(19)中华人民共和国国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 105732513 A
(43)申请公布日 2016.07.06

(21)申请号 201610076960.5

(22)申请日 2009.12.12

(30)优先权数据
08022104.7 2008.12.19 EP

(62)分案原申请数据
200980157250.3 2009.12.12

(71)申请人 拜耳知识产权有限责任公司
地址 德国蒙海姆

(72)发明人 S·莱尔 T·申克 C·H·罗辛格
R·菲舍尔 I·豪瑟-哈恩
D·福伊希特 J·迪特根
P·克里斯托 O·盖特森
S·赫尔曼 O·马萨姆
E-M·弗兰肯

(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285
代理人 王媛 钟守期

(51)Int.Cl.
C07D 237/16(2006.01)
A01N 43/58(2006.01)
A01N 47/06(2006.01)
A01P 13/00(2006.01)

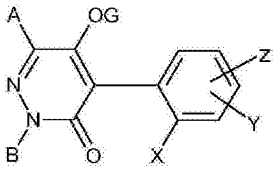
权利要求书4页 说明书42页

(54)发明名称

作为除草剂和杀虫剂的被苯基取代的哒嗪酮

(57)摘要

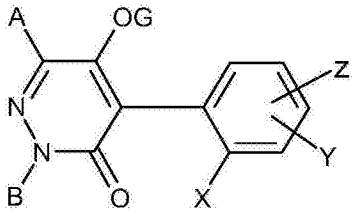
本发明涉及作为除草剂和杀虫剂的式(I)的哒嗪酮。在所述的式(I)中,A、B、G、X1、Y和Z为诸如氢的基团、诸如烷基的有机基团、以及诸如卤素、硝基和氰基的其它基团。



(I)

CN 105732513 A

1.式(I)的4-苯基哒嗪酮或其盐



(I)

其中

A为氢；

B为(C_1-C_6)烷基；

G为氢；

X为卤素；

Y和Z各自彼此独立地为氢或卤素；

条件是,排除化合物4-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2-甲基哒嗪-3(2H)-酮。

2.权利要求1的4-苯基哒嗪酮,其中

A为氢；

B为甲基、乙基、异丁基或叔丁基；

G为氢；

并且

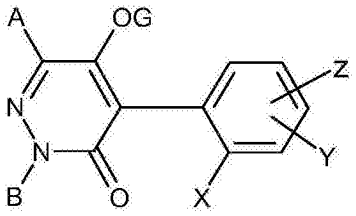
X为氟、溴、氯或碘；

Y为氢、氟、溴、氯或碘；

Z为氢、氟、溴、氯或碘，

条件是,排除化合物4-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2-甲基哒嗪-3(2H)-酮。

3.式(I)的4-苯基哒嗪酮或其盐，



(I)

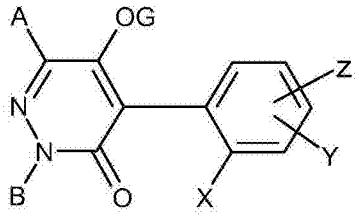
选自以下化合物：

编号	X	Y	Z	A	B	G
I-1-a-4	H	4-Cl	3-Cl	H	Me	H
I-1-a-5	Cl	H	4-Cl	H	t-Bu	H

其中,Me为甲基,t-Bu为叔丁基。

4.权利要求1至3中任一项的式(I)的4-苯基哒嗪酮用作杀虫剂的用途。

5.式(I)的4-苯基哒嗪酮或其盐



(I)

其中

A为氢或甲基；

B为甲基或叔丁基；

G为氢、C(=O)R^1、C(=L)MR^2或E；

E为Na^+；

L为氧；

M为氧；

R^1为(C_1-C_6)烷基；

R^2为(C_1-C_6)烷基；

并且

X为溴或氯；

Y为氢、氟、溴、氯、甲基、三氟甲基或三氟甲氧基；且

Z为氢，

或

X为三氟甲氧基；

Y为溴；且

Z为溴，

或

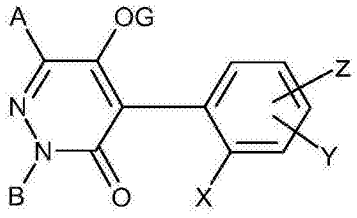
X为溴或氯；

Y为甲基；且

Z为溴或氯，

条件是，排除化合物4-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2-甲基哒嗪-3(2H)-酮。

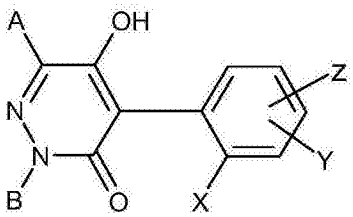
6.式(I)的4-苯基哒嗪酮或其盐



(I)

选自以下化合物：

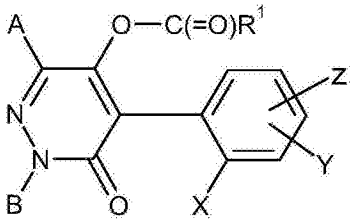
a)G为氢的式(I)化合物



(I-a)

编号	X	Y	Z	A	B
I-1-a-9	Cl	4-Me	6-Br	Me	Me
I-1-a-25	OCF_3	4-Br	6-Br	Me	Me
I-1-a-27	Cl	4-Cl	H	Me	Me

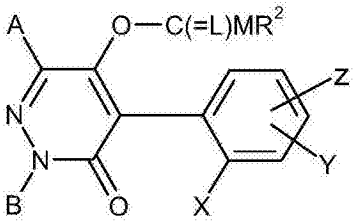
b)G为C(=O)R^1的式(I)化合物



(I-b)

编号	X	Y	Z	R^1	A	B
I-1-b-1	Cl	6-F	H	i-Pr	Me	Me
I-1-b-3	Cl	6-Cl	H	i-Pr	Me	Me

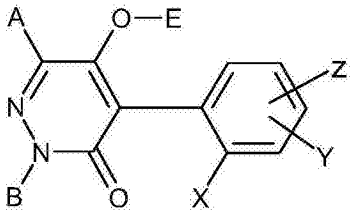
c)G为C(=L)MR^2的式(I)化合物



(I-c)

编号	X	Y	Z	A	B	L	M	R^2
I-1-c-7	Cl	6-F	H	Me	Me	O	O	Et
I-1-c-8	Cl	6-Cl	H	Me	Me	O	O	Et
I-1-c-9	Cl	4-Cl	H	Me	Me	O	O	Et
I-1-c-14	OCF_3	4-Br	6-Br	Me	Me	O	O	Et

d)G为E的式(I)化合物



(I-g)

编号	X	Y	Z	E	A	B
I-1-g-1	Br	4-Me	6-Cl	Na^+	Me	Me

其中,Me为甲基,Et为乙基,i-Pr为异丙基。

7.一种除草组合物,其包含有效量的至少一种权利要求5或6的式(I)的4-苯基哒嗪酮。

8.权利要求7的除草组合物，混有配制助剂。

9.权利要求7或8的除草组合物，其包含至少一种选自杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀菌剂、安全剂和生长调节剂的其它农药活性化合物。

10.权利要求9的除草组合物，其包含安全剂。

11.权利要求9或10的除草组合物，其包含另一种除草剂。

12.一种防治不想要的植物的方法，其中将有效量的至少一种权利要求5或6的式(I)的4-苯基哒嗪酮或者权利要求7至11中任一项的除草组合物施用于植物或者施用于不想要的植物生长的地方。

13.权利要求5或6的式(I)的4-苯基哒嗪酮或者权利要求7至11中任一项的除草组合物用于防治不想要的植物的用途。

14.权利要求13的用途，其中将所述式(I)的4-苯基哒嗪酮用于防治有益植物作物中不想要的植物。

15.权利要求14的用途，其中所述有益植物为转基因有益植物。

作为除草剂和杀虫剂的被苯基取代的哒嗪酮

[0001] 本申请是2009年12月12日提交的名称为“作为除草剂和杀虫剂的被苯基取代的哒嗪酮”的200980157250.3发明专利申请的分案申请。

[0002] 本发明涉及作物保护剂的技术领域，特别是用于选择性防治有益植物作物中的阔叶杂草和禾本科杂草(weed grass)的除草剂的技术领域。

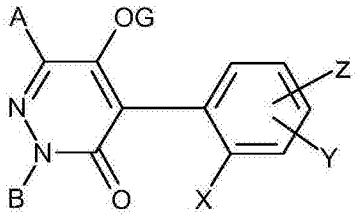
[0003] 具体而言，本发明涉及被芳基取代的哒嗪酮衍生物、其制备方法及其用作除草剂和杀虫剂的用途。

[0004] 多篇公开文本描述了具有除草性质的被取代的4-苯基哒嗪酮。2-甲基-4-苯基哒嗪酮已知于Stevenson et.al,J.Het.Chem.,(2005),427及后中。WO2007/119434 A1描述了在苯环的2位上带有一个烷基基团的4-苯基哒嗪酮。WO2009/035150 A2公开了在苯环的2位上带有一个烷基或烷氧基基团、并且其它位置任选地被卤原子或其它基团取代的4-苯基哒嗪酮。

[0005] 然而，由这些公开文本已知的化合物的除草活性通常不足。因此，本发明的一个目的是提供可供选择的除草活性化合物。

[0006] 已发现苯环上带有某些取代基的4-苯基哒嗪酮特别适于作为除草剂。

[0007] 本发明提供了式(I)的4-苯基哒嗪酮或其盐

[0008] 

(I)

[0009] 其中

[0010] A和B各自彼此独立地为氢或(C_1-C_6)烷基；

[0011] G为氢、C(=O)R^1、C(=L)MR^2、SO_2R^3、P(=L)R^4R^5、C(=L)NR^6R^7或E；

[0012] E为一种金属离子等效物(equivalent)或铵离子；

[0013] L为氧或硫；

[0014] M为氧或硫；

[0015] R^1为(C_1-C_6)烷基、(C_2-C_6)烯基、(C_1-C_4)烷氧基-(C_1-C_6)烷基、二-(C_1-C_4)烷氧基-(C_1-C_6)烷基或(C_1-C_4)烷硫基-(C_1-C_6)烷基，所述基团各自被n个卤原子取代，

[0016] 含有3至5个碳原子与1至3个选自氧、硫和氮的杂原子的完全饱和的3至6元环，所述环被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代，

[0017] 被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代的(C_3-C_6)环烷基、苯基、苯基-(C_1-C_4)烷基、杂芳基、苯氧基-(C_1-C_4)烷基或杂芳基-氧基-(C_1-C_4)烷基；

[0018] R^2为(C_1-C_6)烷基、(C_2-C_6)烯基、(C_1-C_4)烷氧基-(C_1-C_6)烷基或二-(C_1-C_4)烷氧基-(C_1-C_6)烷基，所述基团各自被n个卤原子取代，

[0019] 或者为(C_3-C_6)环烷基、苯基或苄基，所述基团各自被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代；

[0020] R^3、R^4和R^5各自彼此独立地为被n个卤原子取代的(C_1-C_6)烷基,(C_1-C_4)烷氧基、N-(C_1-C_6)烷基氨基、N,N-二-(C_1-C_6)烷基氨基、(C_1-C_4)烷硫基、(C_2-C_4)烯基或(C_3-C_6)环烷基硫基,

[0021] 或苯基、苄基、苯氧基或苯硫基,所述基团被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代;

[0022] R^6和R^7各自彼此独立地为氢,

[0023] 被n个卤原子取代的(C_1-C_6)烷基,(C_3-C_6)环烷基、(C_2-C_6)烯基、(C_1-C_6)烷氧基或(C_1-C_4)烷氧基-(C_1-C_6)烷基,

[0024] 苯基或苄基,所述基团各自被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代;

[0025] 或者R^6和R^7以及与之相连的氮原子一起形成含有2至5个碳原子和0或1个氧或硫原子的3至6元环;

[0026] m为1、2或3;

[0027] n为0、1、2或3;

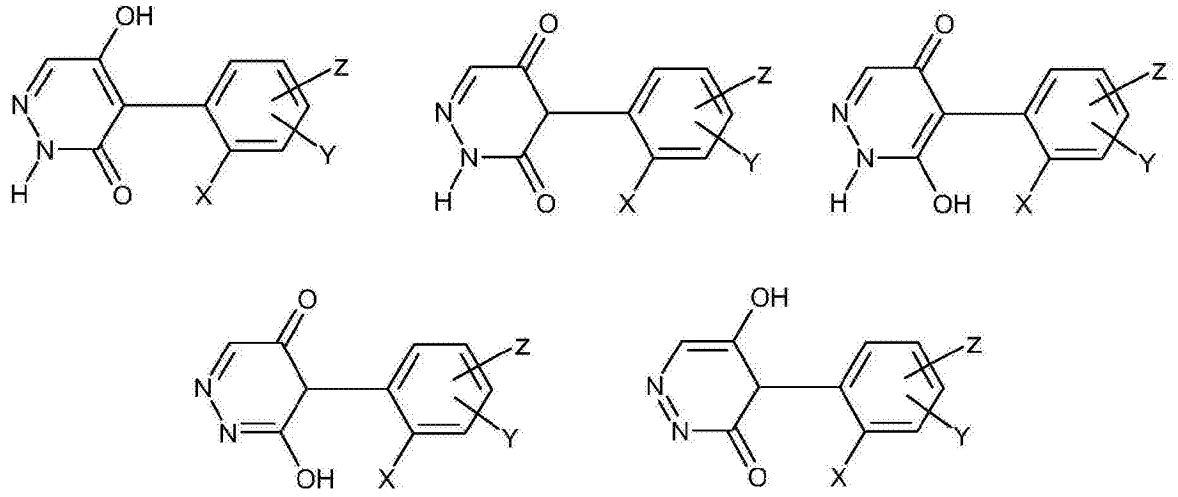
[0028] X为卤素、氰基、(C_3-C_6)环烷基、硝基,或者为(C_1-C_6)烷基或(C_1-C_6)烷氧基,所述基团各自被m个卤原子取代,或者为被n个卤原子取代的苯基;

[0029] Y和Z各自彼此独立地为氢、卤素、氰基、硝基、(C_3-C_6)环烷基,或者为(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷氧基或苯基,所述基团各自被n个卤原子取代,

[0030] 条件是,如果n为0,则Y和Z均不是位于6位的(C_1-C_6)烷基或(C_1-C_6)烷氧基基团。

[0031] 如果G和/或B为氢,则本发明的式(I)化合物可以,根据外部条件(例如pH、溶剂和温度),以均为通式(I)所包括的多种互变异构结构存在:

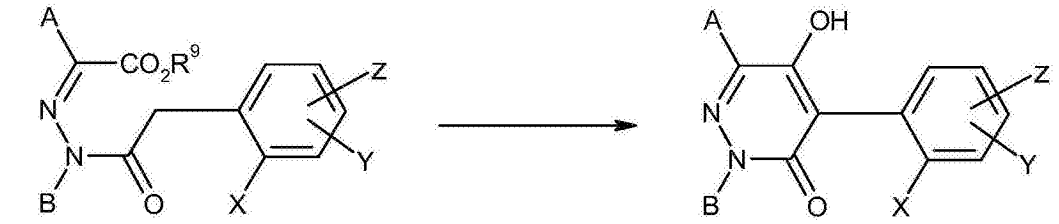
[0032]



[0033] 在以下所有结构中,除非另外定义,所述取代基具有与上文式(I)化合物中所给相同的含义。

[0034] 其中G为氢的本发明式(I)化合物,可例如根据方案1中给出的方法通过式(II)化合物的碱诱导缩合反应来制备。此处,R^9为(C_1-C_6)烷基,特别是甲基或乙基。

方案 1

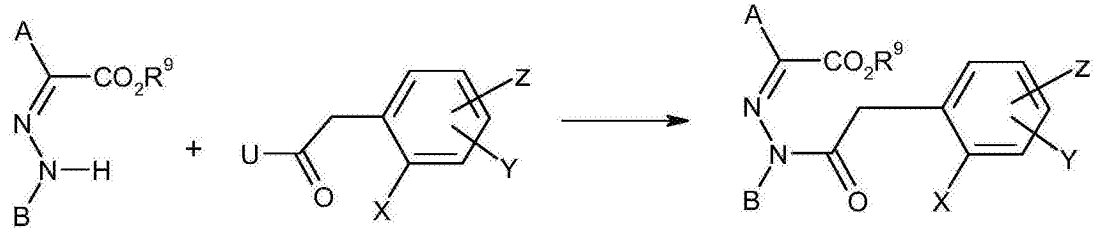
[0035] 

(II) (I)

[0036] 式(II)的化合物可例如根据方案1a给出的方法通过使亚肼基羧酸衍生物与苯基乙酸衍生物反应来制备。此处,U为通过活化羧酸的试剂——例如羰基二咪唑、羰基二亚胺(例如二环己基碳二亚胺)、磷酰化试剂(例如$POCl_3$、BOP-Cl)、卤化剂(例如亚硫酰氯、草酰氯、光气或氯甲酸酯)——而引入的离去基团。这类方法也可由本领域技术人员自WO2007/119434、BCS07-3099和其中引用的文献中获知。

[0037]

方案 1a

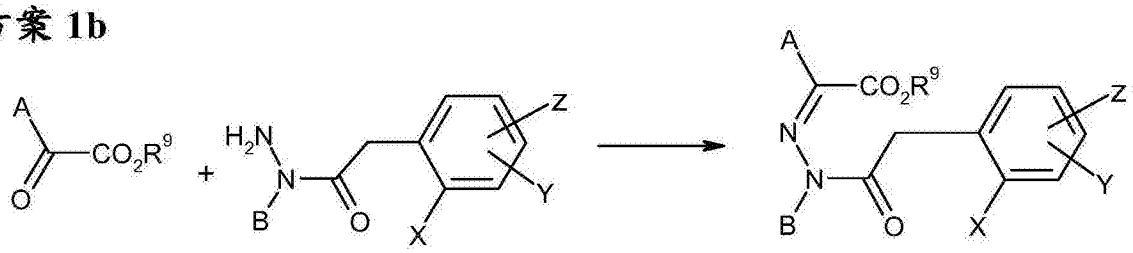


(II)

[0038] 式(II)的化合物也可例如根据方案1b中所示的方法通过本领域技术人员由Zh.Obs.Khim.1992,62,2262中已知的酰肼(IIa)与式A-CO-CO_2R^9的酮羧酸的反应来制备。

[0039]

方案 1b



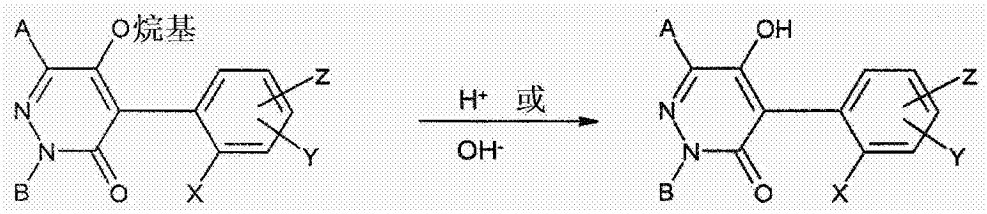
(IIa) (II)

[0040] 方案1b中所示的式(IIa)的酰肼可例如通过使式B-NH-NH_2的肼与方案1a中所示的苯基乙酸衍生物根据记载于J.Org.Chem.1980,45,3673中的方法反应来制备。方案1a中所示的酰肼可由方案1b中所示的酮羧酸A-CO-CO_2R^9(其本身是已知的)例如根据记载于J.Med.Chem.1985(28),1436中的方法来制备。

[0041] 制备方案1a中所示的苯基乙酸衍生物所需的游离苯基乙酸(即其中U为羟基的那些)是已知的,或者可通过本身已知的方法制备,例如通过已知于WO 2005/075401、WO 2001/96277、WO 1996/35664和WO 1996/25395中的方法来制备。

[0042] 然而，某些苯基乙酸衍生物也可用乙酸酯烯醇化物在钯催化剂的存在下制备，所述钯催化剂例如由钯源(如$Pd_2(dba)_3$或$Pd(Oac)_2$)和配体(如$(t\text{-}Bu)_3P$、iMes*HCl或2'-(N,N-二甲基氨基)-2-(二环己基膦基)联苯)形成的钯催化剂(WO 2005/048710，J.Am.Chem.Soc 2002.124，.12557，J.Am.Chem.Soc 2003.125，11176或J.Am.Chem.Soc.2001，123，799)。此外，可将某些被取代的芳基卤化物在铜催化下转化成相应的被取代的丙二酸酯(例如记载于Org.Lett.2002，2，269，WO 2004/108727中)，其可通过已知的方法将转化成苯基乙酸。

[0043] 其中G为氢的本发明式(I)化合物也可例如根据方案2中给出的方法通过使其中G为烷基(优选甲基)的式(I)化合物与强无机碱(例如氢氧化钠或氢氧化钾)反应、或者在浓无机酸(例如氢溴酸)中反应来制备。方案2

[0044] 

[0045] 其中G为$C(=O)R^1$的本发明式(I)化合物也可例如通过本领域技术人员已知的、其中G为氢的式(I)化合物与式$Hal\text{-}CO\text{-}R^1$的碳酰卤或与式$R^1\text{-}CO\text{-}O\text{-}CO\text{-}R^1$的羧酸酐的反应来制备。

[0046] 其中G为$C(=L)MR^2$的本发明式(I)化合物也可例如通过本领域技术人员已知的、其中G为氢的式(I)化合物与a)式$R^2\text{-}M\text{-}COOR^1$的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯或与b)氯甲酰基卤化物或硫代氯甲酰基卤化物(chloroformyl thiohalide)的反应来制备。

[0047] 其中G为SO_2R^3的本发明式(I)化合物也可例如通过本领域技术人员已知的、其中G为氢的式(I)化合物与式$R^3\text{-}SO_2\text{-}Cl$的磺酰氯的反应来制备。

[0048] 其中G为$P(=L)R^4R^5$的本发明式(I)化合物也可例如通过本领域技术人员已知的、其中G为氢的式(I)化合物与式$Hal\text{-}P(=L)R^4R^5$的磷酰氯的反应来制备。

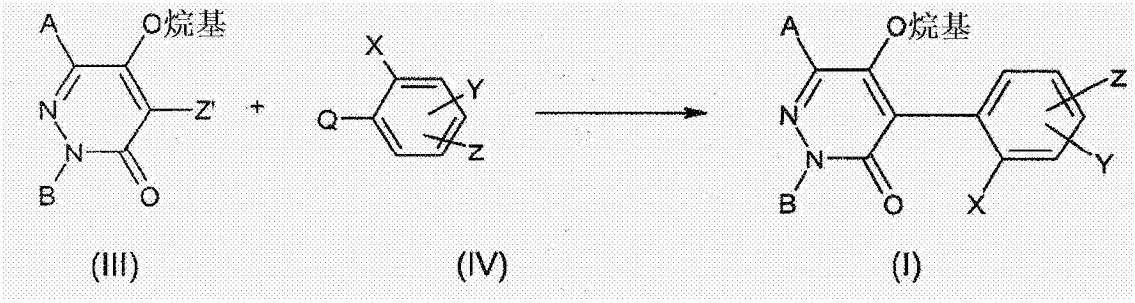
[0049] 其中G为E的本发明式(I)化合物也可例如通过本领域技术人员已知的、其中G为氢的式(I)化合物与式$Me(OR^{10})_t$的金属化合物或者与胺的反应来制备。此处，Me为一价或二价金属离子，优选碱金属或碱土金属，例如锂、钠、钾、镁或钙。附标t为1或2。铵离子为NH_4^+或$R^{13}R^{14}R^{15}R^{16}N^+$，其中$R^{13}$、$R^{14}$、$R^{15}$和$R^{16}$彼此独立地优选为($C_1$-$C_6$)烷基或苄基。

[0050] 其中G为$C(=L)NR^6R^7$的本发明式(I)化合物也可例如通过本领域技术人员已知的、其中G为氢的式(I)化合物与式$R^6\text{-}N=C=L$的异氰酸酯或异硫氰酸酯或者与式$R^6R^7N\text{-}C(=L)Cl$的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯的反应来制备。

[0051] 其中G为烷基(优选甲基)的本发明式(I)化合物也可例如根据方案3通过本领域技术人员已知的、式(III)化合物与式(IV)化合物的反应来制备。此处，Z'为溴或碘且Q为三烷基锡基团、卤化镁基团、或优选为硼酸或其酯。这些反应通常在催化剂(例如Pd盐或Pd络合物)的存在下且在碱(例如碳酸钠、磷酸钾)的存在下进行。

[0052] 方案3

[0053]



(III) (IV) (I)

[0054] 根据上文定义的取代基的种类，式(I)的化合物具有酸性或碱性性质，并且也可与无机或有机的酸或碱或与金属离子形成盐(以及如果合适内盐或加合物)。如果式(I)的化合物带有氨基基团、烷基氨基基团或产生碱性性质的其它基团，则这些化合物可与酸反应形成盐，或者它们在合成中以盐的形式直接获得。

[0055] 无机酸的实例为氢卤酸(例如氢氟酸、氢氯酸、氢溴酸和氢碘酸)、硫酸、磷酸和硝酸，以及酸式盐(例如$NaHSO_4$和$KHSO_4$)。

[0056] 合适的有机酸为例如：甲酸、碳酸和链烷酸，例如乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸和丙酸；以及乙醇酸、硫氰酸、乳酸、丁二酸、柠檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、烷基磺酸(含有1至20个碳原子的直链或支链的烷基基团的磺酸)、芳基磺酸或芳基二磺酸(带有一个或多个磺酸基团的芳香族基团例如苯基和萘基)、烷基膦酸(含有1至20个碳原子的直链或带支链的烷基基团的膦酸)、芳基膦酸或芳基二膦酸(带有一个或两个膦酸基团的芳香族基团例如苯基和萘基)，其中所述烷基或芳基基团可带有其它取代基，例如对甲苯磺酸、水杨酸、对氨基水杨酸、2-苯氧基苯甲酸、2-乙酰氧基苯甲酸等。

[0057] 合适的金属离子特别是第二主族元素(特别是钙和镁)、第三主族和第四主族元素(特别是铝、锡和铅)、以及第一至第八过渡族元素(特别是铬、锰、铁、钴、镍、铜、锌和其它)的离子。特别优选第四周期元素的金属离子。此处，所述金属可以其可呈现的不同价态而存在。

[0058] 如果式(I)化合物带有羟基、羧基或产生酸性性质的其它基团，则这些化合物可与碱反应形成盐。

[0059] 合适的碱为例如：碱金属和碱土金属——特别是钠、钾、镁和钙——的氢氧化物、碳酸盐、碳酸氢盐，此外还有氨，带有(C_1-C_4)烷基基团的伯胺、仲胺和叔胺，(C_1-C_4)烷醇的一烷醇胺、二烷醇胺和三烷醇胺，胆碱以及氯胆碱。

[0060] 卤素为氟、氯、溴和碘。

[0061] 金属离子等效物是具有阳电荷的金属离子，例如Na^+、K^+、$(Mg^{2+})_{1/2}$、$(Ca^{2+})_{1/2}$、MgH^+、CaH^+、$(Al^{3+})_{1/3}(Fe^{2+})_{1/2}$或$(Fe^{3+})_{1/3}$。

[0062] 烷基为含有1至8个碳原子的饱和的直链或支链的烃基；所述烷基例如C_1-C_6烷基，如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基和1-乙基-2-甲基丙基。

[0063] 卤代烷基为含有1至8个碳原子的直链或支链的烷基基团(如上文所述的),其中该基团中的一些或所有氢原子可被卤原子替代;所述卤代烷基例如C_1-C_2卤代烷基,如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氯乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氯乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基和1,1,1-三氟丙-2-基。

[0064] 烯基为含有2至8个碳原子并且在任意位置上具有双键的不饱和的直链或支链的烃基;所述烯基例如C_2-C_6烯基,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基和1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。

[0065] 烷氧基为含有1至8个碳原子的饱和的直链或支链的烷氧基基团;所述烷氧基例如C_1-C_6烷氧基,如甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基、戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基(hexoxy)、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基和1-乙基-2-甲基-丙氧基;

[0066] 卤代烷氧基为含有1至8个碳原子的直链或支链的烷氧基基团(如上文所述的),其中该基团中的一些或所有氢原子可被如上文所述的卤原子替代;所述卤代烷氧基例如C_1-C_2卤代烷氧基,如氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氯乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氯乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基和1,1,1-三氟丙-2-氧基。

[0067] 烷硫基为含有1至8个碳原子的饱和的直链或支链的烷硫基基团;所述烷硫基例如C_1-C_6烷硫基,如甲硫基、乙硫基、丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫

基、1,1-二甲基乙硫基、戊硫基、1-甲基丁硫基、2-甲基丁硫基、3-甲基丁硫基、2,2-二-甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、己硫基、1,1-二甲基丙硫基、1,2-二甲基丙硫基、1-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、4-甲基戊硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、2,3-二甲基丁硫基、3,3-二甲基丁硫基、1-乙基丁硫基、2-乙基丁硫基、1,1,2-三甲基丙硫基、1,2,2-三甲基丙硫基、1-乙基-1-甲基丙硫基和1-乙基-2-甲基丙硫基；

[0068] 卤代烷硫基为含有1至8个碳原子的直链或支链的烷硫基基团(如上文所述的)，其中该基团中的一些或所有氢原子可被如上文所述的卤原子替代；所述卤代烷硫基例如C_1-C_2卤代烷硫基，例如氯甲硫基、溴甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氯甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基、二氯氟甲硫基、氯二氟甲硫基、1-氯乙硫基、1-溴乙硫基、1-氟乙硫基、2-氟乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基、五氟乙硫基和1,1,1-三氟丙-2-基硫基。

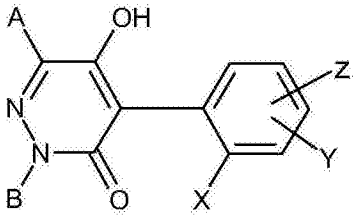
[0069] 杂芳基为2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-异噁唑基、4-异噁唑基、5-异噁唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、5-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,4-三唑-1-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-4-基、1,2,4-三唑-5-基、1,2,3-三唑-1-基、1,2,3-三唑-2-基、1,2,3-三唑-4-基、四唑-1-基、四唑-2-基、四唑-5-基、吲哚-1-基、吲哚-2-基、吲哚-3-基、异吲哚-1-基、异吲哚-2-基、苯并呋喃-2-基、苯并噻吩-2-基、苯并呋喃-3-基、苯并噻吩-3-基、苯并噁唑-2-基、苯并噻唑-2-基、苯并咪唑-2-基、吲唑-1-基、吲唑-2-基、吲唑-3-基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基或1,2,4-三嗪-6-基。该杂芳基各自为未被取代的或者被选自以下的相同或不同基团单取代或多取代：氟、氯、溴、碘、氰基、羟基、巯基、氨基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、1-氯环丙基、乙烯基、乙炔基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、甲硫基、乙硫基、三氟甲硫基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、氯氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2-二氟-2-氯乙基、2-氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2-甲氧基乙氧基、乙酰基、丙酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、N-甲基氨基、N,N-二甲基氨基、N-乙基氨基、N,N-二乙基氨基、氨基羰基、甲基氨基羰基、二甲基氨基羰基、二甲基氨基甲酰基氨基、甲氧基羰基氨基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氨基、乙氧基羰基氧基、甲基氨磺酰基、二甲基氨磺酰基、苯基或苯氧基。

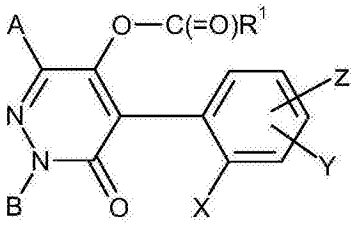
[0070] 尤其是根据取代基的种类，式(I)的化合物可以几何异构体和/或旋光异构体或者不同组成的异构体混合物而存在，所述异构体混合物如果合适可用常规的方式分离。本发明提供了纯异构体和异构体混合物、其制备和用途，以及包含其的组合物。然而，下文中，为简便起见，总是称为式(I)化合物，但是这意欲包括纯化合物和，如果合适，含有不同比例的异构体化合物的混合物。

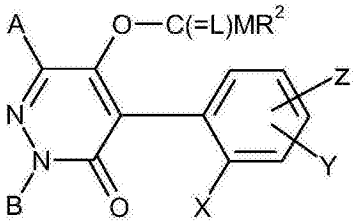
[0071] 如果一个基团被一些基团多取代，则这应理解为表示该基团被一个或多个选自所

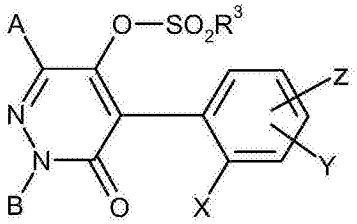
提及的基团中的相同或不同基团取代。

[0072] 优选通式(I-a)、(I-b)、(I-c)、(I-d)、(I-e)、(I-f)和(I-g)的化合物。

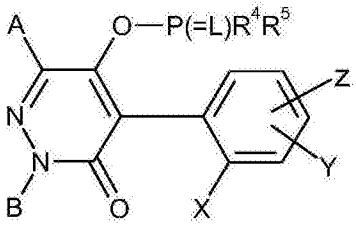

(I-a)

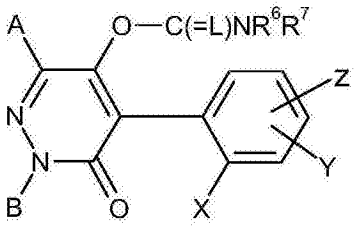

(I-b)

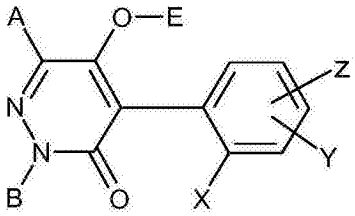

(I-c)


(I-d)

[0073]


(I-e)


(I-f)


(I-g)

[0074] 还优选这样的通式(I)的化合物:其中

[0075] A为氢或(C_1-C_6)烷基;

[0076] B为氢或(C_1-C_6)烷基;

[0077] G为氢、C(=O)R^1、C(=L)MR^2、SO_2R^3、P(=L)R^4R^5、C(=L)NR^6R^7或E;

[0078] E为Na^+、K^+、$(Mg^{2+})_{1/2}$、$(Ca^{2+})_{1/2}$、$R^{13}R^{14}R^{15}R^{16}N^+$或$NH_4^+$;

[0079] R^{13}、R^{14}、R^{15}和R^{16}彼此独立地为(C_1-C_6)烷基或苄基;

[0080] L为氧;

[0081] M为氧;

[0082] R^1为被n个卤原子取代的(C_1-C_6)烷基,或者为(C_3-C_6)环烷基、苯基或苯基-(C_1-C_4)烷基,所述基团各自被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代;

[0083] R^2为被n个卤原子取代的(C_1-C_6)烷基,或者为(C_3-C_6)环烷基、苯基或苄基,所述基团各自被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代;

[0084] R^3、R^4和R^5各自彼此独立地为被n个卤原子取代的(C_1-C_6)烷基,或者为苯基或苄基,所述基团被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代;

[0085] R^6和R^7各自彼此独立地氢、被n个卤原子取代的(C_1-C_6)烷基，或者为苯基或苄基，所述基团被n个选自卤素、(C_1-C_4)烷基和(C_1-C_4)烷氧基的基团取代；

[0086] m为0、1、2或3；

[0087] n为0、1、2、3，条件是m和n不为0；

[0088] X为卤素、氰基、(C_3-C_6)环烷基、硝基，或者为(C_1-C_6)烷基或(C_1-C_6)烷氧基，所述基团各自被m个卤原子取代；

[0089] Y和Z各自彼此独立地为氢、卤素、氰基、硝基、(C_3-C_6)环烷基，或者为(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷氧基或苯基，所述基团各自被n个卤原子取代。

[0090] 特别优选这样的通式(I)的化合物，其中

[0091] A为氢、甲基、乙基、异丁基；

[0092] B为氢、甲基、乙基、异丁基、叔丁基；

[0093] G为氢、C(=O)R^1、C(=L)MR^2、SO_2R^3、P(=L)R^4R^5、C(=L)NR^6R^7或E；

[0094] E为Na^+、K^+、$(Mg^{2+})_{1/2}$、$(Ca^{2+})_{1/2}$、$(CH_3)_4N^+$或NH_4^+；

[0095] L为氧；

[0096] M为氧；

[0097] R^1为(C_1-C_6)烷基或(C_3-C_6)环烷基；

[0098] R^2为(C_1-C_6)烷基、(C_3-C_6)环烷基或苄基；

[0099] R^3、R^4和R^5各自彼此独立地为(C_1-C_6)烷基、苯基或苄基；

[0100] R^6和R^7各自彼此独立地为氢、(C_1-C_6)烷基、苯基或苄基；

[0101] m为1、2或3；

[0102] n为0、1、2或3；

[0103] 并且

[0104] X为氟、溴、氯、碘、氰基、硝基、三氟甲基、三氟甲氧基或环丙基；

[0105] Y为氢、氟、溴、氯、碘、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基或环丙基；

[0106] Z为氢、氟、溴、氯、碘、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、环丙基、氯苯基或氟苯基。

[0107] 极特别优选表1至25中所列的通式(I)化合物，其可以类似于本文提及的方法获得。

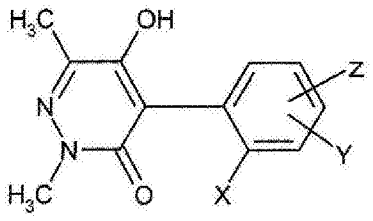
[0108] 所用缩写定义如下：

[0109] Bz＝苄基　　c-Pr＝环丙基　　Et＝乙基

[0110] i-Bu＝异丁基　　t-Bu＝叔丁基　　i-Pr＝异丙基

[0111] Me＝甲基　　Ph＝苯基

[0112] 表1：本发明的通式(I)化合物，其中G为氢且A和B各自为甲基。

[0113] 

[0114]

编号	X	Y	Z
1	F	H	H
2	Cl	H	H
3	Br	H	H
4	I	H	H
5	CF_3	H	H
6	CN	H	H
7	NO_2	H	H
8	OCF_3	H	H
9	H	3-CF_3	H
10	H	3-Me	H
11	H	3-F	H
12	H	3-Cl	H
13	H	3-CN	H

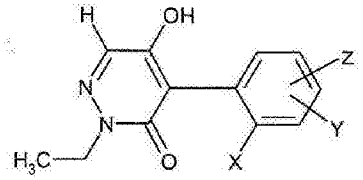
[0115]

编号	X	Y	Z
14	H	3-BrI	H
15	H	3-I	H
16	H	3-NO_2	H
17	H	3-OCF_3	H
18	H	3-OMe	H
19	H	3-OEt	H
20	H	4-CF_3	H
21	H	4-Me	H
22	H	4-F	H
23	H	4-Cl	H
24	H	4-CN	H
25	H	4-Br	H
26	H	4-I	H
27	H	4-NO_2	H
28	H	4-OCF_3	H
29	H	4-OMe	H
30	H	4-OEt	H
31	Cl	4-Cl	H
32	H	3-Cl	4-Cl
33	Br	4-Cl	H
34	Cl	H	6-Cl
35	Cl	H	6-F
36	F	H	6-F
37	Cl	4-Cl	6-Cl
38	Br	4-Me	6-Br
39	Cl	4-Me	6-Cl
40	I	H	4-Me
41	I	6-Cl	4-Me
42	c-Pr	4H	H
43	c-Pr	4-Me	H
44	c-Pr	4-Me	6-Cl
45	Cl	6-F	3-Me
46	F	6-F	3-F
47	F	6-F	3-OEt
48	F	H	5-Cl
49	H	3-CF_3	5-CF_3
50	OCF_3	4-Me	H
51	OCF_3	5-Me	H
52	Br	4-OCF_3	6-Cl

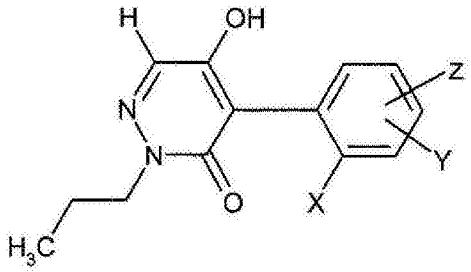
[0116]

编号	X	Y	Z
53	Br	4-OCF_3	6-Br
54	Cl	4-OCF_3	6-Cl
55	OCF_3	6-Cl	4-Br
56	OCF_3	6-Cl	4-Me
57	Cl	5-OCF_3	H
58	Br	5-OCF_3	H
59	Cl	6-CF_3	H
60	Cl	3-Cl	6-CF_3
61	Cl	3-F	6-F
62	Cl	4-Cl	6-c-Pr
63	Cl	3-Cl	H
64	Br	4-Br	6-OCF_3
65	Br	4-Cl	6-OCF_3
68	Cl	4-Br	6-CF_3
69	Br	4-Cl	6-CF_3
70	CF_3	5-CF_3	H
71	F	3-F	H
72	Cl	4-Cl	6-c-Pr
73	F	3-Me	6-F
74			

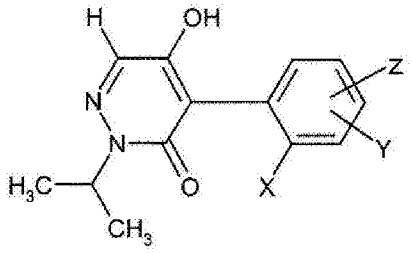
[0117] 表2:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为氢且B为乙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0118] 

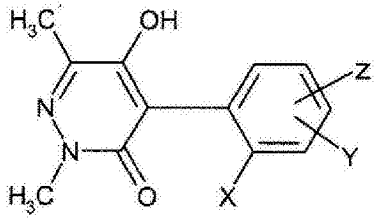
[0119] 表3:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为氢且B为正丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0120] 

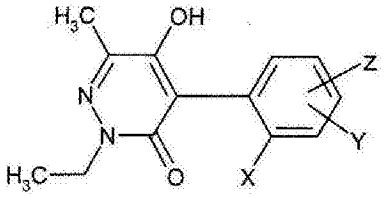
[0121] 表4:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢、A为氢且B为异丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0122] 

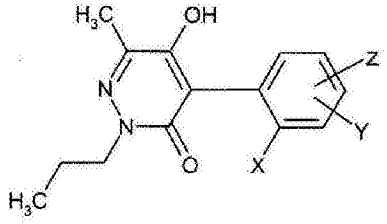
[0123] 表5:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,并且A为甲基且B为甲基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0124] 

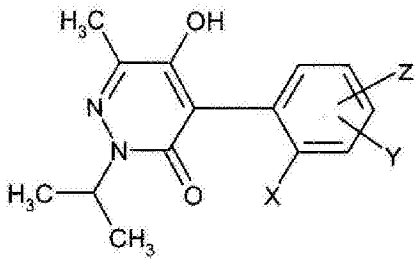
[0125] 表6:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为甲基且B为乙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0126] 

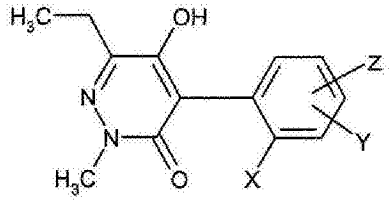
[0127] 表7:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为甲基且B为正丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0128] 

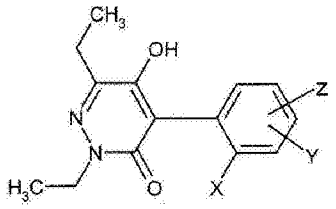
[0129] 表8:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为甲基且B为异丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0130] 

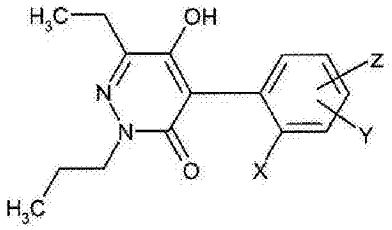
[0131] 表9:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为乙基且B为甲基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0132] 

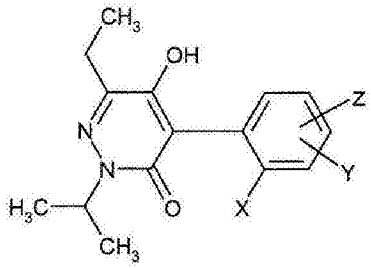
[0133] 表10:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为乙基且B为乙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0134] 

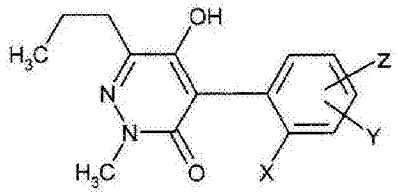
[0135] 表11:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为乙基且B为正丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0136] 

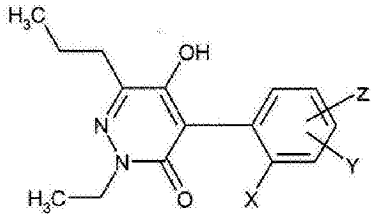
[0137] 表12:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为乙基且B为异丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0138] 

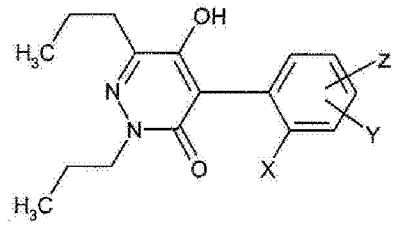
[0139] 表13:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,并且A为丙基且B为甲基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0140] 

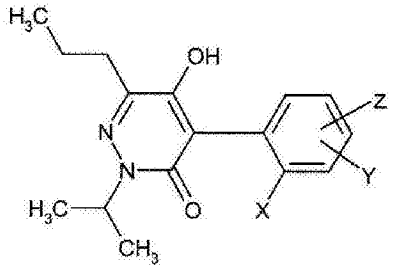
[0141] 表14:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为丙基且B为乙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0142] 

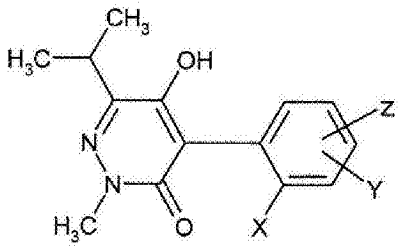
[0143] 表15:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为丙基且B为正丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0144] 

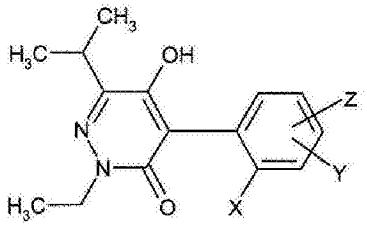
[0145] 表16:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为丙基且B为异丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0146] 

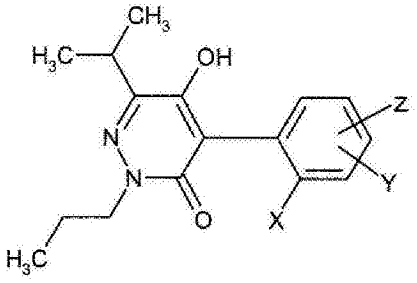
[0147] 表17:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,并且A为异丙基且B为甲基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0148] 

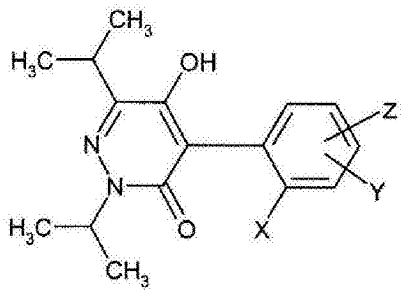
[0149] 表18:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为异丙基且B为乙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0150] 

[0151] 表19:本发明的通式(I)化合物,其中G为氢,A为异丙基且B为正丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0152] 

[0153] 表20:本发明的通式(I)的化合物,其中G为氢,A为异丙基且B为异丙基,并且X、Y和Z各自具有表1中给出的含义。

[0154] 

[0155] 极特别优选的还有以上表1至20中所列的化合物,其中G各自为$C(=O)R^1$、$C(=L)LR^2$、SO_2R^3、$P(=L)R^4R^5$、$C(=L)NR^6R^7$或E。

[0156] 可根据上述反应合成的式(I)化合物和/或其盐的集合(collection)也可以并行的方式制备,其可以手动方式或者部分或完全自动化的方式实现。此处,可例如使产品或中间体的反应操作、后处理(work-up)或纯化自动化。总之,这应理解为表示例如由D.Tiebes在Combinatorial Chemistry-Synthesis,Analysis,Screening(编者Günther Jung),Wiley 1999,1至34页中描述的方法。

[0157] 多种市售可得的装置可用于并行的反应操作和后处理,例如购自Barnstead International,Dubuque,Iowa 52004-0797,USA的Calpyso反应模块(reaction block),或者购自Radleys,Shirehill,Saffron Walden,Essex,CB 11 3AZ,England的反应站,或者购自Perkin Elmar,Waltham,Massachusetts 02451,USA的多探针自动工作站。色谱装置,例如购自ISCO,Inc.,4700 Superior Street,Lincoln,NE 68504,USA的色谱装置,尤其是可用于平行纯化式(I)化合物及其盐或制备过程中产生的中间体。

[0158] 所列装置导致模块化操作,其中各途径(pass)均是自动化的,但所述途径之间必须进行手动操作。这可以通过使用部分或全部集成的自动化系统而避免,其中相关的自动化模块由例如机器人(robot)操作。这类自动化系统可例如自Caliper,Hopkinton,MA 01748,USA获得。

[0159] 各个或多个合成步骤的实施可借助于使用聚合物负载的试剂/清除剂树脂。专业文献描述了一系列实验方案,例如在ChemFiles,Vol.4,No.1,Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis(Sigma-Aldrich)中。

[0160] 除了此处所描述的方法,式(I)的化合物及其盐的制备可完全或部分地通过固相负载法(solid-phase-supported method)实现。为此目的,将所述合成或适于相关操作的合成中的各个中间体或所有中间体与合成树脂结合。固相负载合成法在专业文献中有充分描述,例如Barry A.Bunin在"The Combinatorial Index",Academic Press,1998,及

Combinatorial Chemistry-Synthesis,Analysis,Screening(编者Günther Jung),Wiley,1999中。使用固相负载合成法使得可实施由文献中已知的一系列方案,所述方案也可手动进行或以自动化的方式进行。例如,所述反应可在购自Nexus Biosystems,12140Community Road,Poway,CA92064,USA的微反应器中借助于IRORI技术来进行。

[0161] 在固体上及在液相中实施单个或多个合成步骤可借助于使用微波技术实现。专业文献中,例如Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry(编者C.O.Kappe和A.Stadler),Wiley,2005中,记载了一系列实验方案。

[0162] 根据本文所述方法进行的制备生成了物质集合形式的式(I)化合物及其盐,称为库(libraries)。本发明还涉及包含至少两种式(I)化合物和其盐的库。

[0163] 本发明的式(I)化合物(和/或其盐),以下一起称为"本发明化合物",对较宽范围的经济上重要的单子叶和双子叶一年生有害植物具有突出的除草活性。所述活性物质还高效地作用于由根茎、根状茎或其它多年生器官生芽且难以防治的多年生有害植物。

[0164] 因此本发明还涉及一种防治不想要的植物或用于调节植物生长的方法(优选在植物作物中),其中将一种或多种本发明化合物施用于植物(例如有害植物,如单子叶或双子叶杂草或不想要的作物植物)、种子(例如谷粒、种子或无性繁殖体,如块茎或带芽的枝条部位)或植物生长区域(例如栽培区域)。在本文中,本发明的化合物可例如在种植前(如果合适,还通过引入土壤中)、出苗前或出苗后施用。将提及可由本发明化合物防治的各种代表性的单子叶和双子叶杂草植物群的实例,但所述提及并不意欲限于某些属种。

[0165] 以下属的单子叶有害植物:山羊草属(Aegilops)、冰草属(Agropyron)、剪股颖属(Agrostis)、看麦娘属(Alopecurus)、假剪股颖属(Apera)、燕麦属(Avena)、臂形草属(Brachiaria)、雀麦属(Bromus)、蒺藜草属(Cenchrus)、鸭跖草属(Commelina)、狗牙根属(Cynodon)、莎草属(Cyperus)、龙爪茅属(Dactyloctenium)、马唐属(Digitaria)、稗属(Echinochloa)、荸荠属(Eleocharis)、蟋蟀草属(Eleusine)、画眉草属(Eragrostis)、野黍属(Eriochloa)、羊茅属(Festuca)、飘拂草属(Fimbristylis)、异蕊花属(Heteranthera)、白茅属(Imperata)、鸭嘴草属(Ischaemum)、千金子属(Leptochloa)、黑麦草属(Lolium)、雨久花属(Monochoria)、黍属(Panicum)、雀稗属(Paspalum)、鹹草属(Phalaris)、梯牧草属(Phleum)、早熟禾属(Poa)、筒轴茅属(Rottboellia)、慈姑属(Sagittaria)、莞草属(Scirpus)、狗尾草属(Setaria)、高粱属(Sorghum)。

[0166] 以下属的双子叶杂草:白麻属(Abutilon)、苋属(Amaranthus)、豚草属(Ambrosia)、单花葵属(Anoda)、春黄菊属(Anthemis)、Aphanes、蒿属(Artemisia)、滨藜属(Atriplex)、雏菊属(Bellis)、鬼针属(Bidens)、荠属(Capsella)、飞廉属(Carduus)、决明属(Cassia)、矢车菊属(Centaurea)、藜属(Chenopodium)、蓟属(Cirsium)、旋花属(Convolvulus)、曼陀罗属(Datura)、山蚂蝗属(Desmodium)、刺酸模属(Emex)、糖芥属(Erysimum)、大戟属(Euphorbia)、鼬瓣花属(Galeopsis)、牛膝菊属(Galinsoga)、拉拉藤属(Galium)、芙蓉属(Hibiscus)、番薯属(Ipomoea)、地肤属(Kochia)、野芝麻属(Lamium)、独行菜属(Lepidium)、母草属(Lindernia)、母菊属(Matricaria)、薄荷属(Mentha)、山靛属(Mercurialis)、Mullugo、勿忘我属(Myosotis)、罂粟属(Papaver)、牵牛属(Pharbitis)、车前属(Plantago)、蓼属(Polygonum)、马齿苋属(Portulaca)、毛茛属(Ranunculus)、萝卜属(Raphanus)、蔊菜属(Rorippa)、节节菜属(Rotala)、酸模属(Rumex)、猪毛菜属(Salsola)、

千里光属(Senecio)、田菁属(Sesbania)、黄花稔属(Sida)、白芥属(Sinapis)、茄属(Solanum)、苦苣菜属(Sonchus)、尖瓣花属(Sphenoclea)、繁缕属(Stellaria)、蒲公英属(Taraxacum)、葶苈属(Thlaspi)、车轴草属(Trifolium)、荨麻属(Urtica)、婆婆纳属(Veronica)、堇菜属(Viola)、苍耳属(Xanthium)。

[0167] 如果将本发明化合物在发芽前施用于土壤表面，则杂草幼苗的出土被完全阻止，或者杂草生长至其达到子叶期，但然后其生长停止，并最终在三至四周后彻底死亡。

[0168] 当将所述活性物质于出苗后施用于植物绿色部位时，在处理后生长停止，并且有害植物停留在施用时的生长期，或在一段时间后彻底死亡，从而在早的时间点持续地消除对作物植物有害的杂草竞争。

[0169] 尽管本发明的化合物对单子叶和双子叶杂草具有突出的除草活性，但对经济上重要作物的作物植物，例如以下属的双子叶作物：落花生属(Arachis)、甜菜属(Beta)、芸苔属(Brassica)、黄瓜属(Cucumis)、南瓜属(Cucurbita)、向日葵属(Helianthus)、胡萝卜属(Daucus)、大豆属(Glycine)、棉属(Gossypium)、番薯属(Ipomoea)、莴苣属(Lactuca)、亚麻属(Linum)、番茄属(Lycopersicon)、烟草属(Nicotiana)、菜豆属(Phaseolus)、豌豆属(Pisum)、茄属(Solanum)、蚕豆属(Vicia)；或以下属的单子叶作物：葱属(Allium)、凤梨属(Ananas)、天门冬属(Asparagus)、燕麦属(Avena)、大麦属(Hordeum)、稻属(Oryza)、黍属(Panicum)、甘蔗属(Saccharum)、黑麦属(Secale)、高粱属(Sorghum)、小黑麦属(Triticale)、小麦属(Triticum)、玉蜀黍属(Zea)，特别是玉蜀黍属和小麦属，仅具有微小程度的损害或完全没有损害，这取决于本发明各化合物的结构及其施用率。这就是本发明化合物高度适于选择性防治植物作物(例如农业上有益的植物或观赏植物)中不想要的植物生长的原因。

[0170] 此外，本发明的化合物(取决于其各自的结构及所用的施用率)对作物植物具有突出的生长调节性质。它们以调控方式参与植物的代谢并因此可用于以针对性的方式影响植物成分以及便于收获，例如通过引起脱水和矮化生长。此外，它们还适合一般性防治和抑制不希望的营养生长，而在此过程中不损害植物。抑制植物生长在许多单子叶和双子叶作物中起重要作用，因为例如可由此减少或完全防止倒伏。

[0171] 由于所述活性物质的除草和植物生长调节性质，其也可用于防治基因修饰植物作物中或已经常规诱变而修饰的植物作物中的有害植物。一般而言，转基因植物以尤其有利的特性而著称，例如对某些农药的抗性，主要是对某些除草剂的抗性；对植物病害或植物病害病原体的抗性，例如对某些昆虫或微生物(如真菌、细菌或病毒)的抗性。其它特别的性质涉及例如采收物的数量、品质、可贮存性、组成及特定成分。例如，淀粉含量提高的或淀粉品质改变的转基因植物或者其采收物具有不同脂肪酸组成的转基因植物是已知的。

[0172] 优选将本发明的化合物或其盐用于有益植物和观赏植物的经济上重要的转基因作物，所述植物例如谷类，如小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱和粟、稻、木薯和玉米；或以下植物的作物：甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他蔬菜。优选将本发明的化合物用作有益植物作物中的除草剂，所述有益植物对所述除草剂的植物毒性效应具有抗性，或者已通过重组方式而对其具有抗性。

[0173] 产生与现有植物相比具有改变特征的新植物的常规方法有，例如传统育种方法和产生突变体。或者，具有改变特征的新植物可借助重组方法产生(参见，例如EP-A-0221044、

EP-A-0131624)。例如,已描述了下列几个实例:

[0174] -为改性植物中合成的淀粉的目的对作物植物进行重组修饰(例如WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806);

[0175] -对草铵膦(glufosinate)类(参见例如,EP-A-0242236、EP-A-242246)或草甘膦(glyphosate)类(WO 92/00377)或磺酰脲类(EP-A-0257993、US-A-5013659)的某些除草剂具有抗性的转基因作物植物,

[0176] -能够产生苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis)毒素(Bt毒素)从而使植物对某些害虫具有抗性的转基因作物植物,例如棉花(EP-A-0142924、EP-A-0193259),

[0177] -具有改变的脂肪酸组成的转基因作物植物(WO 91/13972),

[0178] -具有新的成分或次生代谢物(例如新的植物抗毒素,其使抗病性提高)的基因修饰作物植物(EPA 309862、EPA0464461),

[0179] -光呼吸作用降低的基因修饰植物,其特征为具有更高的产率和更高的胁迫耐受性(EPA 0305398),

[0180] -产生制药上或诊断上重要的蛋白质的转基因作物植物("分子药耕(molecular pharming)"),

[0181] -以产率更高或品质更好著称的转基因作物植物,

[0182] -以例如上述新特性的结合("基因叠加(gene stacking)")著称的转基因作物植物。

[0183] 可产生具有改变特性的新转基因植物的许多分子生物技术原则上是已知的;见例如I.Potrykus和G.Spangenberg(编者)Gene Transfer to Plants,Springer Lab Manual(1995),Springer Verlag Berlin,Heidelberg.或Christou,"Trends in Plant Science"1(1996)423-431)。

[0184] 为进行此类重组操作,可将核酸分子引入质粒,其能够通过重组DNA序列而产生突变或序列改变。例如,借助标准方法可进行碱基置换、可移除部分序列或者可加入天然或合成序列。为了将DNA片段彼此连接,可以在片段上加入衔接头或连接体;见,例如Sambrook et al.,1989,Molecular Cloning,A Laboratory Manual,第2版,Cold Spring Harbor Laboratory Press,Cold Spring Harbor,NY;或者Winnacker"Gene and Klone",VCH Weinheim第2版,1996。

[0185] 基因产物活性降低的植物细胞可例如通过下列方法生成:通过表达至少一种相应的反义RNA、用于实现共抑制效应的正义RNA,或者通过表达至少一种相应构建的能特异性裂解上述基因产物的转录物的核酶。

[0186] 为此,可首先使用含有基因产物的所有编码序列(包括可能存在的任何侧翼序列)的DNA分子,或使用仅含有部分编码序列的DNA分子,这些部分必须足够长以便在细胞中产生反义作用。也可使用与基因产物的编码序列具有高度同源性但并不完全相同的DNA序列。

[0187] 当在植物中表达核酸分子时,合成的蛋白质可定位于植物细胞的任意区室中。但为实现在特定区室中的定位,可例如使编码区域与确保在特定区室中定位的DNA序列连接。此类序列是技术人员已知的(参见,例如Braun et al.,EMBO J.11(1992),3219-3227;Wolter et al.,Proc.Natl.Acad.Sci.USA 85(1988),846-850;Sonnewald et al.,Plant J.1(1991),95-106)。所述核酸分子还可在植物细胞的细胞器中表达。

[0188] 转基因植物细胞可通过已知技术再生以得到完整植物。原则上，转基因植物可以是任意植物种的植物，即既可以是单子叶植物，也可以是双子叶植物。

[0189] 例如，可得到特征在于由于过表达、阻抑或抑制同源(＝天然)基因或基因序列、或者表达异源(＝外源)基因或基因序列而具有改变特性的转基因植物。

[0190] 优选将本发明化合物用于对以下物质具有抗性的转基因作物中：生长调节剂，例如麦草畏(dicamba)；或抑制植物必需酶的除草剂，所述酶例如乙酰乳酸合酶(ALS)、EPSP合酶、谷氨酰胺合酶(GS)或羟苯丙酮酸双加氧酶(HPPD)；或选自磺酰脲、草甘膦、草铵膦或苯甲酰基异噁唑类和类似活性物质的除草剂。

[0191] 当本发明活性物质用于转基因作物时，除了可在其它作物中观察到的对有害植物的效果之外，还常常观察到对于施用于所述转基因作物而言特定的效果，例如改变的或特别是拓宽的可防治的杂草谱、改变的施用时可使用的施用率、优选地与转基因作物对其具有抗性的除草剂的良好结合性以及对转基因作物植物的生长和产率的影响。

[0192] 本发明因此还涉及本发明的化合物用作除草剂防治转基因作物植物中有害植物的用途。

[0193] 本发明的化合物可以可湿性粉剂、乳油、可喷雾溶液剂、喷粉产品(dusting product)或颗粒剂形式用于常规制剂中。因此，本发明还提供了包含本发明化合物的除草组合物和植物生长调节组合物。

[0194] 根据所需的生物学和/或物理化学参数，本发明的化合物可以多种方式配制。可能的剂型包括，例如：可湿性粉剂(WP)、水溶性粉剂(SP)、水溶性浓缩剂、乳油(EC)、乳剂(EW)(例如水包油乳剂和油包水乳剂)、可喷雾溶液剂、胶悬剂(SC)、油基或水基分散剂、油混溶性溶液剂、胶囊悬浮剂(CS)、喷粉产品(DP)、拌种产品、撒播颗粒剂及土施颗粒剂、微粒形式、喷雾颗粒形式、包衣颗粒形式和吸附颗粒形式的颗粒剂(GR)、水分散性颗粒剂(WG)、水溶性颗粒剂(SG)、ULV制剂、微胶囊剂和蜡剂。

[0195] 所述各种剂型原则上是已知的，并在例如下列文献中有所描述：Winnacker-Küchler，“Chemische Technologie”[Chemical technology]，卷7，C.Hanser Verlag Munich，第4版，1986；Wade van Valkenburg，“Pesticide Formulations”，Marcel Dekker，N.Y.，1973；K.Martens，“Spray Drying”Handbook，第3版，1979，G.Goodwin Ltd.London。

[0196] 必要的配制助剂——例如惰性物质、表面活性剂、溶剂和其他添加剂——也是已知的并在例如下列文献中有描述：Watkins，“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”，第2版，Darland Books，Caldwell N.J.，H.v.Olphen，“Introduction to Clay Colloid Chemistry”；第2版，J.Wiley&Sons，N.Y.；C.Marsden，“Solvents Guide”；第2版，Interscience，N.Y.1963；McCutcheon's“Detergents and Emulsifiers Annual”，MC Publ.Corp.，Ridgewood N.J.；Sisley和Wood，“Encyclopedia of Surface Active Agents”，Chem.Publ.Co.Inc.，N.Y.1964；**Schönfeldt，“Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte”**[Interface-active ethylene oxide adducts]，Wiss.Verlagsgesell.，Stuttgart 1976；**Winnacker-Küchler，**“Chemische Technologie”，卷7，C.Hanser Verlag Munich，第4版，1986。

[0197] 可湿性粉剂为可均匀分散于水中的制剂，其除了含有活性化合物之外、稀释剂或

惰性物质之外，还含有离子型和/或非离子型表面活性剂(湿润剂、分散剂)，例如聚氧乙基化烷基酚、聚氧乙基化脂肪醇、聚氧乙基化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷磺酸盐、烷基苯磺酸盐、木素磺酸钠、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰基甲基氨基乙磺酸钠。为了制备可湿性粉剂，将除草活性成分细细研磨，例如在常规设备如锤式粉碎机、鼓风式磨机(blower mill)和空气喷射式磨机(air-jet mill)中，并同时或随后与配制助剂混合。

[0198] 乳油通过以下方式制备：将活性化合物溶于有机溶剂(例如丁醇、环已酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或者沸点较高的芳香族化合物或烃类)中或者添加有一种或多种离子型和/或非离子型表面活性剂(乳化剂)的有机溶剂的混合物中。所用乳化剂可例如为：烷基芳基磺酸钙，如十二烷基苯磺酸钙；或非离子型乳化剂，如脂肪酸聚乙二醇酯、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、环氧丙烷-环氧乙烷缩合产物、烷基聚醚、脱水山梨糖醇酯(例如脱水山梨糖醇脂肪酸酯)，或聚氧脱水乙烯山梨糖醇酯(如聚氧乙烯脱水山梨糖醇脂肪酸酯)。

[0199] 喷粉产品通过研磨活性化合物与细分散固体物质获得，所述固体物质例如滑石、天然粘土(如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。

[0200] 胶悬剂可为水基的或油基的。它们可以例如通过使用市售可得的砂磨机并任选加入例如已在上文其它制剂类型中列出的表面活性剂进行湿磨来制备。

[0201] 乳剂，例如水包油乳剂(EW)，可以例如借助于搅拌器、胶体磨和/或静态混合器用水性有机溶剂和任选地例如已在上文其它制剂类型中列出的表面活性剂来制备。

[0202] 颗粒剂可以通过将所述活性化合物喷洒在吸附性的颗粒状惰性物质上、或通过借助粘合剂(例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油)将活性化合物浓缩物施用于载体表面而制备，所述载体例如砂、高岭土或颗粒状惰性物质。也可以将合适的活性化合物以制备肥料颗粒的常规方式——如果需要与肥料混合——粒化。

[0203] 水分散性颗粒剂通常以常规方法制备，所述常规方法例如喷雾干燥法、流化床制粒法、盘式制粒法、在不使用固体惰性物质的情况下在高速混合器中混合并挤出法。

[0204] 对于盘式、流体床、挤出机和喷雾颗粒的制备，参见例如“Spray-Drying Handbook”第3版1979,G.Goodwin Ltd.,London;J.E.Browning,“Agglomeration”,Chemical and Engineering 1967,第147页及后;“Perry's Chemical Engineer's Handbook”,第5版,McGraw-Hill,New York 1973,第8-57页中的方法。

[0205] 关于作物保护组合物剂型的更多细节，参见例如G.C.Klingman,“Weed Control as a Science”,John Wiley and Sons,Inc.,New York,1961,第81-96页和J.D.Freyer,S.A.Evans,“Weed Control Handbook”,第5版,Blackwell Scientific Publications,Oxford,1968,第101-103页。

[0206] 所述农业化学制剂通常含有0.1至99重量%、特别是0.1至95重量%的式(I)的活性化合物。

[0207] 在可湿性粉剂中，活性化合物浓度为例如约10至90重量%；补足至100重量%的余量物由常规制剂成分组成。在乳油的情况下，活性化合物浓度可为约1至90重量%、优选地为5至80重量%。粉末型制剂含有1至30重量%的活性化合物，优选常常5至20重量%的活性化合物；可喷雾溶液剂含有约0.05至80重量%、优选地为2至50重量%的活性化合物。在水

分散性颗粒剂中，活性化合物含量部分地取决于所述活性化合物以固体形式还是液体形式存在，以及所用的制粒助剂和填充剂等。在可分散于水中的颗粒剂中，活性化合物含量为例如1至95重量％、优选地为10至80重量％。

[0208] 此外，所提及的活性化合物制剂任选地包含各常规粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂和溶剂、填充剂、载体和染料、消泡剂、挥发抑制剂以及改变pH和粘度的试剂。

[0209] 基于这些制剂，还可制备——例如成品制剂或者桶混物形式的——与其它农药活性化合物(例如杀虫剂、杀螨剂、除草剂、杀菌剂)以及与安全剂、肥料和/生长调节剂的结合物。合适的安全剂为例如吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、双苯恶唑酸(isoxadifen-ethyl)、解草酯(cloquintocet-mexyl)和烯丙酰草胺(dichlormid)。

[0210] 可与本发明化合物以混合制剂或桶混物的形式结合使用的活性化合物为例如基于如对下列物质的抑制作用的已知活性化合物：乙酰乳酸合酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合成酶、烯醇丙酮酰莽草酸-3-磷酸合酶、谷氨酰胺合成酶、对羟基苯基丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素去饱和酶、光系统I、光系统II、原卟啉原氧化酶；所述活性化合物记载于例如Weed Research 26(1986)441-445或“The Pesticide Manual”，第14版，The British Crop Protection Council和the Royal Soc.of Chemistry，2003及其中所引用的文献中。可与本发明化合物结合的已知除草剂或植物生长调节剂为例如，以下活性物质(所述化合物以国际标准化组织(ISO)的通用名或以化学名称而指出，如果合适与代号一起指出)，且总是包括所有使用形式，例如酸、盐、酯和异构体(如立体异构体和旋光异构体)。本文中，以实例方式提及一种使用形式，在一些情况下也为几种使用形式：

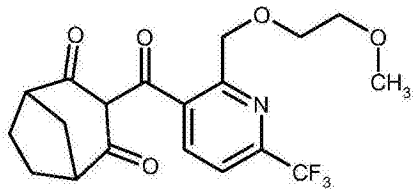
[0211] 乙草胺(acetochlor)、活化酯(acibenzolar)、苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、三氟羧草醚(acifluorfen,acifluorfen-sodium)、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、二丙烯草胺(allidochlor)、枯杀达(alloxydim,alloxydim-sodium)、莠灭净(ametryne)、氨唑草酮(amicarbazone)、先甲草胺(amidochlor)、酰嘧磺隆(amidosulfuron)、环丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、氯氨吡啶酸(aminopyralid)、杀草强(amitrole)、氨基磺酸铵、环丙嘧啶醇(ancymidol)、莎稗磷(anilofos)、磺草灵(asulam)、莠去津(atrazine)、唑啶草酮(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、叠氮津(aziprotryne)、BAH-043、BAS-140H、BAS-693H、BAS-714H、BAS-762H、BAS-776H、BAS-800H、氟丁酰草胺(beflubutamid)、草除灵(benazolin,benazolin-ethyl)、酰苯草酮(bencarbazone)、乙丁氟灵(benfluralin)、呋草黄(benfuresate)、地散磷(bensulide)、苄嘧磺隆(bensulfuron-methyl)、灭草松(bentazone)、双苯嘧草酮(benzfendizone)、双环磺草酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟磺胺草(benzofluor)、新燕灵(benzoylprop)、甲羧除草醚(bifenox)、双丙氨膦(bilanafos,bilanafos-sodium)、双草醚(bispyribac,bispyribac-sodium)、除草定(bromacil)、溴丁酰草胺(bromobutide)、溴酚肟(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)、氯溴隆(bromuron)、特克草(buminafos)、羟草酮(busoxinone)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、抑草磷(butamifos)、丁烯草胺(butenachlor)、仲丁灵(butralin)、丁氧环酮(butroxydim)、丁草敌(butylate)、唑草胺(cafenstrole)、双酰草胺(carbetamide)、氟唑草酮(carfentrazone,carfentrazone-

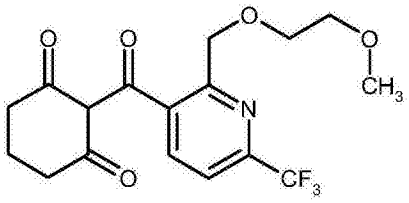
ethyl)、甲氧除草醚(chlomethoxyfen)、草灭畏(chloramben)、炔禾灵(chlorazifop、chlorazifop-butyl)、氯溴隆(chlorbromuron)、氯炔灵(chlorbufam)、伐草克(chlorfenac,chlorfenac-sodium)、燕麦酯(chlorfenprop)、甲基氯芴素(chlorflurenol,chlorflurenol-methyl)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron,chlorimuron-ethyl)、矮壮素(chlormequat-chloride)、草枯醚(chlornitrofen)、chlorophthalim、氯酞酸甲酯(chlorthal-dimethyl)、绿麦隆(chlorotoluron)、氯磺隆(chlorsulfuron)、吲哚酮草酯(cinidon,cinidon-ethyl)、环庚草醚(cinmethylin)、醚磺隆(cinosulfuron)、烯草酮(clethodim)、炔草酸(clodinafop)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、杀雄嗪酸(clofencet)、异噁草松(clomazone)、氯甲酰草胺(clomeprop)、调果酸(cloprop)、二氯吡啶酸(clopyralid)、氯酯磺草酸(cloransulam,cloransulam-methyl)、苄草隆(cumyluron)、氨基氰(cyanamide)、氰草津(cyanazine)、环丙酰胺酸(cyclanilide)、环草敌(cycloate)、环丙嘧磺隆(cyclosulfamuron)、噻草酮(cycloxydim)、环莠隆(cycluron)、氰氟草酯(cyhalofop,cyhalofop-butyl)、莎草快(cyperquat)、环丙津(cyprazine)、环唑塞胺(cyprazole)、2,4-D、2,4-DB、杀草隆(daimuron/dymron)、茅草枯(dalapon)、丁酰肼(daminozide)、棉隆(dazomet)、正癸醇、甜菜安(desmedipham)、敌草净(desmetryn)、detosyl-pyrazolate(DTP)、燕麦敌(diallate)、麦草畏(dicamba)、敌草腈(dichlobenil)、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、精2,4-滴丙酸(dichlorprop-P)、氯甲草(diclofop)、禾草灵(diclofop-methyl)、diclofop-P-methyl、双氯磺草胺(diclosulam)、乙酰甲草胺(diethatyl,diethatyl-ethyl)、枯莠隆(difenoxuron)、野燕枯(difenzoquat)、吡氟酰草胺(diflufenican)、二氟吡隆(diflufenzopyr,diflufenzopyr-sodium)、噁唑隆(dimefuron)、调呋酸(dikegulac-sodium)、噁唑隆(dimefuron)、哌草丹(dimepiperate)、二甲草胺(dimethachlor)、异戊乙净(dimethametryn)、二甲吩草胺(dimethenamid)、精二甲吩草胺(dimethenamid-P)、噻节因(dimethipin)、dimetrasulfuron、氨氟灵(dinitramine)、地乐酚(dinoseb)、特乐酚(dinoterb)、双苯酰草胺(diphenamid)、异丙净(dipropetryn)、敌草快(diquat,diquat-dibromide)、氟硫草定(dithiopyr)、敌草隆(diuron)、DNOC、草止津(eglinazine-ethyl)、茵多酸(endothal)、EPTC、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟灵(ethalfluralin)、胺苯磺隆(ethametsulfuron-methyl)、乙烯利(ethephon)、磺噻隆(ethidimuron)、乙嗪草酮(ethiozin)、乙氧呋草黄(ethofumesate)、氟乳醚(ethoxyfen)、氟乳醚乙酯(ethoxyfen-ethyl)、乙氧嘧磺隆(ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺(etobenzanid)、F-5331即N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧-1H-四唑-1-基]苯基]乙磺酰胺、2,4,5-涕丙酸(fenoprop)、噁唑禾草灵(fenoxaprop)、高噁唑禾草灵(fenoxaprop-P)、噁唑禾草灵(fenoxaprop-ethyl)、高噁唑禾草灵(fenoxaprop-P-ethyl)、四唑酰草胺(fentrazamide)、非草隆(fenuron)、氟燕灵(flamprop)、强氟燕灵(flamprop-M-isopropyl)、甲氟燕灵(flamprop-M-methyl)、啶嘧磺隆(flazasulfuron)、双氟磺草胺(florasulam)、吡氟禾草灵(fluazifop)、精吡氟禾草灵(fluazifop-P)、吡氟禾草灵丁酯(fluazifop-butyl)、精吡氟禾草灵丁酯(fluazifop-P-butyl)、异丙吡草酯(fluazolate)、氟酮磺隆(flucarbazone,flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氯乙氟灵(fluchloralin)、氟噻草胺(flufenacet,thiafluamide)、氟哒嗪草酯(flufenpyr,flufenpyr-ethyl)、氟节胺(flumetralin)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟烯草酸

(flumiclorac,flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、炔草胺(flumipropyn)、氟草隆(fluometuron)、三氟硝草醚(fluorodifen)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen,fluoroglycofen-ethyl)、氟胺草唑(flupoxam)、flupropacil、四氟丙酸(flupropanate)、氟啶嘧磺隆(flupyrsulfuron,flupyrsulfuron-methyl-sodium)、9-羟基笏甲酸(flurenol)、芴丁酯(flurenol-butyl)、氟啶草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氯氟吡氧乙酸(fluroxypyr,fluroxypyr-meptyl)、呋嘧醇(flurprimidol)、呋草酮(flurtamone)、噻草酸(fluthiacet)、噻草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、噻唑草酰胺(fluthiamide)、氟磺胺草醚(fomesafen)、甲酰氨磺隆(foramsulfuron)、氯吡脲(forchlorfenuron)、杀木膦(fosamine)、呋氧草醚(furyloxyfen)、赤霉素(gibberellic acid)、草铵膦、L-草铵膦(L-glufosinate,L-glufosinate-ammonium)、草铵膦(glufosinate-ammonium)、草甘膦、草甘膦异丙胺盐(glyphosate-isopropylammonium)、H-9201、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron,halosulfuron-methyl)、氟吡禾灵(haloxyfop)、精氟吡禾灵(haloxyfop-P)、氟吡禾灵乙氧基乙酯(haloxyfop-ethoxyethyl)、吡氟氯禾灵乙氧基乙酯(haloxyfop-P-ethoxyethyl)、氟吡禾灵甲酯(haloxyfop-methyl)、吡氟氯禾灵甲酯(haloxyfop-P-methyl)、环嗪酮(hexazinone)、HNPC-9908、HOK-201、HW-02、咪草酸(imazamethabenz,imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟(imazamox)、甲咪唑烟酸(imazapic)、咪唑烟酸(imazapyr)、咪唑喹啉酸(imazaquin)、咪唑乙烟酸(imazethapyr)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、抗倒胺(inabenfide)、茚草酮(indanofan)、吲哚乙酸(IAA)、4-吲哚-3-基丁酸(IBA)、碘甲磺隆(iodosulfuron,iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(ioxynil)、丁脒酰胺(isocarbamid)、异丙乐灵(isopropalin)、异丙隆(isoproturon)、异噁隆(isouron)、异噁酰草胺(isoxaben)、异噁氯草酮(isoxachlortole)、异噁唑草酮(isoxaflutole)、异噁草醚(isoxapyrifop)、KUH-043、KUH-071、特胺灵(karbutilate)、ketospiradox、乳氟禾草灵(lactofen)、环草定(lenacil)、利谷隆(linuron)、马来酰肼(maleic hydrazide)、MCPA、MCPB、MCPB甲酯、MCPB乙酯、MCPB钠、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、2-甲-4-氯丙酸钠、mecoprop-butotyl、mecoprop-P-butotyl、精-2-甲-4-氯丙酸二甲基铵(mecoprop-P-dimethylammonium)、精-2-甲-4-氯丙酸-2-乙基己酯(mecoprop-P-2-ethylhexyl)、精-2-甲-4-氯丙酸钾(mecoprop-P-potassium)、苯噻酰草胺(mefenacet)、氯磺酰草胺(mefluidide)、甲哌啶(mepiquat-chloride)、甲磺胺磺隆(mesosulfuron,mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮(mesotrione)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、威百亩(metam)、噁唑酰草胺(metamifop)、苯嗪草酮(metamitron)、吡唑草胺(metazachlor)、灭草唑(methazole)、苯草酮(methoxyphenone)、甲基杀草隆(methyldymron)、1-甲基环丙烯、氰土灵(methyl isothiocyanate)、吡喃隆(metobenzuron)、溴谷隆(metobromuron)、异丙甲草胺(metolachlor)、精异丙甲草胺(S-metolachlor)、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、嗪草酮(metribuzin)、甲磺隆(metsulfuron,metsulfuron-methyl)、禾草敌(molinate)、庚酰草胺(monalide)、monocarbamide、甲酰胺硫酸盐(monocarbamide dihydrogen sulfate)、绿谷隆(monolinuron)、单嘧磺隆(monosulfuron)、灭草隆(monuron)、MT 128、MT-5950即N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺、NGGC-011、萘丙胺(naproanilide)、敌草胺

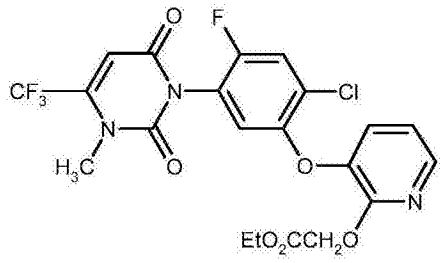
(napropamide)、萘草胺(naptalam)、NC-310即4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄基氧基吡唑、NC-620、草不隆(neburon)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、氟氯草胺(nipyraclofen)、甲磺乐灵(nitralin)、除草醚(nitrofen)、硝基苯酚钠(异构体混合物)、硝氟草醚(nitrofluorfen)、壬酸、氟草敏(norflurazon)、坪草丹(orbencarb)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、氨磺乐灵(oryzalin)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、噁草酮(oxadiazon)、环氧嘧磺隆(oxasulfuron)、噁唑草酮(oxaziclomefone)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、多效唑(paclobutrazole)、百草枯(paraquat,paraquat dichloride)、壬酸、二甲戊灵(pendimethalin)、pendralin、五氟磺草胺(penoxsulam)、甲氯酰草胺(pentanochlor)、环戊噁草酮(pentoxazone)、黄草伏(perfluidone)、烯草胺(pethoxamid)、棉胺宁(phenisopham)、甜菜宁(phenmedipham,phenmedipham-ethyl)、氨氯吡啶酸(picloram)、氟吡酰草胺(picolinafen)、唑啉草酯(pinoxaden)、哌草磷(piperophos)、pirifenop、pirifenop-butyl、丙草胺(pretilachlor)、氟嘧磺隆(primisulfuron,primisulfuron-methyl)、烯丙苯噻唑(probenazole)、氟唑草胺(profluazol)、环丙氰津(procyazine)、氨氟乐灵(prodiamine)、环丙氟灵(prifluraline)、环苯草酮(profoxydim)、调环酸(prohexadione)、调环酸钙(prohexadione-calcium)、茉莉酮(prohydrojasmone)、扑灭通(prometon)、扑草净(prometryn)、毒草胺(propachlor)、敌稗(propanil)、噁草酸(propaquizafop)、扑灭津(propazine)、苯胺灵(propham)、异丙草胺(propisochlor)、丙苯磺隆(propoxycarbazone,propoxycarbazone-sodium)、炔苯酰草胺(propyzamide)、磺亚胺草(prosulfalin)、苄草丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、丙炔草胺(prynachlor)、双唑草腈(pyraclonil)、吡草醚(pyraflufen,pyraflufen-ethyl)、磺酰草吡唑(pyrasulfotole)、吡唑特(pyrazolynate,pyrazolate)、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron-ethyl))、苄草唑(pyrazoxyfen)、pyribambenz、异丙酯草醚(pyribambenz-isopropyl)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、pyridafol、哒草特(pyridate)、环酯草醚(pyriftalid)、嘧草醚(pyriminobac,pyriminobac-methyl)、pyrimisulfan、嘧草硫醚(pyrithiobac,pyrithiobac-sodium)、pyroxasulfone、甲氧磺草胺(pyroxsulam)、二氯喹啉酸(quinchlorac)、氯甲喹啉酸(quinmerac)、灭藻醌(quinoclamine)、喹禾灵(quizalofop)、喹禾灵乙酯(quizalofop-ethyl)、精喹禾灵(quizalofop-P)、精喹禾灵乙酯(quizalofop-P-ethyl)、喹禾糠酯(quizalofop-P-tefuryl)、砜嘧磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、仲丁通(secbumeton)、烯禾啶(sethoxydim)、环草隆(siduron)、西玛津(simazine)、西草净(simetryn)、SN-106279、磺草酮(sulcotrione)、菜草畏(sulfallate,CDEC)、甲磺草胺(sulfentrazone)、甲嘧磺隆(sulfometuron,sulfometuron-methyl)、草硫膦(sulfosate,glyphosate-trimesium)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、SYN-523、SYP-249、SYP-298、SYP-300、牧草胺(tebutam)、丁噻隆(tebuthiuron)、四氧硝基苯(tecnazene)、tefuryltrione、tembotrione、吡喃草酮(tepraloxydim)、特草定(terbacil)、特草灵(terbucarb)、特丁草胺(terbuchlor)、特丁通(terbumeton)、特丁津(terbuthylazine)、特丁净(terbutryne)、TH-547即propyrisulfuron、噻吩草胺(thenylchlor)、thiafluamide、噻氟隆(thiazafluron)、噻唑烟酸(thiazopyr)、噻二唑草胺(thidiazimin)、噻苯隆(thidiazuron)、thiencarbazone、thiencarbazone-methyl、噻吩

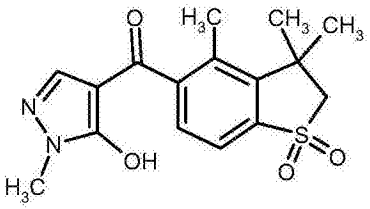
磺隆(thifensulfuron,thifensulfuron-methyl)、禾草丹(thiobencarb)、仲草丹(tiocarbazil)、topramezone、三甲苯草酮(tralkoxydim)、野燕畏(triallate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、三嗪氟草胺(triaziflam)、triazofenamide、苯磺隆(tribenuron,tribenuron-methyl)、三氯乙酸(TCA)、三氯吡氧乙酸(triclopyr)、灭草环(tridiphane)、草达津(trietazine)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron,trifloxysulfuron-sodium)、氟乐灵(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、氟胺磺隆甲酯(triflusulfuron-methyl)、三甲隆(trimeturon)、抗倒酯(trinexapac,trinexapac-ethyl)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、tsitodef、烯效唑(uniconazole)、精烯效唑(uniconazole-P)、灭草敌(vernolate)、ZJ-0166、ZJ-0270、ZJ-0543、ZJ-0862和以下化合物

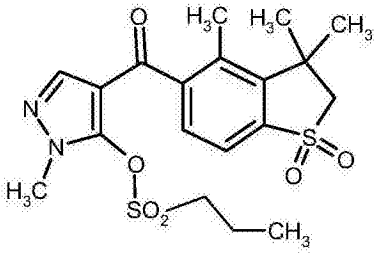


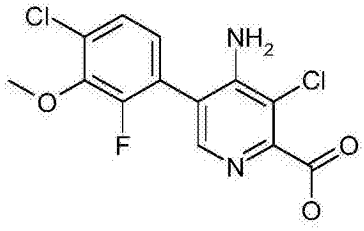


[0212]

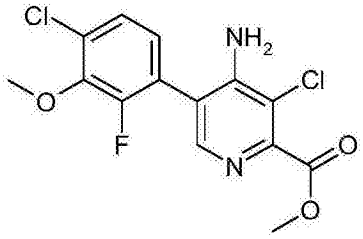








[0213]



[0214] 为进行使用,将市售形式的制剂如果合适以常规方式稀释,例如在可湿性粉剂、分散剂和水分散性颗粒剂的情况下用水稀释。粉末剂、土施颗粒剂或者撒播颗粒剂以及可喷雾溶液剂形式的制剂在施用前通常不用其它惰性物质稀释。

[0215] 式(I)化合物的施用率根据外部条件变化,所述外部条件例如尤其是温度、湿度和所用除草剂类型。其可在很宽的范围内变化,例如在0.001至1.0kg/ha或更多活性物质之间;然而,其优选在0.005至750g/ha之间。

[0216] 除了除草作用之外,本发明的化合物还具有良好的杀虫作用。因此,本发明还涉及

其用作杀虫剂的用途。

[0217] 以下实施例用于示例说明本发明。

[0218] 化学实施例

[0219] 1.4-(2-氯-6-氟苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-3(2H)哒嗪酮(表21中的编号1)的制备

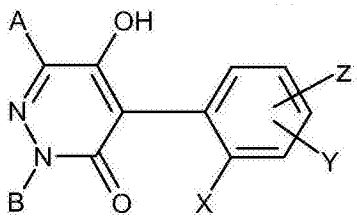
[0220] 首先投入2.1g(2当量)叔丁醇钾在10mL DMF中的溶液,并于<0℃下缓慢滴加10mL DMF中2.8g(9.4mmol)的2-{[2-(2-氯-6-氟苯基)乙酰基]甲基亚肼基}丙酸乙酯。将该混合物温热至RT,然后再搅拌0.5小时。然后将该反应溶液倒入100mL冷的1N盐酸中,并每次用250mL乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用50mL饱和氯化钠溶液洗涤,然后用硫酸钠干燥,于减压下浓缩,并用柱色谱法纯化(硅胶,乙酸乙酯/正庚烷梯度)。这样得到1.2g纯产物。

[0221] 2.4-(3,4-二氯苯基)-5-羟基-2-甲基-3(2H)-哒嗪酮(表21中的编号4)的制备

[0222] 将4mL水/乙二醇(1:1)加入1.0g(7.4mmol)的4-(3,4-二氯苯基)-5-甲氧基-2-甲基-2H-哒嗪-3-酮和0.4g氢氧化钾(2当量)中,并将该混合物于150℃反应过夜。将反应混合物加入50mL水中,并用浓盐酸调节至pH 1,且滤出所得沉淀物。用异丙醇重结晶,得到0.2g纯产物。

[0223] 以下化合物类似于上述实施例1和2而制备:

[0224] 表21:其中G为氢的本发明通式(I)化合物。

[0225] 

(I-a)

[0226]

编号	X	Y	Z	A	B	分析数据
I-1-a-1	Cl	6-F	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.88 (bs, 1H), 7.48 (m, 1H), 7.40 (dd, 1H), 7.27 (t, 1H) 3.58 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-a-2	NO_2	H	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.7 (bs, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.78 (t, 1H), 7.62 (t, 1H), 7.45 (d, 1H) 3.53 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
I-1-a-3	Cl	3-Cl	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.58 (bs, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.25 (d, 1H) 3.58 (s, 3H), 2.21 (s, 3H)
I-1-a-4	H	4-Cl	3-Cl	H	Me	mp.: 315 °C
I-1-a-5	Cl	H	4-Cl	H	t-Bu	mp.: 250 °C
I-1-a-6	Cl	6-Cl	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.8 (bs, 1H), 7.52 (假 d, 2H), 7.43 (t, 1H), 3.58 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-a-7	H	3-Ph	H	H	t-Bu	mp.: 244 °C
I-1-a-8	H	5-CF_3	3-CF_3	H	t-Bu	mp.: 239 °C
I-1-a-9	Cl	4-Me	6-Br	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.65 (bs, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 3.57 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)

[0227]

编号	X	Y	Z	A	B	分析数据
I-1-a-10	Cl	5-(4-Cl-Ph)	H	H	t-Bu	mp.: 250 °C
I-1-a-11	Br	4-Me	Br	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.56 (s, 2H), 3.58 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-a-12	Cl	H	3-Cl	H	t-Bu	无定形粉末
I-1-a-13	Cl	6-Cl	H	i-Bu	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.8 (bs, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.43 (t, 1H), 3.56 (s, 3H), 2.51 (m, 2H,因溶剂而模糊), 2.03 (m, 1H), 0.90 (d, 6H)
I-1-a-14	Cl	4-OCF_3	6-Cl	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 11.0 (bs, 1H), 7.72 (s, 2H), 3.58 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-a-15	Cl	4-Me	6-c-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.07 (s, 1H), 6.82(s, 1H), 3.53 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.81 (m, 1H), 0.89 (m, 2H), 0.63 (m, 2H)
I-1-a-16	Cl	4-Me	6-OCF_3	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.42 (s, 1H), 7.23 (s, 1H), 3.56 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.22 (s, 3H)
I-1-a-17	F	3-Me	6-F	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.37 (q, 1H), 7.03 (t, 1H), 3.56 (s, 3H), 2.23 (假 d, 6H)
I-1-a-18	Cl	3-Me	6-F	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.37 (t, 1H), 7.12 (t, 1H), 3.52 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-a-19	F	3-OMe	6-F	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.17 (m, 1H), 7.02 (t, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 2.18 (s, 3H)
I-1-a-20	Cl	4-Br	6-Cl	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.82 (s, 2H), 3.54 (s, 3H), 2.21 (s, 3H)
I-1-a-21	F	6-F	H	Me	H	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.50 (m, 1H), 7.12 (m, 1H), 2.23 (假 d, 6H)
I-1-a-22	Cl	6-CF_3	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.75 (bs, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.67 (t, 1H), 3.56 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-a-23	Cl	4-Cl	6-Br	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.75 (bs, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.68 (t, 1H), 3.58 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-a-24	F	3-F	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.8 (bs, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 7.11 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 2.22 (s, 3H)
I-1-a-25	OCF_3	4-Br	6-Br	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.92 (s, 1H), 7.59 (s, 1H), 3.48 (s, 3H), 2.11 (s, 3H)
I-1-a-26	I	H	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.92 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.15 (m, 2H), 3.56 (s, 3H), 2.24 (s, 3H)

[0228]

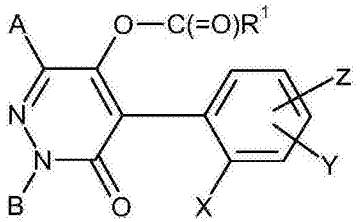
编号	X	Y	Z	A	B	分析数据
I-1-a-27	Cl	4-Cl	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.54 (bs, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.48 (dd, 1H), 7.16 (d, 1H) 3.58 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-a-28	H	4-Cl	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 10.4 (bs, 1H), 7.50 (假 s, 4 H), 3.59 (s, 3H), 2.24 (s, 3H)
I-1-a-29	H	3-Cl	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 600MHz, d6-DMSO, 10.4 (bs, 1H), 7.47 (m, 3H) 7.39 (d, 2 H), 3.61 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)
I-1-a-30	H	3-CF_3	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 10.54 (bs, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.75-7.55 (m, 4H), 3.71 (s, 3H), 2.31 (s, 3H)
I-1-a-31	Cl	H	H	Me	Me	^{1}H-NMR, 600MHz, d6-DMSO, 10.4 (bs, 1H), 7.49 (m, 2H) 7.44 (d, 2 H), 7.41 (d, 2 H), 3.59 (s, 3H), 2.24 (s, 3H)
I-1-a-32	Cl	6-F	H	Me	H	^{1}H-NMR 400 MHz, d6-DMSO : 12.27 ppm (宽 s, 1H), 7.41-7.47 (m, 1H); 7.36 (d, 1H); 7.19-7.23 (m, 1H); 2.22 (s, 3H)
I-1-a-33	Cl	6-F	4-F	Me	H	油
I-1-a-34	Cl	6-Cl	4-Cl	Me	H	^{1}H-NMR 400 MHz, d6-DMSO : 12.27 ppm ((宽 s, 1H), 7.66 (s, 2H); 2.20 (s, 3H)
I-1-a-35	Cl	6-F	3-Me	Me	H	^{1}H-NMR 400 MHz, d6-DMSO : 12.27 ppm (宽 s, 1H), 7.23-7.33 (m, 2H); 2.49 (s, 3H); 2.48 (s, 3H)
I-1-a-36	F	6-F	3-F	Me	H	^{1}H-NMR 400 MHz, d6-DMSO : 12.38 ppm (宽 s, 1H), 7.50 (ddd, 1H); 7.10-7.16 (m, 1H); 2.22 (s, 3H),

[0229] 3.5-异丙氧基-4-(2-氯-6-氟苯基)-2,6-二甲基-3(2H)-哒嗪酮(表22中的编号1)的制备

[0230] 首先在10mL二氯甲烷中投入0.15g(0.55mmol)表21中的本发明化合物I-1-a-1和0.07g三乙胺(1.3当量)。然后在10分钟内滴加0.06g(1.0当量)的异丁酰氯。将该混合物搅拌1小时,并加入10mL的5%的碳酸氢钠溶液。将有机相分离出来,然后干燥,色谱纯化(硅胶,梯度乙酸乙酯/正庚烷)之后,得到0.18g。

[0231] 表22的化合物可类似于上述方法而获得。

[0232] 表22:其中G为C(=O)R^1的本发明通式(I)化合物。

[0233] 

(I-b)

[0234]

编号	X	Y	Z	R^1	A	B	分析数据
I-1-b-1	Cl	6-F	H	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.53 (m, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.35 (t, 1H) 3.71 (s, 3H), 2.65 (m, 1H), 2.20 (s, 3H), 0.88 (m, 6H)
I-1-b-2	H	3-Cl	4-Cl	i-Pr	Me	H	89℃
I-1-b-3	Cl	6-Cl	H	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.60 (假 d, 2H), 7.50 (t, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.62 (m, 1H), 2.20 (s, 3H), 0.86 (d, 6H)
I-1-b-4	NO_2	H	H	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 8.20 (d, 1H), 7.88 (t, 1H), 7.72 (t, 1H), 7.38 (d, 1H) 3.67 (s, 3H), 2.65 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 0.92 (m, 6H)
I-1-b-5	F	3-F	H	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.55 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 7.07 (m, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.68 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 0.93 (m, 6H)
I-1-b-6	Cl	4-Me	6-Br	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.58 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 3.71 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.19 (s, 3H)
I-1-b-7	Cl	4-OCF_3	6-Cl	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.32 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.62 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.01 (d, 6H)
I-1-b-8	Br	4-Me	6-Br	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.41 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 0.99 (d, 6H)
I-1-b-9	Cl	3-Cl	H	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.50 (d, 1H), 7.25 (t, 1H), 7.09 (d, 1H) 3.82 (s, 3H), 2.57 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.00 (dd, 6H)
I-1-b-10	Cl	4-Me	6-OCF_3	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.21 (s, 1H), 7.02 (s, 1H), 3.75 (s, 3H), 2.57 (m, 1H), 2.38 (s, 6H), 0.99 (m, 6H)
I-1-b-11	F	3-Me	6-F	Et	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.43 (m, 1H), 7.12 (t, 1H), 3.68 (s, 3H), 2.40 (t, 1H), 2.21 (s, 6H), 0.89 (m, 6H)
I-1-b-12	Cl	3-Me	6-F	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.52 (m, 1H), 7.22 (t, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.22 (s, 3H),

[0235]

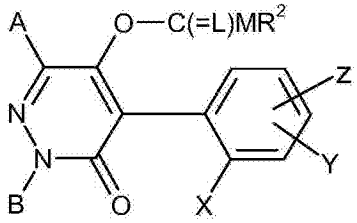
编号	X	Y	Z	R^1	A	B	分析数据
							2.09 (s, 3H)
I-1-b-13	Cl	4-Br	6-Cl	i-Pr	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.96 (s, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.70 (m, 1H), 2.23 (s, 3H), 0.92 (m, 6H)
I-1-b-14	Cl	4-Cl	6-Br	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.96 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 3.71 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.12 (s, 3H)
I-1-b-15	Cl	4-Me	6-c-Pr	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.58 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 3.68 (s, 3H), 2.29 8s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.05 (s, 3H)
I-1-b-16	Cl	6-Cl	H	i-Pr	i-Bu	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.39 (d, 2H), 7.28 (t, 1H), 3.87 (s, 3H), 2.53 (m, 1H), 2.42 (d, 2H), 2.06 (m, 1H), 0.96 (m, 12H)

[0236] 4.4-(2,6-二氯苯基)-5-乙氧基羰基氧基-2-甲基-6-异丁基-3(2H)-哒嗪酮(表23中的编号1)的制备

[0237] 首先在25mL二氯甲烷中投入0.5g(1.52mmol)表21的本发明化合物I-1-a-13,并加入0.2g三乙胺和0.18g氯甲酸乙酯。将该混合物于RT搅拌15分钟,然后将其加入30mL 5%浓度的碳酸氢钠溶液中。将有机相分离出来并然后干燥、浓缩且用柱色谱法(硅胶,梯度乙酸乙酯/正庚烷)纯化。这样得到0.47g。

[0238] 表23的化合物可类似于上述方法而获得。

[0239] 表23:其中G为C(=L)MR^2的本发明通式(I)化合物。

[0240] 

(I-c)

[0241]

编号	X	Y	Z	A	B	L	M	R^2	分析数据
I-1-c-1	Cl	6-Cl	H	i-Bu	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.40 (d, 2H), 7.29 (t, 1H), 4.13 (q, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.51 (d, 2H), 2.10 (m, 1H), 1.15 (t, 3H), 0.96 (d, 6H)
I-1-c-2	F	3-Me	6-F	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.46 (q 1H), 7.13

[0242]

编号	X	Y	Z	A	B	L	M	R^2	分析数据
									(t, 1H), 4.32 (q, 2H), 3.82 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.32 (t, 3H)
I-1-c-3	F	3-OMe	6-F	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.32 (m, 1H), 7.17 (t, 1H), 4.13 (q, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.09 (t, 3H)
I-1-c-4	Cl	6-Br	4-Me	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.59 (s, 1H), 7.47 (s, 1H), 4.16 (q, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)
I-1-c-5	NO_2	H	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 8.23 (d, 1H), 7.88 (t, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.43 (d, 1H), 4.15 (m, 2H), 3.68 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 0.92 (m, 6H)
I-1-c-6	Cl	3-Cl	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, DMSO, 7.72 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.22 (d, 1H), 4.13.(q, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)
I-1-c-7	Cl	6-F	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.58 (m, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.38 (t, 1H) 3.71 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)
I-1-c-8	Cl	6-Cl	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.60 (d, 2H), 7.52 (t, 1H), 4.13 (q, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.15 (t, 3H)
I-1-c-9	Cl	4-Cl	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.79 (d, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.28 (d, 1H), 4.16 (q, 2H), 3.70 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)
I-1-c-10	F	3-F	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.57 (m, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.13 (m, 1H), 4.13 (q, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)
I-1-c-11	Br	6-Br	4-Me	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.61 (s, 2H), 4.18 (q, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)
I-1-c-12	Cl	6-Cl	4-OCF_3	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.82 (s, 2H),

[0243]

编号	X	Y	Z	A	B	L	M	R^2	分析数据
									4.17 (q, 2H,) 3.72 (s, 3H) 2.28 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)
I-1-c-13	Cl	6-OCF_3	4-Me	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.48 (s, 1H), 7.32 (s, 1H), 4.18 (q, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)
I-1-c-14	OCF_3	4-Br	6-Br	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 8.18 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 4.18 (q, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.13 (t, 3H)
I-1-c-15	H	3-CF_3	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.72 (d, 1H), 7.70-7.55 (m, 4H), 4.13 (q, 2H), 3.81 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.17 (t, 3H)
I-1-c-16	Cl	3-Me	6-F	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.52 (t, 1H), 7.28 (t, 1H), 4.12 (q, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)
I-1-c-17	Cl	4-Br	6-Cl	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.95 (s, 2H), 4.18 (q, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.13 (t, 3H)
I-1-c-18	CF_3	6-Cl	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.97 (d, 1H), 7.89 (d, 1H), 7.73 (t, 1H), 4.16 (q, 2H), 3.73 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)
I-1-c-19	I	H	H	Me	Me	O	O	Et	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.95 (d, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.13 (q, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.10 (t, 3H)
I-1-c-20	Cl	4-Me	6-Br	Me	Me	O	O	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.60 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.26 (s, 3H)
I-1-c-21	Cl	3-Me	6-F	Me	Me	O	O	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.52 (t, 1H), 7.28 (t, 1H), 3.72 (s, 6H), 2.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
I-1-c-22	F	3-F	H	Me	Me	O	O	Bzl	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.53 (m, 1H), 7.38 (m, 3H), 7.25 (m, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.13 (m, 1H), 5.18

[0244]

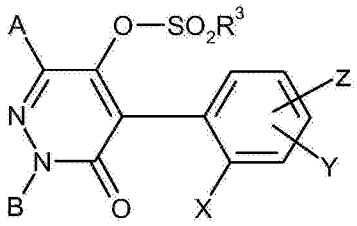
编号	X	Y	Z	A	B	L	M	R^2	分析数据
									(s, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
I-1-c-23	Cl	3-Cl	H	Me	Me	O	O	iBu	^{1}H-NMR, 400MHz, DMSO, 7.72 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.22 (d, 1H), 3.93.(m, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.72 (m, 1H), 0.72 (d, 6H)
I-1-c-24	Cl	4-Me	6-OCF_3	Me	Me	O	O	All	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.49 (s, 1H), 7.32 (s, 1H), 5.78 (m, 1H), 5.18 (m, 2H), 4.62 (d, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.26 (s, 3H)
I-1-c-25	Cl	6-Cl	H	i-Bu	Me	O	O	All	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.39 (d, 2H), 7.32 (t, 1H), 5.72 (m, 1H), 5.20 (m, 2H), 4.53 (d, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.50 (d, 2H), 2.09 (m, 1H), 0.97 (d, 6H)

[0245] 5.4-(2-氯苯基)-5-甲基磺酰氧基-2,6-二甲基-3(2H)-哒嗪酮(表24中的编号1)的制备

[0246] 首先在10mL的乙酸乙酯中投入0.03g(0.12mmol)表21的本发明化合物I-1-a-31，加入0.02g三乙胺和一刮勺尖的DMAP，并将该混合物温热至60℃。然后加入在2mL乙酸乙酯中的0.015g甲磺酰氯，并将该混合物搅拌1小时。加入6mL饱和氯化钠溶液之后，将有机相干燥、浓缩并用柱色谱法(硅胶，梯度乙酸乙酯/正庚烷)纯化。这样得到0.02g纯产物。

[0247] 表24的化合物可类似于上述方法而得到。

[0248] 表24：其中G为SO_2R^3的本发明通式(I)化合物。

[0249] 

(I-d)

[0250]

编号	X	Y	Z	R^3	A	B	分析数据
I-1-d-1	Cl	H	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.55 (s, 1H), 7.42 (假 t, 3H), 3.81 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 2.48 (s, 3H)
I-1-d-2	Cl	6-F	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.58 (m, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.37

[0251]

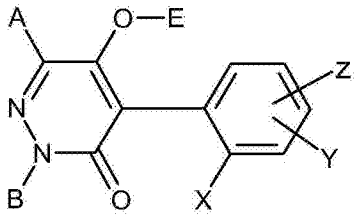
编号	X	Y	Z	R^3	A	B	分析数据
							(t, 1H) 3.73 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 2.39 (t, 3H)
I-1-d-3	Cl	4-Me	6-Br	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.61 (s, 1H), 7.48 (s, 1H), 3.71 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.33 (s, 3H)
I-1-d-4	NO_2	H	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 8.23 (d, 1H), 7.88 (t, 1H), 7.77 (t, 1H), 7.60 (d, 1H) 3.67 (s, 3H), 3.05 (s, 3H), 2.39 (s, 3H)
I-1-d-5	Cl	4-Br	6-Cl	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.96 (s, 2H), 3.71 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 2.40 (s, 3H)
I-1-d-6	F	3-F	H	Toly l	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO: 7.43 (d, 2H); 7.33 (m, 1H), 7.25 (d, 2H), 7.09 (m, 1H), 7.02 (m, 1H), 3.68 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.35 (s, 3H)
I-1-d-7	Cl	4-OCF_3	6-Cl	Et	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.82 (s, 2H), 3.72 (s, 3H), 3.33 (q, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)
I-1-d-8	F	3-OCH_3	6-F	Me	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO: 7.33 (m, 1H); 7.18 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 2.41 (s, 3H)
I-1-d-9	Cl	6-Cl	H	Me	i-Bu	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, $CDCl_3$, 7.45 (d, 2H), 7.32 (t, 3H), 3.85 (s, 3H), 2.71 (d, 2H), 2.61 (s, 3H), 0.99 (d, 6H)

[0252] 6.4-(2-溴-6-氯-4-甲基苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-3(2H)-哒嗪酮(表25中的编号1)的制备

[0253] 将0.1g(0.12mmol)表21的本发明化合物I-1-a-9和0.011g氢氧化钠溶解于10mL的无水甲醇中并搅拌1小时。将该混合物于减压下浓缩并溶于甲苯中。将溶剂再次除去,得到无定形粉末。

[0254] 表25的化合物可类似于上述方法而获得。

[0255] 表25.其中G为E的本发明通式(I)化合物。

[0256] 

(I-g)

[0257]

编号	X	Y	Z	E	A	B	分析数据
I-1-g-1	Br	4-Me	6-Cl	Na^+	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.32 (s, 1H), 7.18 (s, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.92 (s, 3H)
I-1-g-2	NO_2	H	H	Na^+	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.78 (d, 1H), 7.65 (t, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.20 (d, 1H) 3.18 (s, 3H), 1.93 (s, 3H)
I-1-g-3	NO_2	H	H	$(Me)_4N^+$	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.78 (d, 1H), 7.65 (t, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.22 (d, 1H) 3.38 (s, 3H), 3.12 (s, 12H), 1.95 (s, 3H)
I-1-g-4	F	3-F	H	$(Me)_4N^+$	Me	Me	^{1}H-NMR, 400MHz, d6-DMSO, 7.08 (m, 1H), 6.98 (m, 1H), 7.13 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.13 (s, 12H), 1.96 (s, 3H)

[0258] 7.式(II)化合物制备的示例性说明：

[0259] 实施例1：

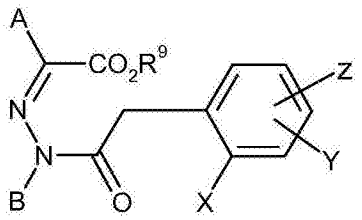
[0260] 首先在50mL二氯甲烷中投入0.45g(9.7mmol)甲肼以及0.99g三乙胺和0.06g的DMAP(0.05当量)。于0℃缓慢滴加在50mL二氯甲烷中的由2,6-二氯苯基乙酸和草酰氯新制备的2.2g的2,6-二氯苯乙酰氯。然后将该混合物于室温搅拌过夜，并加入氯化铵溶液。将有机相分离出来，干燥并浓缩。用柱色谱法纯化得到1.5g的1-(2,6-二氯苯乙酸)1-甲基酰肼。

[0261] 加入1.43g丙酮酸甲酯，并将该混合物溶解于20mL乙醇。将该反应混合物在回流状态下于沸点(at the boil)加热2h，然后在减压下浓缩并用柱色谱法(硅胶，流动相为正庚烷/乙酸乙酯梯度)纯化。这样得到1.3g 2-{[2-(2,6-二氯苯基)乙酰基]甲基亚肼基}丙酸甲酯。

[0262] 实施例2：

[0263] 首先在50mL二氯甲烷中投入2g(10.1mmol)的2,4-二氯苯乙酸，加入1.1mL(1.67当量)的草酰氯和一滴DMF，并将混合物在回流状态下于沸点下加热，直到停止放出气体。将该混合物于减压下浓缩，再加入两倍的二氯甲烷，并再次浓缩该混合物，然后将剩余物溶于5mL二氯甲烷中。将以此方式获得的溶液于0℃下在20分钟内滴加至1.4g(1.1当量)的2-(甲基亚肼基)丙酸甲酯和2.9mL三乙胺(2.1当量)在20mL二氯甲烷的溶液中。然后将该混合物于室温搅拌过夜，加入30mL水。将水相除去并浓缩有机相。将获得的剩余物用柱色谱法(硅胶，梯度正庚烷/乙酸乙酯)纯化。这样得到共计0.7g的2-{[2-(2,4-二氯苯基)乙酰基]甲基亚肼基}丙酸甲酯。

[0264] 表26:通式(II)的化合物

[0265] 

(II)

[0266]

编号	X	Y	Z	A	B	R^9	分析数据
II-a-1	Cl	3-Cl	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以 ppm 计): 7.54 (d, 1H), 7.34 (m, 2H), 4.10 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)
II-a-2	Cl	6-F	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.37 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 4.06 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-3	Cl	6-Cl	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.77 (d, 2H), 7.32 (t, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 2.29 (s, 3H)
II-a-4	Cl	4-Cl	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, $CDCl_3$,位移以ppm计): 7.45 - 7.04 (m, 3H), 4.10 (s, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 2.29 (s, 3H)
II-a-5	H	4-Cl	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, $CDCl_3$,位移以ppm计): 7.45 - 7.15 (m, 4H), 3.97 (s, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
II-a-6	Cl	H	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, $CDCl_3$,位移以ppm计): 7.45 - 7.05 (m, 4H), 4.14 (s, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)
II-a-7	H	3-Cl	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, $CDCl_3$,位移以ppm计): 7.40 - 7.05 (m, 4H), 3.98 (s, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 2.21 (s, 3H)
II-a-8	H	3-CF_3	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, $CDCl_3$,位移以ppm计): 7.70 - 7.35 (m, 4H), 4.06

[0267]

编号	X	Y	Z	A	B	R^9	分析数据
							(s, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
II-a-9	Br	4-Me	6-Br	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.52 (s, 2H), 4.22 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 2.28 (s, 6H)
II-a-10	Cl	4-OCF_3	Cl	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.64 (s, 2H), 4.22 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-11	Cl	4-Me	6-c-Pr	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.11 (s, 1H), 6.82 (s, 1H), 4.22 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.78 8m, 1H), 0.82 (m, 2H), 0.57 (m, 2H)
II-a-12	Cl	4-Me	6-OCF_3	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.38 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-13	F	3-Me	6-F	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.22 (m, 1H), 6.98 (t, 1H), 3.92 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.20 (s, 3H)
II-a-14	Br	4-Br	6-OCF_3	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.99 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 4.09 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-15	Cl	3-Me	6-F	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.32 (m, 1H), 7.13 (t, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-16	F	3-OMe	6-F	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.12 (m, 1H), 7.02 (t, 1H), 3.92 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 2.25 (s, 3H),
II-a-17	Cl	4-Br	6-Cl	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.79 (s, 2H), 4.15 (s, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-18	Cl	6-Cl	H	Me	i-Bu	Et	^{1}H-NMR (400MHz, $CDCl_3$,位移以ppm计): 7.32 (d, 2H), 7.15 (m, 1H), 4.32 (m, 4H), 3.40和3.22 (各自均为s, 共3H), 2.70和2.42 (各自均为m, 共2H) 2.00 (m, 1H), 1.42 (m, 3H), 0.95 (m, 6H)
II-a-19	I	H	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.82 (d, 2H), 7.32 (m, 2H), 7.02 (t, 1H), 4.03 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 2.26 (s, 3H)
II-a-20	Cl	4-Cl	6-Br	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.82 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 4.21 (s, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-	Cl	6-CF_3	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.82 (d, 1H), 7.75 (d,

[0268]

编号	X	Y	Z	A	B	R^9	分析数据
21							1H), 7.54 (t, 1H), 4.21 (s, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-22	2-CF_3	5-CF_3	H	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.92 (t, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 4.26 (s, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)
II-a-23	Cl	4-Cl	6-c-Pr	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.42 (s, 1H), 7.05 (s, 1H), 4.23 (s, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.82 (m, 1H), 0.88 (m, 2H), 0.68 (m, 2H)
II-a-24	Cl	4-Cl	6-Br	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.81 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 4.22 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-25	Cl	4-Br	6-OCF_3	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.88 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 4.08 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.33 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-26	Br	4-Cl	6-OCF_3	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 7.92 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 4.11 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
II-a-27	Cl	4-Br	6-OCF_3	Me	Me	Me	^{1}H-NMR (400MHz, d6-DMSO,位移以ppm计): 8.18 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 4.18 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.32 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)

[0269] B.配制实施例

[0270] a)粉剂通过以下方式获得:将10重量份式(I)化合物和/或其盐与90重量份作为惰性物质的滑石混合并在锤式粉碎机中粉碎该混合物。

[0271] b)易分散于水中的可湿性粉剂通过以下方式获得:将25重量份式(I)化合物和/或其盐、64重量份作为惰性物质的含高岭土的石英、10重量份木质素磺酸钾与1重量份作为湿润剂和分散剂的油酰基甲基牛磺酸钠混合,并在销盘式磨机(pinned-disk mill)中研磨该混合物。

[0272] c)易分散于水中的分散浓缩剂通过以下方式获得:将20重量份式(I)化合物和/或其盐与6重量份烷基酚聚乙二醇醚(®Triton X 207)、3重量份异十三烷醇聚乙二醇醚(8EO)和71重量份石蜡矿物油(沸程例如约255至277℃以上)混合,并将该混合物在球磨机中研磨至细度低于5微米。

[0273] d)乳油由以下物质获得:15重量份式(I)化合物和/或其盐、75重量份作为溶剂的环己酮和10重量份作为乳化剂的氧乙基化壬基酚。

[0274] e)水分散性颗粒剂通过以下方式获得:

[0275] 将以下物质混合:

[0276] 75重量份式(I)化合物和/或其盐、

[0277] 10重量份木质素磺酸钙、

[0278] 5重量份十二烷基硫酸钠、

[0279] 3重量份聚乙烯醇和

[0280] 7重量份高岭土，

[0281] 在销盘式磨机中研磨该混合物，并将所述粉末在流化床中通过喷雾作为制粒液体的水而粒化。

[0282] f)水分散性颗粒剂还通过以下方式获得：

[0283] 将以下物质在胶体磨中进行均化并预粉碎：

[0284] 25重量份式(I)化合物、

[0285] 5重量份2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、

[0286] 2重量份油酰基甲基牛磺酸钠、

[0287] 1重量份聚乙烯醇、

[0288] 17重量份碳酸钙和

[0289] 50重量份水，

[0290] 然后在砂磨机中研磨该混合物，并将所得悬浮液在喷雾塔中用单流体喷嘴雾化和干燥。

[0291] C.生物学实施例

[0292] 1.对有害植物的苗前除草作用

[0293] 将单子叶或双子叶杂草或作物植物的种子置于木纤维盆中的砂壤土中，并用土覆盖。然后将配制为可湿性粉剂(WP)或乳油(EC)形式的本发明化合物，在添加0.2％润湿剂的情况下，以水性悬浮液或乳液的形式以600至800l/ha(换算值)的水施用率施用于覆盖土的表面。在处理后，将盆置于温室中，并使之保持处于对于测试植物而言良好的生长条件下。3周的试验期之后，通过与未处理的对照组比较，目测评价对供试植株的损害(除草活性以百分比(％)计：100％活性＝植株均死亡，0％活性＝与对照植株类似)。此处，例如，编号为I-1-c-8、I-1-a-16和I-1-c-13的化合物在320g/ha的施用率下各自对淡甘菊(Matricaria inodora)、繁缕(Stellaria media)和阿拉伯婆婆纳(Veronica persica)表现出至少90％的活性。

[0294] 2.对有害植物的苗后除草活性

[0295] 将单子叶或双子叶杂草或作物植物的种子置于木纤维盆中的砂壤土中，用土覆盖，并使之于温室中良好生长条件下生长。播种后2至3周，将所述供试植株在一叶期处理。然后将配制为可湿性粉剂(WP)或乳油(EC)形式的本发明化合物，在添加0.2％润湿剂的情况下，以水性悬浮液或乳液的形式以600至800L/ha(换算值)的水施用率喷雾到绿色植物部位上。将所述供试植株于温室中在最佳生长条件下放置约3周之后，通过与未处理的对照组进行比较目测评价所述制剂的活性(除草活性以百分比(％)计：100％活性＝植株均死亡，0％活性＝与对照植物类似)。此处，例如化合物I-1-a-27、I-1-c-7、I-1-c-8、I-1-b-3、I-1-b-1、I-1-c-9、I-1-a-9、I-1-c-14、I-1-g-1和I-1-a-25在320g/ha的施用率下对反枝苋(Amaranthus retroflexus)、阿拉伯婆婆纳和三色堇(Viola tricolor)表现出至少80％的活性。

[0296] 3.杀虫活性

[0297] 实施例A

[0298] 桃蚜(Myzus)试验(MYZUPE喷雾处理)

[0299] 溶剂：78重量份丙酮

[0300] 1.5重量份二甲基甲酰胺

[0301] 乳化剂:0.5重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0302] 为制备适合的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将浓液用含乳化剂的水稀释至所需浓度。受到所有阶段的桃蚜(Myzus persicae)侵扰的大白菜(Brassica pekinensis)的圆叶片用所需浓度的活性化合物制剂进行喷雾处理。经过所需时间后,确定以%计的效果。100%表示所有蚜虫被杀死;0%表示无蚜虫被杀死。在本实验中,例如,编号为I-1-a-4和I-1-a-8的化合物在500g/ha的施用率下表现出至少80%的活性。

[0303] 实施例B

[0304] 烟芽夜蛾试验(喷雾处理)

[0305] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[0306] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0307] 乳化剂:0.5重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0308] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓液用含有乳化剂的水稀释至所需浓度。大豆(Glycine max.)的叶片用所需浓度的活性化合物制剂喷雾,并在变干之后,接种烟芽夜蛾(Heliothis virescens)的虫卵。7天之后,确定以%计的效果。100%表示所有的虫卵均被杀死;0%表示没有虫卵被杀死。在该试验中,例如,编号为I-1-a-5的化合物在500g/ha的施用率下表现出至少80%的活性。

[0309] 实施例C

[0310] 南方根结线虫试验(MELGIN)

[0311] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[0312] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0313] 乳化剂:0.5重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0314] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将所述浓液用水稀释至所需浓度。将砂、活性化合物溶液、南方根结线虫(Meloidogyne incognita)卵/幼虫悬浮液和莴苣种子装入容器中。莴苣种子发芽且植物生长。根上形成虫瘿。所需时间后,以%计的杀线虫活性通过虫瘿的形成确定。100%表示无虫瘿形成;0%表示经过处理的植株上的虫瘿数量与未经处理的对照组上的虫瘿数量相当。此处试验中,例如编号为I-1-a-10的化合物在20ppm的施用率下表现出至少80%的药效。