如四氢呋喃、二噁烷或乙二醇二甲醚, 二甲基亚砷, 叔酰胺, 例如二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或二甲基乙酰胺, 或脂族脲, 例如 N,N'-二甲基亚丙基脲。

按照本发明, 就式 I 化合物或包含它们的组合物的用途而言, 可以考虑农业中惯用的所有施用方法, 例如芽前施用、芽后施用和种子敷裹, 以及各种方法和技术, 例如活性成分的控制释放。为此, 将活

性成分的溶液涂敷于无机颗粒载体或聚合物颗粒(尿素/甲醛),干燥。如果需要的话也有可能施用包衣(包衣的颗粒),这允许活性成分历经指定时间被计量释放。

式 I 化合物在用作除草剂时可以是它们未经修饰的形式,也就是说合成所得形式,但是优选地按照惯用方式将它们与制剂技术中常用的助剂一起配制,例如制成可乳化的浓缩物、可直接喷洒或稀释的溶液、稀乳剂、可湿性粉剂、可溶性粉剂、粉剂、颗粒剂或微囊剂。这类制剂例如描述在 WO 97/34485 的第 9 至 13 页上。关于组合物的属性,按照预期目的和当前环境选择施用方法,例如喷洒、雾化、撒布、湿润、扩散或倾倒。

包含式 I 化合物(活性成分)或至少一种式 I 化合物和通常一种或多种固体或液体制剂助剂的制剂、也就是说组合物、制备物或混合物,是按照已知方式制备的,例如均匀混合和/或研磨活性成分与制剂助剂,例如溶剂或固体载体。在制剂的制备中还可以另外使用表面活性化合物(表面活性剂)。溶剂和固体载体的实例例如参见 WO 97/34485 的第 6 页。

根据所要配制的式 I 化合物的属性,适合的表面活性化合物有非离子型、阳离子型和/或阴离子型表面活性剂和表面活性剂混合物,它们具有良好的乳化、分散和湿润性质。适合的阴离子型、非离子型和阳离子型表面活性剂的实例例如列举在 WO 97/34485 的第 7 和 8 页上。另外,制剂技术中常用的表面活性剂尤其描述在"McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1981, Stache, H., "Tensid-Taschenbuch", Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna 1981,和 M. and J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81, 也适合于制备根据本发明的除草组合物。

通过加入喷洒筒助剂，可以增加含有除草有效量的式 I 化合物的根据本发明的除草与植物生长抑制组合物的活性。

这类助剂例如可以是：非离子表面活性剂、非离子表面活性剂混合物、阴离子表面活性剂与非离子表面活性剂混合物、阳离子表面活性剂、有机硅表面活性剂、含有与不含表面活性剂的矿物油衍生物、加入与不加入表面活性剂的植物油衍生物、含有与不含表面活性剂的植物或矿物来源的油的烷基化衍生物、含有与不含表面活性剂的鱼油和其他动物油（动物性的）及其烷基衍生物、优选含有 8 至 28 个碳原子的天然存在的高级脂肪酸及其烷基酯衍生物、含有芳族环系和一个或多个羧酸酯的有机酸及其烷基衍生物、和乙酸乙烯酯聚合物或乙酸乙烯酯/丙烯酸乙烯酯共聚物的混悬液。个别助剂彼此的混合物以及与有机溶剂的组合能够导致作用的进一步增加。

适合的非离子表面活性剂例如是脂族或脂环族醇的、饱和或不饱和脂肪酸的和烷基酚的聚乙二醇醚衍生物，它们可以优选地含有 3 至 30 个乙二醇醚基团，在（脂族）烃基团中含有 8 至 20 个碳原子，在烷基酚的烷基基团中含有 6 至 18 个碳原子。

进一步适合的非离子表面活性剂是聚氧乙烯与聚丙二醇的水溶性加合物、乙二氨基聚丙二醇和烷基聚丙二醇，优选地在烷基链中含有 1 至 10 个碳原子，该加合物含有 20 至 250 个乙二醇醚基团和 10 至 100 个丙二醇醚基团。这些化合物通常含有 1 至 5 个乙二醇单元每丙二醇单元。

可以提到的非离子表面活性剂的进一步实例包括壬基苯酚聚乙氧基乙醇、蓖麻油聚乙二醇醚、聚氧丙烯/聚氧乙烯加合物、三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇、聚乙二醇和辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。

此外，聚氧乙烯失水山梨醇的脂肪酸酯也是可以考虑的，例如聚氧乙烯失水山梨醇三油酸酯。

在阴离子表面活性剂中，尤其优选烷基硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐和烷基化磷酸及其乙氧基化衍生物。烷基基团通常含有 8 至 24 个碳原子。

优选的非离子表面活性剂是已知的下列商品：

聚氧乙烯椰油烷基胺 (e.g. AMIET[®] 105 (Kao Co.)), 聚氧乙烯油基胺 (e.g. AMIET[®] 415 (Kao Co.)), 壬基苯酚聚乙氧基乙醇, 聚氧乙烯硬脂酰基胺 (e.g. AMIET[®] 320 (Kao Co.)), N-聚乙氧基乙基胺 (e.g. GENAMIN[®] (Hoechst AG)), N,N,N',N'-四(聚乙氧基聚丙氧基乙基)乙二胺 (e.g. TERRONIL[®] and TETRONIC[®] (BASF Wyandotte Corp.)), BRIJ[®] (Atlas Chemicals), ETHYLAN[®] CD and ETHYLAN[®] D (Diamond Shamrock), GENAPOL[®] C, GENAPOL[®] O, GENAPOL[®] S and GENAPOL[®] X080 (Hoechst AG), EMULGEN[®] 104P, EMULGEN[®] 109P and EMULGEN[®] 408 (Kao Co.); DISTY[®] 125 (Geronazzo), SOPROPHOR[®] CY 18 (Rhone Poulenc S.A.); NONISOL[®] (Ciba-Geigy), MYRJ[®] (ICI); TWEEN[®] (ICI); EMULSOGEN[®] (Hoechst AG); AMIDOX[®] (Stephan Chemical Co.), ETHOMID[®] (Armak Co.); PLURONIC[®] (BASF Wyandotte Corp.), SOPROPHOR[®] 461P (Rhone Poulenc S.A.), SOPROPHOR[®] 496/P (Rhone Poulenc S.A.), ANTAROX FM-63 (Rhone Poulenc S.A.), SLYGARD 309 (Dow Corning), SILWET 408, SILWET L-7607N (Osi-Specialities)。

阳离子表面活性剂尤其是季铵盐，含有至少一个具有 8 至 22 个碳原子的烷基基团作为 N-取代基，并且具有低级未取代的或卤化的烷基、苄基或羟基-低级烷基基团作为进一步的取代基。盐优选地是卤化物、甲基硫酸盐或乙基硫酸盐的形式，例如氯化硬脂酰基三甲基铵或溴化苄基二(2-氯乙基)乙基铵。

所用的油可以是矿物或天然来源的。天然的油此外可以是动物或植物来源的。在动物油的情况下，尤其优选牛脂衍生物，以及鱼油（例如沙丁鱼）及其衍生物。植物油通常是各种来源的种子油。作为尤其使用的植物油的实例，可以提到椰子油、菜籽油和向日葵油及其衍生物。

在根据本发明的组合物中，油添加剂的用量一般是 0.01 至 2%，基于喷洒混合物而言。油添加剂例如可以在已经制得喷洒混合物之后按所需浓度加入到喷洒筒内。

在根据本发明的组合物中，优选的油添加剂包含植物来源的油，例如菜籽油或向日葵油，植物来源油的烷基酯，例如甲基衍生物，或矿物油。

尤其优选的油添加剂包含高级脂肪酸(C_8-C_{22})的烷基酯，尤其是 $C_{12}-C_{18}$ 脂肪酸的甲基衍生物，例如月桂酸、棕榈酸和油酸的甲基酯。这些酯称为月桂酸甲酯(CAS-111-82-0)、棕榈酸甲酯(CAS-112-39-0)和油酸甲酯(CAS-112-62-9)。

通过与表面活性物质联合使用，可以提高油添加剂的施用和作用，例如非离子、阴离子或阳离子表面活性剂。适合的阴离子、非离子和阳离子表面活性剂的实例列在 WO 97/34485 第 7 和 8 页中。

优选的表面活性物质是十二烷基苄基磺酸盐类型的阴离子表面活性剂，尤其是其钙盐，以及脂肪醇乙氧基化物类型的非离子表面活性剂。特别优选乙氧基化 $C_{12}-C_{22}$ 脂肪醇，乙氧基化程度为 5 至 40。商业上可得到的优选表面活性剂的实例是 Genapol 类型(Clariant AG, Muttenz, Switzerland)。基于总添加剂而言，表面活性物质的浓度一般是 1 至 30 重量%。

由油或矿物油或其衍生物与表面活性剂组成的油添加剂的实例是

Edenor ME SU®, **Emery 2231®** (Henkel subsidiary **Cognis GMBH**, **DE**), **Turbocharge®** (**Zeneca Agro**, **Stoney Creek, Ontario, CA**)或者尤其是 **Actipron®** (**BP Oil UK Limited, GB**)。

向油添加剂/表面活性剂混合物加入有机溶剂此外可以带来作用的进一步增加。适合的溶剂例如是 **Solvesso®** (**ESSO**)或 **Aromatic Solvent®** (**Exxon Corporation**)类型。

这些溶剂的浓度可以占总重量的 10 至 80%。

这类油添加剂例如也描述在 **US-A-4 834 908** 中, 是根据本发明的组合物所尤其优选的。尤其优选的油添加剂是 **MERGE®**; 它可以从 **BASF Corporation** 获得, 其基本说明例如参见 **US-A-4 834 908** 第 5 栏, 实施例 **COC-1**。按照本发明优选的另一油添加剂是 **SCORE®** (**Novartis Crop Protection Canada**)。

表面活性剂, 油、尤其是植物油, 其衍生物, 例如烷基化脂肪酸及其混合物, 例如优选与阴离子表面活性剂的混合物, 例如烷基化磷酸、烷基硫酸盐和烷基芳基磺酸盐以及高级脂肪酸, 它们是制剂和助剂技术中惯用的, 也可以用在根据本发明的组合物及其喷洒筒溶液中, 尤其描述于 "**McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual**" **MC Publishing Corp.**, **Ridgewood New Jersey, 1998**, **Stache, H.**, "**Tensid-Taschenbuch**", **Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna, 1990**, **M. and J. Ash**, "**Encyclopedia of Surfactants**", **Vol I-IV**, **Chemical Publishing Co.**, **New York, 1981-89**, **G. Kapusta**, "**A Compendium of Herbicide Adjuvants**", **Southern Illinois Univ., 1998**, **L. Thomson Harvey**, "**A Guide to Agricultural Spray Adjuvants Used in the United States**", **Thomson Pubns., 1992**。

除草制剂通常含有 0.1 至 99 重量%、尤其 0.1 至 95 重量%的除草剂, 1 至 99.9 重量%、尤其 5 至 99.8 重量%的固体或液体制剂助剂,

和 0 至 25 重量%、尤其 0.1 至 25 重量%的表面活性剂。尽管商业产品将优选地被配制成浓缩物，不过终端用户将通常采用稀制剂。组合物还可以包含另外的成分，例如稳定剂，例如植物油或环氧化植物油（环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油），防沫剂，例如硅酮油，防腐剂，粘度调节剂，粘合剂，增稠剂以及肥料或其他活性成分。

式 I 化合物一般施用于植物或其局部，施用比率为 0.001 至 4kg/ha，尤其是 0.005 至 2kg/ha。达到所需效果所需的浓度可以借助实验加以测定。这依赖于作用的属性、所培育的植物与种子的发育阶段和施用条件（位置、时间、方法），可以作为这些参数的函数各不相同。

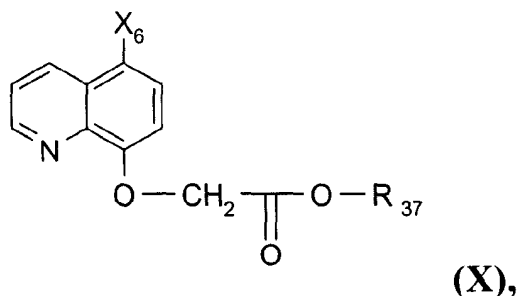
式 I 化合物是以除草和生长抑制性质为特征的，这允许它们用于有用的植物作物，尤其是谷类、棉花、大豆、甜菜、甘蔗、栽培作物、油菜、玉蜀黍和稻，也用于非选择性杂草控制。术语“作物”被理解为也包括已对一类或几类除草剂产生耐受性的作物，而这是常规育种方法或遗传工程技术的后果，它们例如是 IMI Maize, Poast Protected Maize (稀禾定耐受性), Liberty Link Maize, B.t./Liberty Link Maize, IMI/Liberty Link Maize, IMI/Liberty Link /B.t. Maize, Roundup Ready Maize 和 Roundup Ready/B.t. Maize。

所要控制的杂草可以是单子叶或双子叶的杂草，例如繁缕属、豆瓣菜属、剪股颖属、马唐属、燕麦属、狗尾草属、白芥属、黑麦草属、茄属、稗属、蔗草属、雨久花属、慈菇属、雀麦属、看麦娘属、石茅高粱、稷属、筒轴茅属、莎草属、苘麻属、黄花稔属、苍耳属、苋属、藜属、番薯属、苘蒿属、猪殃殃属、董菜属和婆婆纳属。

已经惊人地表明，从 US-A-5 041 157, US-A-5 541 148, US-A-5 006 656, EP-A-0 094 349, EP-A-0 551 650, EP-A-0 268 554, EP-A-0 375 061, EP-A-0 174 562, EP-A-492 366, WO 91/7874, WO

94/987, DE-A-196 12 943, WO 96/29870, WO 98/13361, WO 98/39297, WO 98/27049, EP-A-0 716 073, EP-A-0 613 618, US-A-5 597 776, EP-A-0 430 004, DE-A-4 331 448, WO 99/16744, WO 00/30447 和 WO 00/00020 已知的安全剂适合于与根据本发明的除草组合物混合。本发明因此还涉及选择性除草组合物, 用于控制有用植物作物、尤其是玉米和谷类作物中的禾草和杂草, 该组合物包含式 I 除草剂和安全剂(抗衡剂, 解毒剂), 保护有用的植物——而非杂草——免受除草剂的植物毒性作用, 以及这样一种组合物在控制有用植物作物中的杂草中的用途。

安全剂优选地对应于式 X 化合物



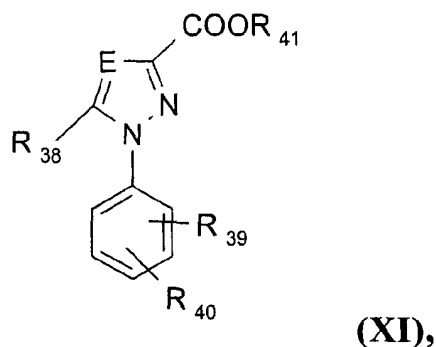
其中

R_{37} 是氢、 C_1 - C_8 烷基或者被 C_1 - C_6 烷氧基或 C_3 - C_6 烯氧基取代的 C_1 - C_8 烷基;

X_6 是氢或氯;

或者对应于式 X 化合物的水合物或盐, 例如瑞士专利申请 2135/00 和 2066/01 所述;

或者对应于式 XI 化合物



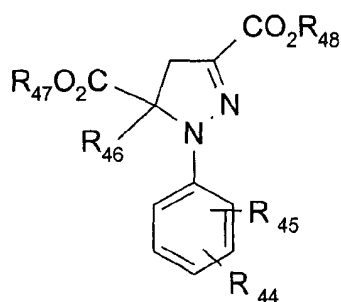
其中 E 是氮或次甲基;

R_{38} 是 $-CCl_3$ 、苯基或者被卤素取代的苯基;

R_{39} 和 R_{40} 彼此独立地是氢或卤素; 以及

R_{41} 是 C_1 - C_4 烷基;

或者对应于式 XII 化合物

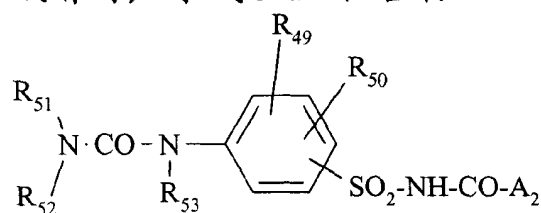


(XII),

其中 R_{44} 和 R_{45} 彼此独立地是氢或卤素; 以及

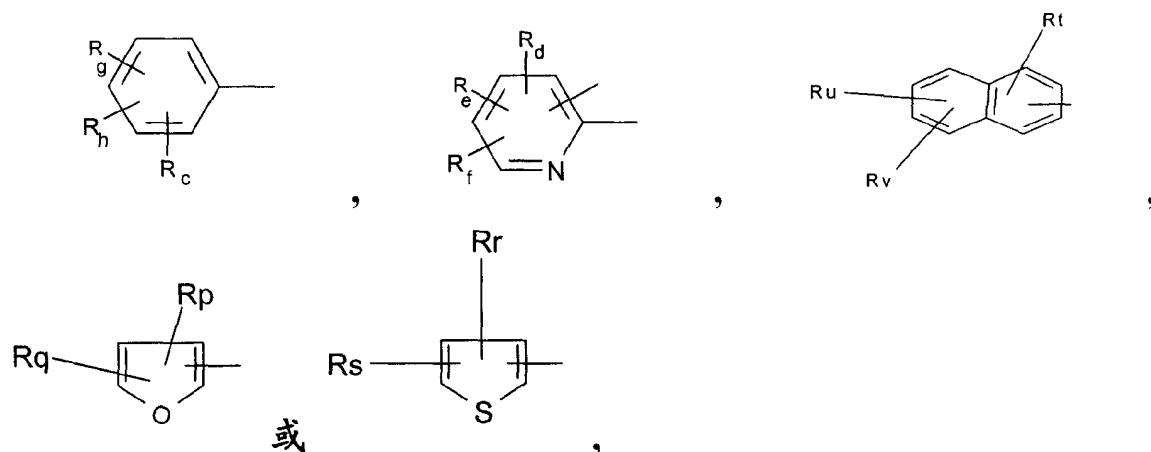
R_{46} 、 R_{47} 和 R_{48} 彼此独立地是 C_1 - C_4 烷基;

或者对应于式 XIII 化合物

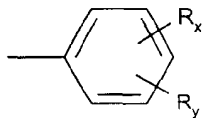


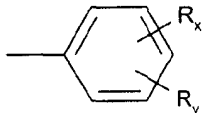
(XIII),

其中 A_2 是下列基团



R_{51} 和 R_{52} 彼此独立地是氢、 C_1 - C_8 烷基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_3 - C_6 烯

基、C₃-C₆炔基、 或者被 C₁-C₄ 烷氧基或

 取代的 C₁-C₄ 烷基；或者 R₅₁ 和 R₅₂ 一起构成 C₄-C₆ 亚烷基桥，它可以被氧、硫、SO、SO₂、NH 或 -N(C₁-C₄ 烷基)-中断；

R₅₃ 是氢或 C₁-C₄ 烷基；

R₄₉ 是氢、卤素、氰基、三氟甲基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、-COOR_j、-CONR_kR_m、-COR_n、-SO₂NR_kR_m 或 -OSO₂-C₁-C₄ 烷基；

R_g 是氢、卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷基硫基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、-COOR_j、-CONR_kR_m、-COR_n、-SO₂NR_kR_m、-OSO₂-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基或者被 C₁-C₄ 烷氧基或卤素取代的 C₁-C₆ 烷氧基、C₃-C₆ 烯氧基或者被卤素取代的 C₃-C₆ 烯氧基、或 C₃-C₆ 炔氧基；或者

R₄₉ 和 R₅₀ 一起构成 C₃-C₄ 亚烷基桥，它可以被卤素或 C₁-C₄ 烷基取代，或者一起构成 C₃-C₄ 亚烯基桥，它可以被卤素或 C₁-C₄ 烷基取代，或者一起构成 C₄ 亚链二烯基桥，它可以被卤素或 C₁-C₄ 烷基取代；

R₅₀ 和 R_h 彼此独立地是氢、卤素、C₁-C₄ 烷基、三氟甲基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷基硫基或 -COOR_j；

R_c 是氢、卤素、硝基、C₁-C₄ 烷基或甲氧基；

R_d 是氢、卤素、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、-COOR_j 或 -CONR_kR_m；

R_e 是氢、卤素、C₁-C₄ 烷基、-COOR_j、三氟甲基或甲氧基；或者

R_d 和 R_e 一起构成 C₃-C₄ 亚烷基桥；

R_p 是氢、卤素、C₁-C₄ 烷基、-COOR_j、三氟甲基或甲氧基；

R_q 是氢、卤素、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷基硫基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、-COOR_j 或 -CONR_kR_m；或

者

R_p 和 R_q 一起构成 C_3 - C_4 亚烷基桥;

R_r 是氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 $-\text{COOR}_j$ 、三氟甲基或甲氧基;

R_s 是氢、卤素、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 $-\text{COOR}_j$ 或 $-\text{CONR}_kR_m$; 或者

R_r 和 R_s 一起构成 C_3 - C_4 亚烷基桥;

R_t 是氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 $-\text{COOR}_j$ 、三氟甲基或甲氧基;

R_u 是氢、卤素、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 $-\text{COOR}_j$ 或 $-\text{CONR}_kR_m$; 或者

R_v 和 R_u 一起构成 C_3 - C_4 亚烷基桥;

R_f 和 R_v 各自是氢、卤素或 C_1 - C_4 烷基;

R_x 和 R_y 彼此独立地是氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 $-\text{COOR}_{54}$ 、三氟甲基、硝基或氰基;

R_j 、 R_k 和 R_m 彼此独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基; 或者

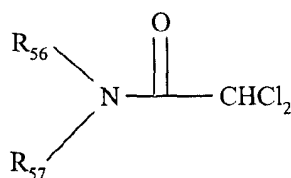
R_k 和 R_m 一起构成 C_4 - C_6 亚烷基桥, 它可以被氧、NH 或 $-\text{N}(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ -中断;

R_n 是 C_1 - C_4 烷基、苯基、或者被卤素、 C_1 - C_4 烷基、甲氧基、硝基或三氟甲基取代的苯基;

R_{54} 是氢、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷基、二- C_1 - C_4 烷基氨基- C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_8 烷基、 C_2 - C_8 烯基、卤代- C_2 - C_8 烯基、 C_3 - C_8 炔基、 C_3 - C_7 环烷基、卤代- C_3 - C_7 环烷基、 C_1 - C_8 烷基羰基、烯丙基羰基、 C_3 - C_7 环烷基羰基、苯甲酰基, 它是未取代的或者在苯基环上被至多三个相同或不同的卤素、 C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 烷氧基取代基取代; 呋喃甲酰基; 噻吩基; 被苯基、卤代苯基、 C_1 - C_4 烷基苯基、 C_1 - C_4 烷氧基苯基、卤代- C_1 - C_4 烷基苯基、卤代- C_1 - C_4 烷氧基苯基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_8 烷氧基羰基、 C_3 - C_8 烯氧基羰基、 C_3 - C_8

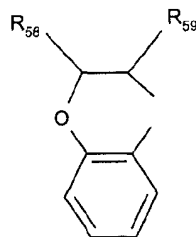
炔氧基羰基、 C_1 - C_8 烷硫基羰基、 C_3 - C_8 烯硫基羰基、 C_3 - C_8 炔硫基羰基、氨基甲酰基、单- C_1 - C_4 烷基氨基羰基、二- C_1 - C_4 烷基氨基羰基取代的 C_1 - C_4 烷基；苯基氨基羰基，它是未取代的或者在苯基上被至多三个相同或不同的卤素、 C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷基、卤代- C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 烷氧基取代基或者一个氰基或硝基取代基取代；二氧戊环-2-基，它是未取代的或者被一个或两个 C_1 - C_4 烷基基团取代；二噁烷-2-基，它是未取代的或者被一个或两个 C_1 - C_4 烷基基团取代； C_1 - C_4 烷基，它被氰基、硝基、羧基或 C_1 - C_8 烷硫基- C_1 - C_8 烷氧基羰基取代；

或者对应于式 XIV 化合物



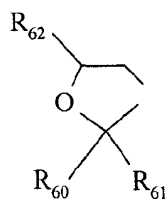
(XIV)

其中 R_{56} 和 R_{57} 彼此独立地是 C_1 - C_6 烷基或 C_2 - C_6 烯基；或者



R_{56} 和 R_{57} 一起是

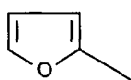
R_{58} 和 R_{59} 彼此独立地是氢或 C_1 - C_6 烷基；或者



R_{56} 和 R_{57} 一起是

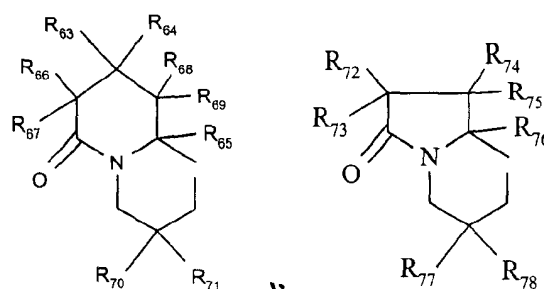
R_{60} 和 R_{61} 彼此独立地是 C_1 - C_4 烷基；或者

R_{60} 和 R_{61} 一起是 $-(CH_2)_5-$ ；



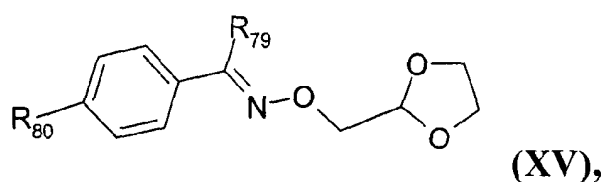
R_{62} 是氢、 C_1 - C_4 烷基或

；或者

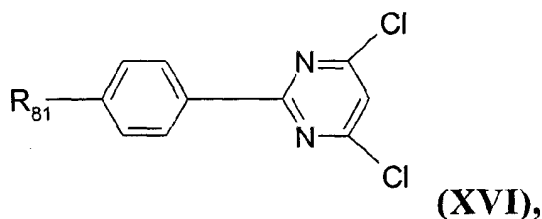


R_{56} 和 R_{57} 一起是 或 ;

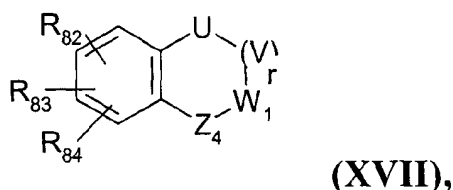
R_{63} 、 R_{64} 、 R_{65} 、 R_{66} 、 R_{67} 、 R_{68} 、 R_{69} 、 R_{70} 、 R_{71} 、 R_{72} 、 R_{73} 、 R_{74} 、 R_{75} 、 R_{76} 、 R_{77} 和 R_{78} 彼此独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;
或者对应于式 XV 化合物



其中 R_{80} 是氢或氯, R_{79} 是氰基或三氟甲基;
或者对应于式 XVI 化合物



其中 R_{81} 是氢或甲基;
或者对应于式 XVII 化合物

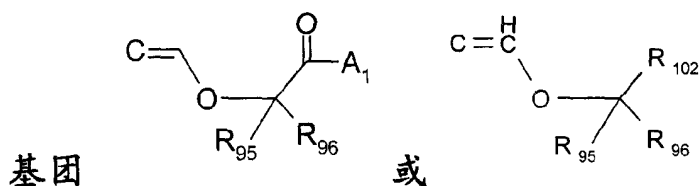


其中 R_{82} 是氢、 C_1 - C_4 烷基或者被 C_1 - C_4 烷基- X_2 -或 C_1 - C_4 卤代烷基- X_2 -取代的 C_1 - C_4 烷基, 或者是 C_1 - C_4 卤代烷基、硝基、氰基、 $-\text{COOR}_{85}$ 、 $-\text{NR}_{86}\text{R}_{87}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}_{88}\text{R}_{89}$ 或 $-\text{CONR}_{90}\text{R}_{91}$;

R_{83} 是氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、三氟甲基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基;

R_{84} 是氢、卤素或 C_1 - C_4 烷基;

U、V、W₁和Z₄彼此独立地是氧、硫、C(R₉₂)R₉₃、羰基、NR₉₄、

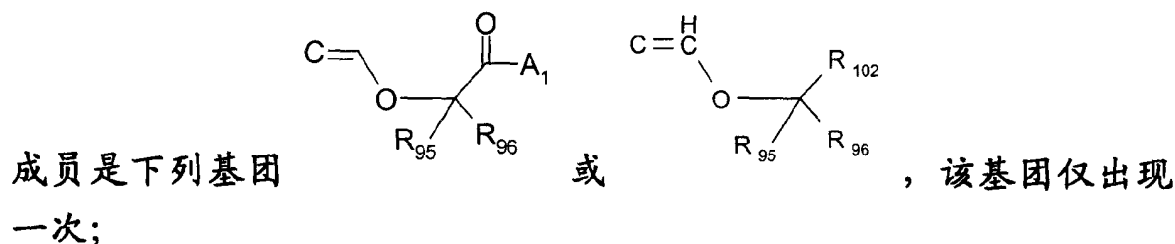


, 其中 R₁₀₂ 是 C₂-C₄ 烯

基或 C₂-C₄ 炔基;

其条件是

a)至少一个环成员 U、V、W₁或Z₄是羰基,与它或它们相邻的环



b)两个相邻的环成员 U 与 V、V 与 W₁和 W₁与 Z₄不能同时是氧;

R₉₅和R₉₆彼此独立地是氢或C₁-C₈烷基;或者

R₉₅和R₉₆一起构成C₂-C₆亚烷基;

A₁是R₉₉-Y₁-或-NR₉₇R₉₈;

X₂是氧或-S(O)_s;

Y₁是氧或硫;

R₉₉是氢、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基、C₁-C₄烷氧基-C₁-C₈烷基、C₃-C₆烯氧基-C₁-C₈烷基或苯基-C₁-C₈烷基,该苯基环有可能被卤素、C₁-C₄烷基、三氟甲基、甲氧基或甲基-S(O)_s-取代,或者是C₃-C₆烯基、C₃-C₆卤代烯基、苯基-C₃-C₆烯基、C₃-C₆炔基、苯基-C₃-C₆炔基、氧杂环丁烷基、呋喃基或四氢呋喃基;

R₈₅是氢或C₁-C₄烷基;

R₈₆是氢、C₁-C₄烷基或C₁-C₄烷基羰基;

R₈₇是氢或C₁-C₄烷基;或者

R₈₆和R₈₇一起构成C₄-或C₅-亚烷基;

R₈₈、R₈₉、R₉₀和R₉₁彼此独立地是氢或C₁-C₄烷基;或者

R₈₈与R₈₉一起或者R₉₀与R₉₁一起彼此独立地是C₄-或C₅-亚烷基,

一个碳原子有可能被氧或硫代替, 或者一个或两个碳原子有可能被 $-\text{NR}_{100}$ -代替;

R_{92} 、 R_{100} 和 R_{93} 彼此独立地是氢或 C_1 - C_8 烷基; 或者

R_{92} 和 R_{93} 一起是 C_2 - C_6 亚烷基;

R_{94} 是氢或 C_1 - C_8 烷基;

R_{97} 是氢、 C_1 - C_8 烷基、苯基或苯基- C_1 - C_8 烷基, 该苯基环有可能被氟、氯、溴、硝基、氰基、 $-\text{OCH}_3$ 、 C_1 - C_4 烷基或 CH_3SO_2 -取代, 或者是 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_8 烷基、 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 炔基;

R_{98} 是氢、 C_1 - C_8 烷基、 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 炔基; 或者

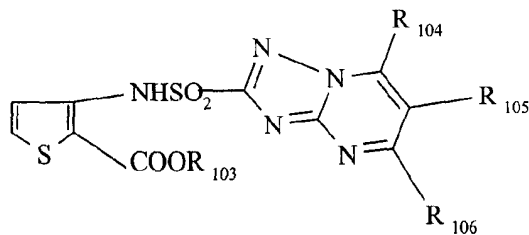
R_{97} 和 R_{98} 一起是 C_4 -或 C_5 -亚烷基, 一个碳原子有可能被氧或硫代替, 或者一个或两个碳原子有可能被 $-\text{NR}_{101}$ -代替;

R_{101} 是氢或 C_1 - C_4 烷基;

r 是 0 或 1; 以及

s 是 0、1 或 2;

或者对应于式 XVIII 化合物

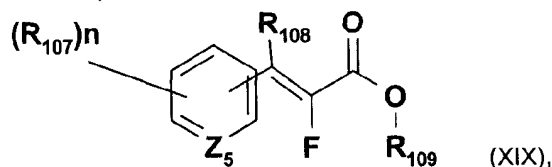


(XVIII),

其中 R_{103} 是氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 炔基;

R_{104} 、 R_{105} 和 R_{106} 彼此独立地是氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基或 C_1 - C_6 烷氧基, 其条件是取代基 R_{104} 、 R_{105} 和 R_{106} 之一不是氢;

或者对应于式 XIX 化合物



(XIX),

其中 Z_5 是 N 或 CH, 当 Z_5 是 N 时, n 是 0、1、2 或 3, 当 Z_5 是

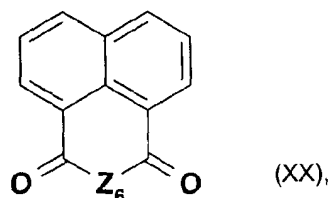
CH 时, n 是 0、1、2、3 或 4;

R_{107} 是卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、硝基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 C_1 - C_4 烷氧基羰基、苯基或苯氧基、或者被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基或苯氧基;

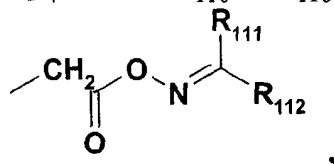
R_{108} 是氢或 C_1 - C_4 烷基;

R_{109} 是氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_2 - C_6 卤代烯基、 C_2 - C_6 卤代炔基、 C_1 - C_4 烷硫基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烯氧基- C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 炔氧基- C_1 - C_4 烷基;

或者对应于式 XX 化合物

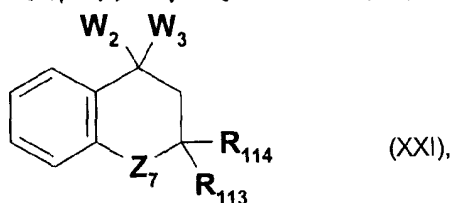


其中 Z_6 是氧或 N - R_{110} , R_{110} 是下式基团



其中 R_{111} 和 R_{112} 彼此独立地是氰基、氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_2 - C_6 烯基、芳基、苯基或杂芳基、或者被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基、芳基或杂芳基;

或者对应于式 XXI 化合物

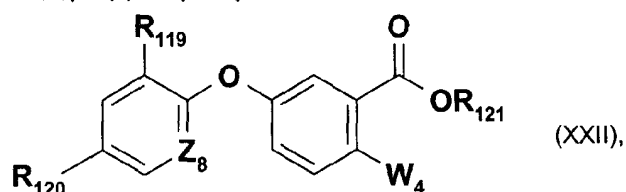


其中 Z_7 是氧、硫、 $S=O$ 、 SO_2 或 CH_2 ;

R_{113} 和 R_{114} 彼此独立地是氢、卤素或 C_1 - C_4 烷基;

W_2 和 W_3 彼此独立地是 CH_2COOR_{115} 或 $COOR_{0115}$, 或者一起是式 $-(CH_2)C(O)-O-C(O)-(CH_2)-$ 基团, R_{115} 和 R_{0115} 彼此独立地是氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、金属阳离子或铵阳离子;

或者对应于式 XXII 化合物

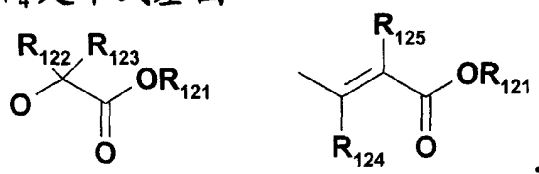


其中 R_{119} 和 R_{120} 彼此独立地是氢、卤素或 C_1 - C_4 卤代烷基;

R_{121} 是氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_4 烯基、 C_3 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、金属阳离子或铵阳离子;

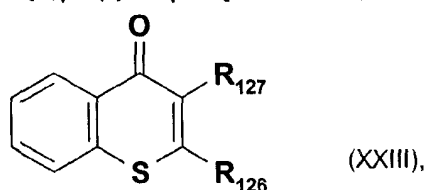
Z_8 是 N、CH、C-F 或 C-Cl;

W_4 是下式基团



其中 R_{122} 和 R_{123} 彼此独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基, R_{124} 和 R_{125} 彼此独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;

或者对应于式 XXIII 化合物



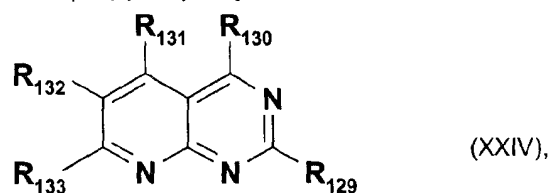
其中 R_{126} 是氢、氰基、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基羰基、 C_1 - C_4 烷硫基羰基、 $-NH-R_{128}$ 、 $-C(O)NH-R_{0128}$ 、芳基或杂芳基、或者被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的芳基或杂芳基;

R_{127} 是氢、氰基、硝基、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 硫代烷基；以及

R_{128} 和 R_{0128} 彼此独立地是 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_3 - C_4 烯基、 C_3 - C_4 炔基、 C_3 - C_4 环烷基、芳基或杂芳基或者被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的芳基或杂芳基、甲酰基、 C_1 - C_4 烷基羰基或 C_1 - C_4 烷基磺酰基；

或者对应于式 XXIV 化合物



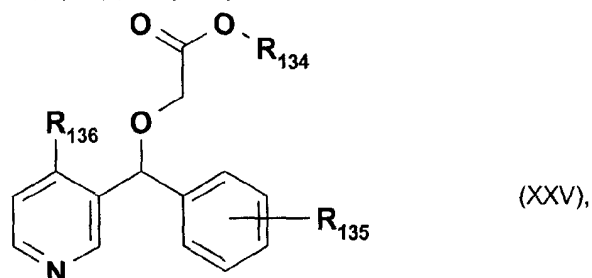
其中 R_{129} 和 R_{130} 彼此独立地是氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、单- C_1 - C_8 -或二- C_1 - C_8 -烷基氨基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_4 硫代烷基、苯基或杂芳基；

R_{131} 是如 R_{129} 所定义的，另外可以是 OH、 NH_2 、卤素、二- C_1 - C_4 氨基烷基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基或 C_1 - C_4 烷氧基羰基；

R_{132} 是如 R_{129} 所定义的，另外可以是氰基、硝基、羧基、 C_1 - C_4 烷氧基羰基、二- C_1 - C_4 氨基烷基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 SO_2 -OH、异- C_1 - C_4 氨基烷基磺酰基或 C_1 - C_4 烷氧基磺酰基；

R_{133} 是如 R_{129} 所定义的，另外可以是 OH、 NH_2 、卤素、二- C_1 - C_4 氨基烷基、吡咯烷-1-基、哌啶-1-基、吗啉-1-基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 C_1 - C_4 烷氧基羰基、苯氧基、萘氧基、苯基氨基、苯甲酰氧基或苯基磺酰氧基；

或者对应于式 XXV 化合物



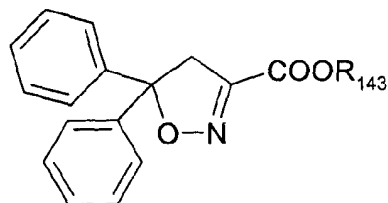
其中 R_{134} 是氢、 C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基或 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基；

R_{135} 是氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷氧基；

R_{136} 是氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷氧基，

其条件是 R_{135} 和 R_{136} 不同时是氢；

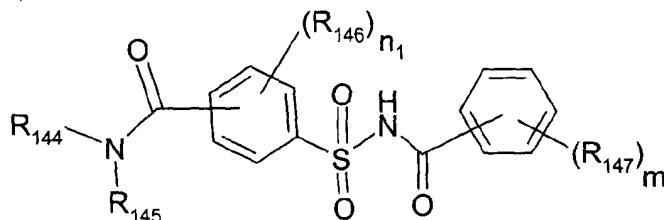
或者对应于式 XXVI



(XXVI),

其中 R_{143} 是氢、碱金属阳离子、碱土金属阳离子、铕阳离子或铵阳离子，或者是乙基；

或者对应于式 XXVII



(XXVII),

其中 R_{144} 和 R_{145} 彼此独立地是氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基或 C_3 - C_6 环烷基；

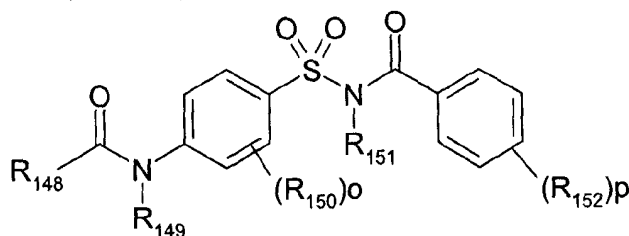
R_{146} 是氢、卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基或 C_1 - C_6 卤代烷氧基；

R_{147} 是氢、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 烷氧基羰基或硝基；

n_1 是 0、1、2 或 3；以及

m 是 1 或 2；

或者对应于式 XXVIII



(XXVIII),

其中 R_{148} 是氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_3 - C_8

环烷基、苯基、苯基- C_1 - C_6 烷基或杂芳基；所述基团有可能被卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羰基、羧基、甲酰基、甲酰胺或磺酰胺取代；

R_{149} 是氢、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_4 卤代烷基；

每个 R_{150} 彼此独立地是氢、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 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、氰基、硝基、甲酰基或羧基；

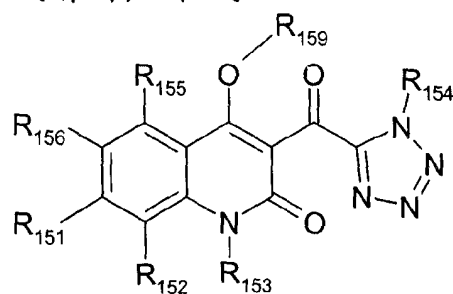
R_{151} 是氢、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_4 卤代烷基；

每个 R_{152} 彼此独立地是氢、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 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、氰基、硝基、甲酰基或羧基；

o 是 0、1 或 2；以及

p 是 0、1 或 2；

或者对应于式 XXIX



(XXIX),

其中 R_{159} 是氢、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 烯基羰基、 C_{1-6} 炔基羰基、 C_{1-6} 烷氧基羰基、 C_{1-6} 烷硫基羰基、 C_{3-8} 环烷基羰基、苯基- C_{1-6} 烷基羰基、苯基羰基、 C_{1-6} 烷基磺酰基、 C_{1-6} 烯基磺酰基或苯基磺酰基，上述烃基有可能被一个或多个卤原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代；

R_{153} 是氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烯基、 C_{1-6} 炔基、 C_{3-8} 环烷基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 烯基羰基、 C_{1-6} 炔基羰基、 C_{1-6} 烷氧基羰基、 C_{1-6} 烷硫基羰基、 C_{3-8} 环烷基羰基、 C_{1-6} 烷基磺酰基、 C_{1-6} 烯基磺酰基或苯基磺酰基，上述烃基有可能被一个或多个卤原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代；

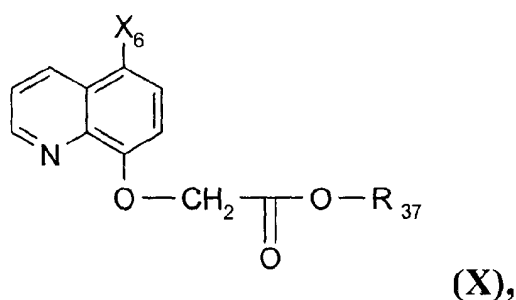
R_{154} 是氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烯基、 C_{1-6} 炔基、 C_{3-8} 环烷基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 烯基羰基、 C_{1-6} 炔基羰基、 C_{1-6} 烷氧基羰基、 C_{1-6} 烷硫基羰基、 C_{3-8} 环烷基羰基、 C_{1-6} 烷基磺酰基、 C_{1-6} 烯基磺酰基或苯基磺酰基，上述烃基有可能被一个或多个卤原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代；

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} 和 R_{158} 彼此独立地是氢、卤素、氨基、 C_{1-3} 烷基氨基、 C_{1-6} 二烷基氨基、羟基、氰基、硝基、甲酰基、羧基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 卤代烷氧基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 烷氧基羰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 卤代烷基、 C_{1-6} 烯基或 C_{1-6} 炔基；或者

R_{153} 和 R_{158} 与它们所键合的环原子一起构成五-或六-元部分饱和或不饱和环，它可以含有至多 2 个相同或不同的选自氧、硫和氮的杂原子，该环有可能被氧代基团取代。

根据本发明的组合物优选地包含除草剂拮抗作用有效量的式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV 或 XXV 安全剂。

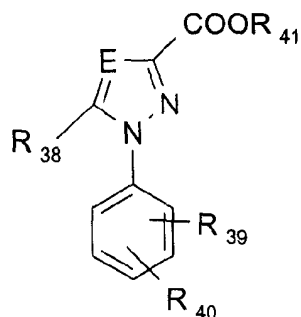
根据本发明的选择性除草组合物尤其包含除草剂拮抗作用有效量的式 X 化合物



其中 R_{37} 是氢、 C_1 - C_8 烷基、或者被 C_1 - C_6 烷氧基或 C_3 - C_6 烯氧基取代的 C_1 - C_8 烷基；

X_6 是氢或氯；

或式 XI 化合物



(XI),

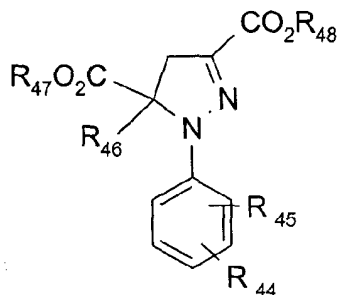
其中 E 是氮或次甲基;

R_{38} 是 $-CCl_3$ 、苯基或卤素-取代的苯基;

R_{39} 和 R_{40} 彼此独立地是氢或卤素;

R_{41} 是 C_1 - C_4 烷基; 以及

或式 XII 化合物

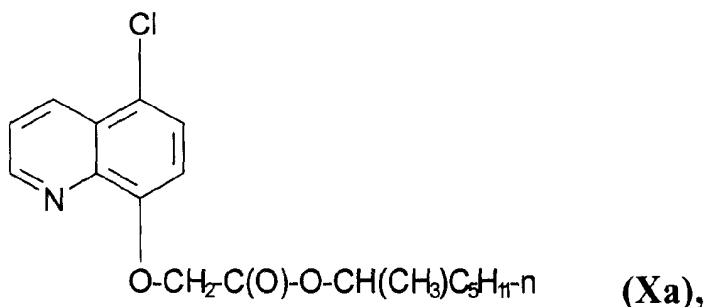


(XII),

其中 R_{44} 和 R_{45} 彼此独立地是氢或卤素; 以及

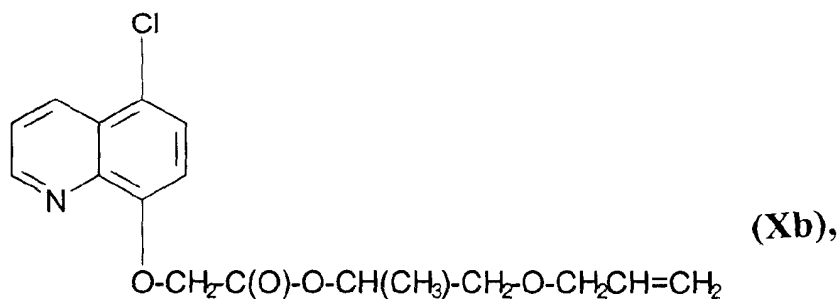
R_{46} 、 R_{47} 和 R_{48} 彼此独立地是 C_1 - C_4 烷基。

上面关于式 I 化合物所提到的优选含义也适用于式 I 化合物与式 X 至 XVIII 安全剂的混合物的情况。根据本发明的优选组合物包含选自式 Xa 化合物

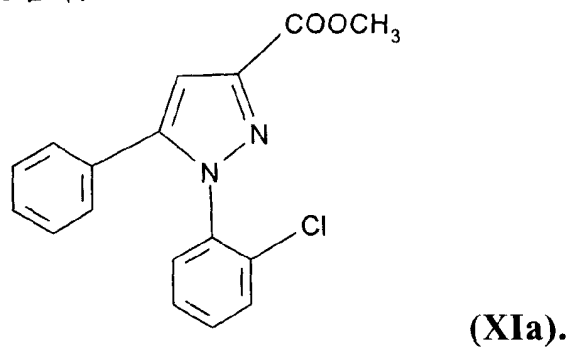


(Xa),

式 Xb 化合物



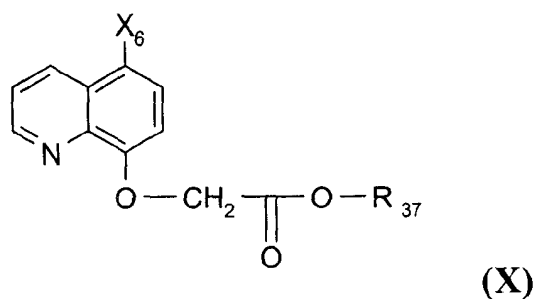
和式 XIa 化合物



的安全剂。

其它优选的式 X、XI 和 XII 化合物也列在表 9、10 和 11 中。

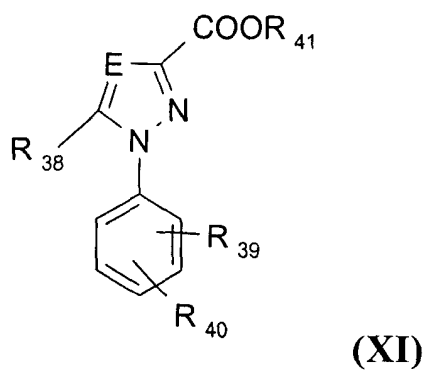
表 9: 式 X 化合物:



Comp. no.	X ₆	R ₃₇
9.01	Cl	-CH(CH ₃)-C ₅ H _{11-n}
9.02	Cl	-CH(CH ₃)-CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂
9.03	Cl	H
9.04	Cl	C ₄ H _{9-n}

优选的式 XI 化合物列在表 10 中。

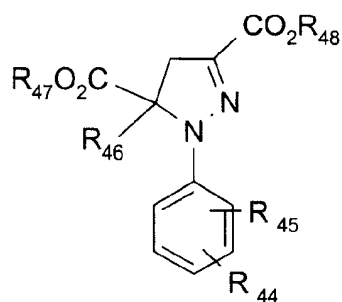
表 10: 式 XI 化合物:



Comp. no.	R ₄₁	R ₃₈	R ₃₉	R ₄₀	E
10.01	CH ₃	苯基	2-Cl	H	CH
10.02	CH ₃	苯基	2-Cl	4-Cl	CH
10.03	CH ₃	苯基	2-F	H	CH
10.04	CH ₃	2-氯苯基	2-F	H	CH
10.05	C ₂ H ₅	CCl ₃	2-Cl	4-Cl	N
10.06	CH ₃	苯基	2-Cl	4-CF ₃	N
10.07	CH ₃	苯基	2-Cl	4-CF ₃	N

优选的式 XII 化合物列在表 11 中。

表 11: 式 XII 化合物:

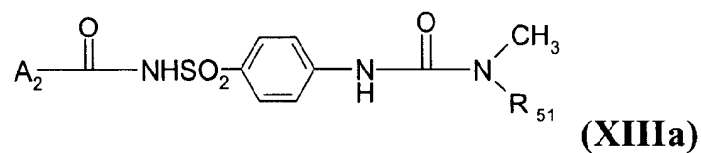


(XII)

Comp. no.	R ₄₆	R ₄₇	R ₄₈	R ₄₄	R ₄₅
11.01	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
11.02	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	2-Cl	4-Cl
11.03	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	2-Cl	4-Cl

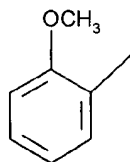
优选的式 XIII 化合物列在下表 12 中，以式 XIIIa 化合物表示：

表 12: 式 XIIIa 化合物：



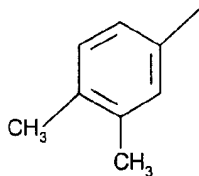
Comp. no.	A ₂	R ₅₁
-----------	----------------	-----------------

12.001



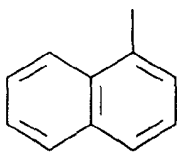
H

12.002

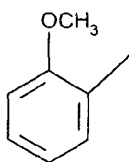


H

12.003

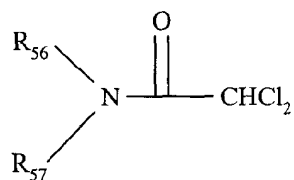
 CH_3

12.004

 CH_3

优选的式 XIV 化合物列在表 13 中:

表 13: 式 XIV 化合物:



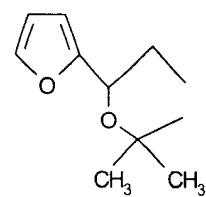
(XIV)

Comp. no.	R_{56}	R_{57}	$\text{R}_{56} + \text{R}_{57}$
13.001	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2$	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2$	-
13.002	--	--	
13.003	--	--	
13.004	-	-	

13.005

--

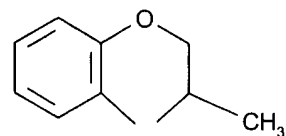
--



13.006

--

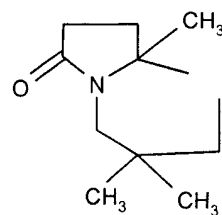
--



13.007

--

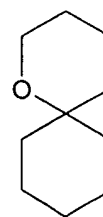
--



13.008

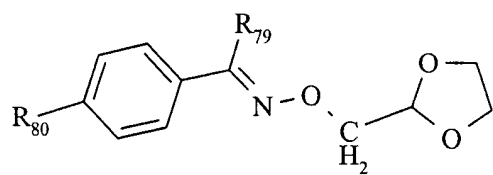
--

--



优选的式 XV 化合物列在表 14 中:

表 14: 式 XV 化合物:



(XV)

Comp. no.

 R_{80} R_{79}

14.01

H

CN

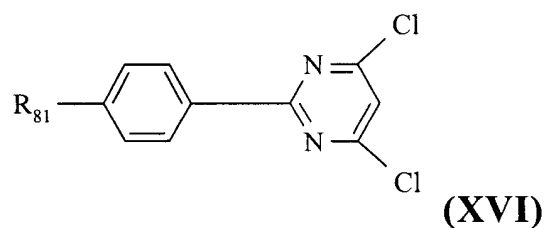
14.02

Cl

 CF_3

优选的式 XVI 化合物列在表 15 中:

表 15: 式 XVI 化合物:



Comp. no.

R₈₁

15.01

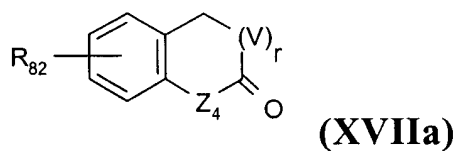
H

15.02

CH₃

优选的式 XVII 化合物列在下表 16 中, 以式 XVIIa 化合物表示:

表 16: 式 XVIIa 化合物:



Comp. no.

R₈₂

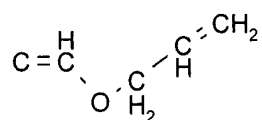
Z₄

V

r

16.001

H

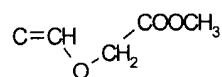


O

1

16.002

H

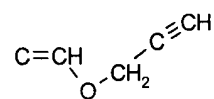


O

1

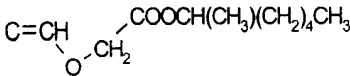
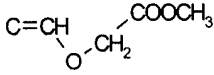
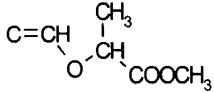
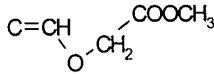
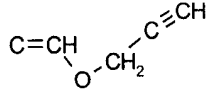
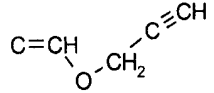
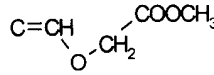
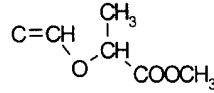
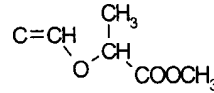
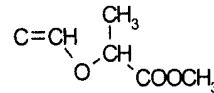
16.003

H



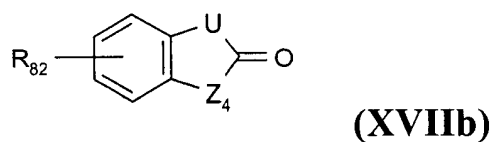
O

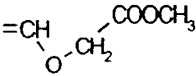
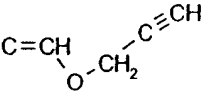
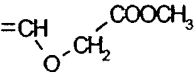
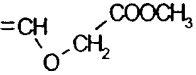
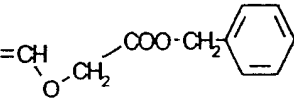
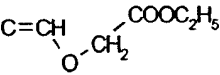
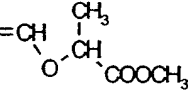
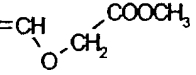
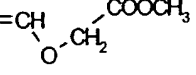
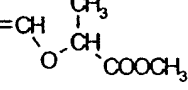
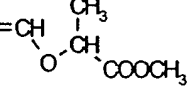
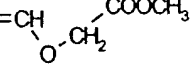
1

Comp. no.	R ₈₂	Z ₄	V	r
16.004	H		O	1
16.005	H		CH ₂	1
16.006	H		CH ₂	1
16.007	H		S	1
16.008	H		S	1
16.009	H		NCH ₃	1
16.010	H		NCH ₃	1
16.011	H		NCH ₃	1
16.012	H		O	1
16.013	H		S	1

优选的式 XVII 化合物列在下表 17 中，以式 XVIIb 化合物表示：

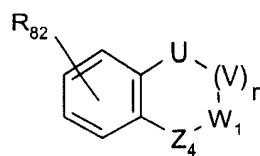
表 17: 式 XVIIb 化合物:



Comp. no.	U	R ₈₂	Z ₄
17.001	O	H	
17.002	O	H	
17.003	O	5-Cl	
17.004	CH ₂	H	
17.005	CH ₂	H	
17.006	CH ₂	H	
17.007	NH	5-Cl	
17.008	NH	5-Cl	
17.009	NH	H	
17.010	NH	H	
17.011	NCH ₃	H	
17.012	NCH ₃	H	

优选的式 XVII 化合物列在下表 18 中，以式 XVIIc 化合物表示：

表 18: 式 XVIIc 化合物:

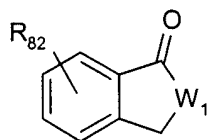


(XVIIc)

Comp. no.	U	V	r	W ₁	Z ₄	R ₈₂
18.001	O	C=O	1		CH ₂	H
18.002	O	C=O	1		CH ₂	H
18.003	CH ₂	C=O	1		CH ₂	H
18.004	CH ₂	C=O	1		CH ₂	H
18.005	CH ₂	CH ₂	1		C=O	H
18.006	CH ₂	CH ₂	1		C=O	H
18.007	NCH ₃	C=O	1		CH ₂	H

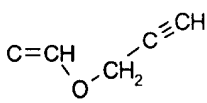
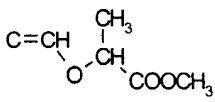
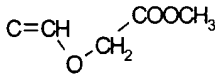
优选的式 XVII 化合物列在下表 19 中，以式 XVIIId 化合物表示：

表 19: 式 XVIIId 化合物：



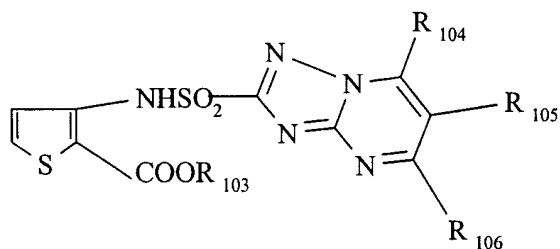
(XVIIId)

Comp. no.	R ₈₂	W ₁
19.001	6-Cl	
19.002	6-Cl	

Comp. no.	R ₈₂	W ₁
19.003	H	
19.004	H	
19.005	H	

优选的式 XVIII 化合物列在下表 20 中:

表 20: 式 XVIII 化合物:



(XVIII),

Comp. no.	R ₁₀₃	R ₁₀₄	R ₁₀₅	R ₁₀₆
20.01	CH ₃	H	环丙基	H
20.02	CH ₃	C ₂ H ₅	环丙基	H
20.03	CH ₃	环丙基	C ₂ H ₅	H
20.04	CH ₃	CH ₃	H	H
20.05	CH ₃	CH ₃	环丙基	H
20.06	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
20.07	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
20.08	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
20.09	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
20.10	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
20.11	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	H
20.12	H	OCH ₃	OCH ₃	H

20.13	H	CH ₃	CH ₃	H
20.14	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃
20.15	H	H	H	CH ₃
20.16	CH ₃	H	H	CH ₃
20.17	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃

在式 XXVIII 化合物中, 优选这些, 其中

R₁₄₈ 是氢、C₁-C₆ 烷基、C₃-C₈ 环烷基或苯基, 所述基团有可能被卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羰基、羧基、甲酰基、羧酰胺或磺酰胺取代;

R₁₄₉ 是氢;

每个 R₁₅₀ 彼此独立地是氢、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、氰基、硝基或甲酰基;

R₁₅₁ 是氢; 以及

每个 R₁₅₂ 彼此独立地是氢、卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、氰基、硝基或甲酰基。

尤其优选的式 XXVIII 化合物选自

2-甲氧基-N-[4-(2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]乙酰胺,
N-[4-(2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]环丙烷羧酰胺,
N-[4-(2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]环丁烷羧酰胺,
N-[4-(2-氯苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]环丙烷羧酰胺,
N-[4-(2-氯苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]乙酰胺,
N-[4-(2-三氟甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]乙酰胺,
N-[4-(2-三氟甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]环丙烷羧酰胺,
N-[4-(2-三氟甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]环丙烷羧酰胺,
N-[4-(2-三氟甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]环丁烷羧酰胺和
N-[4-(2-三氟甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]乙酰胺。

在式 XXIX 化合物中, 优选这些, 其中

R_{159} 是氢、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 烯基羰基、 C_{1-6} 炔基羰基、 C_{1-6} 烷氧基羰基、 C_{1-6} 烷硫基羰基、 C_{3-8} 环烷基羰基、苯基- C_{1-6} 烷基羰基或苯基羰基, 上述烃基基团有可能被一个或多个卤原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代;

R_{153} 是氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烯基、 C_{1-6} 炔基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基或 C_{1-6} 烷氧基羰基, 上述烃基基团有可能被一个或多个卤原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代;

R_{154} 是氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烯基、 C_{1-6} 炔基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基或 C_{1-6} 烷氧基羰基, 上述烃基基团有可能被一个或多个卤原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代;

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} 和 R_{158} 彼此独立地是氢、卤素、氰基、硝基、甲酰基、羧基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 卤代烷氧基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 烷氧基羰基、 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 卤代烷基; 或者

R_{153} 和 R_{158} 与它们所键合的环原子一起构成五-或六-元部分饱和或不饱和环, 它可以含有至多 2 个相同或不同的选自氧、硫和氮的杂原子, 该环有可能被氧代基团取代。

特别优选这样的式 XXIX 化合物, 其中

R_{159} 是氢、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 烯基羰基、 C_{1-6} 炔基羰基、 C_{1-6} 烷氧基羰基、 C_{1-6} 烷硫基羰基、 C_{3-8} 环烷基羰基或苯基羰基;

R_{153} 是氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烯基、 C_{1-6} 炔基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基或 C_{1-6} 烷氧基羰基;

R_{154} 是氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烯基、 C_{1-6} 炔基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基或 C_{1-6} 烷氧基羰基;

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} 和 R_{158} 彼此独立地是氢、卤素、氰基、硝基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 卤代烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基; 或者

R_{153} 和 R_{158} 与它们所键合的环原子一起构成五-或六-元部分饱和或不饱和环, 它可以含有至多 2 个相同或不同的选自氧、硫和氮的杂

原子，该环有可能被氧代基团取代。

非常尤其优选的式 XXIX 化合物选自

4-羟基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，
1-乙基-4-羟基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，
6-羟基-5-(1H-四唑-5-羰基)-1, 2-二氢-吡咯并[3, 2, 1-ij.]喹啉-4-酮，
3-(1-乙酰基-1H-四唑-5-羰基)-4-羟基-1-甲基-1H-喹啉-2-酮，
6-氟-4-羟基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，
6-氟-4-羟基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，
4-羟基-1, 6-二甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，
4-羟基-6-甲氧基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，
4-羟基-6-甲氧基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，
乙酸 1-甲基-2-氧代-3-(1H-四唑-5-羰基)-1,2-二氢-喹啉-4-基酯和
2,2-二甲基-丙酸 1-甲基-2-氧代-3-(1H-四唑-5-羰基)-1,2-二氢-喹啉-4-基酯。

本发明还涉及选择性控制有用植物作物中的杂草的方法，该方法包含同时或者单独用除草有效量的式 I 除草剂和除草剂拮抗作用有效量的式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX、优选式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII 或 XVIII 安全剂处理有用植物、其种子或插条或者其种植区域。

所要控制的杂草可以是单子叶或双子叶的杂草，例如单子叶杂草燕麦属、剪股颖属、藜草属、黑麦草属、雀麦属、看麦娘属、狗尾草属、马唐属、臂形草属、稗属、稷属、Sorghum hal./bic.、筒轴茅属、莎草属、臂形草属、稗属、蔗草属、雨久花属、慈菇属和繁缕属，和双子叶杂草白芥属、藜属、猪殃殃属、堇菜属、婆婆纳属、母菊属、罌

粟属、茄属、苘麻属、黄花稔属、苍耳属、苋属、番薯属和茛蒿属。

种植区域包括作物植物已经生长的或者作物植物已经播种的土地，以及打算种植这类作物植物的土地。

根据预期用途，式 X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII 或 XXIX 安全剂可以用于作物植物种子的预处理（种子或插条的敷裹），或者可以在播种前后加入到土壤中。不过，它也可以在植物发芽之后单独或者与除草剂一起施用。用安全剂处理植物或种子因此原则上可以在时间上独立于除草剂的施用。不过，也可以同时施用除草剂和安全剂（例如以桶混制剂的形式）处理植物。安全剂施用比率与除草剂施用比率之比很大程度上依赖于施用的方法。在田间处理的情况下，采用包含安全剂与除草剂的组合的桶混制剂或者单独施用安全剂或除草剂，除草剂与安全剂之比一般是 100:1 至 1:10，优选 20:1 至 1:1。在田间处理的情况下，通常施用 0.001 至 1.0kg 安全剂/ha，优选 0.001 至 0.25kg 安全剂/ha。

除草剂的施用比率一般是 0.001 至 2kg/ha，但是优选 0.005 至 0.5kg/ha。

根据本发明的组合物适合于所有农业中常用的施用方法，例如芽前施用、芽后施用和拌种。

在拌种的情况下，一般施用 0.001 至 10g 安全剂/kg 种子，优选 0.05 至 2g 安全剂/kg 种子。若在播种前不久以液体形式施用安全剂，即浸泡种子，则安全剂溶液有利地含有浓度为 1 至 10 000ppm 的活性成分，优选 100 至 1000ppm。

出于施用的目的，有利地将式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 安全剂或者这些安全剂与式 I 除草剂的组合与制剂技术惯用的助剂一起配制，例如配制成可乳化浓缩物、可包衣糊剂、可直接喷雾或稀释的溶液、稀乳剂、可湿性粉剂、可溶性粉剂、粉尘剂、颗粒剂或微囊剂。

这类制剂例如描述在 WO 97/34485 第 9 至 13 页中。制剂是按照已知方式制备的，例如将活性成分与液体或固体制剂助剂紧密混合和/或研磨，例如溶剂或固体载体。另外，在制剂的制备中还可以使用表面活性物质（表面活性剂）。适合于此的溶剂和固体载体例如描述在 WO 97/34485 第 6 页中。

根据所要配制的式 I 化合物的属性，可以考虑具有良好乳化、分散和湿润性质的非离子、阳离子和/或阴离子表面活性剂和表面活性剂混合物作为表面活性化合物。适合的阴离子、非离子和阳离子表面活性剂的实例例如列举在 WO 97/34485 第 7 和 8 页中。适合于根据本发明的除草组合物的制备的还有制剂技术中常用的表面活性剂，尤其描述于 "McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1981, Stache, H., "Tensid-Taschenbuch", Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna, 1981 and M. and J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81。

除草制剂通常含有 0.1 至 99 重量%、尤其 0.1 至 95 重量%的包含式 I 化合物与式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 化合物的活性成分混合物，1 至 99.9 重量%的固体或液体制剂助剂，和 0 至 25 重量%、尤其 0.1 至 25 重量%的表面活性剂。尽

管商业产品将优选地被配制成浓缩物，不过终端用户将通常采用稀释剂。

组合物还可以包含另外的成分，例如稳定剂，例如植物油或环氧化植物油（环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油），防沫剂，例如硅酮油，防腐剂，粘度调节剂，粘合剂，增稠剂以及肥料或其他活性成分。就式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 安全剂或包含它们的组合物在保护作物植物免受式 I 除草剂破坏作用中的用途而言，可以考虑各种方法和技术，例如下列：

i) 拌种

a) 用式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 化合物的可湿性粉剂拌种，在容器内摇动直至均匀分布在种子表面（干法拌种）。在该方法中，每 100kg 种子使用大约 1 至 500g 式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 化合物（4g 至 2kg 可湿性粉剂）。

b) 按照方法 a)，用式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 化合物的可乳化浓缩物敷裹种子（湿法拌种）。

c) 将种子浸入包含 100 至 1000ppm 式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 化合物的溶液达 1 至 72 小时，可选地随后干燥种子（浸渍拌种）。

拌种或者处理发芽的种子自然是优选的施用方法，因为用活性成分处理完全针对目标作物。每 100kg 种子一般使用 1 至 1000g 解毒剂，

优选 5 至 250g 解毒剂，但是根据方法，也允许加入其他活性成分或微量营养素，可以采用在所限度以上或以下的浓度（反复拌种）。

ii)作为桶混制剂施用

使用解毒剂与除草剂混合物的液体制剂（彼此的重量比为 10:1 至 1:100），除草剂的施用比率为 0.005 至 5.0kg 每公顷。在播种前后施用这类桶混制剂。

iii)施用于种沟

以可乳化浓缩物、可湿性粉剂或颗粒剂的形式，向开放的播种了的种沟加入式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 化合物。一旦种沟已经被覆盖，按照通常的方式芽前施用除草剂。

iv)活性成分的控制释放

将式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 化合物的溶液施加于矿物载体颗粒或聚合颗粒（脲/甲醛）上，干燥。如果需要的话，也有可能涂一层包衣，允许活性成分历经指定时间计量释放（包衣颗粒）。

如上所述，通过加入喷洒桶助剂可以增加含有除草有效量式 I 化合物和除草剂拮抗作用有效量式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 化合物的根据本发明的除草与植物生长抑制组合物的活性。

优选的制剂尤其具有下列组成：

(% = 重量百分比)

可乳化浓缩物:

活性成分混合物: 1 至 90 %, 优选 5 至 20 %
表面活性剂: 1 至 30 %, 优选 10 至 20 %
液体载体: 5 至 94 %, 优选 70 至 85 %

粉剂:

活性成分混合物: 0.1 至 10 %, 优选 0.1 至 5 %
固体载体: 99.9 至 90 %, 优选 99.9 至 99 %

混悬液浓缩物:

活性成分混合物: 5 至 75 %, 优选 10 至 50 %
水: 94 至 24 %, 优选 88 至 30 %
表面活性剂: 1 至 40 %, 优选 2 至 30 %

可湿性粉剂

活性成分混合物: 0.5 至 90 %, 优选 1 至 80 %
表面活性剂: 0.5 至 20 %, 优选 1 至 15 %
固体载体: 5 至 95 %, 优选 15 至 90 %

颗粒剂:

活性成分混合物: 0.1 至 30 %, 优选 0.1 至 15 %
固体载体: 99.5 至 70 %, 优选 97 至 85 %

下列实施例进一步阐述发明, 但是不限制发明。

式 I 除草剂与式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、
XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、

XXVIII 或 XXIX 安全剂混合物的制剂实施例(% = 重量百分比)

F1. 可乳化浓缩物	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5 %	10 %	25 %	50 %
十二烷基苯磺酸钙	6 %	8 %	6 %	8 %
蓖麻油聚乙二醇醚	4 %	-	4 %	4 %
(36 mol 环氧乙烷)				
辛基苯酚聚乙二醇醚	-	4 %	-	2 %
(7-8 mol 环氧乙烷)				
环己酮	-	-	10 %	20 %
芳族烃混合物	85 %	78 %	55 %	16 %

C₉-C₁₂

用水稀释这类浓缩物，可以得到任意所需浓度的乳剂。

F2. 溶液	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5 %	10 %	50 %	90 %
1-甲氧基-3-(3-甲氧基-丙氧基)-丙烷	-	20 %	20 %	-
聚乙二醇 MW 400	20 %	10 %	-	-
N-甲基-2-吡咯烷酮	-	-	30 %	10 %
芳族烃混合物	75 %	60 %	-	-

C₉-C₁₂

溶液适合以微滴的形式使用。

F3. 可湿性粉剂	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5 %	25 %	50 %	80 %
木质素磺酸钠	4 %	-	3 %	-
月桂基硫酸钠	2 %	3 %	-	4 %
二异丁基萘磺酸钠	-	6 %	5 %	6 %

辛基苯酚聚乙二醇醚 (7-8 mol 环氧乙烷)	-	1 %	2 %	-
高分散性硅酸	1 %	3 %	5 %	10 %
高岭土	88 %	62 %	35 %	-

将活性成分与助剂充分混合,在适合的研磨机中充分研磨混合物,得到可湿性粉剂,可以用水稀释得到任意所需浓度的悬浮液。

F4. 包衣颗粒剂	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1 %	5 %	15 %
高分散性硅酸	0.9 %	2 %	2 %
无机载体	99.0 %	93 %	83 %

(直径 0.1 - 1 mm)

例如 CaCO_3 或 SiO_2

将活性成分溶于二氯甲烷,喷涂在载体上,然后在真空中蒸发除去溶剂。

F5. 包衣颗粒剂	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1 %	5 %	15 %
聚乙二醇 MW 200	1.0 %	2 %	3 %
高分散性硅酸	0.9 %	1 %	2 %
无机载体	98.0 %	92 %	80 %

(直径 0.1 - 1 mm)

例如 CaCO_3 或 SiO_2

在混合机中,将微细研磨的活性成分均匀涂在用聚乙二醇湿润的载体上。按照这种方式得到无尘包衣颗粒剂。

F6. 挤出颗粒剂	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	0.1 %	3 %	5 %	15 %
木质素磺酸钠	1.5 %	2 %	3 %	4 %

羧甲基纤维素	1.4 %	2 %	2 %	2 %
高岭土	97.0 %	93 %	90 %	79 %

将活性成分与助剂混合、研磨，将混合物用水湿润。挤出混合物，然后在空气流中干燥。

F7. 粉剂	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1 %	1 %	5 %
滑石	39.9 %	49 %	35 %
高岭土	60.0 %	50 %	60 %

将活性成分与载体混合，在适合的研磨机中研磨混合物，得到即用型粉剂。

F8. 混悬液浓缩物	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	3 %	10 %	25 %	50 %
乙二醇	5 %	5 %	5 %	5 %
壬基苯酚聚乙二醇醚 (15 mol 环氧乙烷)	-	1 %	2 %	-
木质素磺酸钠	3 %	3 %	4 %	5 %
羧甲基纤维素	1 %	1 %	1 %	1 %
37%甲醛水溶液	0.2 %	0.2 %	0.2 %	0.2 %
硅酮油乳剂	0.8 %	0.8 %	0.8 %	0.8 %
水	87 %	79 %	62 %	38 %

将微细研磨的活性成分与助剂紧密混合，得到胶悬液浓缩物，用水稀释可以得到任意所需浓度的悬浮液。

经常更实际的是将式 I 化合物和式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII 或 XXIX 混合伴侣单独配制，然后在施用前不久，在施用器内按照所需混合比一起在水中混合成“桶混制剂”的形

式。

式 I 化合物可以有利地与大量已知除草剂混合，从而实质性拓宽杂草控制谱，在很多情况下也增加关于有用植物的选择性。尤其是，式 I 化合物与至少一种下列除草剂的混合物是很重要的：

苯氧基-苯氧基丙酸类除草剂，例如禾草灵、精吡氟禾草灵、精喹禾灵(quizalafop-P-ethyl)、噁草酯、炔草酯、氟氟草酯(cyhalofop-butyl)、高恶唑禾草灵、吡氟氟禾灵或吡氟氟禾灵；

羟胺类除草剂，例如稀禾定、枯杀达、烯草酮、噻草酮、tepraloxym、肟草酮或丁氧环酮；

磺酰脲类除草剂，例如磺氨黄隆、四唑黄隆、苄嘧黄隆、氯嘧黄隆、醚黄隆、绿黄隆、氯嘧黄隆、环丙黄隆、胺苯黄隆、乙氧嘧黄隆、啶嘧黄隆(fluzasulfuron)、氟啶黄隆、啶咪黄隆、iodosulfuron (CAS RN 144550-36-7 和 185119-76-0)、甲黄隆、烟嘧黄隆、环丙氧黄隆、氯嘧黄隆、吡嘧黄隆、乙黄隆、玉嘧黄隆、噻黄隆、醚苯黄隆、苯黄隆、氟胺黄隆、氟丙黄隆、flucarbazone 或 tritosulfuron (CAS RN 142469-14-5)；

咪唑啉酮类除草剂，例如 imazethapyr、咪草酯(imazamethabenz)、imazamethapyr、灭草喹(imazaquin)、咪草啶酸(imazamox)或灭草烟(imazapyr)；

嘧啶类除草剂，例如嘧硫苯甲酸钠(pyribac-sodium)、肟啶草(pyriminobac)、双嘧苯甲酸钠(bispyribac-sodium)；

三嗪类除草剂，例如莠去津(atrazine)、西玛津(simazine)、西草净(simetryn)、去草净(terbutryn)、特丁津(terbuthylazine)；

脲类除草剂，例如异丙隆(isoproturon)、绿麦隆(chlorotoluron)、敌草隆(diuron)、香草隆(dymron)、伏草隆(fluometuron)、利谷隆(linuron)或噻唑隆(methabenzthiazuron)；

膦酸衍生物类除草剂，例如草甘膦(glyphosate)、草铵膦

(glufosinate)、草硫磷(sulfosate)或 phosphinothricin;

PPO 化合物类除草剂,例如除草醚(nitrofen)、治草醚(bifenox)、氟锁草醚(acifluorfen)、乳氟禾草灵(lactofen)、氟硝草醚(oxyfluorfen)、ethoxyfen、乙羧氟草醚(fluroglycofen)、氟黄胺草醚(fomesafen)、氟硝磺酰胺(halosafen)、唑啶炔草(azafenidin)(CAS RN 68049-83-2)、benzfendizone(CAS RN 158755-95-4)、butafenacil(known from US-A-5 183 492、CAS RN 158755-95-4)、氟酮唑草(carfentrazone-ethyl)、cinidon-ethyl(CAS RN 142891-20-1)、酰亚胺苯氧乙酸戊酯(flumiclorac-pentyl)、氟噁嗪酮(flumioxazin)、达草氟(fluthiacet-methyl)、炔丙噁唑草(oxadiargyl)、恶草灵(oxadiazon)、戊噁唑草(pentoxazone)、磺胺草唑(sulfentrazone)、fluazolate(CAS RN 174514-07-9)或氟唑草酯(pyraflufen-ethyl);

氯乙酰苯胺类除草剂,例如草不绿(alachlor)、乙草胺(acetochlor)、丁草胺(butachlor)、克草胺(dimethachlor)、噻吩草胺(dimethenamid)、S-噻吩草胺(S-dimethenamid)、吡草胺(metazachlor)、异丙甲草胺(metolachlor)、S-异丙甲草胺(S-metolachlor)、丙草胺(pretilachlor)、毒草安(propachlor)、异丙草胺(propisochlor)、噻醚草胺(thenylchlor)或 pethoxamid(CAS RN 106700-29-2);

苯氧基乙酸类除草剂,例如2,4-滴(2,4-D)、氟草烟(fluroxypyr)、2甲4氯(MCPA)、2甲4氯丙酸(MCPP)、2甲4氯丁酸(MCPB)、定草酯(triclopyr)或2甲4氯丙酸钾(mecoprop-P);

三嗪酮类除草剂,例如六嗪同(hexazinone)、苯嗪草(metamitron)或赛克津(metribuzin);

二硝基苯胺类除草剂,例如黄草消(oryzalin)、胺硝草(pendimethalin)或氟乐灵(trifluralin);

吡嗪酮类除草剂,例如杀草敏(chloridazon)或达草灭(norflurazon);

氨基甲酸酯类除草剂,例如氯苯胺灵(chlorpropham)、异苯敌

草 (desmedipham)、苯敌草 (phenmedipham) 或苯胺灵 (propham) ;

羟乙酰胺类除草剂, 例如苯噻草胺 (mefenacet) 或达草氟 (fluthiacet) ;

硫代氨基甲酸酯类除草剂, 例如苏达灭 (butylate)、草灭特 (cycloate)、燕麦敌 (diallate)、扑草灭 (EPTC)、禾草畏 (esprocarb)、草达灭 (molinate)、苄草丹 (prosulfocarb)、杀草丹 (thiobencarb) 或野麦畏 (triallate) ;

azolourea 类除草剂, 例如 fentrazamide (CAS RN 158237-07-1) 或 cafenstrole ;

苯甲酸类除草剂, 例如麦草畏 (dicamba) 或毒莠定 (picloram) ;

酰基苯胺类除草剂, 例如吡氟草胺 (diflufenican) 或敌稗 (propanil) ;

腈类除草剂, 例如溴苯腈 (bromoxynil)、敌草腈 (dichlobenil) 或碘苯腈 (ioxynil) ;

三酮类除草剂, 例如磺草酮 (sulcotrione)、mesotrione (known from US-A-5 006 158)、异噁氟草 (isoxaflutole) 或 isoxachlortole ;

磺酰胺类除草剂, 例如 flucarbazone (CAS RN 181274-17-9)、procarbazone (CAS RN 145026-81-9)、唑啉磺胺盐 (cloransulam)、唑啉磺胺 (diclosulam) (CAS RN 145701-21-9)、florasulam、氟唑啉草 (flumetsulam) 或唑草磺胺 (metosulam) ;

以及杀草强 (amitrole)、呋草黄 (benfuresate)、噻草平 (bentazone)、环庚草醚 (cinmethylin)、异恶草酮 (clomazone)、二氯皮考啉酸 (clopyralid)、苯敌快 (difenzoquat)、氟硫草定 (dithiopyr)、乙呋草黄 (ethofumesate)、flurochloridone、indanofan、异恶草胺 (isoxaben)、氟噁嗪草 (oxaziclomefone)、达草止 (pyridate)、pyridafol (CAS RN 40020-01-7)、二氯喹啉酸 (quinclorac)、喹草酸 (quinmerac)、灭草环 (tridiphane) 或氟燕灵 (flamprop)、amicarbazone、benfluamid、benzobicyclon、flufenacet、flufenpyr、foramsulfuron、indanofan、mesosulfuron、氟噁嗪草 (oxaziclomefone)、penoxsulam、pethoxamid、

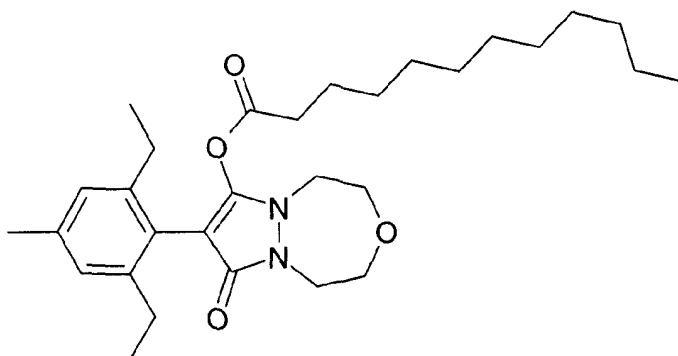
picolinafen、profluazol、profoxydim、propoxycarbazon、氟唑草酯 (pyraflufen)、pyrazogyl、乙黄黄隆 (sulfosulfuron)、tepraloxym 或 tritosulfuron。

除非另有指示，式 I 化合物的上述混合伴侣可从 The Pesticide Manual, Eleventh Edition, 1997, BCPC 已知。式 I 化合物的混合伴侣也可以酌情以酯或盐的形式存在，例如 The Pesticide Manual, Eleventh Edition, 1997, BCPC 所述。

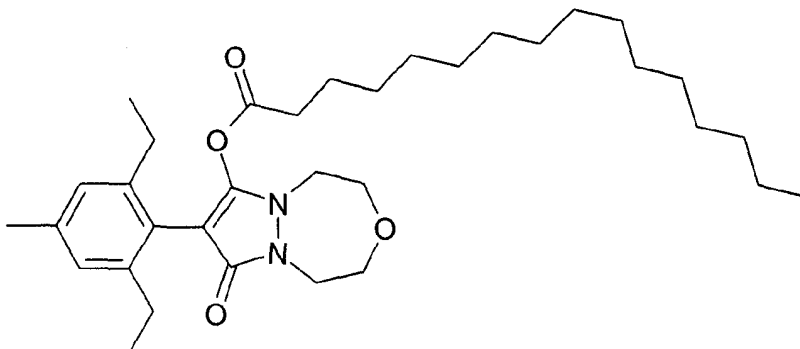
下列实施例进一步阐述本发明，但是不限制本发明。

制备实施例：

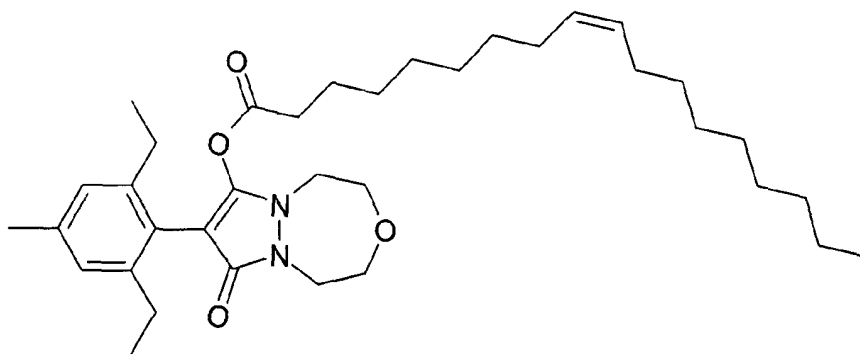
实施例 P1：化合物 1.01 的制备



将三乙胺(1.0 ml, 7.17 mmol)和一匙尖 4-N,N-二甲氨基吡啶加入到 8-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并-[1,2-d][1,4,5]氧杂二氮杂革-7,9-二酮(2.00 g, 6.4 mmol)的 50 ml 四氢呋喃溶液中。在 20°C 下滴加月桂酰氯(1.7 ml, 7.16 mmol)，同时搅拌。立即生成白色沉淀。5 分钟后薄层色谱显示反应是完全的。在抽吸下过滤反应混合物，蒸发浓缩滤液。将残余物悬浮在己烷和少量乙醚中，抽吸过滤，在真空中干燥。所得结晶性物质具有 106-107°C 的熔点 (MS (电喷雾): $m/z = 499$ $[M+H]^+$)。

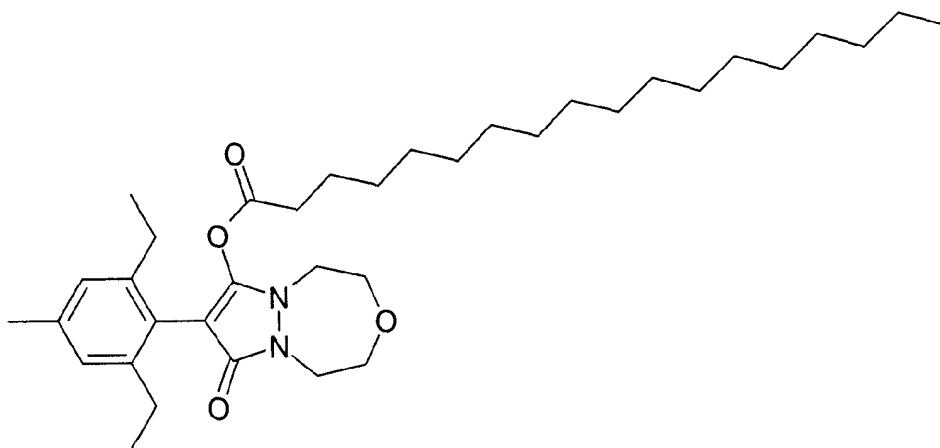
实施例 P2: 化合物 1.02 的制备

将三乙胺(1.4 ml, 10 mmol)和一匙尖 4-N,N-二甲氨基吡啶加入到 8-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并-[1,2-d][1,4,5]氧杂二氮杂革-7,9-二酮(2.00 g, 6.4 mmol)的 50 ml 四氢呋喃溶液中。在 22°C 下滴加 棕榈酰氯(2.2 ml, 7.24 mmol)，同时搅拌。立即生成白色沉淀。5 分钟后薄层色谱显示反应是完全的。蒸发浓缩反应混合物，残余物经过短硅胶柱色谱处理，用乙酸乙酯/己烷混合物洗脱。将产物悬浮在戊烷中，在抽吸下滤出，在真空中干燥。所得结晶性物质在 91-92°C 下熔化 (MS (电喷雾): $m/z = 555 [M+H]^+$)。

实施例 P3: 化合物 1.03 的制备

将三乙胺(1 ml, 7.1 mmol)和一匙尖 4-N,N-二甲氨基吡啶加入到 8-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并-[1,2-d][1,4,5]氧杂二氮杂革-7,9-二酮(1.90 g, 6.0 mmol)的 40 ml 四氢呋喃溶液中。在 20°C 下滴加油酰氯(7.0 mmol) (在草酰氯的作用下从油酸得到)的 10 ml 四氢呋喃溶液, 同时搅拌。立即生成白色沉淀。10 分钟后薄层色谱显示反应是完全的。在抽吸下通过玻璃料过滤反应混合物, 残余物用四氢呋喃冲洗。蒸发浓缩滤液, 向残余物加入己烷(50 ml)。加入小部分乙醚, 直至产物溶解。利用旋转蒸发器部分蒸发浓缩溶液, 无需加热, 生成白色混悬液。将混悬液离心, 除去溶液。将固体悬浮在己烷中, 离心后除去溶液。在真空中干燥后, 得到所需产物, 为蜡状固体, 具有 73-74°C 的熔点。

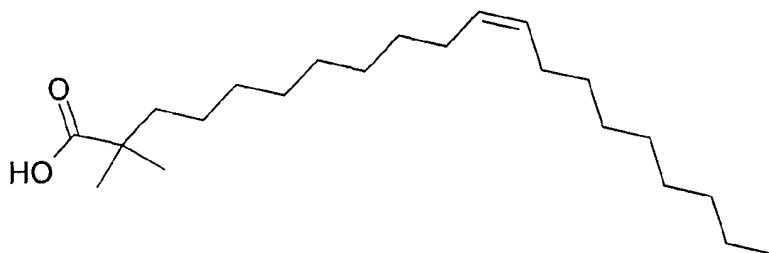
实施例 P4: 化合物 1.04 的制备



在 20°C 下, 将利用 Kugelrohr 烘箱新鲜蒸馏的硬脂酰氯(1.2 ml, 3.6 mmol)加入到 8-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并-[1,2-d][1,4,5]氧杂二氮杂革-7,9-二酮(1.00 g, 3.2 mmol)、三乙胺(0.7 ml, 5.0 mmol)与一匙尖 4-N,N-二甲氨基吡啶的 30 ml 四氢呋喃溶液中。搅拌 30 分钟后, 蒸发浓缩反应混合物, 将残余物溶于二氯甲烷, 迅速经

过短硅胶柱色谱处理，用乙酸乙酯/己烷混合物洗脱。将纯的部分悬浮在戊烷中，在抽吸下过滤。分离所需产物，为白色晶体，具有 32-33°C 的熔点。

实施例 P5: 化合物 1.05a 的制备



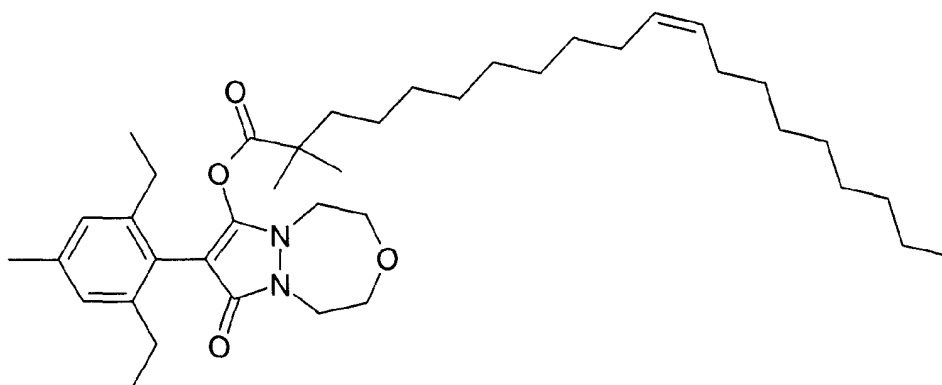
在具有机械搅拌器的装置中，将 N,N-二异丙胺(0.464 g, 4.6 mmol)加入到氢氧化钠(0.20 g, 60%/油, 4.95 mmol)的 15 ml 四氢呋喃混悬液中。在 0°C 下，加入异丁酸(0.396 g, 4.5 mmol)。将反应混合物在 65°C 下加热 20 分钟，然后冷却至 0°C，用正丁基锂(1.6M 己烷溶液, 2.81 ml, 4.5 mmol)滴加处理。白色混悬液变为浅黄色溶液。20 分钟后，升高温度至 30°C，15 分钟后，再次降低至 0°C。加入油酰溴(1.49 g, 4.5 mmol)的 4 ml 四氢呋喃溶液。15 分钟后，升高温度至 30°C。一小时后，再次冷却，加入水，分离各相。有机相用水/乙醚萃取。合并水相，用乙醚萃取，用 2N 盐酸酸化，再次用乙醚萃取。将最终的萃取液用盐水摇动，经硫酸钠干燥，蒸发浓缩。得到所需的酸，为无色的油状物的形式。

光谱数据:

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): δ = 5.40-5.30 (m, 2H, 乙烯基), 2.08-1.95 (m, 4H, 烯丙基), 1.58-1.47 (m, 2H, CH_2 羧酸 β 位), 1.40-1.20 (m, 24H), 0.88 (t, 3H, 甲基).

^{13}C NMR (CDCl_3 , 75 MHz): δ = 185.0 (COOH), 130.3 和 130.2

(C=C)

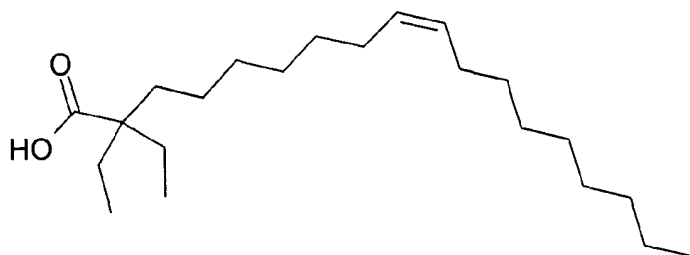
MS (电喷雾): $m/z=337$ $[M-H]^-$ 化合物 1.05b 的制备

在 20°C 下, 将 25 ml 从顺式-2,2-二甲基-二十碳-11-烯酸(21.38 mmol)和草酰氯制备的酰氯的乙醚溶液加入到 8-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并-[1,2-d][1,4,5]氧杂二氮杂革-7,9-二酮(6.44 g, 20.36 mmol)、三乙胺(5.2 ml, 37.31 mmol)与一匙尖 4-N,N-二甲氨基吡啶的 300 ml 四氢呋喃溶液中。搅拌 30 分钟后, 在抽吸下过滤反应混合物, 残余物用乙醚冲洗。蒸发浓缩滤液, 经过硅胶柱色谱(HPLC)处理, 用 25% 乙酸乙酯和 75% 己烷混合物洗脱。分离得到所需产物, 为黄色的油状物。

光谱数据:

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): $\delta=$ 6.90 (s, 2H, 芳基), 5.37 (m, 2H, 乙烯基), 4.28-4.23 (m, 2H), 3.95-3.89 (m, 2H), 3.88-3.78 (m, 4H), 2.60-2.35 (m, 4H, Ar- CH_2), 2.29 (s, 3H, Ar- CH_3), 2.08-1.97 (m, 4H, 烯丙基).

MS (电喷雾): $m/z=1274$ $[2M+H]^+$, 638 $[M+H]^+$ 实施例 P6: 化合物 1.06a 的制备



在 0-5°C 下, 将 N,N-二异丙胺(1.11 g, 11.0 mmol)、再将油酸(3.00 g, 10.6 mmol)缓慢滴加到氢化钠(60%/油, 0.47 g, 11.7 mmol)的 100 ml 四氢呋喃混悬液中, 同时搅拌。将反应混合物在 65°C 下加热 15 分钟。将混悬液冷却至 0°C, 缓慢滴加正丁基锂溶液(1.6M 己烷溶液, 10.0 ml, 16.0 mmol)。15 分钟后, 将所得黄色溶液在 35-40°C 下加热 30 分钟, 再次冷却至 0°C, 用乙基溴(1.74 g, 16.0 mmol)的 5 ml 四氢呋喃溶液处理, 在 20°C 下搅拌过夜。将白色混悬液再次冷却至 0°C, 滴加另一部分正丁基锂溶液(1.6M 己烷溶液, 10.0 ml, 16.0 mmol)。将反应混合物在 35-40°C 下加热 30 分钟, 再次冷却至 0°C, 用乙基溴(1.74 g, 16.0 mmol)的 5 ml 四氢呋喃溶液处理。因为反应不完全(根据薄层色谱), 进行另外两次丁基锂溶液和乙基溴的依次加入, 用量和温度同上。当反应完全时, 向反应混合物加入水, 分离各相。有机相用水/乙醚萃取。合并水相, 用乙醚萃取, 用 2N 盐酸酸化, 再次用乙醚萃取。将最终的萃取液用盐水摇动萃取, 经硫酸钠干燥, 蒸发浓缩。得到所需的酸, 为无色的油状物的形式。

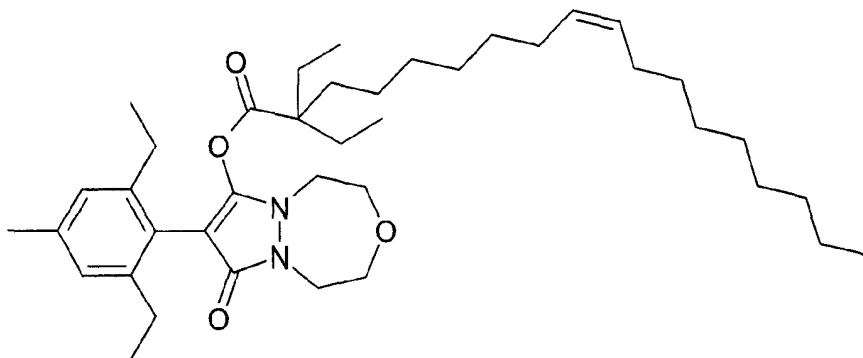
光谱数据:

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): δ = 5.40-5.30 (m, 2H, 乙烯基), 2.1-1.9 (m, 4H, 烯丙基), 1.7-1.5 (m, 6H, H 羧酸 β 位), 1.4-1.1 (m, 20H), 1.0-0.75 (m, 9H, 甲基)。

^{13}C NMR (CDCl_3 , 75 MHz): δ = 184.0 (COOH), 130.0 和 129.8 (C=C)

MS (电喷雾): $m/z=337$ $[M-H]^-$

化合物 1.06b 的制备



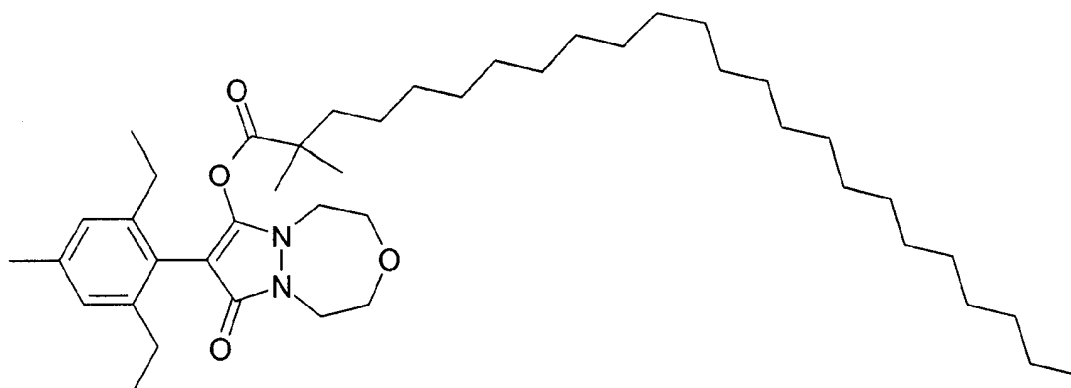
在 20°C 下, 将 30 ml 从顺式-2,2-二乙基-十八碳-9-烯酸(5.91 mmol)和草酰氯制备的酰氯的四氢呋喃溶液加入到 8-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并-[1,2-d][1,4,5]氧杂二氮杂革-7,9-二酮(1.62 g, 5.12 mmol)、三乙胺(0.83 ml, 5.94 mmol)与一匙尖 4-N,N-二甲氨基吡啶的 40 ml 四氢呋喃溶液中。搅拌 30 分钟后, 在抽吸下过滤反应混合物, 残余物用乙醚冲洗。利用旋转蒸发器蒸发浓缩滤液, 无需加热, 经过短硅胶柱色谱处理, 用 10% 乙酸乙酯/90% 己烷至 100% 乙酸乙酯梯度洗脱。分离所需产物, 为黄色的油状物的形式。

光谱数据:

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): $\delta= 6.85$ (s, 2H, 芳基), 5.40-5.25 (m, 2H, 乙烯基), 2.6-2.3 (m, 4H, 苄基), 2.28 (s, 3H, 苄基).

MS (电喷雾): $m/z=1274$ $[2M+H]^+$, 638 $[M+H]^+$

实施例 P7: 化合物 1.07 的制备

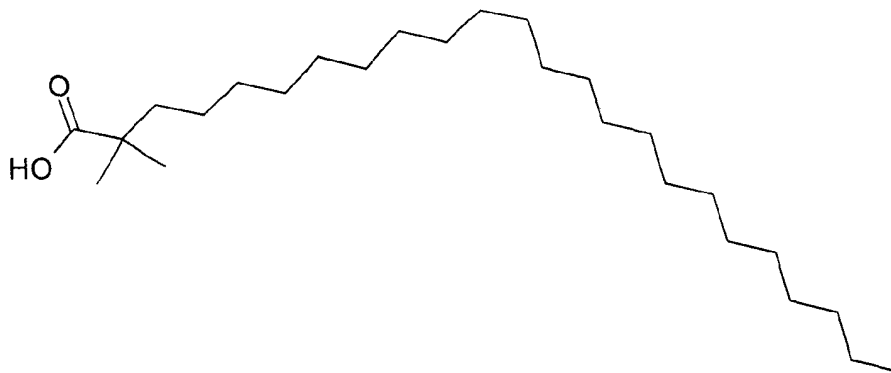


将 8-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并-[1,2-d][1,4,5]氧杂二氮杂萘-7,9-二酮(1.0 g, 0.00316 mol)、2,2-二甲基二十四烷酰氯(1.58 g, 在甲苯中从 2,2-二甲基二十四烷酸和亚硫酸氯制备)与三乙胺(0.38 g, 0.0038 mmol)混合在 25 ml 乙腈中, 在 20°C 下搅拌 20 小时。将反应混合物倒在 300 ml 稀盐酸中, 用乙酸乙酯萃取两次。将有机相用盐水洗涤, 经硫酸钠干燥, 蒸发浓缩。粗产物经过硅胶柱色谱处理, 用乙酸乙酯/己烷混合物洗脱。分离产物, 为结晶性物质的形式, 具有 80-82°C 的熔点。

光谱数据:

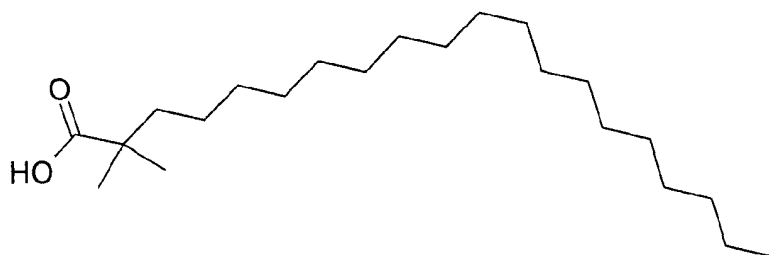
^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): δ =6.90 (s, 2H, 芳基), 4.30-4.20 (m, 2H), 3.99-3.92 (m, 2H), 3.90-3.82 (m, 4H), 2.61-2.37 (m, 4H, Ar-CH₂-CH₃), 2.29 (s, 3H, 苄基), 1.4-1.2 (m, 42H), 1.13 (t, J=13 Hz, 6H, Ar-CH₂-CH₃), 1.04 (s, 6H, α -甲基), 0.90 (t, J=12Hz, 3H, 甲基).

实施例 P8: 化合物 1.08a 的制备



将 N,N-二异丙胺(5.06 g, 0.05 mol)的 100 ml 四氢呋喃溶液冷却至 -30°C ，加入正丁基锂(1.6M 己烷溶液, 30 ml, 0.048 mol)，使温度不超过 -10°C 。历经 15 分钟滴加异丁酸(2.02 g, 0.0229 mol)的 20 ml 四氢呋喃溶液。然后将反应混合物加热 50°C ，90 分钟后，冷却至 20°C 。滴加 1-溴二十二烷(9.74 g, 0.025 mol)的 20 ml 四氢呋喃溶液。搅拌 20 小时后，向反应混合物加入 100 ml 饱和氯化铵水溶液和 8 ml 浓盐酸溶液。分离各相，将有机相用盐水摇动萃取，经硫酸钠干燥，蒸发浓缩。将酸从己烷中重结晶。

实施例 P9: 化合物 1.09a 的制备



在 20°C 下，将异丁酸(4.65 ml, 50 mmol)加入到氢化钠(60%/油, 2.2 g, 55 mmol)的 70 ml 四氢呋喃与 N,N-二异丙胺(7.3 ml, 50 mmol)混悬液中。加热至 65°C 后，冷却至 0°C ，滴加正丁基锂(2.0M 己烷溶液, 25 ml, 50 mmol)。将所得溶液在 40°C 下加热 30 分钟，然后冷却至 0°C ，然后加入 1-溴十八烷(17.5 g, 52.5 mmol)的 40 ml 四氢呋喃溶液。将反

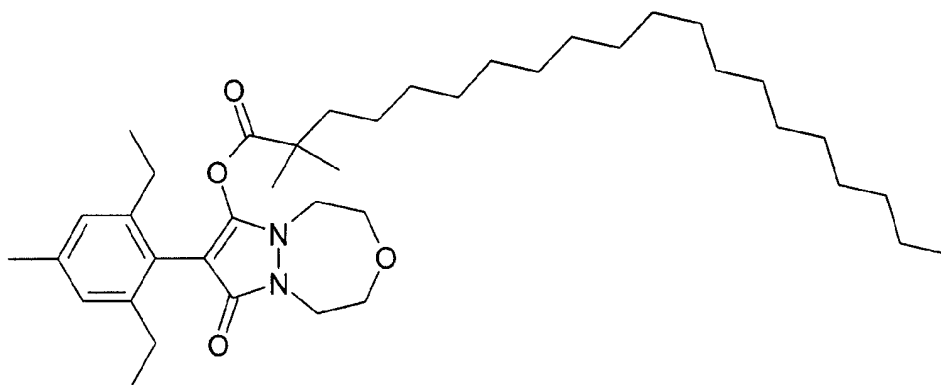
应混合物在 35°C 下搅拌 1 小时，然后冷却，倒在冰/水混合物中；加入 2N 氢氧化钠溶液。在抽吸下过滤混悬液，将残余物用 1N 氢氧化钠溶液、水和己烷洗涤；然后搅拌加入到乙醚/4N 盐酸中。分离各相，水相用乙醚萃取两次，合并有机相，用水、再用盐水摇动萃取，经硫酸钠干燥，蒸发浓缩。

光谱数据：

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): $\delta=1.20$ (s, 6H, α -甲基)

MS (电喷雾): $m/z=339$ $[\text{M}-\text{H}]^-$, 385 $[\text{M}+\text{HCOO}]^-$

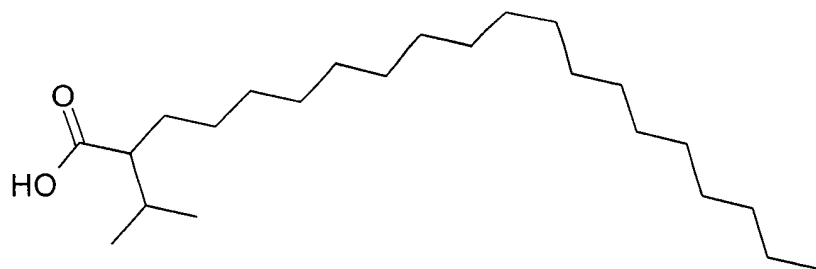
化合物 1.09b 的制备



方法类似于实施例 P7，得到所需化合物，具有下列光谱数据：

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): $\delta=6.87$ (s, 2H, 芳基), 2.29 (s, 3H, 芳基- CH_3), 1.12 (t, $J=13$ Hz, 6H, $\text{Ar}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$), 1.05 (s, 6H, α -甲基); MS (电喷雾): $m/z=640$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

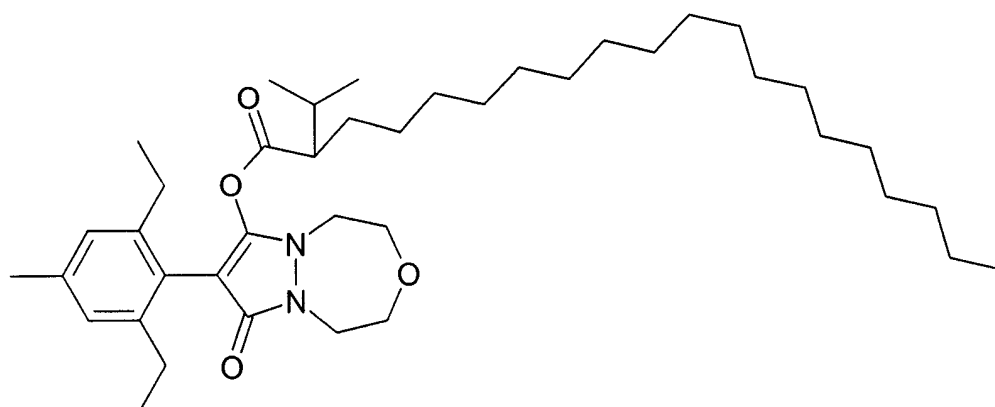
实施例 P10: 化合物 1.10a 的制备



方法同实施例 P9a，得到所需化合物，具有下列光谱数据：

MS (电喷雾): $m/z=353 [M-H]^-$, $399 [M+HCOO]^-$

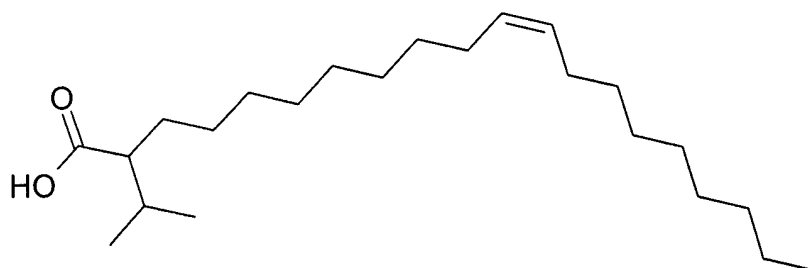
化合物 1.10b 的制备



方法同实施例 P7，得到所需化合物，具有下列光谱数据：

MS (电喷雾): $m/z=653 [M+H]^+$

实施例 P11: 化合物 1.11a 的制备

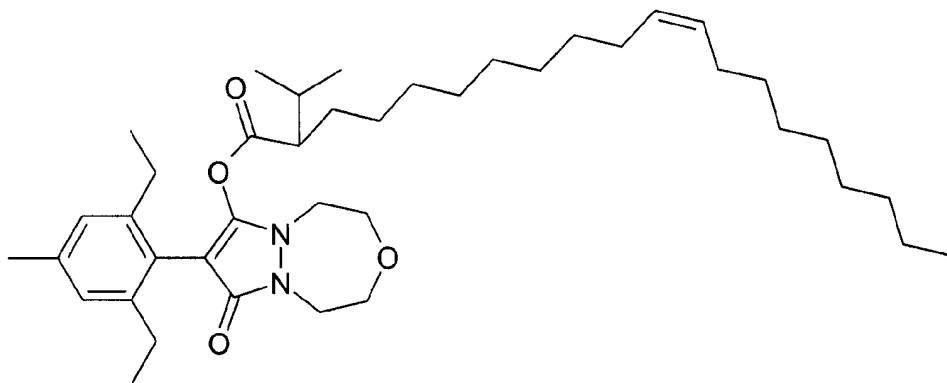


方法同实施例 P9a，得到所需化合物，具有下列光谱数据：

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): $\delta=5.40-5.30$ (m, 2H, 烯属)..., 0.98 (d, 6H, 异丙基), 0.87 (t, 3H, 甲基)

MS (电喷雾): $m/z=351$ $[\text{M}-\text{H}]^-$, 397 $[\text{M}+\text{HCOO}]^-$

化合物 1.11b 的制备

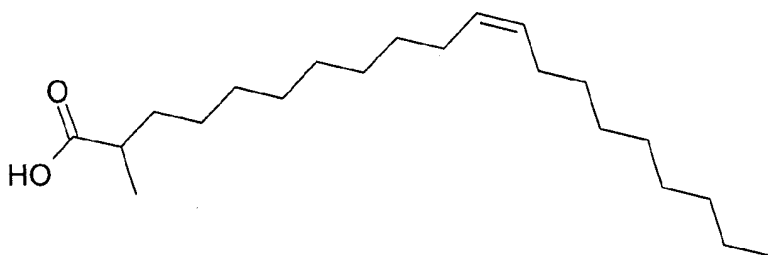


方法同实施例 P7, 得到所需化合物, 具有下列光谱数据:

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): $\delta=6.88$ (s, 2H, 芳基), 5.45-5.35 (m, 2H, 烯属), 2.65-2.35 (m, 4H, 芳基- $\text{CH}_2\text{-CH}_3$), 2.28 (s, 3H, 芳基- CH_3),

MS (电喷雾): $m/z=652$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

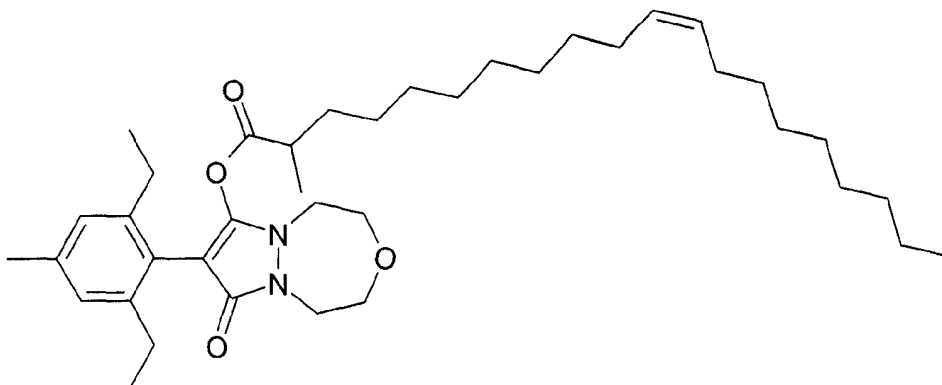
实施例 P12: 化合物 1.12 的制备



方法同实施例 P9a, 得到所需化合物, 具有下列光谱数据:

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): $\delta=5.40-5.30$ (m, 2H, 烯属), 2.46 (六重峰, 1H, $\alpha\text{-H}$), 1.15 (d, 3H, $\alpha\text{-甲基}$)

化合物 1.12b 的制备



方法同实施例 P7，得到所需化合物，具有下列光谱数据：

^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz): $\delta=6.87$ (s, 2H, 芳基), 5.42-5.33 (m, 2H, 烯属), 2.63-2.36 (m, 4H, 芳基- $\text{CH}_2\text{-CH}_3$), 2.30 (s, 3H, 芳基- CH_3), 1.01 (d, 3H, α -甲基), 0.90 (t, 3H, 甲基); MS (电喷雾): $m/z=623$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

生物学实施例

在塑料罐内，将单子叶与双子叶杂草和夏小麦(Lona)播种在标准土壤中。在播种后直接施用供试化合物 EC 125 和 WP 10（不含额外的表面活性化合物）。施用比率为 125 g 活性物质每公顷。然后在温室中使供试植物生长在最佳条件下。施用后 20 天进行评价：100 表示对有关植物的 100%破坏。

供试植物：剪股颖属(Agr)、看麦娘属 (Alo)、蒭草属(Pha)、黑麦草属(Lol)和狗尾草属(Set)。

表 21: 在 125 g/ha 施用比率下的除草作用

	化合物 A EC 125	化合物 1.03 WP 10	化合物 1.12b WP 10	化合物 1.05b WP 10
小麦	20	10	10	0
Agr	95	98	95	80
Alo	100	90	90	80
Pha	100	100	100	100
Lol	98	90	80	70
Set	100	100	90	70

化合物 A 是 8-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢吡唑并[1,2-d][1,4,5]氧杂二氮杂茛-7,9-二酮。

与化合物 A 相比，所采用的根据本发明的化合物对于小麦表现较少的植物毒性，而对于杂草则具有大约相同的活性。