[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl[7]
C07C317/24
C07C323/22
C07D231/20
A01N 33/08
A01N 41/10

[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 03808774.X

[43] 公开日 2005 年 7 月 27 日

[11] 公开号 CN 1646488A

[22] 申请日 2003.2.12 [21] 申请号 03808774.X
[30] 优先权
[32] 2002. 2.19 [33] DE [31] 10206792.9
[86] 国际申请 PCT/EP2003/001365 2003.2.12
[87] 国际公布 WO2003/070696 德 2003.8.28
[85] 进入国家阶段日期 2004.10.19
[71] 申请人 拜尔农作物科学股份公司
地址 德国蒙海姆
[72] 发明人 H·-G·施瓦茨 M·W·德鲁斯 P·达门 D·福伊希特 R·庞岑 M·施密特

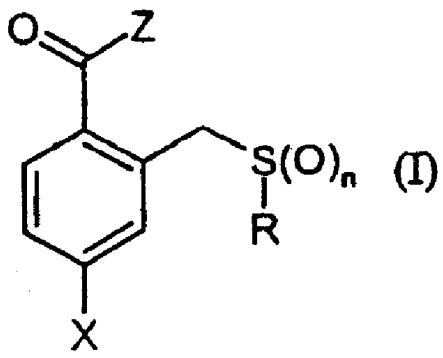
[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司
代理人 温宏艳 王景朝

权利要求书 12 页 说明书 58 页

[54] 发明名称 取代的芳基酮类化合物

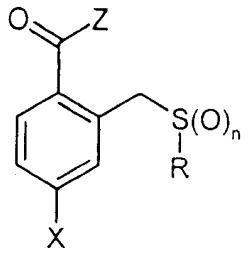
[57] 摘要

本发明涉及新的式(I)的取代的芳基酮类化合物，其中 Z、X、R 和 n 如说明书中所定义。本发明还涉及这些取代的芳基酮类化合物制备方法和涉及它们的作为植物处理剂的应用，且涉及用于制备式(I)化合物的中间体产品。



ISSN1008-4274

1. 式（Ⅰ）化合物，



(I)

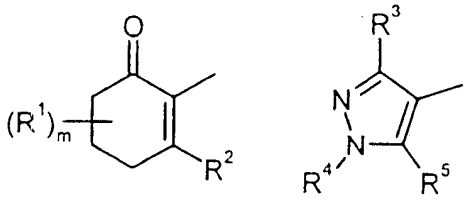
其中

n 代表数字 0、1 或 2，

R 代表各自任选地取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、芳基或芳烷基，

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

Z 代表下面基团中的一个



其中

m 代表数字 0-6，

R^1 代表氢、卤素或代表各自任选地取代的烷基、烷硫基或芳基，或者-如果 m 代表数字 2-6—也任选地与第二基团 R^1 一起代表氧或链烷二基（亚烷基），

R^2 代表羟基、甲酰氧基、卤素，或者代表各自任选地取代的烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基氨基羰氧基、烷基磺酰氧基、链烯氧基、炔氧基、芳氧基、芳硫基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、芳基羰氧基、芳基羰基烷氧基、

芳基磺酰氧基、芳基烷氧基、芳基烷硫基、芳基烷基亚磺酰基、芳基烷基磺酰基或代表经由氮连接的杂环基，

R^3 代表氢、氰基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、卤素或代表各自任选地取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷氧基羰基或环烷基，

R^4 代表氢或代表各自任选地取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、芳基或芳基烷基，和

R^5 代表羟基、甲酰氧基，或者各自代表任选地取代的烷氧基、烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基氨基羰氧基、烷基磺酰氧基、链烯氧基、炔氧基、芳基烷氧基、芳基羰氧基、芳基羰基烷氧基或芳基磺酰氧基。

2. 根据权利要求 1 的式（ I ）化合物，其中

n 代表数字 0 或 2，

R 代表任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基取代的具有 1-6 个碳原子的烷基，或代表各自任选地被氰基-或卤素-取代的各自具有 2-6 个碳原子的链烯基或炔基，或代表各自任选地被氰基-、卤素-或 C_1-C_4-烷基-取代的在环烷基中各自具有 3-6 个碳原子的，并且如果适当，在烷基部分有 1-4 个碳原子环烷基或环烷基烷基，或代表各自任选地被硝基-、氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷基-、C_1-C_4-卤代烷基-、C_1-C_4-烷氧基-或 C_1-C_4-卤代烷氧基-取代的各自在芳基基团中具有 6 或 10 个碳原子，并且如果适当，在烷基部分有 1-4 个碳原子的芳基或芳基烷基，

X 代表氢、硝基、氰基、羧基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、卤素，或者代表各自任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的各自在烷基基团中具有 1-6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，

m 代表数字 0、1、2 或 3，

R^1 代表氢、卤素，各自代表任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4 烷氧基-、C_1-C_4 烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的各自具有 1-6 个碳原子的烷基或烷硫基，或代表苯基，或—如果 m 代表 2 或 3—任选地也与第二基团 R^1 一起代表氧或具有 3-5 个碳原子

的链烷二基（亚烷基），

R^2 代表羟基、甲酰氧基、卤素，

代表各自任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4烷氧基-、C_1-C_4烷氧基-羰基-、C_1-C_4烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的各自具有 1-6 个碳原子的烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基氨基羰氧基或烷基磺酰氧基，

代表各自任选地被卤素取代的各自具有 3-6 个碳原子的链烯氧基或炔氧基，

代表各自任选地被硝基-、氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷基-、C_1-C_4-卤代烷基-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-卤代烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-卤代烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-卤代烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-烷基磺酰基-或 C_1-C_4-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基基团中有 6 或 10 个碳原子，并且如果适合，在烷基部分中有 1-4 个碳原子的芳氧基、芳硫基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、芳基羰氧基、芳基羰基烷氧基、芳基磺酰氧基、芳基烷氧基、芳基烷硫基、芳烷基亚磺酰基或芳烷基磺酰基，或

代表吡咯基、吡唑基、咪唑基、三唑基、四唑基、它们中的每一个都通过氮相连。

R^3 代表氢、氰基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、卤素，代表各自任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基取代的各自在烷基基团中具有 1-6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基或烷氧基羰基，或

任选地代表被氰基-、卤素-或 C_1-C_4-烷基-取代的具有 3-6 个碳原子的环烷基。

R^4 代表氢，

任选地代表被氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的具有 1-6 个碳原子的烷基，

代表各自任选地被氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的链烯基或炔基，

代表各自任选地被氰基-、卤素-或 C_1-C_4-烷基-取代的各自在环烷

基基团中具有 3-6 个碳原子，并且如果合适，在烷基部分中具有 1-4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基，或

代表各自任选地被硝基-、氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷基-、C_1-C_4-卤代烷基-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-卤代烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-卤代烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-卤代烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-烷基磺酰基-或 C_1-C_4-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基基团中具有 6 或 10 个碳原子，并且如果适合，在烷基部分中有 1-4 个碳原子的芳基或芳烷基，

R^5 代表羟基、甲酰氧基，

代表各自任选地被氰基-、卤素-或 C_1-C_4-烷氧基-取代的各自在烷基基团中具有 1-6 个碳原子的烷氧基、烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基氨基羰氧基或烷基磺酰氧基，

代表各自任选地被氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的链烯氧基或炔氧基，或

代表各自任选地被硝基-、氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷基-、C_1-C_4-卤代烷基-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-卤代烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-卤代烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-卤代烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-烷基磺酰基-或 C_1-C_4-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基基团中具有 6 或 10 个碳原子，并且如果合适，在烷基部分中具有 1-4 个碳原子的芳基烷氧基、芳基羰氧基、芳基羰基烷氧基或芳基磺酰氧基。

3. 根据权利要求 1 的式（ I ）化合物，其中

n 代表数字 2。

R 代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、正-或异-丙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-、和/或正-或异-丙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、正-、异-、仲-或叔-戊基，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-和/或溴-取代的乙烯基、丙烯基、丁烯基、戊烯基、乙炔基、丙炔基、丁炔基或戊炔基，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-和/或正-或异-丙基-取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙甲基、环丁甲基、环戊甲基或环己甲基，或

代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-和/或三氟甲氧基-取代的苯基、萘基、苯甲基、苯乙基或苯丙基，

X 代表氢、硝基、氰基、羧基、氨甲酰基、硫代氨甲酰、氟、氯、溴、碘，或

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、正-、异-、仲-或叔-丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、正-、异-、仲-或叔-丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异-丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异-丙基磺酰基、甲氨基、乙氨基、正-或异-丙氨基、正-、异-、仲-或叔-丁氨基、二甲氨基、二乙氨基、二甲氨基磺酰基或二乙氨基磺酰基，

m 代表数字 0、1 或 2，

R^1 代表氢、氟、氯或溴，代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、正-、异-、仲-或叔-丁硫基，或代表苯基，或—如果 m 代表 2—任选地也和第二基团 R^1 一起代表氧、丙烷-1，3-二基或丁烷-1，4-二基，

R^2 代表羟基、甲酰氧基、氟或氯，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异-丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异-丙氧基羰基氧基、甲氨基羰基氧基、乙氨基羰基氧基、正-或异-丙氨基羰基氧基、甲基磺酰

氧基、乙基磺酰氧基、正-或异-丙基磺酰氧基，

代表各自任选地被氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯氧基、丁烯氧基、丙炔氧基或丁炔氧基，

代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基取代的苯氧基、苯硫基、苯基亚磺酰基、苯基磺酰基、苯基羰氧基、苯基羰基甲氧基、苯基磺酰氧基、苯基甲氧基、苯基甲硫基、苯基甲基亚磺酰基或苯基甲基磺酰基或代表吡唑基、咪唑基、三唑基，它们中的每一个都通过氮相连，

R^3 代表氢、氰基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、氟、氯、溴，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基，或

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲基-或乙基-取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基，

R^4 代表氢，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲基-或乙基-取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基，或

代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基或苯甲基，

R^5 代表羟基、甲酰氧基，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-取代的甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异-丁酰氧基、甲氧基羰酰氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异-丙氧基羰基氧基、甲氨基羰基氧基、乙氨基羰基氧基、正-或异-丙氨基羰基氧基、甲基磺酰氧基、乙基磺酰氧基、正-或异-丙基磺酰氧基，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯氧基、丁烯氧基、丙炔氧基或丁炔氧基，或

代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基甲氧基、苯基羰基氧基、苯基羰基甲氧基或苯基磺酰氧基。

4. 根据权利要求 1 的式（ I ）化合物，其中

R 代表各自任选地被氟-和/或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-或仲-丁基，

代表各自任选地被氟-、氯-或甲基-取代的环丙基、环戊基或环己基，或

代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯基或苯甲基，

X 代表硝基、氰基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、氟、氯、溴、碘，或

代表各自任选地被氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-和/或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、二甲氨基或二甲氨基磺酰基，

m 代表数字 0，

R^1 代表氢，

代表各自任选地被氟-或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基，或代表苯基，或—如果 m 代表 2—任选地也和第二基团 R^1 一起代表氧、丙烷-1，3-二基或丁烷-1，4-二基，

R^2 代表羟基，

代表各自任选地被氟-或氯-取代的甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异-丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异-丙氧基羰基氧基、甲氨基羰基氧基、乙氨基羰基氧基、正-或异-丙氨基羰基氧基、甲基磺酰氧基、乙基磺酰氧基、正-或异-丙基磺酰氧基，

代表各自任选地被氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯氧基、丁烯氧基、丙炔氧基或丁炔氧基，

代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯氧基、苯硫基、苯基羰氧基、苯基羰基甲氧基、苯基磺酰氧基、苯基甲氧基或苯基甲硫基，或

代表吡唑基或咪唑基，它们中的每一个都通过氮相连，

R^3 代表氢、氟、氯、溴，

代表各自任选地被氟-或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、甲氧

基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基，或

代表各自任选地被氟-、氯-或甲基-取代的环丙基，

R^4 代表氢，

代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基，

代表各自任选地被氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基，代表各自任选地被氟-、氯-或甲基-取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基，或

代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基或苯甲基，

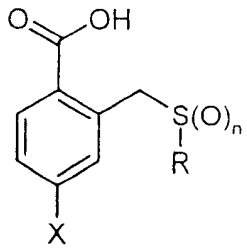
R^5 代表羟基，

代表各自任选地被氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-取代的甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异-丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异-丙氧基羰基氧基、甲氨基羰基氧基、乙氨基羰基氧基、正-或异-丙氨基羰基氧基、甲基磺酰氧基、乙基磺酰氧基、正-或异-丙基磺酰氧基，

代表各自任选地被氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯氧基、丁烯氧基、丙炔氧基或丁炔氧基，或代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基甲氧基、苯基羰基氧基、苯基羰基甲氧基或苯基磺酰氧基。

5. 一种制备根据权利要求 1 的式（ I ）化合物的方法，其特征在

于，将式（Ⅱ）化合物



(Ⅱ)

其中

n、R 和 X 如权利要求 1 中所定义，

—或它的反应性衍生物，例如相应的酰基卤、酸的氰化物或酯—

与通式（Ⅲ）的化合物反应

H-Z （Ⅲ）

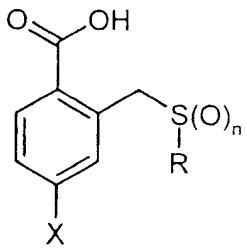
其中

Z 如权利要求 1 中所定义，

如果合适在脱水剂的存在下，和如果合适在一种或多种反应助剂的存在下，和如果合适在一种或多种稀释剂的存在下进行，

和，如果合适，使在已经进行了按照本发明的方法后获得的通式（Ⅰ）化合物进行随后的反应，来转化为通式（Ⅰ）的其它化合物。

6. 式（Ⅱ）的化合物



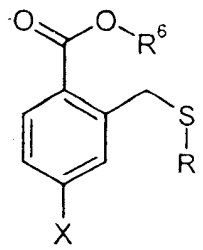
(Ⅱ)

其中

X 代表 CF_3，

n 和 R 如权利要求 1 中所定义。

7. 式（Ⅵ）的化合物



(VI)

其中

X 代表 CF_3，

R^6 代表烷基、苄基或烯丙基，和

R 如权利要求 1 中所定义。

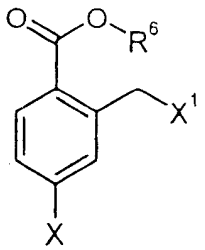
8．组合物，其特征在于它们包含至少一种根据权利要求 1-4 中任一项的式（ I ）化合物。

9．根据权利要求 1-4 中任一项的式（ I ）化合物或根据权利要求 8 的组合物用于控制不合需要的植物的应用。

10．控制不合需要的植物的方法，其特征在于使至少一种根据权利要求 1-4 中任一项的式（ I ）化合物或根据权利要求 8 的组合物作用于不合需要的植物和/或它们的栖息地。

11．根据权利要求 1 的式（ I ）化合物用于制备杀虫剂的应用。

12．一种制备根据权利要求 6 的式（ II ）化合物的方法，其特征在于使式（ IV ）的化合物



(IV)

其中

X 如权利要求 1 中所定义，

R^6 代表烷基、苄基或烯丙基，和

X^1 代表卤素，

与通式（V）的巯基化合物，

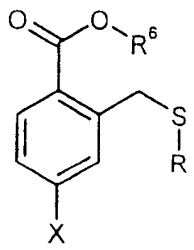
$$HS-R \qquad (V)$$

其中

R 如权利要求 1 中所定义，

—或与式（V）化合物的碱金属盐反应，

如果合适在一种或多种反应助剂的存在下，和如果合适在一种或多种稀释剂存在下进行，和将得到的通式（VI）的羧酸酯



(VI)

其中 R、R^6和 X 如上所定义，

如果合适，与氧化剂反应，如果合适在一种或多种稀释剂的存在下进行，并且将得到的酯通过惯用方法转化成式（II）的化合物。

取代的芳基酮类化合物

技术领域

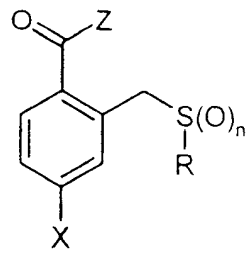
本发明涉及新的取代的芳基酮类化合物，涉及它们的制备方法，以及涉及它们作为农作物处理剂尤其是除草剂的应用。

背景技术

已知某些取代的芳基酮类化合物具有除草性质（参见 EP-A-090 262，EP-A-135 191，EP-A-186 118，EP-A-186 119，EP-A-186 120，EP-A-319 075，EP-A-352 543，EP-A-418 175，EP-A-487 357，EP-A-527 036，EP-A-527 037，EP-A-560 483，EP-A-609 797，EP-A-609 798，EP-A-625 505，EP-A-625 508，EP-A-636 622，US-A-5 804 532，US-A-5 834 402，US-A-5 846 906，US-A-5 863 865，WO-A-95/31446，WO-A-96/26192，WO-A-96/26193，WO-A-96/26200，WO-A-96/26206，WO-A-97/27187，WO-A-97/35850，WO-A-97/41105，WO-A-97/41116，WO-A-97/41117，WO-A-97/41118，WO-A-97/43270，WO-A-97/46530，WO-A-98/28981，WO-A-98/31681，WO-A-98/31682，WO-A-99/03856，WO-A-99/07688，WO-A-99/07697，WO-A-99/10327，WO-A-99/10328，WO-A-00/05221，WO-A-00/21924）。然而，这些化合物的活性不能完全令人满意。

发明内容

现在本发明提供新的式（Ⅰ）的取代的芳基酮类化合物



(I)

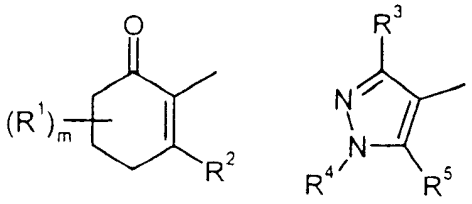
其中

n 代表数字 0、1 或 2，

R 代表各自任选地被取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、芳基或芳基烷基，

X 代表氢、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰、硫代氨甲酰、卤素或代表各自任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，和

Z 代表下面基团中的一个



其中

m 代表数字 0-6，

R^1 代表氢、卤素或代表各自任选地被取代的烷基、烷硫基或芳基，或者—如果 m 代表数字 2-6—任选地也与第二基团 R^1 一起代表氧或链烷二基（亚烷基），

R^2 代表羟基、甲酰氧基、卤素，或者代表各自任选地取代的烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基氨基羰氧基、烷基磺酰氧基、链烯氧基、炔氧基、芳氧基、芳硫基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、芳基羰氧基、芳基羰基烷氧基、芳基磺酰氧基、芳基烷氧基、芳基烷硫基、芳基烷基亚磺酰基、芳基烷基磺酰基或代表经由氮连接的杂环基，

R^3 代表氢、氰基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、卤素或代表各自任选地取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷氧基羰基或环烷基，

R^4 代表氢或代表各自任选地取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、芳基或芳烷基，和

R^5 代表羟基、甲酰氧基，或者代表各自任选取代的烷氧基、烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基氨基羰氧基、烷基磺酰氧基、链烯氧基、炔氧基、芳基烷氧基、芳基羰氧基、芳基羰基烷氧基或芳基磺酰氧基。

在定义中，烃链例如烷基或链烷二基，各自是直链或支链的—包括与杂原子结合，例如在烷氧基中。

如果通式（Ⅰ）的化合物能够以不同的互变异构的或立体异构的形式存在，则本发明包括各自可能的互变异构的或立体异构的形式。

在上面和下面给出的式中存在的基团的优选的取代基或优选的范围定义如下。

n 优选地代表数字 0 或 2。

R 优选地代表任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的具有 1-6 个碳原子的烷基，或代表各自任选地被氰基-或卤素-取代的各自具有 2-6 个碳原子的链烯基或炔基，或代表各自任选地被氰基-、卤素-或 C_1-C_4-烷基-取代的各自在环烷基中具有 3-6 个碳原子，并且如果适当，在烷基部分有 1-4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基，或代表各自任选地被硝基-、氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷基-、C_1-C_4-卤代烷基-、C_1-C_4-烷氧基-或 C_1-C_4-卤代烷氧基-取代的各自在芳基基团中具有 6 或 10 个碳原子，并且如果适当，在烷基部分有 1-4 个碳原子的芳基或芳基烷基。

X 优选地代表氢、硝基、氰基、羧基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、卤素，或者代表各自任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的各自在烷基基团中具有 1-6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基。

m 优选地代表数字 0、1、2 或 3。

R^1 优选地代表氢、卤素，优选地代表各自任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4烷氧基-、C_1-C_4烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的各自具有 1-6 个碳原子的烷基或烷硫基，或代表苯基，或—如果 m 代表 2 或 3—任选地也与第二基团 R^1 一起代表氧或具有 3-5 个碳原子的链烷二基（亚烷基），

R^2 优选地代表羟基、甲酰氧基、卤素，

优选地代表各自任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4烷氧基、C_1-C_4烷氧基-羰基-、C_1-C_4烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的各自具有 1-6 个碳原子的烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基氨基羰氧基或烷基磺酰

氧基，

优选地代表各自任选地被卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的链烯氧基或炔氧基。

优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、卤素、C_1-C_4-烷基-、C_1-C_4-卤代烷基-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-卤代烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-卤代烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-卤代烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-烷基磺酰基-或 C_1-C_4-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基基团中有 6 或 10 个碳原子，并且如果适合，在烷基部分中有 1-4 个碳原子的芳氧基、芳硫基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、芳基羰氧基、芳基羰基烷氧基、芳基磺酰氧基、芳基烷氧基、芳基烷硫基、芳烷基亚磺酰基或芳烷基磺酰基，或

优选地代表吡咯基、吡唑基、咪唑基、三唑基、四唑基，它们中的每一个都通过氮相连。

R^3 优选地代表氢、氰基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、卤素，

优选地代表各自任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的各自在烷基基团中具有 1-6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基或烷氧基羰基，或

优选地代表任选地被氰基-、卤素-或 C_1-C_4-烷基-取代的具有 3-6 个碳原子的环烷基。

R^4 优选地代表氢，

优选地代表任选地被氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-或 C_1-C_4-烷基磺酰基-取代的具有 1-6 个碳原子的烷基，

优选地代表各自任选地被氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的链烯基或炔基，

优选地代表各自任选地被氰基-、卤素-或 C_1-C_4-烷基取代的各自在环烷基基团中具有 3-6 个碳原子，并且如果合适，在烷基部分中具有 1-4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基，或

优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷基-、C_1-C_4-卤代烷基-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-卤代烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-卤代烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-卤代烷基亚磺酰基-、C_1-

C_4-烷基磺酰基-或 C_1-C_4-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基基团中具有 6 或 10 个碳原子，并且如果适合，在烷基部分中有 1-4 个碳原子的芳基或芳烷基。

R^5 优选地代表羟基、甲酰氧基，

优选地代表各自任选地被氰基-、卤素-或 C_1-C_4-烷氧基-取代的各自在烷基基团中具有 1-6 个碳原子的烷氧基、烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基氨基羰氧基或烷基磺酰氧基，

优选地代表各自任选地被氰基-或卤素-取代的各自具有 3-6 个碳原子的链烯氧基或炔氧基，或

优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、卤素-、C_1-C_4-烷基-、C_1-C_4-卤代烷基-、C_1-C_4-烷氧基-、C_1-C_4-卤代烷氧基-、C_1-C_4-烷硫基-、C_1-C_4-卤代烷硫基-、C_1-C_4-烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-卤代烷基亚磺酰基-、C_1-C_4-烷基磺酰基-或 C_1-C_4-卤代烷基磺酰基-取代的各自在芳基基团中具有 6 或 10 个碳原子，并且如果合适，在烷基部分中具有 1-4 个碳原子的芳基烷氧基、芳基羰氧基、芳基羰基烷氧基或芳基磺酰氧基。

n 尤其优选地代表数字 2。

R 尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、正-或异-丙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-、和/或正-或异-丙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、正-、异-、仲-或叔-戊基，

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-和/或溴-取代的乙烯基、丙烯基、丁烯基、戊烯基、乙炔基、丙炔基、丁炔基或戊炔基，

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-和/或正-或异-丙基-取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙甲基、环丁甲基、环戊甲基或环己甲基，或

尤其优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-和/或三氟甲氧基-取代的苯基、萘基、苯甲基、苯乙基或苯丙基。

X 尤其优选地代表氢、硝基、氰基、羧基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、氟、氯、溴、碘，或

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、正-、异-、仲-或叔-丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、正-、异-、仲-或叔-丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异-丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异-丙基磺酰基、甲氨基、乙氨基、正-或异-丙氨基、正-、异-、仲-或叔-丁氨基、二甲氨基、二乙氨基、二甲氨基磺酰基或二乙氨基磺酰基。

m 尤其优选地代表数字 0、1 或 2。

R^1 尤其优选地代表氢、氟、氯或溴，代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、正-、异-、仲-或叔-丁硫基，或代表苯基，或—如果 m 代表 2—任选地也和第二基团 R^1 一起代表氧、丙烷-1，3-二基或丁烷-1，4-二基。

R^2 尤其优选地代表羟基、甲酰氧基、氟或氯，

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲氧基羰基-、乙氧基羰基-、正-或异-丙氧基羰基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异-丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异-丙氧基羰基氧基、甲氨基羰基氧基、乙氨基羰基氧基、正-或异-丙氨基羰基氧基、甲基磺酰氧基、乙基磺酰氧基、正-或异-丙基磺酰氧基，

尤其优选地代表各自任选地被氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯氧基、丁烯氧基、丙炔氧基或丁炔氧基，

尤其优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、

甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯氧基、苯硫基、苯基亚磺酰基、苯基磺酰基、苯基羰氧基、苯基羰基甲氧基、苯基磺酰氧基、苯基甲氧基、苯基甲硫基、苯基甲基亚磺酰基或苯基甲基磺酰基或尤其优选地代表吡唑基、咪唑基、三唑基，它们中的每一个都通过氮相连。

R^3 尤其优选地代表氢、氰基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、氟、氯、溴，

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基，或

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲基-或乙基-取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

R^4 尤其优选地代表氢，

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基，

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基，代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲基-或乙基-取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基或尤其优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基或苯甲基。

R^5 尤其优选地代表羟基、甲酰氧基，

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-取代的甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异-丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异-丙氧基羰基氧基、甲氨基羰基氧基、乙氨基羰基氧基、正-或异-丙氨基羰基氧基、甲基磺酰氧基、乙基磺酰氧基、正-或异-丙基磺酰氧基，

尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯氧基、丁烯氧基、丙炔氧基或丁炔氧基，或

尤其优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基甲氧基、苯基羰基氧基、苯基羰基甲氧基或苯基磺酰氧基。

R 更尤其优选地代表各自任选地被氟-和/或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-或仲-丁基，

更尤其优选地代表各自任选地被氟-、氯-或甲基-取代的环丙基、环戊基或环己基，或

更尤其优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-或三氟甲氧基-取代的苯基或苯甲基。

X 更尤其优选地代表硝基、氰基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、氟、氯、溴、碘，或

更尤其优选地代表各自任选地被氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-和/或乙基磺酰基-取代的甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、二甲氨基或二甲氨基磺酰基。

m 更尤其优选地代表数字 0，

R^1 更尤其优选地代表氢，

更尤其优选地代表各自任选地被氟-或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基，或代表苯基，或—如果 m 代表 2—任选地也和第二基团 R^1 一起代表氧、丙烷-1，3-二基或丁烷-1，4-二基。

R^2 更尤其优选地代表羟基，

更尤其优选地代表各自任选地被氟-或氯-取代的甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异-丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异-丙氧基羰基氧基、甲氨基羰基氧基、乙氨基羰基氧基、正-或异-丙氨基羰基氧基、甲基磺酰氧基、乙基磺酰氧基、正-或异-丙基磺酰氧基，

更尤其优选地代表各自任选地被氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯氧基、丁烯氧基、丙炔氧基或丁炔氧基，

更尤其优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基取代的苯氧基、苯硫基、苯基羰氧基、苯基羰基甲氧基、苯基磺酰氧基、苯基甲氧基、苯基甲硫基，或

更尤其优选地代表吡唑基或咪唑基，它们中的每一个都通过氮相连。

R^3 更尤其优选地代表氢、氟、氯、溴，

更尤其优选地代表各自任选地被氟-或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基，或

更尤其优选地代表各自任选地被氟-、氯-或甲基-取代的环丙基。

R^4 更尤其优选地代表氢，

更尤其优选地代表各自任选地被氰基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的甲

基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基，

更尤其优选地代表各自任选地被氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基，

代表各自任选地被氟-、氯-或甲基-取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基，或

更尤其优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基或苯甲基。

R^5 更尤其优选地代表羟基，

更尤其优选地代表各自任选地被氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-取代的甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异-丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异-丙氧基羰基氧基、甲氨基羰基氧基、乙氨基羰基氧基、正-或异-丙氨基羰基氧基、甲基磺酰氧基、乙基磺酰氧基、正-或异-丙基磺酰氧基，

更尤其优选地代表各自任选地被氟-、氯-和/或溴-取代的丙烯氧基、丁烯氧基、丙炔氧基或丁炔氧基，或更尤其优选地代表各自任选地被硝基-、氰基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、三氟甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、二氟甲氧基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、二氟甲硫基-、三氟甲硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、三氟甲基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-或三氟甲基磺酰基-取代的苯基甲氧基、苯基羰基氧基、苯基羰基甲氧基或苯基磺酰氧基。

X 最优选地代表氟、氯、溴、碘、甲氧基、甲硫基、甲基磺酰基或三氟甲基。

R 最优选地代表甲基、乙基、正-丙基、异-丙基、正-丁基、异-丁基、叔-丁基、1,1,1-三氟乙基或苯基。

R^1 最优选地代表氢或甲基。

R^2 最优选地代表羟基、氯或正-吡唑基。

R^3 最优选地代表氢或甲基。

R^4 最优选地代表甲基或乙基。

R^5 最优选地代表羟基、炔丙氧基、正-丙基磺酰氧基、甲苯磺酰氧基、（苯甲酰）甲氧基、（乙氧基羰基）甲氧基，或

代表任选地被氟-、氯-、溴-、甲基-或三氟甲基取代的苄氧基。

尤其强调的式（Ⅰ）化合物，其中

R 代表任选地被氟-、氯-、硝基-或氰基-取代的甲基、乙基、正-、异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、环丙基、环戊基、环己基、烯丙基、炔丙基、苄基或苯基，

X 代表氟、氯、溴、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基或硝基，

n 代表 0 或 2 和

Z 如上所定义。

也尤其强调式（Ⅰ）化合物，其中

R 代表甲基，

X 代表三氟甲基，

n 代表 2 和

Z 如上所定义。

也尤其强调式（Ⅰ）化合物，其中

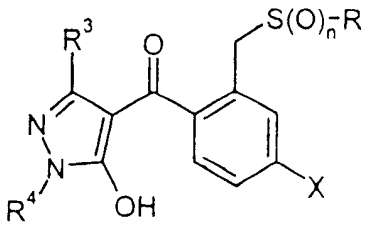
R 代表甲基，

X 代表溴，

n 代表 2 和

Z 如上所定义。

尤其可以提及的是式（Ⅰa）化合物

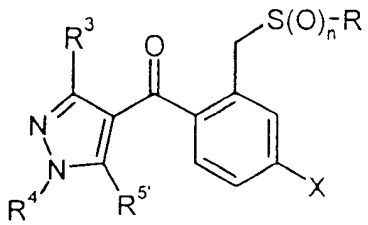


(Ia)

其中

n、X、R、R^3和R^4如上所定义。

此外尤其可以提及的是式（Ⅰb）化合物



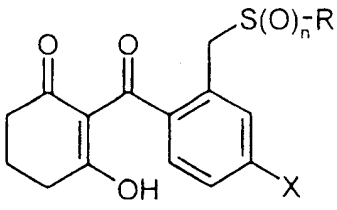
(Ib)

其中

n、X、R、R^3和R^4如上所定义，和

R^5 具有上面提及的对R^5的含义，除了羟基。

此外可以尤其提及的是式（Ⅰc）化合物

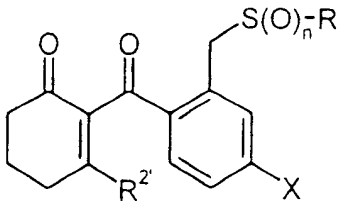


(Ic)

其中

n、X和R如上所定义。

进而尤其可以提及的是式（Ⅰd）化合物



(Id)

其中

n、X 和 R 如上所定义，和

$R^{2'}$ 具有上面提及的对 R^2 的含义，除了羟基。

上述提及的取代基的定义可以按需要相互结合。而且，单独的定义不可以应用。

按照本发明的优选式（Ⅰ）化合物，其包含作为优选的上面列出的定义的结合。

按照本发明的尤其优选式（Ⅰ）化合物，其包含作为尤其优选的上面列出的定义的结合。

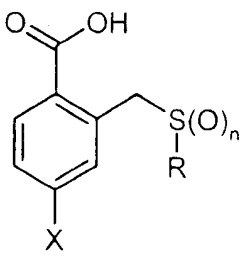
按照本发明的更尤其优选式（Ⅰ）化合物，其包含作为更尤其优选的上面列出的定义的结合。

上面提及的一般或优选的基团定义既应用于式（Ⅰ）的终产物，并且也相应地应用于各自为制备所需的起始物质或中间体。

这些基团定义可以按需要相互组合，即包括在给定的优选范围之间的组合。

新的式（Ⅰ）的取代的芳基酮类化合物具有强效和选择性除草活性。

当使通式（Ⅱ）的羧酸



(II)

其中

n，R 和 X 如上所定义，

—或它的反应性衍生物，例如相应的酰基卤、酸的氰化物（acid cyanides）或酯—

与通式（Ⅲ）的化合物反应

$$H\text{-}Z \qquad (Ⅲ)$$

其中

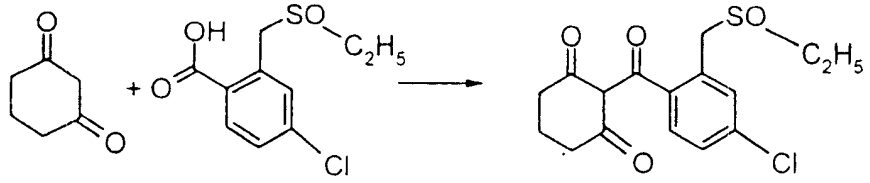
Z 如上所定义，

获得新的式（Ⅰ）的取代的芳基酮类化合物，

如果合适在脱水剂的存在下，和如果合适在一种或多种反应助剂的存在下，和如果合适在一种或多种稀释剂的存在下进行，

和，如果合适，使在已经进行按照本发明的方法后获得的通式（Ⅰ）化合物进行随后的在取代基定义中的反应（例如取代、氧化或还原反应），按照通常的方法转化成通式（Ⅰ）的其它化合物。

例如，利用 4-氯-2-（乙基亚磺酰甲基）苯甲酸和环己-1，3-二酮作为起始物质，在按照本发明的方法中反应的过程可以通过下面的结构式反应路线来说明：



式（Ⅱ）提供羧酸的一般定义，此羧酸被用作在按照本发明的制备通式（Ⅰ）的化合物的方法中的起始物质。在通式（Ⅱ）中，n、R 和 X 优选地具有那些上面描述本发明的通式（Ⅰ）的化合物中已经被提及的、为 n、R 和 X 优选的、尤其优选的、更尤其优选的或最优选的定义。

一些通式（Ⅱ）的起始物质是已知的和/或可以通过本身已知的方法制备（参考 J. Med. Chem. 21（1978），529-536; J. Org. Chem.

36（1971），3636-3638；DE-A-20 65 636；US-3733364；制备实施例）。式（II）的单独的化合物是新的，并且构成本申请主题的一部分。

式（III）提供化合物的一般定义，此化合物进一步被用作在按照本发明制备通式（I）化合物的方法中的起始物质。在通式（III）中，Z优选地具有那些已经在上面描述本发明的通式（I）的化合物中提及的，为Z的优选的、尤其优选的、更尤其优选的或最优选的定义。通式（III）的起始物质已知是用于合成的有机化学产品。

本发明的用于制备式（I）化合物的方法优选地利用一种或多种反应助剂来进行。合适的反应助剂通常是惯用的无机或有机碱或酸性接受体。这些优选地包括碱金属或碱土金属醋酸盐、氨基化物、碳酸盐、碳酸氢盐、氢化物、氢氧化物或醇盐，例如醋酸钠、醋酸钾或乙酸钙、氨基化锂、氨基钠、氨基钾或氨基钙、碳酸钠、碳酸钾或碳酸钙、碳酸氢钠、碳酸氢钾或碳酸氢钙、氢化锂、氢化钠、氢化钾或氢化钙、氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾或氢氧化钙、甲醇钠、乙醇钠、正-或异-丙醇钠、正-、异-、仲-或叔-丁醇钠或甲醇钾、乙醇钾、正-或异-丙醇钾、正-、异-、仲-或叔-丁醇钾；此外也包括碱性有机氮化合物，例如三甲胺、三乙胺、三丙胺、三丁胺、乙基二异丙基胺、N,N-二甲基环己胺、二环己胺、乙基二环己胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苯甲基胺、吡啶、2-甲基-、3-甲基-、4-甲基-、2,4-二甲基-、2,6-二甲基-、3,4-二甲基-和3,5-二甲基吡啶、5-乙基-2-甲基吡啶、4-二甲氨基吡啶、N-甲基哌啶、N-乙基哌啶、N-甲基吗啉、N-乙基吗啉、1,4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷（DABCO）、1,5-二氮杂二环[4.3.0]壬-5-烯（DBN）或1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯（DBU）。

本发明的方法，如果合适，利用脱水剂来进行。合适的脱水剂是惯常用来结合水的化学产品。

可以被提及的实例是二环己基碳化二亚胺、羰基二咪唑和丙烷膦酸酐。

可以被提及作为尤其合适的脱水剂的是二环己基碳化二亚胺和丙烷膦酸酐。

本发明的用于制备通式（I）化合物的方法优选地利用一种或多种稀释剂来进行。合适的稀释剂特别是惰性有机溶剂。这些尤其包括

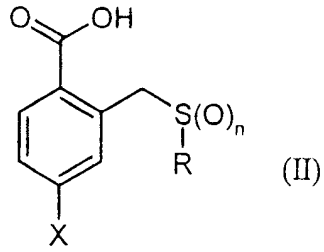
脂肪族的、脂环族的或芳香族的任选地卤代烃，例如苯、石油精、甲苯、二甲苯、氯苯、二氯苯、石油醚、己烷、环己烷、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳；醚，例如二乙基醚、二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃或乙二醇二甲基醚或乙二醇二乙基醚；酮，例如丙酮、丁酮或甲基异丁基酮；腈，例如乙腈、丙腈或丁腈；酰胺，例如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺；酯，例如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亚砜，例如二甲基亚砜。

当进行本发明的方法时，反应温度可以在相对宽的范围内变化。通常，在 0℃-150℃之间，优选地在 10℃-120℃之间温度进行此方法。

本发明的方法通常在大气压下进行。然而，也可以在高压或减压下进行本发明的方法-通常在 0.1 巴-10 巴之间。

为进行本发明的方法，通常以大约等摩尔量使用起始物质。然而，也可以应用相对较大过量的一种成分。反应通常在反应助剂的存在下在合适的稀释剂中进行，并且反应混合物通常在需要的温度搅拌许多小时。利用惯用的方法进行后处理（参考制备实施例）。

式（II）的化合物



(II)

其中

X 代表 CF_3，

n 和 R 如上所定义，是新的并且也构成本申请的部分主题。

尤其优选式（II）化合物，其中

X 代表 CF_3，

n 代表 0、1 或 2 和

R 代表甲基。

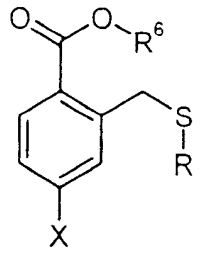
也尤其优选式（Ⅱ）化合物，其中

X 代表溴，

n 代表 0、1 或 2 和

R 代表甲基。

式（Ⅵ）化合物



(VI)

其中

X 代表 CF_3，

R^6 代表烷基、苯甲基或烯丙基，和

R 如上所定义，

是新的，并且也构成本申请的部分主题。

尤其优选式（Ⅵ）化合物，其中

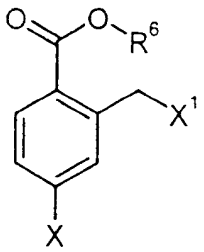
X 代表 CF_3，

R^6 代表甲基、乙基、烯丙基或苯甲基，和

R 代表甲基、乙基、烯丙基或苯甲基。

式（Ⅱ）和（Ⅵ）的新的化合物适用于制备用于制药学、生物学和农业目的的活性化合物。它们尤其适用于制备式（Ⅰ）化合物。

当使通式（Ⅳ）的卤代甲基苯甲酸酯



(IV)

其中

X 如上所定义，

R^6 代表烷基（尤其是甲基或乙基）、苯甲基或烯丙基，和

X^1 代表卤素（尤其是氯或溴），

与通式（V）的巯基化合物，

HS-R （V）

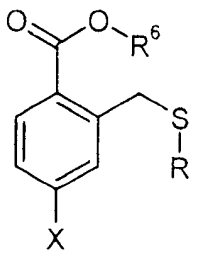
其中

R 如上所定义

—或与式（V）化合物的碱金属盐，例如钠盐或钾盐—反应，

获得通式（II）的新的羧酸类化合物，

如果合适在一种或多种反应助剂例如碳酸钾、三乙胺或氢化钠的存在下，和如果合适在一种或多种稀释剂例如四氢呋喃、乙腈或 N,N-二甲基甲酰胺存在下，在 0℃-150℃的温度进行，并且将得到的通式（VI）的羧酸酯



(VI)

其中 R、R^6和 X 如上所定义

如果合适，与氧化剂例如过氧化氢反应，如果合适在一种或多种

稀释剂例如醋酸和/或水的存在下，在0℃-120℃的温度进行，并且将得到的酯通过惯用方法例如通过与含水氢氧化钠且随后与盐酸反应转化成式（II）的羧酸酯（参考制备实施例）。

一些式（VI）化合物是已知的，和/或它们可以通过已知方法制备。式（VI）的个别的化合物是新的，并且也构成本申请的部分主题。

本发明的活性化合物可以被用作脱叶剂、干燥剂、除稻草剂和尤其作为除草剂。杂草最广义上被理解为在不合需要的场合生长的所有植物。本发明的物质是否作为非选择性的或选择性的除草剂基本上取决于施用的量。

例如，本发明的活性化合物可以被用于下面的植物：

双子叶属杂草：白麻、苋属、豚草属、Anoda、春黄菊属、Aphanes、滨藜属、Bellis、鬼针草属、瘦果、Carduus、肉桂、矢车菊属、藜属、蓟、旋花植物、曼陀罗属、金钱草、Emex、糖芥属、大戟属、Galeopsis、Galinsoga、猪殃殃属、芙蓉、番薯属、地肤、夜芝麻属、独行菜属、母草属、母菊属、薄荷属、山靛属、Mullugo、勿忘草属、罂粟属、牵牛子、车前草属、蓼属、马齿苋属 、毛茛属、萝卡属、Rorippa、Rotala、酸模属、猪毛菜、千里光属、田菁属、黄花稔属、芥子、茄属、苦苣菜属、Sphenoclea、繁缕属、蒲公英、Thlaspi、三叶草、荨麻属、婆婆纳、堇菜属、苍耳属。

双子叶属的农作物：花生属、甜菜属、芸苔、黄瓜属、南瓜属、向日葵属、胡萝卜属、大豆属、棉属、番薯属、莴苣属、亚麻属、番茄属、烟草属、菜豆属、豌豆属、茄属、蚕豆属。

单子叶属杂草：Aegilops、冰草属、Agrostis、Alopecurus、Apera、燕麦属、臂形草属、Bromus、Cenchrus、鸭跖草属、狗牙根属、莎草属、Dactyloctenium、马唐属、Echinochloa、Eleocharis、Eleusine、Eragrostis、Eriochloa、羊茅属、飘拂草、异蕊花属、白茅属、Ischaemum、Leptochloa、黑麦草属、鸭舌草、黍、.雀稗属 、Phalaris、Phleum、早熟禾属、Rottboellia、慈菇属、莞草属、鬃丝虫属、高粱属。

单子叶属的农作物：葱属、风梨属、天门冬属、燕麦属、大麦属、稻属、黍、甘蔗属、黑麦属、高粱属、黑小麦、小麦属、玉蜀黍属。

然而，本发明活性化合物的应用决不限于这些属，但是以相同的

方式扩展至其它植物。

取决于浓度，本发明的活性化合物适于非选择性杂草控制，例如用于工业地形和铁路轨道，和用于有或没有树的道路和区域。同样地，本发明的活性化合物可以被用来控制多年生的农作物中的杂草，例如森林、观赏树木种植、果园、葡萄园、柑橘林、坚果果园、香蕉种植园、咖啡种植园、茶种植园、橡胶种植园、油椰种植园、可可种植园、无核小水果种植园和蛇麻草田，控制草坪、草皮和牧场中的杂草，和用于选择性地控制一年生农作物中的杂草。

本发明式（Ⅰ）化合物当被应用于土壤和气生植物部分时显示强效除草活性和广谱作用。在一定程度上，它们也适用于选择性控制单子叶和双子叶农作物中的单子叶和双子叶杂草，都通过种子发芽前和种子发芽后方法。

在一定浓度或比率，本发明的活性化合物也可以被用于控制动物害虫和真菌或细菌植物疾病。如果合适，它们也可以被用作合成进一步的活性成分的中间体或前体。

按照本发明可以处理所有植物和植物部分，植物在本上下文中被理解为指植物和植物种群，例如需要的和不合需要的野生植物或农作物植物（包括天然地存在的农作物植物）。农作物植物可以是这样的植物，其可以通过常规的植物育种和最优化方法或通过生物技术和重组方法或这些方法的结合获得，包括转基因植物且包括能被植物育种法（Plant Breeders' Rights）保护或不能被保护的植物变种。植物部分被理解为指所有气生植物和地下植物部分和植物的器官例如枝条、叶、花和根，可以被提及的例子是叶、针叶、茎秆、茎、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根茎。植物部分也包括收获的货物和植物的和生殖的繁殖物质，例如插枝、块茎、根茎、侧枝和种子。

用活性化合物直接进行按照本发明的植物和植物部分的处理，或通过惯用的处理方法例如通过浸渍、喷洒、熏蒸、弥雾、撒布、涂上，和在繁殖物质的情况下，尤其是种子的情况下，也通过应用一种或多种涂层，使化合物作用于它们的周围环境、环境或储存空间来进行处理。

活性化合物可以被转化成通常的剂型例如溶液、乳剂、可湿的粉剂、混悬液、粉剂、粉尘、膏剂、可溶的粉末、颗粒、悬浮-乳液浓缩

剂、用活性化合物浸清的天然和合成物质，和在聚合材料中的微胶囊。

这些制剂以已知的方式生产，例如通过将活性化合物与增量剂即液体溶剂和/或固体载体混合，任选地应用表面活性剂即乳化剂和/或分散剂和/或泡沫形成剂。

如果使用的增量剂是水，则也可以使用例如有机溶剂作为助溶剂。合适的液体溶剂基本上是芳香族化合物例如二甲苯、甲苯或烷基萘、氯化芳烃和氯化脂族烃例如氯苯、氯乙烯类或二氯甲烷，脂族烃例如环己烷或烷属烃，例如矿物油成分、矿物或植物油，醇例如丁醇或乙二醇和它们的醚和酯，酮例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮，强极性溶剂例如二甲基甲酰胺和二甲基亚砜，和水。

合适的固体载体是：例如铵盐和研磨的天然矿物例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石或硅藻土，和研磨的合成矿物例如高度分散的硅石、氧化铝和硅酸盐；用于颗粒的合适的固体载体是：例如碾碎的且分级的天然岩石例如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石，要不就是无机和有机研磨的合成颗粒，和有机材料例如锯屑、 椰壳、玉米棒子和烟草秆的颗粒；合适的乳化剂和/或泡沫形成剂是：例如非离子和阴离子乳化剂例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐和蛋白质水解产物；合适的分散剂是：例如 ligno 亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

粘合剂例如羧甲基纤维素和粉末、颗粒或胶乳形式的天然和合成聚合物，例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚醋酸乙烯酯，要不就是天然磷脂例如脑磷脂和卵磷脂和可以用于制剂中的合成磷脂。其它可能的添加剂是矿物和植物油。

可以应用着色剂例如无机颜料，例如氧化铁、氧化钛和普鲁士兰，和有机染料例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料，和微量营养物例如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

制剂通常包含以重量计 0.1%-95%，优选 0.5%-90%的活性化合物。

本发明的活性化合物，以其本身或在它们的制剂中，也可以作为与已知除草剂和/或促进作物耐受性的材料（安全剂）的混合物被应用于杂草控制，立即混合和罐中混合是可能的。因此，带有包含一种或多种已知除草剂和安全剂的除草剂的混合物也是可能的。

用于混合物的合适的除草剂是已知除草剂，例如乙草胺、氟锁草醚（-钠）、aclonifen、草不绿 、alloxydim（-钠）、莠灭净、amicarbazone、氨基氯乙烷、amidosulfuron、anilofos、黄草灵、莠去津、azafenidin、azimsulfuron、beflubutamid、草除灵（-乙基）、benfuresate、苄嘧磺隆（-甲基）、噻草平、benzfendizone、benzobicyclon、benzofenap、新燕灵（-乙基）、bialaphos、治草醚、bispyribac(-钠)、溴丙酸 、杀草全、溴苯腈、去草胺、butafenacil（-烯丙基）、butroxydim、苏达灭 、cafenstrole、caloxydim、长杀草、carfentrazone（-乙基）、chlomethoxyfen、草灭平、chloridazon、chlorimuron（-乙基）、草枯醚、chlorsulfuron、绿麦隆、cinidon(-乙基)、cinmethylin、cinosulfuron、clefoxydim、clethodim、clodinafop（-炔丙基）、氯胺 T、clomeprop、clopyralid、clopyrasulfuron（-甲基）、cloransulam（-甲基）、cumyluron、草净津、cybutryne、草灭特、cyclosulfamuron、cycloxydim、cyhalofop（-丁基）、2,4-D、2,4-DB、desmedipham、燕麦敌、麦草畏、2, 4-滴丙酸（-P）、二氯苯氧基苯氧基丙酸（-甲基）、diclosulam、diethatyl（-乙基）、野燕枯、diflufenican、diflufenzopyr 、dimefuron 、dimepiperate 、dimethachlor 、dimethametryn、dimethenamid、dimexyflam、硝胺、 草乃敌、杀草快、dithiopyr、敌草隆、dymron、epropodan、EPTC、esprocarb、ethalfluralin、ethametsulfuron（-甲基）、唑啶草、ethoxyfen、ethoxysulfuron 、 etobenzanid 、 fenoxaprop （-P-乙基）、fentrazamide、flamprop（-异丙基、-异丙基-L、-甲基）、flazasulfuron、florasulam、氟甲吡啶氧芬丙酸丁酯（-P-丁基）、fluzaolate、flucarbazone（-钠）、flufenacet、flufenpyr、flumetsulam 、 flumiclorac （-戊基） 、 flumioxazin 、flumipropyne、 flumetsulam、 伏草隆、 fluorochloridone、fluoroglycofen （-乙基） 、 flupoxam 、 flupropacil 、flurpyrsulfuron（-甲基、-钠）、抑草丁（-丁基）、fluridone、fluroxypyr(-丁氧基丙基、-meptyl)、flurprimidol、flurtamone、fluthiacet(-甲基)、fluthiamide、氟磺胺草醚、foramsulfuron、glufosinate(-铵)、草甘膦(-异丙铵)、halosafen、haloxyfop

(-乙氧基乙基、-P-甲基)、hexazinone、imazamethabenz(-甲基)、imazamethapyr、imazamox、imazapic、imazapyr、imazaquin、imazethapyr、imazosulfuron、iodosulfuron(-甲基、-钠)、碘苯腈、异乐灵、异丙隆、isouron、isoxaben、isoxachlortole、isoxaflutole、isoxapyrifop、ketospiradox、lactofen、环草定、利谷隆、MCPA、Z-[(4-氯-邻用苯基)氧]丙酸、mefenacet、mesotrione、metamitron、metazachlor、噻唑隆、metobenzuron、秀谷隆、(α-)甲氧毒草安、metosulam、甲氧隆、赛克津、metsulfuron(-甲基)、草达灭、绿谷隆、naproanilide、敌草胺、草不隆、nicosulfuron、达草灭、orbencarb、黄草消、oxadiargyl、恶草灵、oxasulfuron、oxaziclomefone、oxyfluorfen、百草枯、壬酸、喷达曼萨林、pendralin、penoxysulam、pentoxazone、pethoxamid、苯敌草、picolinafen、哌草磷、pretilachlor、primisulfuron(-甲基)、profluazol、profoxydim、扑草净、毒草安、敌稗、propaquizafop、propisochlor、propoxycarbazone(-钠)、拿草特、prosulfocarb、prosulfuron、pyraflufen(-乙基)、pyrazogyl、pyrazolate、pyrazosulfuron(-乙基)、pyrazoxyfen、pyribenzoxim、pyributicarb、pyridate、pyridatol、pyriftalid、pyriminobac(-甲基)、pyrithiobac(-钠)、quinchlorac、quinmerac、quinoclamine、quizalofop(-P-乙基, -P-tefuryl)、rimsulfuron、稀禾定、西玛津、西草净、sulcotrione、sulfentrazone、sulfometuron(-甲基)、sulfosate、sulfosulphuron、tebutam、tebuthiuron、tepraloxydim、特丁津、去草净、thenylchlor、thiafluamide、thiazopyr、thidiazimin、thifensulfuron(-甲基)、禾草丹、tiocarbazil、tralkoxydim、野麦畏、triasulfuron、tribenuron(-甲基)、定草酯、tridiphane、氟乐灵、trifloxysulfuron、triflusulfuron(-甲基)、tritosulfuron。

也适用于混合物的是已知的安全剂，例如 AD-67、BAS-145138、benoxacor、cloquintocet(-甲基)、cyometrinil、2,4-D、DKA-24、dichlormid、dymron、fenclorim、fenchloazol(-乙基)、flurazole、fluxofenim、furilazole、isoxadifen(-乙基)、MCPA、

Z-[(4-氯-邻用苯基)氧]丙酸(-P)、mefenpyr(-二乙基)、MG-191、oxabetrinil、PPG-1292、R-29148。

与其它已知活性化合物例如杀真菌剂、杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、驱鸟剂、植物营养物和土壤改良剂的混合物也是可能的。

活性化合物可以这样被应用，即以其本身、它们的制剂的形式或通过由其进一步稀释制备的使用形式，例如即可使用的溶液、混悬液、乳剂、粉末、膏剂和颗粒剂。它们也以惯用的方式应用，例如通过泼浇、喷雾、弥雾、撒布。

本发明的活性化合物既可以在植物种子发芽前又可以在植物种子发芽后被应用。它们也可以在播种前被加入土壤中。

应用的活性化合物的量可以在相当大范围内变化。其实质上取决于所需的效果的性质。通常，应用比率在每公顷土壤表面 1g-10kg 活性化合物之间，优选为每公顷 5g-5kg。

如上面已经提及的，用本发明可以处理所有植物和它们的部分。在优选的具体实施方案中，处理在野外生长的或已经通过常规的生物培植方法例如杂交或原生质体融合获得的植物种类和植物变种和这些植物种类和植物变种的部分。在进一步优选的具体实施方案中，处理已经通过基因工程方法，如果合适与常规方法(遗传改良有机体)结合，获得的转基因植物和植物变种和这些植物和植物变种的部分。术语“部分”或“植物的部分”或“植物部分”在上面已有说明。

尤其优选处理商购的或使用的植物的变种。植物变种应该被理解为指具有某种特性的植物，其是通过常规培植、突变诱发或重组 DNA 技术获得的。它们可以采取变种、生物型和基因型的形式。

取决于植物种类或植物变种，它们的位置和生长条件(土壤、气候、生长期、营养)，作为按照本发明的处理的结果，也可以发生超加和(“协同的”)作用。因此，例如按照本发明可以被使用的物质和组合物的降低的应用比率和/或变宽的作用谱和/或增加的作用—也与其它农用化学品活性化合物组合—，使得较好的作物生长、作物对高或低温的增强的耐受力、作物对干旱或对水或土壤盐渍度的增加的耐受力、增加的开花特性、方便的收获、加速的成熟、较高的产量、较高的质量和/或收获的产品的较高的营养价值、较好的保存期限和/或收获的产品的加工性能成为可能，它们超过了预期的实际效果。

按照本发明被处理的优选的转基因植物或植物变种（通过基因工程获得的），包括所有归因于通过重组方法改性而被提供有赋予这些植物尤其有利的有价值的特性的基因材料的植物。这些性质的例子是较好的植物生长、对高或低温的增强的耐受力、对干旱或对水或土壤盐渍度的增加的耐受力、增加的开花特性、方便的收获、加速的成熟、较高的产量、较高的质量和/或收获的产品的较高的营养价值、较大的保存期限和/或收获的产品的加工性能。其它，这些特性的尤其强调的例子是植物抗动物和微生物害虫例如昆虫、螨、植物致病真菌、细菌和/或病毒的增强的防御，和植物对特定的除草活性化合物的增强的耐受力。可以被提及的转基因植物的例子是重要的作物例如谷物（小麦、稻）、玉米、大豆、马铃薯、棉花、油籽油菜和水果种类（有水果苹果、梨、柑橘类水果和葡萄），尤其强调玉米、大豆、马铃薯、棉花和油籽油菜。尤其强调的特性是通过在植物中形成的毒素的植物抗昆虫的增强的防御，尤其是那些通过来自植物中的芽胞杆菌属(Bacillus thuringiensis)（例如通过基因 CryIA（a）、CryIA（b）、CryIA（c）、CryⅡA、CryⅢA、CryⅢB2、Cry9c Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 和它们的组合）的基因材料产生的植物（下文称作“Bt 植物”）。尤其强调的其它特性是通过系统获得的抗性（SAR）、系统素、植物抗毒素、elicitors 和抗性基因和相应的表达的蛋白质和毒素的植物抗真菌、细菌和病毒的增加的防御。其它尤其强调的特性是植物对特定除草活性化合物例如咪唑啉酮类、磺酰脲、草甘膦或 phosphinothricin（例如“PAT”基因）的增强的耐受力。赋予各种预期的特性的基因也与转基因植物中的基因相互组合发生。可以提及的“Bt 植物”的例子是玉米、棉花、大豆和马铃薯变种，它们以商标名 YIELD GARD®（例如玉米、棉花、大豆）、KnockOut®（例如玉米）、StarLink®（例如玉米）、Bollgard®（棉花）、Nucotn®（棉花）和 NewLeaf®（马铃薯）在商业上提供。可以被提及的除草剂-耐受的植物的例子是玉米、棉花和大豆变种，它们以商标名 Roundup Ready®（对草甘膦耐受，例如玉米、棉花、大豆）、Liberty Link®（对 phosphinothricin 耐受，例如油籽油菜）、IMI®（对咪唑啉酮类耐受）和 STS®（对磺酰脲耐受，例如玉米）在商业上提供。也可以被提及的抗除草剂的植物（对除草剂耐受的常规培植的植物）是以名字 Clearfield®（例如玉米）在商

业上提供的变种。自然，这些陈述也将应用于将在未来被开发的或将在未来销售的和具有这些基因特性或具有将在未来被开发的基因特性的植物变种。

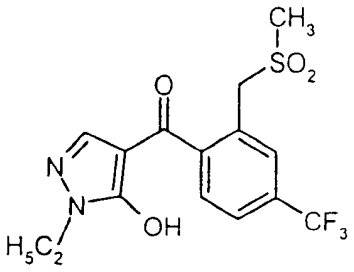
所述的植物可以尤其优选地按照本发明用通式 I 的化合物或本发明的活性化合物混合物处理，除了对草植物的良好的控制，还观察到了与转基因植物或植物变种的上述提及的协同作用。上面陈述的用于活性化合物或混合物的优选的范围也应用于这些植物的处理。在本文中特别陈述的用化合物或混合物对植物的处理是尤其强调的。

按照本发明的活性化合物的制备和应用通过下面的实施例来说明。

具体实施方式

制备实施例:

实施例 1

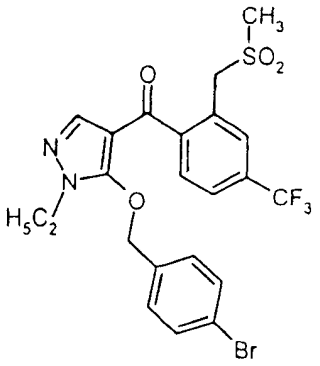


将 3.50 g（12.4 mmol）2-甲基磺酰基甲基-4-三氟甲基苯甲酸、1.39 g（12.4 mmol）1-乙基-5-羟基-1H-吡唑、3.07 g（14.9 mmol）二环己基碳化二亚胺和 75 ml 乙腈的混合物在室温（约 20℃）搅拌 15 小时。然后向这一混合物中加入 3.45 ml 三乙胺和 0.35ml 三甲基甲硅烷基氰化物，并在室温搅拌反应混合物 15 小时。然后在减压下浓缩混合物，并使残留物与饱和的含水碳酸钠溶液搅拌，加入二乙基醚并过滤混合物。分离出滤液的水相，用 2N 盐酸酸化，并用二氯甲烷萃取。用水洗涤有机萃取溶液，用硫酸钠干燥并过滤。在减压下浓缩滤液，用二乙基醚/石油醚消化残留物，并通过抽吸过滤分离得到的结晶产品。

得到 3.8 g（理论值的 81.5%）（1-乙基-5-羟基-1H-吡唑-4-基）

-（2-甲基磺酰基甲基-4-三氟甲基苯基）甲酮。LogP=1.88。

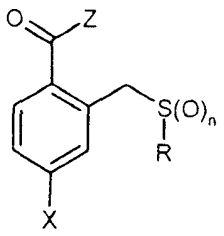
实施例 2



将 1.00 g（2.66 mmol）（1-乙基-5-羟基-1H-吡唑-4-基）（2-甲基磺酰基甲基-4-三氟甲基苯基）甲酮、0.66 g（2.66 mmol）4-溴代苯甲基溴化物、0.485 g 1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯（DBU）和 50 ml 甲苯的混合物在搅拌下加热回流 2 小时，然后在减压下浓缩。用 2N 盐酸/乙酸乙酯摇动残留物，并用硫酸钠干燥有机相并过滤。在减压下浓缩滤液，用己烷/二乙基醚/异丙醇消化残留物，并通过抽吸过滤分离得到的晶体产品。

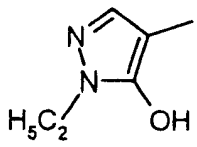
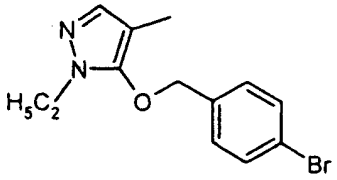
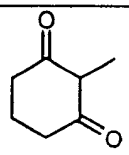
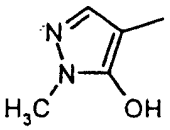
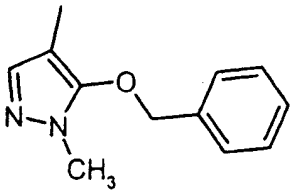
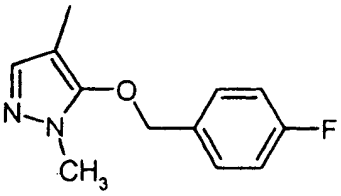
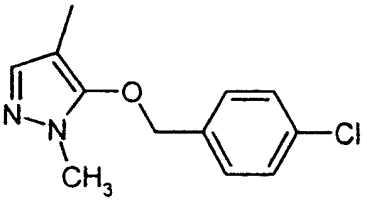
得到 0.55 g（理论值的 38%）[1-乙基-5-（4-溴苯基甲氧基）-1H-吡唑-4-基）-（2-甲基磺酰基甲基-4-三氟甲基苯基）甲酮。LogP=3.76。

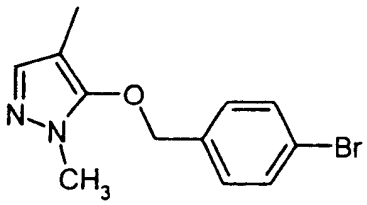
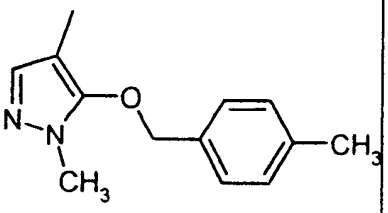
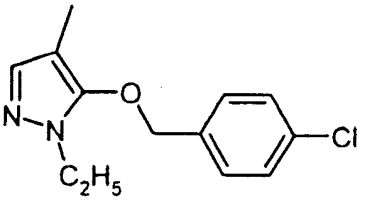
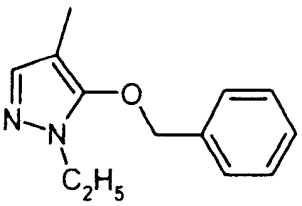
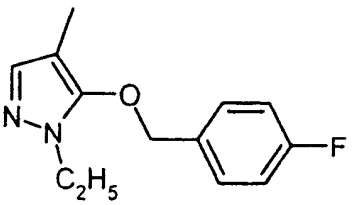
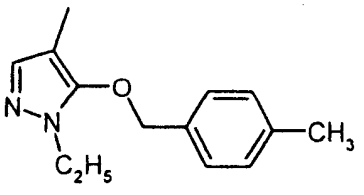
类似于实施例 1 和 2，并且按照本发明的制备方法的一般描述，也可以制备，例如在下面表 1 和 2 中所列的通式（I）的化合物。

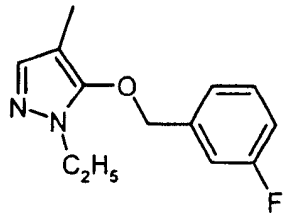
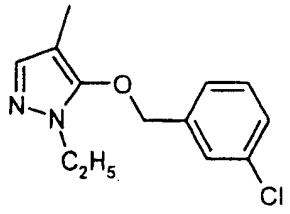
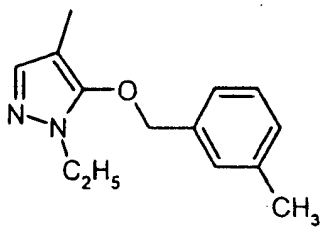
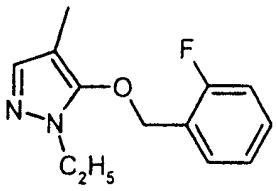
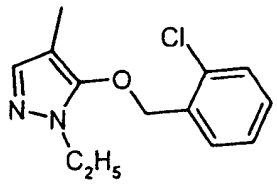
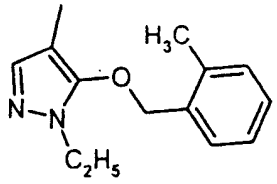
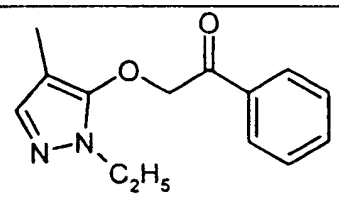


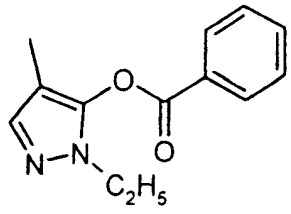
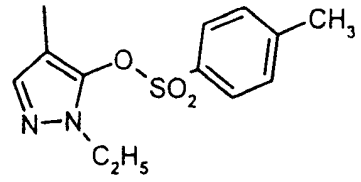
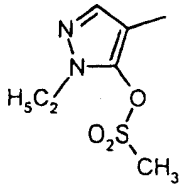
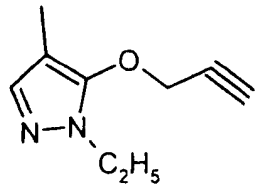
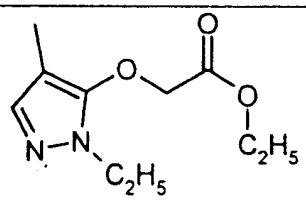
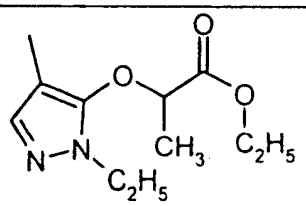
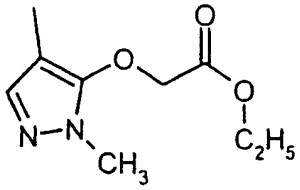
(I)

表1:

实施例编号	n	R	X	Z	物理数据
1	2	CH_3	CF_3		logP = 1.88 a)
2	2	CH_3	CF_3		logP = 3.76 a)
3	2	CH_3	CF_3		logP = 2.17 a)
4	2	CH_3	CF_3		logP = 1.57 a)
5	2	CH_3	CF_3		logP = 2.94 a)
6	2	CH_3	CF_3		logP = 3.02 a)
7	2	CH_3	CF_3		logP = 3.32 a)

实施例编号	n	R	X	Z	物理数据
8	2	CH_3	CF_3		logP = 3.41 [a)]
9	2	CH_3	CF_3		logP = 3.26 [a)]
10	2	CH_3	CF_3		logP = 3.64 [a)]
11	2	CH_3	CF_3		logP = 3.26 [a)]
12	2	CH_3	CF_3		logP = 3.30 [a)]
13	2	CH_3	CF_3		logP = 3.57 [a)]

实施例编号	n	R	X	Z	物理数据
14	2	CH_3	CF_3		logP = 3.30 [a)]
15	2	CH_3	CF_3		logP = 3.60 [a)]
16	2	CH_3	CF_3		logP = 3.57 [a)]
17	2	CH_3	CF_3		logP = 3.29 [a)]
18	2	CH_3	CF_3		logP = 3.56 [a)]
19	2	CH_3	CF_3		logP = 3.52 [a)]
20	2	CH_3	CF_3		logP = 3.01 [a)]

实施例编号	n	R	X	Z	物理数据
21	2	CH_3	CF_3		logP = 3.07 [a)]
22	2	CH_3	CF_3		logP = 3.39 [a)]
23	2	CH_3	CF_3		logP = 2.50 [a)]
24	2	CH_3	CF_3		logP = 2.59 [a)]
25	2	CH_3	CF_3		logP = 2.72 [a)]
26	2	CH_3	CF_3		logP = 3.01 [a)]
27	2	CH_3	CF_3		logP = 2.44 [a)]

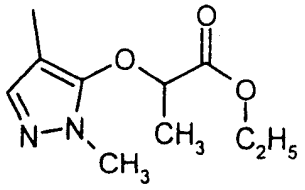
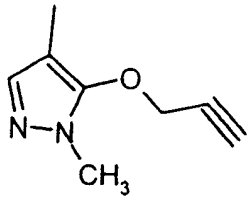
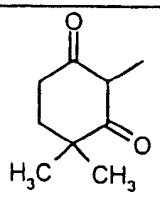
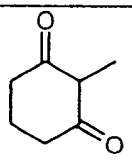
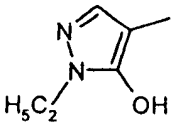
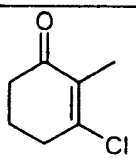
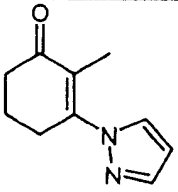
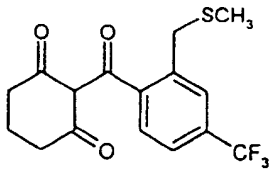
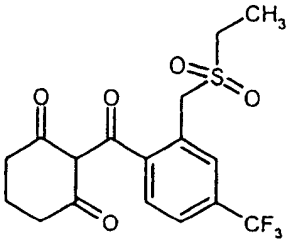
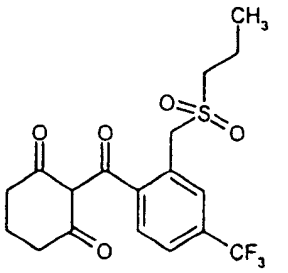
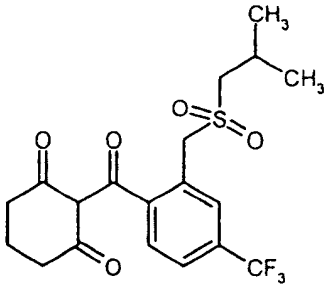
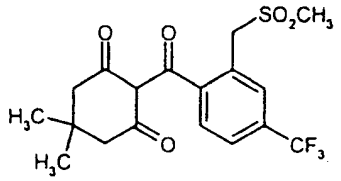
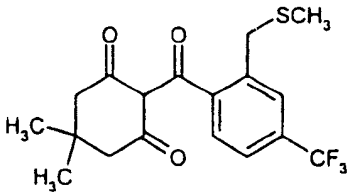
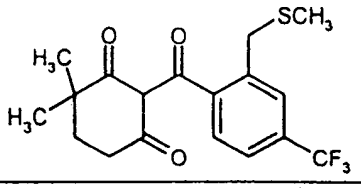
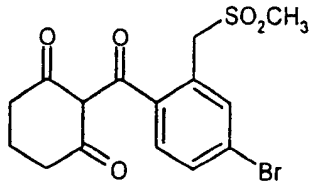
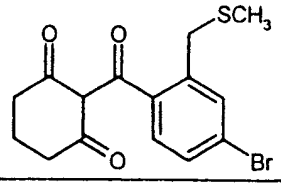
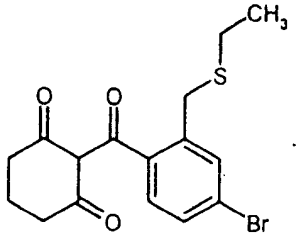
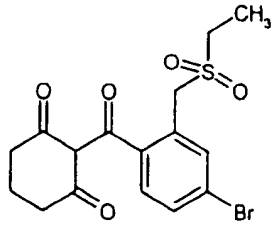
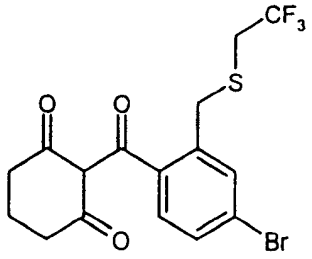
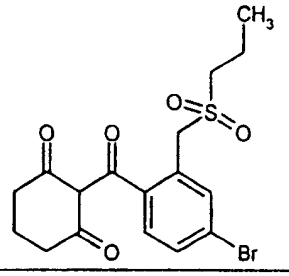
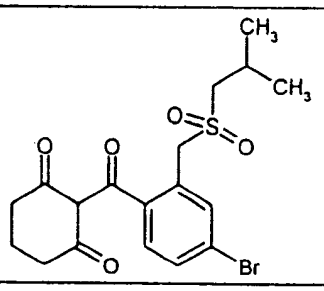
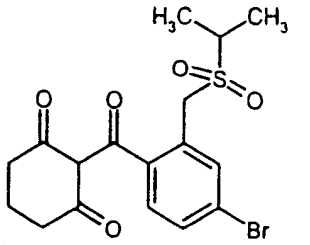
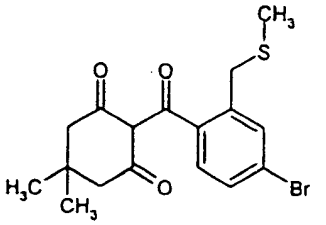
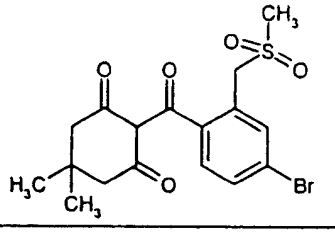
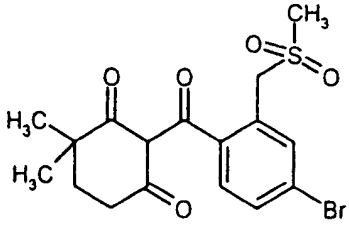
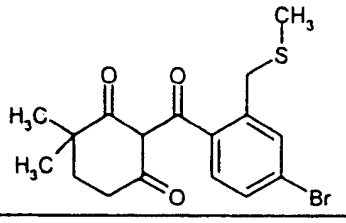
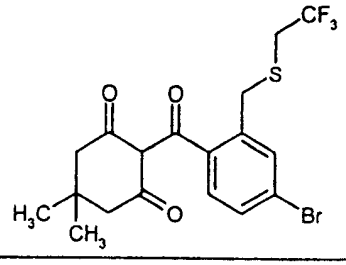
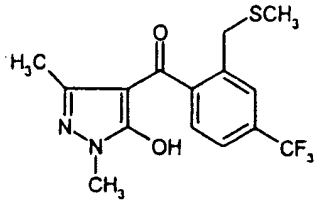
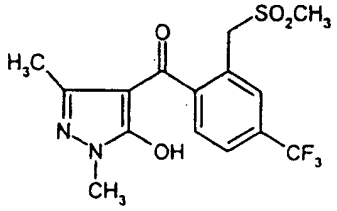
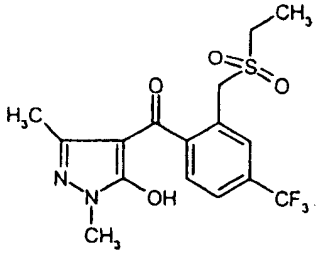
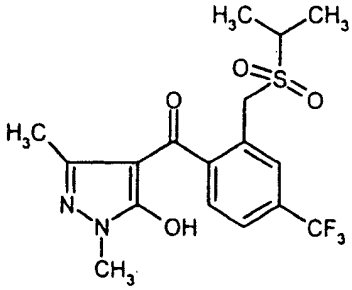
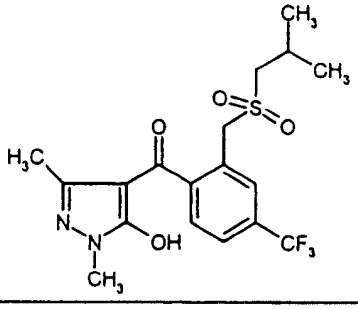
实施例编号	n	R	X	Z	物理数据
28	2	CH_3	CF_3		logP = 2.70 [a)]
29	2	CH_3	CF_3		logP = 2.30 [a)]
30	2	CH_3	CF_3		logP = 2.86 [a)]
31	0	C_2H_5	CF_3		logP = 3.70 [a)]
32	0	C_2H_5	CF_3		logP = 3.36 [a)]
33	2	CH_3	CF_3		logP = 2.42 [a)]
34	2	CH_3	CF_3		logP = 2.17 [a)]

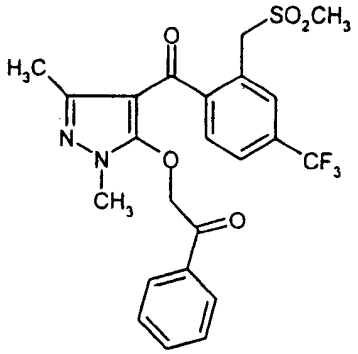
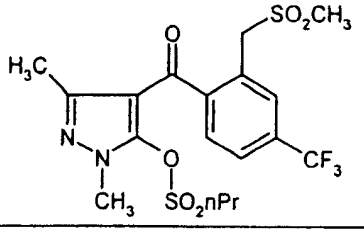
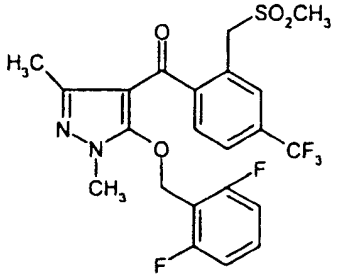
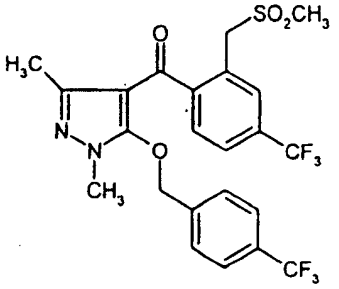
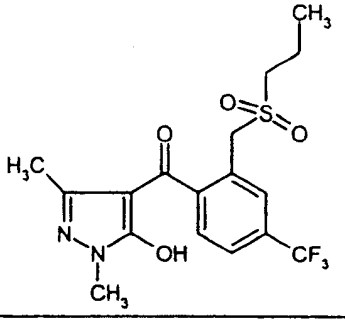
表2

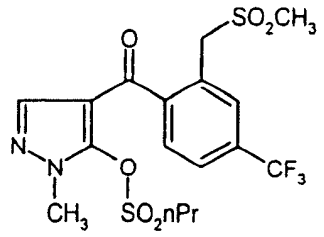
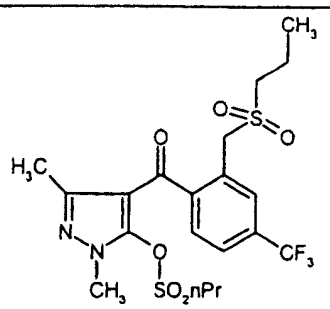
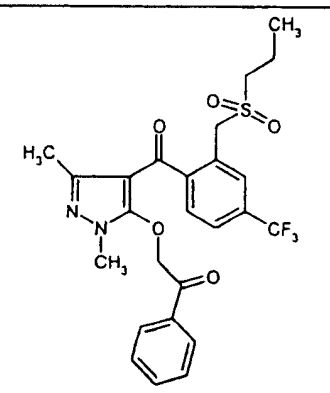
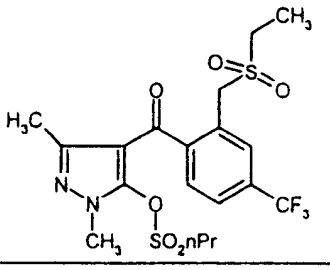
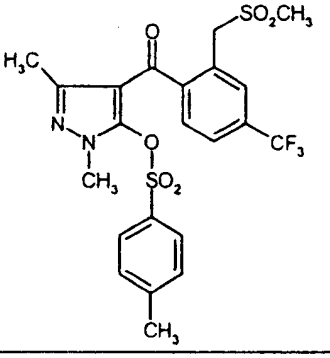
实施例编号	结构	物理数据
35		3.65 ppm
36		4.39 ppm
37		154°C
38		172°C
39		3.70 ppm
40		4.40 ppm
41		3.70 ppm

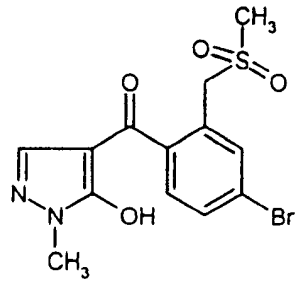
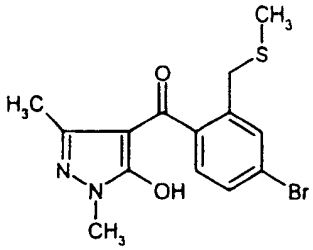
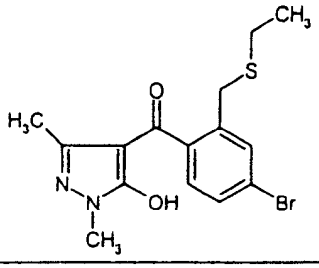
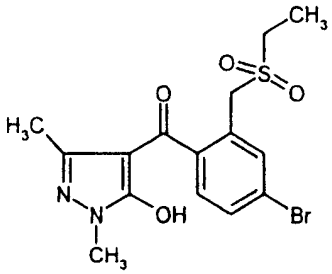
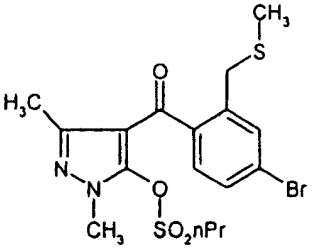
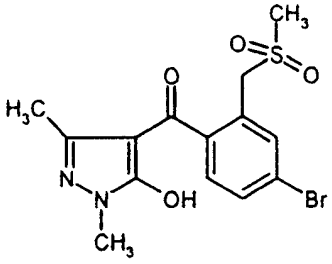
实施例编号	结构	物理数据
42		173.5°C
43		3.62 ppm
44		3.65 ppm
45		4.30 ppm
46		3.80 ppm
47		197°C

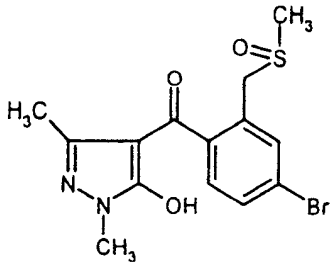
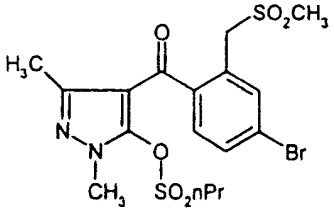
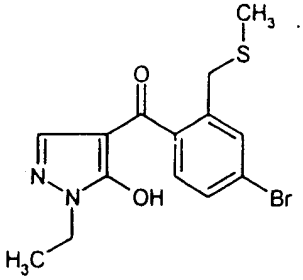
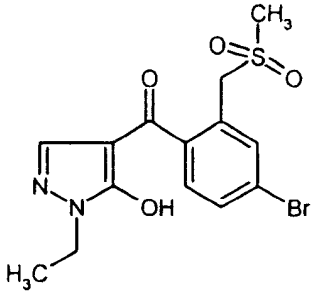
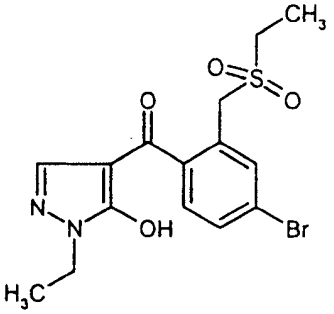
实施例编号	结构	物理数据
48		179 to 181°C
49		4.30 ppm
50		3.62 ppm
51		154°C
52		4.30 ppm
53		3.62 ppm

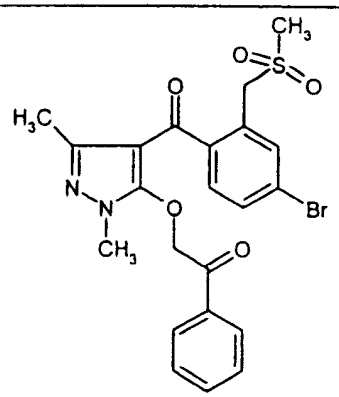
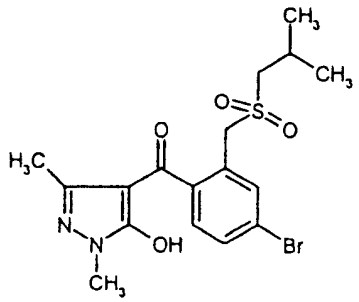
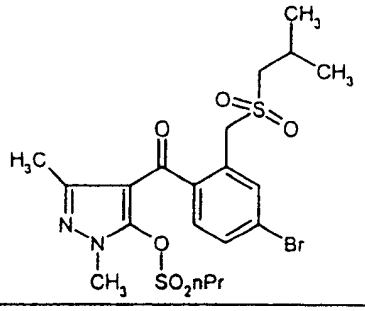
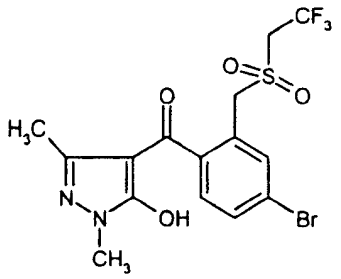
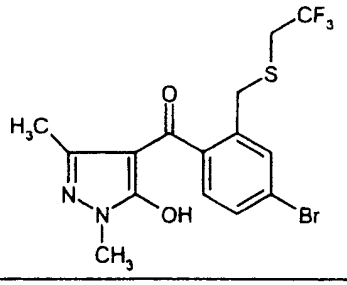
实施例编号	结构	物理数据
54		3.80 ppm
56		3.80 ppm
57		173.5 °C
58		76.5°C
59		78°C
60		60.9°C

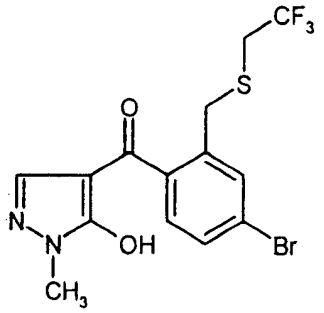
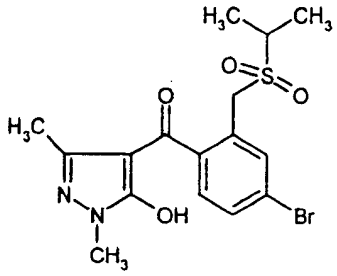
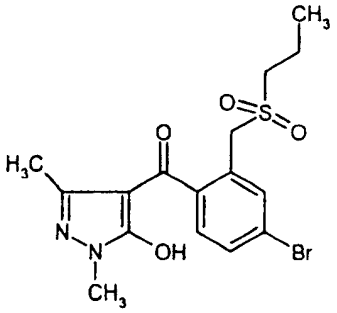
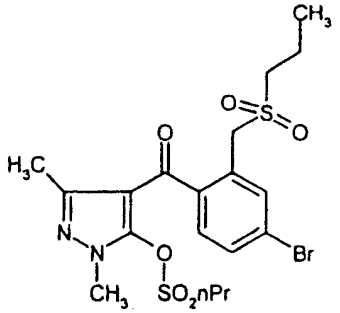
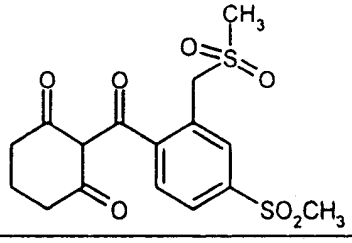
实施例编号	结构	物理数据
61		4.80 ppm
62		4.62 ppm
63		4.80 ppm
64		4.80 ppm
65		65°C

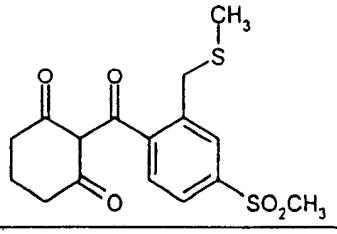
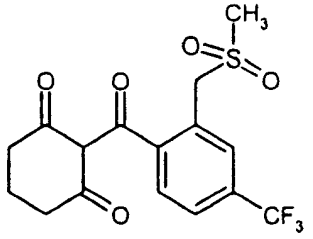
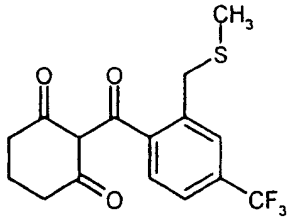
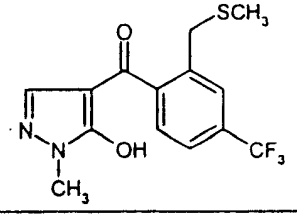
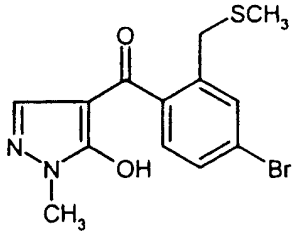
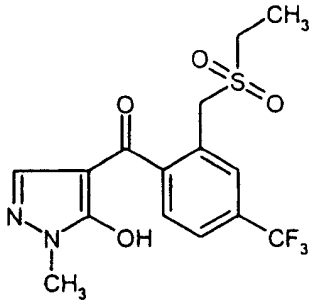
实施例编号	结构	物理数据
66		4.60 ppm
67		4.60 ppm
68		4.70 ppm
69		4.60 ppm
70		175°C

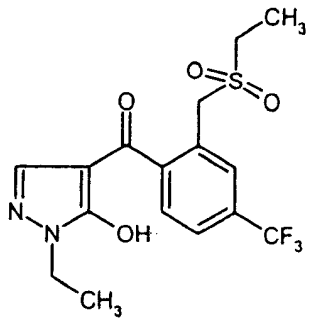
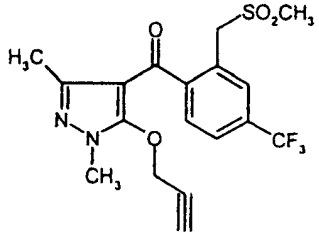
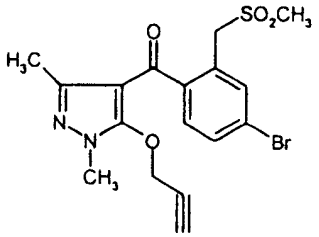
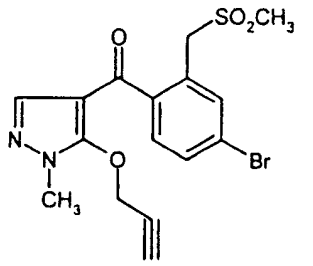
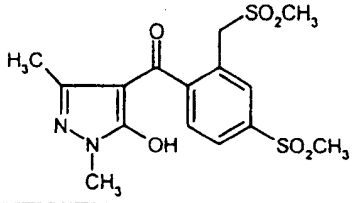
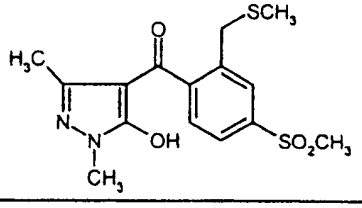
实施例编号	结构	物理数据
71		4.60 ppm
72		123°C
73		3.79 ppm
74		81°C
75		3.80 ppm
76		208 °C

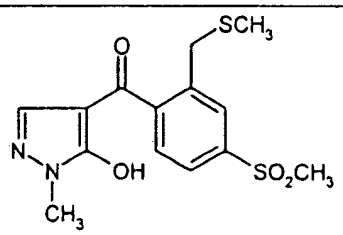
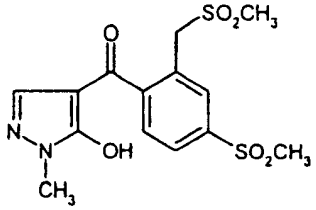
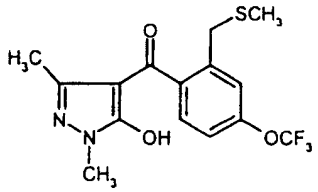
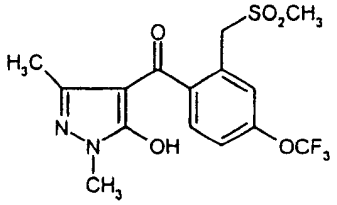
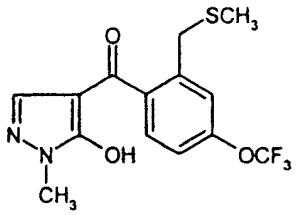
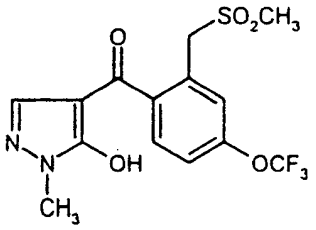
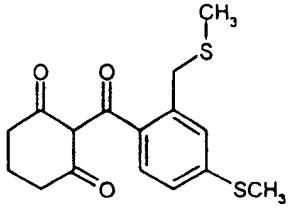
实施例编号	结构	物理数据
77		4.0/4.2 ppm
78		4.50 ppm
79		3.90 ppm
80		4.60 ppm
81		44°C

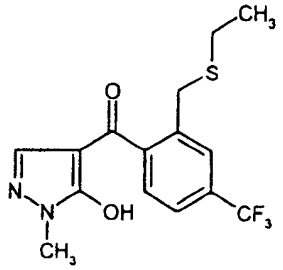
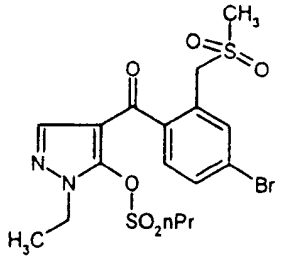
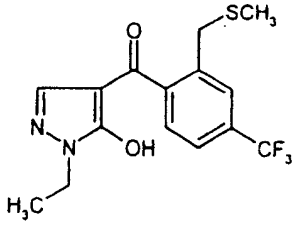
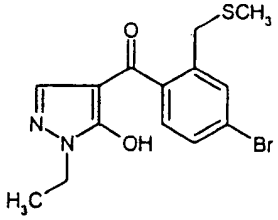
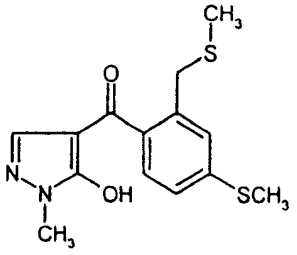
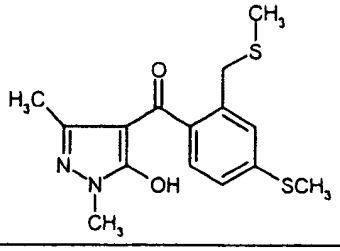
实施例编号	结构	物理数据
82		4.61 ppm
83		169°C
84		51°C
85		4.60 ppm
86		3.90 ppm

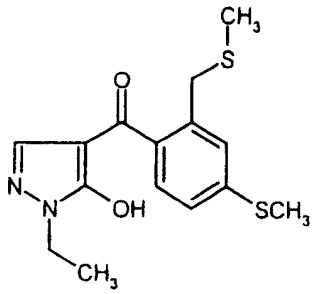
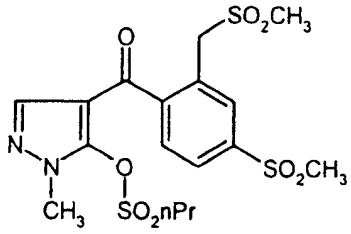
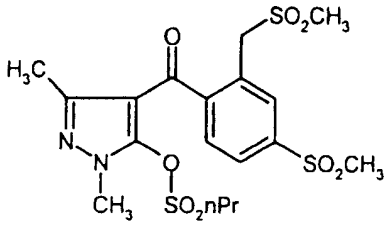
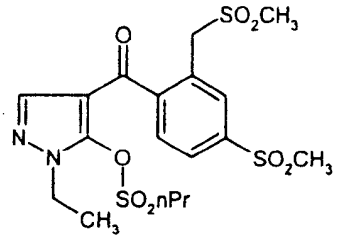
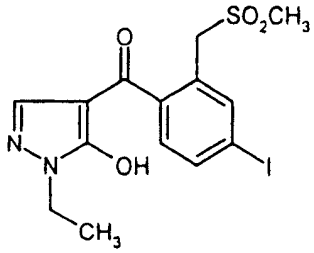
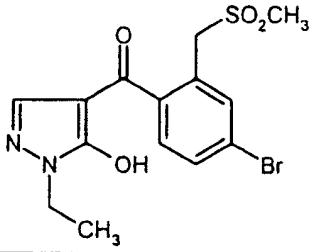
实施例编号	结构	物理数据
87		92°C
88		180°C
89		201°C
90		4.59 ppm
91		

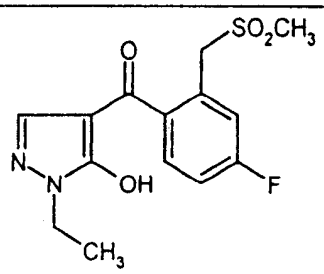
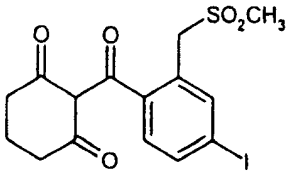
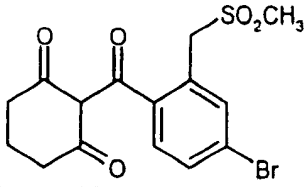
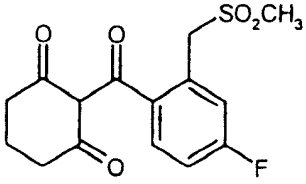
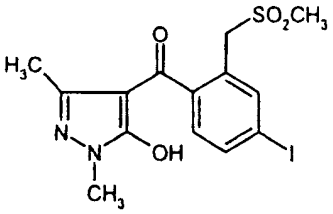
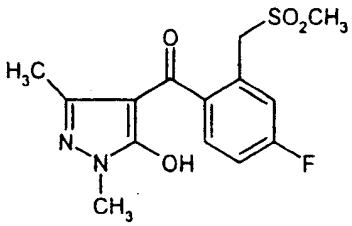
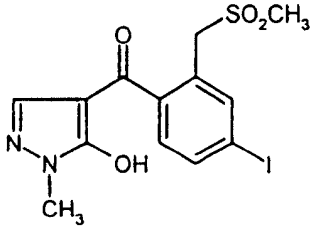
实施例编号	结构	物理数据
92		
93		
94		
95		100°C
96		85°C
97		186°C

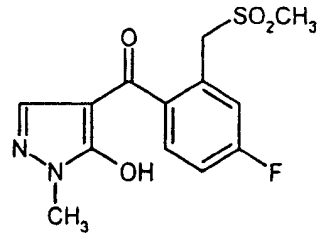
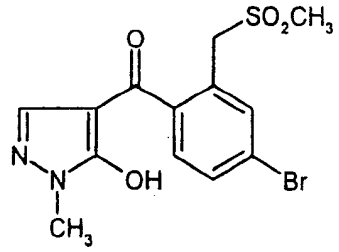
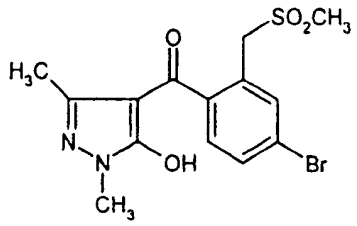
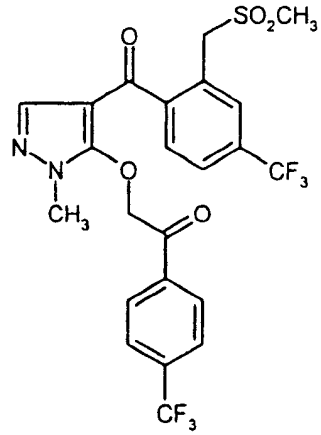
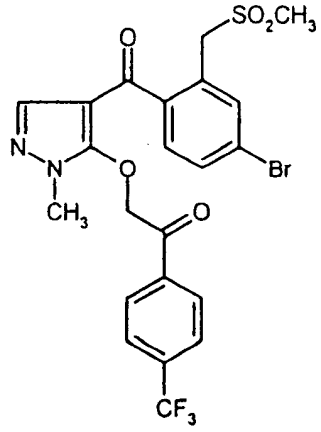
实施例编号	结构	物理数据
98		4.65 ppm
99		
100		
101		4.47 ppm
102		
103		

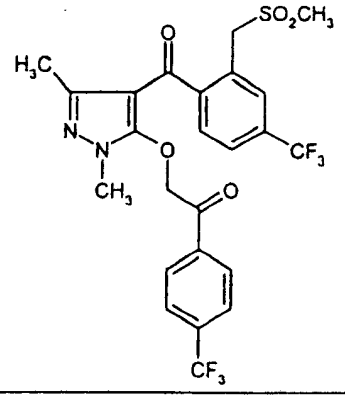
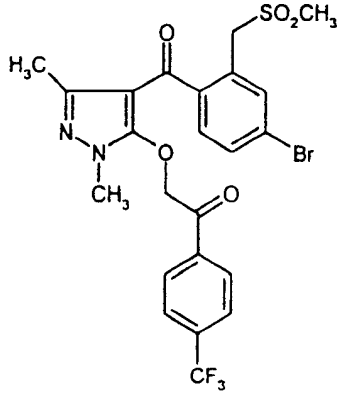
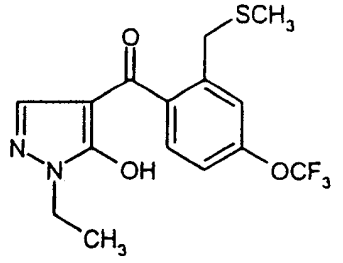
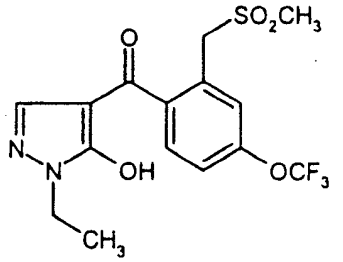
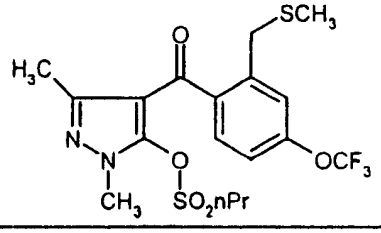
实施例编号	结构	物理数据
104		
105		
106		
107		
108		
109		
110		

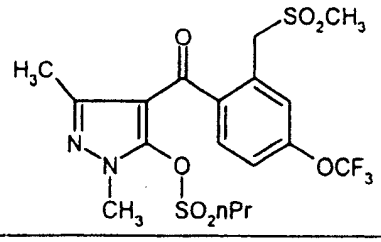
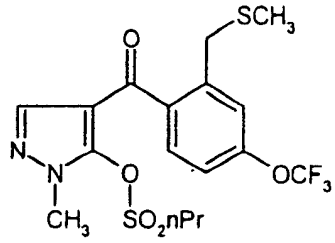
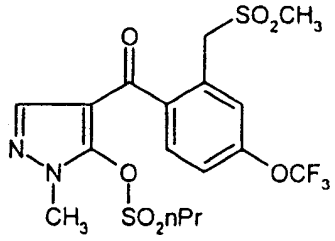
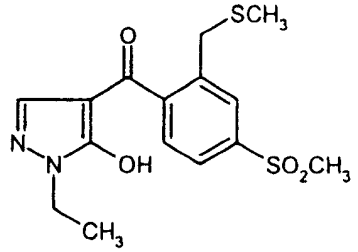
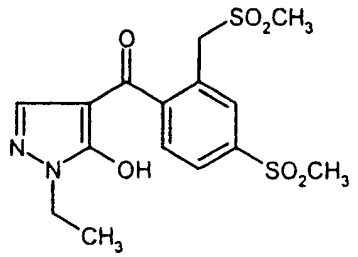
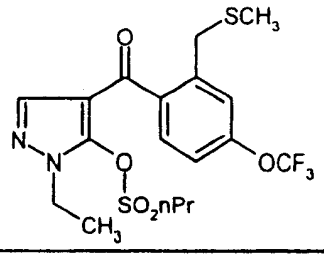
实施例编号	结构	物理数据
111		
112		4.80 ppm
113		
114		
115		
116		

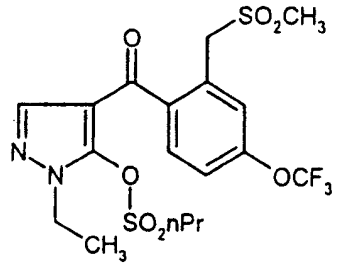
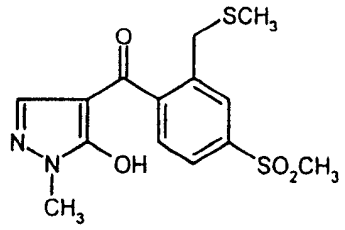
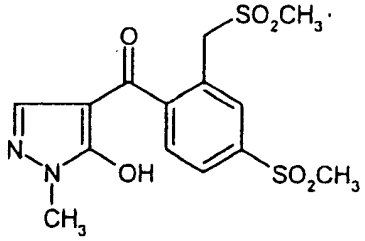
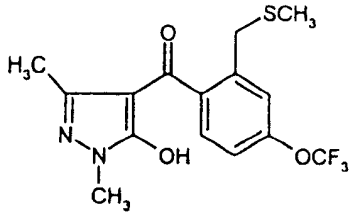
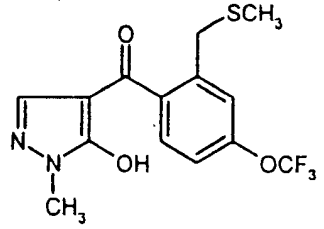
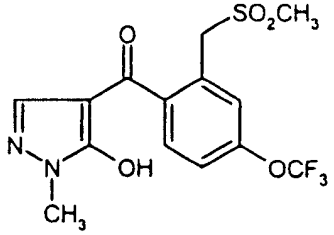
实施例编号	结构	物理数据
117		
118		
119		
120		
121		
122		

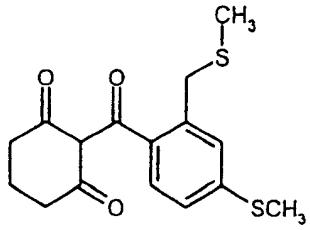
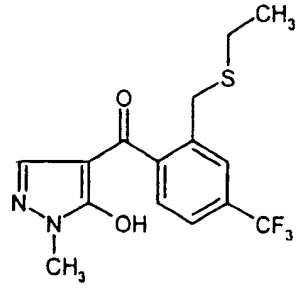
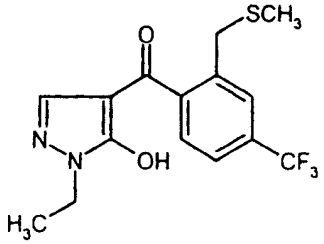
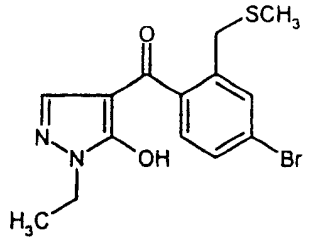
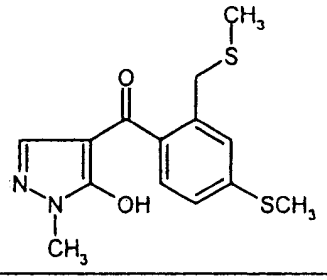
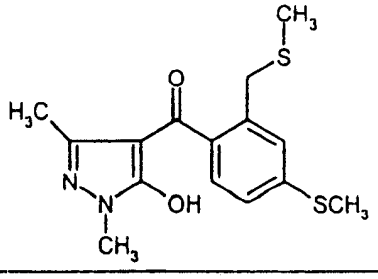
实施例编号	结构	物理数据
123		
124		
125		
126		
127		
128		
129		

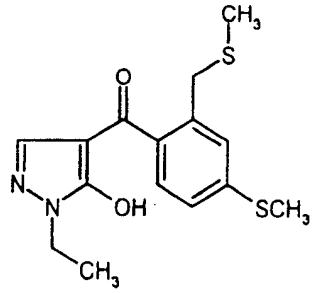
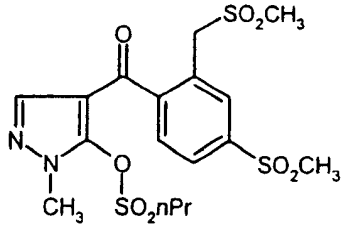
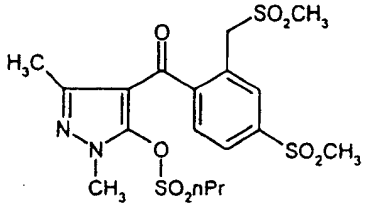
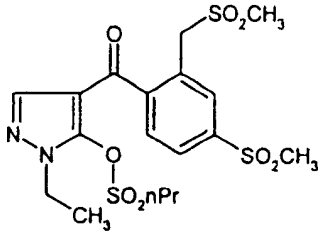
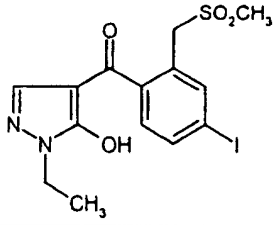
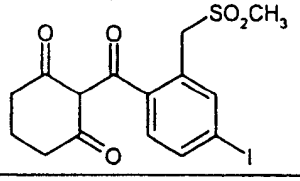
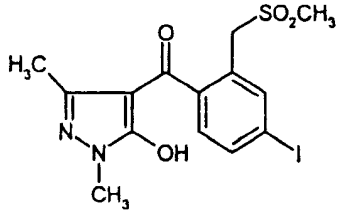
实施例编号	结构	物理数据
130		
131		
132		
133		
134		

实施例编号	结构	物理数据
135		
136		
137		
138		
139		

实施例编号	结构	物理数据
140		
141		
142		
143		
144		
145		

实施例编号	结构	物理数据
146		
147		
148		
149		
150		
151		

实施例编号	结构	物理数据
152		
153		
154		
155		
156		
157		

实施例编号	结构	物理数据
158		
159		
160		
161		
162		
163		
164		

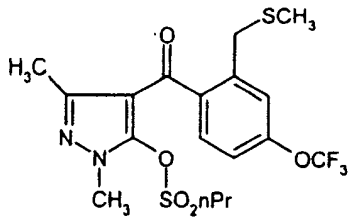
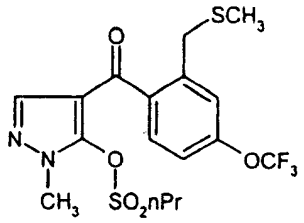
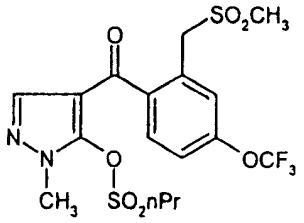
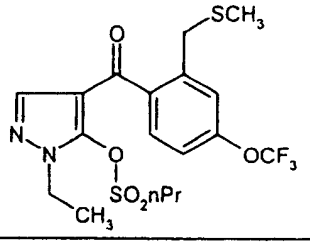
实施例编号	结构	物理数据
165		
166		
167		
168		

表 1 和 2 的纵栏“物理数据”的备注：陈述的是 logP 值、熔点或特征 NMR 信号。

按照 EEC Directive 79/831 附录 V.A 8 通过利用反相柱（C18）温度：43℃的 HPLC（高效液相色谱）测定了在表中给出的 logP 值。

（a）测定酸范围的流动相：0.1%含水磷酸、乙腈；线性梯度从 10%乙腈-90%乙腈—相应的测量数据在表 1 中标记为 a）。

（b）测定中性范围的流动相：0.01 摩尔含水磷酸缓冲液，乙腈；线性梯度从 10%乙腈-90%乙腈—相应的测量数据在表 1 中标记为 b）。

利用具有已知 logP 值的无支链的烷-2-酮（具有 3-16 个碳原子）进行了校准（通过保留时间利用两个连续的烷酮之间的线性内插法来测定 logP 值）。

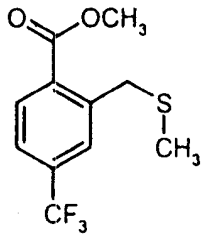
在色谱信号的最大值中利用从 200nm-400nm 的 UV 光谱来测定 λ-最大值。

通过通常的实验室方法在用于熔点测定的毛细管中利用 Büchi 熔点 B-545 仪器测定在表中给出的熔点。熔点以℃叙述。

在 300MHz 仪器中利用溶剂 $CDCl_3$ 测定 ^1H-NMR 数据。陈述的是在中心苯环和基团 $-S(O)_nR$ 之间 CH_2 基团的特征信号。

式（Ⅱ）的起始物质：

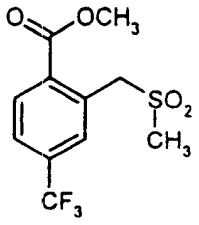
实施例（Ⅱ-1）-步骤 1



将 15 g（50.5 mmol）2-溴甲基-4-三氟甲基苯甲酸甲酯、4.24 g（60.6 mmol）甲基硫醇钠和 100 ml 乙腈的混合物，在搅拌下加热回流 90 分钟。然后将混合物通过硅胶玻璃料抽吸过滤，用石油醚洗涤残留物，并在减压下从滤液小心地蒸馏出溶剂。

得到 12 g（理论值的 90%）2-甲硫基甲基-4-三氟甲基-甲基苯甲酸甲酯。

步骤 2

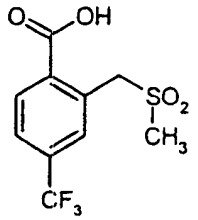


将 12.0 g（45.45 mmol）2-甲硫基甲基-4-三氟甲基苯甲酸甲酯放入 150 ml 醋酸，并在室温在搅拌下逐滴加入 10.2 g 35%浓度的含水过氧化氢溶液（0.10 mol H_2O_2）。在搅拌下，然后将混合物在 100℃加热 90 分钟，然后向其上倾泻入约两倍量的冰。通过抽吸过滤分离

得到结晶产品。

得到 9.1 g（理论值的 68%）的 2-甲基磺酰基甲基-4-三氟甲基苯甲酸甲酯。

步骤 3



将 9.0 g（30.4 mmol）2-甲基磺酰基甲基-4-三氟甲基苯甲酸甲酯、50 ml 40%浓度含水氢氧化钠溶液和 50 ml 水的混合物在 90℃加热 60 分钟。在冷却后，将混合物用水稀释至大约两倍其体积，并用浓缩的盐酸酸化，通过抽吸过滤分离得到晶体的产品。

得到 7.15 g（理论值的 83%）2-甲基磺酰基甲基-4-三氟甲基苯甲酸。

应用实施例:

实施例 A

芽前实验

溶剂: 以重量计 5 份丙酮

乳化剂: 以重量计 1 份烷基芳基聚乙二醇醚

为生产活性化合物的合适的制剂，将以重量计 1 份活性化合物与陈述量的溶剂混合，加入陈述量的乳化剂，并用水将浓度稀释浓缩液至预期的浓度。

将实验植物的种子播种在普通土壤中。在 24 小时后，用活性化合物的制剂喷洒土壤，这样每单位面积应用特定量的预期活性化合物。选择在喷射液体中的活性化合物的浓度，这样以每公顷 1000 升水应用特定量的预期的活性化合物。

在三星期后，与未处理对照的发展相比，对植物损害的程度以%损害评价。数字表示:

0%=无影响（类似未处理对照）

100%=完全破坏

在这一实验中，例如制备实施例 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22 和 23 的化合物显示抗杂草的强效活性，并且它们中的一些被作物例如玉米和大豆良好的耐受。

实施例 B

芽后实验

溶剂: 以重量计 5 份丙酮

乳化剂: 以重量计 1 份烷基芳基聚乙二醇醚

为生产活性化合物的合适的制剂，将以重量计 1 份活性化合物与陈述量的溶剂混合，加入陈述量的乳化剂，并用水将浓缩液稀释至预期的浓度。

用活性化合物的制剂喷洒高度为 5-15cm 的实验植物，这样每单位面积应用特定量的预期活性化合物。选择在喷射液体中的活性化合物的浓度，这样以每公顷 1000 升水中应用特定量的预期的活性化合物。

在三星期后，与未处理对照的发展相比，对植物损害的程度以%损害评估。

数字表示:

0%=无影响（类似未处理对照）

100%=完全破坏

在这一实验中，例如制备实施例 1、2、3、5、18、19、20 和 23 的化合物显示抗杂草的强效活性，并且它们中的一些被作物例如玉米和小麦良好的耐受。