(19)国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 117616017 A
(43)申请公布日 2024.02.27

(21)申请号 202280048412.5
(22)申请日 2022.07.04
(30)优先权数据
21184513.6 2021.07.08 EP
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2024.01.08
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2022/068441 2022.07.04
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2023/280772 DE 2023.01.12
(71)申请人 拜耳公司
地址 德国勒沃库森
(72)发明人 H·阿伦斯 A·科恩 H·詹科比 C·沃尔德拉夫 E·阿斯马斯 B·博伦巴克-沃尔
(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285
专利代理师 杨月 苏萌
(51)Int.Cl.
C07D 271/113(2006.01)
A01P 21/00(2006.01)
A01P 13/00(2006.01)
A01N 43/82(2006.01)

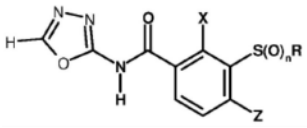
权利要求书2页 说明书55页

(54)发明名称

N-(1,3,4-噁二唑-2-基)苯甲酰胺类除草剂

(57)摘要

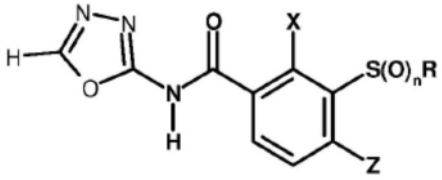
本发明涉及作为除草剂的通式(I)的苯甲酸酰胺类化合物。在该式(I)中,X、R和Z代表如烷基和卤素的基团。



(I)

CN 117616017 A

1.式(I)的苯甲酰胺或其盐



(I)

其中符号和下标定义如下：

X为卤素、(C_1-C_6)-烷基、卤代-(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基、(C_1-C_6)-烷氧基、卤代-(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基或(C_1-C_6)-烷基-$(O)_nS$，

Z为卤代-(C_1-C_6)-烷氧基，

R为(C_1-C_6)-烷基、卤代-(C_1-C_6)-烷基或(C_3-C_6)-环烷基，

n为0、1或2。

2.权利要求1的苯甲酰胺，其中

X为卤素、(C_1-C_6)-烷基、CF_3、(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基或(C_1-C_6)-烷硫基，

Z为卤代-(C_1-C_6)-烷氧基，

R为(C_1-C_6)-烷基或环丙基，

n为0、1或2。

3.权利要求1或2的苯甲酰胺，其中

X为卤素、(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基或(C_1-C_6)-烷硫基，

Z为卤代-(C_1-C_2)-烷氧基，

R为(C_1-C_6)-烷基，

n为0、1或2。

4.权利要求1至3任一项的苯甲酰胺，其中X为F、Cl、Br、Me、Et、MeO、EtO、$MeOCH_2$或MeS，Z为HF_2CO或F_3CO，

R为甲基或乙基，

n为0、1或2。

5.一种除草组合物或植物生长调节组合物，其特征在于它包含一种或多种如权利要求1至4中任一项所述的通式(I)的苯甲酰胺或其盐。

6.如权利要求5所述的除草组合物，其还包括一种制剂助剂。

7.如权利要求5或6所述的除草组合物，其包括至少一种其他活性成分，其选自杀虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂、安全剂和/或生长调节剂。

8.如权利要求5或6所述的除草组合物，其包括安全剂。

9.如权利要求8所述的除草组合物，其中所述安全剂选自吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)、解毒喹(cloquintocet-mexyl)、解草嗪(benoxacor)和二氯丙烯胺(dichlormid)。

10.一种防治不想要的植物的方法，其特征在于将有效量的至少一种如权利要求1至4中任一项所述的式(I)苯甲酰胺或如权利要求5至9中任一项所述的除草组合物施用到植物上或不想要植被的位点。

11.根据权利要求1至4中任一项所述的式(I)的苯甲酰胺或权利要求5至9中任一项所述的除草组合物用于防治不想要的植物的用途。

12.根据权利要求11所述的用途,其特征在于,式(I)的苯甲酰胺用于防治有用植物作物中的不想要的植物。

13.根据权利要求12所述的用途,其特征在于所述有用植物是转基因有用植物。

N-(1,3,4-噁二唑-2-基)苯甲酰胺类除草剂

[0001] 本发明涉及除草剂的技术领域,尤其涉及用于选择性防治有用植物中的阔叶杂草和禾本科杂草(weed grass)的除草剂的技术领域。

[0002] WO 2012/126932 A1、WO 2017/144402 A1和WO 2018/177871 A1中描述的主题包括具有除草作用的苯甲酰胺,它们在酰胺基团的氮原子上带有任选取代的1,3,4-噁二唑。WO 2021094505 A1描述了具有除草活性的苯甲酰胺,它们在苯环的4位上带有一个卤代烷氧基,酰胺基团氮原子上带有的取代基之一为取代的1,3,4-噁二唑。

[0003] 然而,从这些文献中已知的苯甲酰胺并不总为具有充分的除草功效和/或与作物植物的相容性。研究发现,苯甲酰胺

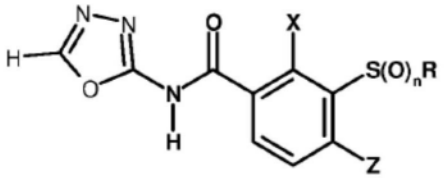
[0004] -在酰胺基团的氮原子上带有未取代的1,3,4-噁二唑、

[0005] -苯环的4位上带有卤代烷氧基

[0006] -在苯环的5和6位上未被取代

[0007] 与现有技术中已知的苯甲酰胺相比,具有更优异的性能。

[0008] 因此,本发明提供了式(I)的苯甲酰胺或其盐类

[0009] 

(I)

[0010] 其中符号和下标定义如下:

[0011] X为卤素、(C_1-C_6)-烷基、卤代-(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基、(C_1-C_6)-烷氧基、卤代-(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基或(C_1-C_6)-烷基-$(O)_nS$,

[0012] Z为卤代-(C_1-C_6)-烷氧基,

[0013] R为(C_1-C_6)-烷基、卤代-(C_1-C_6)-烷基或(C_3-C_6)-环烷基,

[0014] n为0、1或2。

[0015] 在式(I)和之后所有的式中,具有多于两个碳原子的烷基可以为直链或支链。烷基例如可以为甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基或2-丁基、戊基、己基(如正己基、异己基和1,3-二甲基丁基)。同样,烯基例如可以为烯丙基、1-甲基丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、1-甲基丁-3-烯-1-基和1-甲基丁-2-烯-1-基。炔基,例如丙炔基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、1-甲基丁-3-炔-1-基。多键可位于各不饱和基的任何位置。环烷基为具有三至六个碳原子的碳环饱和环系统,例如环丙基、环丁基、环戊基或环己基。卤素取代的烷基意指直链或支链烷基,这些基团中的部分或全部氢原子可被卤素原子取代,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、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2-二氟乙基、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。

[0016] 卤素代表氟、氯、溴或碘。

[0017] 杂环基团(杂环基)为一种5或6元环基,其除碳原子外还含有至少一个来自N、O、S

组的杂原子,并且其为饱和的、不饱和的、部分饱和的或杂芳族的且可以为未取代或取代的,在这种情况下,键合位点位于环原子上。杂环基团的实例有1-或2-或3-吡咯烷基、3,4-二氢-2H-吡咯-2-或3-基、2,3-二氢-1H-吡咯-1-或2-或3-或4-或5-基;2,5-二氢-1H-吡咯-1-或2-或3-基、1-或2-或3-或4-哌啶基;2,3,4,5-四氢吡啶-2-或3-或4-或5-或6-基;1,2,3,6-四氢吡啶-1-或2-或3-或4-或5-或6-基;1,2,3,4-四氢吡啶-1-或2-或3-或4-或5-或6-基;1,4-二氢吡啶-1-或2-或3-或4-基;2,3-二氢吡啶-2-或3-或4-或5-或6-基;2,5-二氢吡啶-2-或3-或4-或5-或6-基,1-或2-或3-或4-氮杂环庚烷基,2-或3-氧杂环戊烷基(=2-或3-四氢呋喃基);2,3-二氢呋喃-2-或3-或4-或5-基;2,5-二氢呋喃-2-或3-基、2-或3-或4-氧杂环戊基(=2-或3-或4-四氢吡喃基);3,4-二氢-2H-吡喃-2-或3-或4-或5-或6-基;3,6-二氢-2H-吡喃-2-或3-或4-或5-或6-基;2H-吡喃-2-或3-或4-或5-或6-基;4H-吡喃-2-或3-或4-基、2-或3-或4-氧杂环庚烷基;2-或3-四氢噻吩;2,3-二氢噻吩-2-或3-或4-或5-基;2,5-二氢噻吩-2-或3-基;四氢-2H-噻喃-2-或3-或4-基;3,4-二氢-2H-噻喃-2-或3-或4-或5-或6-基;3,6-二氢-2H-噻喃-2-或3-或4-或5-或6-基;2H-噻喃-2-或3-或4-或5-或6-基;4H-噻喃-2-或3-或4-基;1-或2-或3-或4-吡唑烷基;4,5-二氢-3H-吡唑-3-或4-或5-基;4,5-二氢-1H-吡唑-1-或3-或4-或5-基;2,3-二氢-1H-吡唑-1-或2-或3-或4-或5-基;1-或2-或3-或4-咪唑烷基;2,3-二氢-1H-咪唑-1-或2-或3-或4-基;2,5-二氢-1H-咪唑-1-或2-或4-或5-基;4,5-二氢-1H-咪唑-1-或2-或4-或5-基;六氢哒嗪-1-或2-或3-或4-基;1,2,3,4-四氢哒嗪-1-或2-或3-或4-或5-或6-基;1,2,3,6-四氢哒嗪-1-或2-或3-或4-或5-或6-基;1,4,5,6-四氢哒嗪-1-或3-或4-或5-或6-基;3,4,5,6-四氢哒嗪-3-或4-或5-基;4,5-二氢哒嗪-3-或4-基;3,4-二氢哒嗪-3-或4-或5-或6-基;3,6-二氢哒嗪-3-或4-基;1,6-二氢哒嗪-1-或3-或4-或5-或6-基;六氢嘧啶-1-或2-或3-或4-基;1,4,5,6-四氢嘧啶-1-或2-或4-或5-或6-基;1,2,5,6-四氢嘧啶-1-或2-或4-或5-或6-基;1,2,3,4-四氢嘧啶-1-或2-或3-或4-或5-或6-基;1,6-二氢嘧啶-1-或2-或4-或5-或6-基;1,2-二氢嘧啶-1-或2-或4-或5-或6-基;2,5-二氢嘧啶-2-或4-或5-基;4,5-二氢嘧啶-4-基或5-或6-基;1,4-二氢嘧啶-1-或2-或4-或5-或6-基;1-或2-或3-哌嗪基;1,2,3,6-四氢吡嗪-1-或2-或3-或5-或6-基;1,2,3,4-四氢吡嗪-1-或2-或3-或4-或5-或6-基;1,2-二氢吡嗪-1-或2-或3-或5-或6-基;1,4-二氢吡嗪-1-或2-或3-基;2,3-二氢吡嗪-2-基或3-基或5-基或6-基;2,5-二氢吡嗪-2-或3-基;1,3-二氧戊环-2-或4-或5-基;1,3-二噁茂-2-或4-基;1,3-二噁烷-2-或4-或5-基;4H-1,3-二噁英-2-或4-或5-或6-基;1,4-二噁烷-2-基或3-基或5-基或6-基;2,3-二氢-1,4-二噁英-2-或3-或5-或6-基;1,4-二噁英-2-或3-基;1,2-二硫杂环戊烷-3-或4-基;3H-1,2-二硫醇-3-或4-或5-基;1,3-二硫杂环戊烷-2-或4-基;1,3-二硫醇-2-或4-基;1,2-二噻烷-3-或4-基;3,4-二氢-1,2-二噻嗪-3-或4-或5-或6-基;3,6-二氢-1,2-二噻嗪-3-或4-基;1,2-二噻嗪-3-或4-基;1,3-二噻烷-2-或4-或5-基;4H-1,3-二噻嗪-2-或4-或5-或6-基;异噁唑烷-2-或3-或4-或5-基;2,3-二氢异噁唑-2-或3-或4-或5-基;2,5-二氢异噁唑-2-或3-或4-或5-基;4,5-二氢异噁唑-3-或4-或5-基;1,3-噁唑烷-2-或3-或4-或5-基;2,3-二氢-1,3-噁唑-2-或3-或4-或5-基;2,5-二氢-1,3-噁唑-2-或4-或5-基;4,5-二氢-1,3-噁唑-2-或4-或5-基;1,2-噁嗪烷-2-或3-或4-或5-或6-基;3,4-二氢-2H-1,2-噁嗪-2-或3-或4-或5-或6-基;3,6-二氢-2H-1,2-噁嗪-2-或3-或4-或5-或6-基;5,6-二氢-2H-1,2-噁嗪-2-或3-或4-或5-或6-基;5,6-二氢-4H-1,2-噁嗪-3-或4-或5-或6-基;2H-1,2-噁嗪-2-或3-或4-或5-

或6-基;6H-1,2-噁嗪-3-或4-或5-或6-基;4H-1,2-噁嗪-3-或4-或5-或6-基;1,3-噁嗪烷-2-或3-或4-或5-或6-基;3,4-二氢-2H-1,3-噁嗪-2-或3-或4-或5-或6-基;3,6-二氢-2H-1,3-噁嗪-2-或3-或4-或5-或6-基;5,6-二氢-2H-1,3-噁嗪-2-或4-或5-或6-基;5,6-二氢-4H-1,3-噁嗪-2-或4-或5-或6-基;2H-1,3-噁嗪-2-或4-或5-或6-基;6H-1,3-噁嗪-2-或4-或5-或6-基;4H-1,3-噁嗪-2-或4-或5-或6-基;吗啉-2-或3-或4-基;3,4-二氢-2H-1,4-噁嗪-2-或3-或4-或5-或6-基;3,6-二氢-2H-1,4-噁嗪-2-或3-或5-或6-基;2H-1,4-噁嗪-2-或3-或5-或6-基;4H-1,4-噁嗪-2-或3-基;异噻唑烷-2-或3-或4-或5-基;2,3-二氢异噻唑-2-或3-或4-或5-基;2,5-二氢异噻唑-2-或3-或4-或5-基;4,5-二氢异噻唑-3-或4-或5-基;1,3-噻唑烷-2-或3-或4-或5-基;2,3-二氢-1,3-噻唑-2-或3-或4-或5-基;2,5-二氢-1,3-噻唑-2-或4-或5-基;4,5-二氢-1,3-噻唑-2-或4-或5-基;、1,3-噻嗪烷-2-或3-或4-或5-或6-基;3,4-二氢-2H-1,3-噻嗪-2-或3-或4-或5-或6-基;3,6-二氢-2H-1,3-噻嗪-2-或3-或4-或5-或6-基;5,6-二氢-2H-1,3-噻嗪-2-或4-或5-或6-基;5,6-二氢-4H-1,3-噻嗪-2-或4-或5-或6-基;2H-1,3-噻嗪-2-或4-或5-或6-基;6H-1,3-噻嗪-2-或4-或5-或6-基;4H-1,3-噻嗪-2-或4-或5-或6-基;4,2-二噁唑烷-2-或-3-或5-基;1,4,2-二噁唑-3-或5-基;1,4,2-二噁嗪烷-2-或-3-或5-或6-基;5,6-二氢-1,4,2-二噁嗪-3-或5-或6-基;1,4,2-二噁嗪-3-或5-或6-基。

[0018] 根据取代基的性质和连接方式的不同,通式(I)化合物可能存在立体异构体。例如,如果存在一个或多个不对称取代的碳原子,则可能存在对映体和非对映体。当n为1时,同样会出现立体异构体(亚砜)。立体异构体可以通过惯用的分离方法,例如色谱分离过程,从制备过程中得到的混合物中获得。同样,也可以通过使用光学活性起始材料和/或辅助剂的立体选择性反应,选择性地制备立体异构体。本发明还涉及通式(I)所包含的但未具体定义的所有立体异构体及其混合物。

[0019] 式(I)化合物可形成盐。例如,合适的碱为有机胺,如三烷基胺、吗啉、哌啶或吡啶,以及铵、碱金属或碱土金属的氢氧化物、碳酸盐和碳酸氢盐,特别为氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠和碳酸氢钾。这些盐为酸性氢被农业上适用的阳离子取代的化合物,例如金属盐,特别为碱金属盐或碱土金属盐,尤其为钠盐和钾盐,或者铵盐、有机胺盐或季铵盐,例如具有式$[NRR'R'R''''']^+$的阳离子,其中R至R''''分别独立地为有机基,尤其为烷基、芳基、芳烷基或烷芳基。烷基锍盐和烷基氧化锍盐也为有用的,如(C_1-C_4)-三烷基锍盐和(C_1-C_4)-三烷基氧化锍盐。

[0020] 优选通式(I)的化合物,其中符号和下标定义如下:

[0021] X为卤素、(C_1-C_6)-烷基、CF_3、(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基或(C_1-C_6)-烷硫基,

[0022] Z为卤代-(C_1-C_6)-烷氧基,

[0023] R为(C_1-C_6)-烷基或环丙基,

[0024] n为0、1或2。

[0025] 特别优选通式(I)的化合物,其中符号和下标定义如下:

[0026] X为卤素、(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基或(C_1-C_6)-烷硫基;

[0027] Z为卤代-(C_1-C_2)-烷氧基;

[0028] R为(C_1-C_6)-烷基;

[0029] n为0、1或2。

[0030] 尤其特别优选通式(I)的化合物,其中符号和下标定义如下:

[0031] X为F、Cl、Br、Me、Et、MeO、EtO、$MeOCH_2$或MeS,

[0032] Z为HF_2CO或F_3CO,

[0033] R为甲基或乙基,

[0034] n为0、1或2。

[0035] 本发明的化合物例如可通过WO2012/126932A1、WO2017/144402A1、WO2018/177871A1和WO2021094505A1中指明的方法制备。相应的苯甲酰氯、苯甲酸酯或其母体苯甲酸原则上为已知的,例如可以通过WO2021094505A1中描述的方法制备。下面描述的工作实例进一步阐明了本发明化合物的制备方法。

[0036] 各反应混合物的后处理通常采用已知的方法进行,例如通过结晶法、水提取后处理,通过色谱法或这些方法的组合。

[0037] 可通过上述反应合成的式(I)化合物和/或其盐的集合也可以并行方式制备,在这种情况下,可以通过手动、部分自动或全自动方式完成。例如,反应的进行、产物和/或中间产物的后处理或纯化都可以实现自动化。总之,这可以理解为例如D.Tiebes在Combinatorial Chemistry-Synthesis、Analysis、Screening(编辑:Günther Jung),Wiley,1999年,第1页至第34页中所描述的程序。

[0038] 式(I)的本发明的化合物(和/或其盐)在下文中统称为"本发明的化合物",对广谱的经济上重要的单子叶和双子叶一年生有害植物具有优异的除草效果。

[0039] 因此,本发明还提供了一种防治不想要的植物或调节植物生长的方法,优选为在植物作物中,其中将一种或多种本发明的化合物施用于植物(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(例如谷物、种子或无性繁殖体,如块茎或带芽的嫩枝部分)或植物生长的区域(例如栽培区域)。例如,本发明的化合物可以在播种前(如果合适,也可以掺入土壤中)、出苗前或出苗后施用。本发明化合物可控制的单子叶和双子叶杂草群的一些代表的具体例子如下,而以下的列举并不限定于特定种类。

[0040] 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)、Apera属、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)。

[0041] 以下属的双子叶杂草:苘麻属(Abutilon)、苋属(Amaranthus)、豚草属(Ambrosia)、Anoda属、春黄菊属(Anthemis)、Aphanes属、艾属(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属、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)、菥蓂属(Thlaspi)、车轴草属(Trifolium)、荨麻属(Urtica)、婆婆纳属(Veronica)、堇菜属(Viola)、苍耳属(Xanthium)。

[0042] 当本发明的化合物在发芽前施用于土壤表面时,要么完全阻止杂草幼苗萌发,要么杂草生长至子叶期,但随后停止生长。

[0043] 如果在出苗后将活性成分施用于植物的绿色部分,则在处理后停止生长,有害植物仍处于施药时的生长阶段,或在一定时间后完全死亡,这样就能很早并以持续方式消除对作物植物为有害的杂草的竞争。

[0044] 本发明的化合物可以选择性地用于有用植物的作物,也可以用作非选择性除草剂。

[0045] 由于这些活性成分具有除草和调节植物生长的特性,也可用于防治已知或尚未开发的转基因植物作物中的有害植物。一般来说,转基因植物具有特殊的优势特性,例如对农用化学工业中使用的某些活性成分(特别为某些除草剂)具有抗性,对植物病害或植物病害的病原体(如某些昆虫或微生物,如真菌、细菌或病毒)具有抗性。其他具体特征例如与收获物的数量、质量、贮藏性、组成和特定成分有关。例如,已知的转基因植物具有增加的淀粉含量或改变的淀粉质量,或者收获物中具有不同的脂肪酸组成。其他特殊性能还在于对非生物胁迫因素(如热、冷、干旱、盐度和紫外线辐射)的耐受性或抗性。

[0046] 优选将本发明的式(I)化合物或其盐用于经济上重要的有用和观赏植物的转基因作物中。

[0047] 式(I)化合物可作为除草剂用于对除草剂的植物毒性作用具有抗性或通过基因工程使其具有抗性的有用植物的作物中。

[0048] 生产与现有植物相比性质有所改变性能的新型植物的传统方法包括例如传统的栽培方法和产生突变体。或者,还可以借助重组方法(例如,见EP 0221044、EP 0131624)培育出具有改变特性的新型植物。例如,已经描述了几例为了改变植物合成的淀粉而对作物植物进行基因改造的案例(如WO 92/011376A、WO 92/014827A、WO 91/019806A),以及对以下除草剂具有抗性的转基因作物植物:对某些草铵膦类除草剂(例如,参见EP 0242236 A、EP 0242246 A)或草甘膦类除草剂(WO 92/000377A)或磺酰脲类除草剂(EP 0257993 A、US 5,013,659),或通过"基因叠加"对这些除草剂的结合物或混合物具有抗性的转基因作物植物,例如转基因作物植物,如商品名或名称为OptimumTM GATTM(耐草甘膦ALS)的玉米或大豆。

[0049] -能产生苏云金芽孢杆菌毒素(Bt毒素)的转基因作物植物,例如棉花,其能使植物抵抗特定害虫(EP 0142924 A、EP 0193259 A),

[0050] -具有改良脂肪酸成分的转基因作物(WO 91/013972A),

[0051] -具有新型成分或次生代谢物(例如新型植物毒素)的转基因作物植物,其可产生抗病性提高(EP 0309862 A、EP 0464461 A),

[0052] -光呼吸量减少的转基因植物,其产量更高,抗逆性更强(EP 0305398A);

[0053] -转基因作物植物,其可生产具有药用或诊断上重要的蛋白质(“分子制药”)、

[0054] -转基因作物植物,其特征为产量更高或质量更好,

[0055] -转基因作物植物,其区别例如为上述新特性的组合(“基因叠加”)。

[0056] 可用于生产具有改良特性的新型转基因植物的许多分子生物学技术原则上是已知的;例如,参见I.Potrykus和G.Spangenberg(编辑),Gene Transfer to Plants,Springer Lab Manual(1995年),Springer Verlag Berlin、Heidelberg或Christou,“Trends in Plant Science”1(1996年)423-431)。

[0057] 为了进行此类遗传操作,可将允许通过DNA序列重组进行诱变或序列改变的核酸分子引入质粒中。例如,借助标准方法,可以进行碱基交换、删除部分序列或添加天然或合成序列。为了使DNA片段彼此连接,可以在片段上添加适配物或连接体;例如,参见Sambrook等人,1989年,Molecular Cloning、A Laboratory Manual,第二版,Cold Spring Harbor Laboratory Press,Cold Spring Harbor,NY;或Winnacker“Gene und Klone”[Genes and Clones],VCH Weinheim,第二版,1996年。

[0058] 例如,基因产物活性降低的植物细胞的产生可以通过下列方法实现: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能够特异性切割上述基因产物的转录物的有合适结构的核酶。为此目的,可以首先使用包括基因产物的完整编码序列——包括所有可能存在的侧翼序列——的DNA分子,也可以使用仅含有部分编码序列的DNA分子,在这种情况下,所述部分必须足够长,以便在细胞中产生反义效果。也可以使用与所述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。

[0059] 当在植物中表达核酸分子时,所合成的蛋白可被定位至植物细胞的任何所需的区室中。然而,为了将其定位于某一特定区室,可以例如将编码区与确保在某一特定区室中定位的DNA序列相连接。这种序列为本领域中技术人员已知的(参见例如Braun等人,EMBO J.11(1992),3219-3227;Wolter等人,Proc.Natl.Acad.Sci.USA 85(1988),846-850;Sonnewald等人,Plant J.1(1991),95-106)。核酸分子也可以在植物细胞中的细胞器中表达。

[0060] 可以使用已知的技术使转基因植物细胞再生以产生完整的植物。原则上,所述转基因植物可为任何所需的植物种类的植物,即既可为单子叶植物,也可为双子叶植物。通过这种方法可以获得转基因植物,其特性因同源(=天然)基因或基因序列的过度表达、阻遏或抑制,或异源(=外来)基因或基因序列的表达而发生改变。

[0061] 本发明的化合物(I)优选用于转基因作物中,所述转基因作物对生长调节剂例如2,4-D、麦草畏具有抗性,或者对抑制重要的植物酶(例如乙酰乳酸合成酶(ALS)、EPSP合成酶、谷氨酰胺合成酶(GS)或羟基苯丙酮酸双加氧酶(HPPD))的除草剂具有抗性,或者对选自磺酰脲、草甘膦、草铵磷或苯甲酰基异噁唑以及类似的活性化合物的除草剂或这些活性成

分的任意组合具有抗性。

[0062] 本发明的化合物特别优选用于抗草甘膦和草铵膦组合、草甘膦和磺酰脲类或咪唑啉酮类的转基因作物植物。最优选的为,本发明的化合物可用于转基因作物植物,例如商品名或名称为OptimumTM GATTM(耐草甘膦ALS)的玉米或大豆。

[0063] 在转基因作物中使用本发明的活性成分时,不仅会出现在其它作物中观察到的对有害植物的效果,而且还经常出现在特定转基因作物中应用时特有的效果,例如,可以防治的杂草谱改变或特别增宽,可用于施用的施用率的改进,优选地与转基因作物对其有抗性的除草剂的更良好的相容性,以及对转基因作物植株的生长和产量的影响。

[0064] 因此本发明还涉及本发明的式(I)化合物作为除草剂用于防治转基因作物植物中的有害植物的用途。

[0065] 本发明的化合物可以以常规剂型施用,所述常规剂型的形式有可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、可喷洒溶液剂、粉剂或颗粒剂。因此,本发明还涉及含有本发明的化合物的除草和植物生长调节组合物。

[0066] 根据所需的生物学和/或物理化学参数,可通过多种方式配制本发明的化合物。合适的制剂的实例包括,例如:可湿性粉剂(WP)、水溶性粉剂(SP)、水溶性浓缩剂、可乳化浓缩剂(EC)、乳剂(EW)例如水包油乳剂和油包水乳剂、可喷洒性溶液、悬浮浓缩剂(SC)、油基分散剂或水基分散剂、油混溶性溶液、胶囊悬浮剂(CS)、粉剂(DP)、拌种产品、用于撒播和土壤施用的颗粒剂、微颗粒形式的颗粒剂(GR)、喷洒颗粒剂、吸收和吸附颗粒剂、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。这些制剂的各个类型原则上都为已知的,并在下列文献中有所描述,例如:Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”[Chemical Technology],卷7,C.Hauser 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。

[0067] 必需的制剂助剂,例如惰性物质、表面活性剂、溶剂和其他添加剂同样也为已知的,并在下列文献中有所描述,例如:Watkins,“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”,第二版,Darland Books、Caldwell N.J.;H.v.Olphen,“Introduction to Clay Colloid Chemistry”,第二版,J.Wiley&Sons、N.Y.;C.Marsden,“Solvents Guide”,第二版,Interscience、N.Y.1963;McCutcheon,“Detergents and Emulsifiers Annual”,MC Publ.Corp.,Ridgewood N.J.;Sisley and Wood,“Encyclopedia of Surface Active Agents”,Chem.Publ.Co.Inc.、N.Y.1964;

Schönfeldt , “ Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte”

[Interface-active ethylene oxide adducts],Wiss.Verlagsgesell.,Stuttgart1976;Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”,第7卷,C.Hanser Verlag Munich,第四版,1986。

[0068] 基于上述制剂,可以生产与其它农药活性物质——例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂和杀菌剂——以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物,例如以成品制剂或桶混形式。

[0069] 可以用于本发明的化合物以混合制剂或桶混形式的结合配对物为例如已知活性化合物,基于抑制例如以下物质:乙酰乳酸合成酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合成酶、烯醇

式丙酮酰莽草酸-3-磷酸合成酶、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、原卟啉原氧化酶或作为植物生长调节剂,例如已知于Weed Research 26(1986)441-445页或“The Pesticide Manual”,第14版,The British Crop Protection Council and the Royal Soc.of Chemistry,2006和其中引用的文献中。

[0070] 可与通式(I)化合物结合的已知除草剂或植物生长调节剂的实例包括以下活性成分(这些化合物或以国际标准化组织(ISO)“通用名称”命名,或以化学名称或代码编号命名),并始终包括所有使用形式,如酸、盐、酯和异构体,如立体异构体和光学异构体。举例来说,它们包括一种使用形式,有时也包括多种使用形式:

[0071] 乙草胺(acetochlor)、三氟羧草醚(acifluorfen)、三氟羧草醚酸(acifluorfen-methyl),三氟羧草醚酸钠盐(acifluorfen-sodium)、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、二丙烯草胺(allidochlor)、禾草灭(alloxydim)、禾草灭钠盐(alloxydim-sodium)、莠灭净(ametryn)、氨唑草酮(amicarbazone)、先甲草胺(amidochlor)、酰嘧磺隆(amidosulfuron)、4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲基苯基)-5-氟吡啶-2-羧酸、环丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、环丙嘧啶酸钾盐(aminocyclopyrachlor-potassium)、环丙嘧啶酸甲酯(aminocyclopyrachlor-methyl)、氯氨吡啶酸(aminopyralid)、氯氨吡啶酸二甲铵(aminopyralid-dimethylammonium)、aminopyralid-tripromine、杀草强(amitrole)、氨基磺酸铵(ammoniumsulfamate)、莎稗磷(anilofos)、磺草灵(asulam)、磺草灵钾盐(asulam-potassium)、磺草灵钠盐(asulam-sodium)、莠去津(atrazine)、唑啶草酮(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、氟丁酰草胺(beflubutamid)、(S)-(-)-beflubutamid、beflubutamid-M、草除灵(benazolin)、草除灵乙酯(benazolin-ethyl)、草除灵二甲基铵盐(benazolin-dimethylammonium)、草除灵钾盐(benazolin-potassium)、乙丁氟灵(benfluralin)、呋草黄(benfuresate)、苄嘧磺隆(bensulfuron)、苄嘧磺隆甲酯(bensulfuron-methyl)、地散磷(bensulide)、灭草松(bentazone)、bentazon-sodium、双环磺草酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟吡草酮(bicyclopyron)、甲羧除草醚(bifenox)、双丙氨膦(bilanafos)、双丙氨膦钠盐(bilanafos-sodium)、bipyrazone、双草醚(bispyribac)、双草醚钠盐(bispyribac-sodium)、bixlozon、除草定(bromacil)、bromacil-lithium、bromacil-sodium、溴丁酰草胺(bromobutide)、溴酚肟(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)、丁酰溴苯腈(bromoxynil-butyrate)、溴苯腈钾盐(bromoxynil-potassium)、庚酰溴苯腈(bromoxynil-heptanoate)和辛酰溴苯腈(bromoxynil-octanoate)、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)、丁苯草酮(butroxydim)、丁草敌(butylate)、唑草胺(cafenstrole)、cambendichlor、双酰草胺(carbetamide)、氟唑草酮(carfentrazone)、氟唑草酮乙酯(carfentrazone-ethyl)、草灭畏(chloramben)、草灭畏铵盐(chloramben-ammonium)、草灭畏二乙醇胺(chloramben-diolamine)、草灭畏甲酯(chloramben-methyl)、草灭畏甲基铵(chloramben-methylammonium)、草灭畏钠盐(chloramben-sodium)、氯溴隆(chlorbromuron)、伐草克(chlorfenac)、伐草克铵盐(chlorfenac-ammonium)、伐草克钠盐(chlorfenac-sodium)、燕麦酯(chlorfenprop)、甲基燕麦酯(chlorfenprop-methyl)、氯芴素(chlorflurenol)、氯芴

素甲酯(chlorflurenol-methyl)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron)、氯嘧磺隆乙酯(chlorimuron-ethyl)、氯邻苯二甲酰亚胺(chlorophthalim)、绿麦隆(chlorotoluron)、氯磺隆(chlorsulfuron)、chlorthal、chlorthal-dimethyl、chlorthal-monomethyl、吲哚酮(cinidon)、吲哚酮草酯(cinidon-ethyl)、环庚草醚(cinmethylin)、exo-(+)-cinmethylin(即(1R,2S,4S)-4-异丙基-1-甲基-2-[(2-甲基苄基)氧基]-7-氧杂双环[2.2.1]庚烷)、exo-(-)-cinmethylin(即(1R,2S,4S)-4-异丙基-1-甲基-2-[(2-甲基苄基)氧基]-7-氧杂双环[2.2.1]庚烷)、醚磺隆(cinosulfuron)、氯酰草膦(clacyfos)、烯草酮(clethodim)、炔草酸(clodinafop)、乙基炔草酯(clodinafop-ethyl)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、异噁草松(clomazone)、氯甲酰草胺(clomeprop)、二氯吡啶酸(clopyralid)、二氯吡啶酸甲酯(clopyralid-methyl)、二氯吡啶酸乙醇胺(clopyralid-olamine)、二氯吡啶酸钾(clopyralid-potassium)、clopyralid-tripomine、氯酯磺草胺酸(cloransulam)、氯酯磺草胺(cloransulam-methyl)、苄草隆(cumyluron)、氨基氰(cyanamide)、氰草津(cyanazine)、环草敌(cycloate)、cyclopyranil、cyclopyrimorate、环丙嘧磺隆(cyclosulfamuron)、噻草酮(cycloxydim)、氰氟草酯(cyhalofop)、氰氟草酯(cyhalofop-butyl)、环草津(cyprazine)、2,4-D(以及其铵、丁酰基、丁基、胆碱、二乙基铵、二甲基铵、二乙醇胺、doboxyl、十二烷基铵、etexyl、乙基、2-乙基己基、庚基铵、异丁基、异辛基、异丙基、异丙基铵、锂、meptyl、甲基、钾、十四烷基铵、三乙基铵、三异丙醇铵、三溴胺和三乙醇胺盐)、2,4-DB、2,4-DB-丁酯、2,4-DB-二甲基铵盐、2,4-DB-异辛酯、2,4-DB-钾盐和2,4-DB-钠盐、杀草隆(daimuron(dymron))、茅草枯(dalapon)、茅草枯钙盐(dalapon-calcium)、茅草枯镁盐(dalapon-magnesium)、茅草枯钠盐(dalapon-sodium)、棉隆(dazomet)、棉隆钠盐(dazomet-sodium)、正癸醇、7-脱氧-D-景天庚酮糖、甜菜安(desmedipham)、detosyl pyrazolate(DTP)、麦草畏(dicamba)及其盐(例如dicamba biproamine、麦草畏N,N-二(3-丙氨基)甲铵盐、麦草畏丁氧基酯(dicamba-butotyl)、麦草畏胆碱(dicamba-choline)、dicamba-diglycolamine、麦草畏二甲铵(dicamba-dimethylammonium)、麦草畏二乙醇铵(dicamba-diethanolaminemmonium)、麦草畏二乙铵(dicamba-diethylammonium)、麦草畏异丙铵(dicamba-isopropylammonium)、麦草畏甲酯(dicamba-methyl)、麦草畏单乙醇铵(dicamba-monoethanolamine)、麦草畏乙醇铵(dicamba-olamine)、麦草畏钾盐(dicamba-potassium)、麦草畏钠盐(dicamba-sodium)、麦草畏三乙醇铵(dicamba-triethanolamine))、敌草腈(dichlobenil)、2-(2,4-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、2-(2,5-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、2,4-滴丙酸丁氧基酯(dichlorprop-butotyl)、2,4-滴丙酸二甲铵(dichlorprop-dimethylammonium)、2,4-滴丙酸乙基己基酯(dichlorprop-etexyl)、2,4-滴丙酸乙基铵(dichlorprop-ethylammonium)、2,4-滴丙酸异辛酯(dichlorprop-isoctyl)、2,4-滴丙酸甲酯(dichlorprop-methyl)、2,4-滴丙酸钾盐(dichlorprop-potassium)、2,4-滴丙酸钠盐(dichlorprop-sodium)、精2,4-滴丙酸(dichlorprop-P)、精2,4-滴丙酸二甲铵(dichlorprop-P-dimethylammonium)、精2,4-滴丙酸乙基己基酯(dichlorprop-P-etexyl)、精2,4-滴丙酸钾(dichlorprop-P-potassium)、精2,4-滴丙酸钠(dichlorprop-sodium)二氯苯氧基丙酸(diclofop)、禾草灵(diclofop-methyl)、精禾草灵(diclofop-P)、精禾草灵(diclofop-P-methyl)、双氯磺草胺(diclosulam)、野燕枯

(difenzoquat)、野燕枯硫酸甲酯(difenzoquat-metilsulfate)、吡氟酰草胺(diflufenican)、二氟吡隆(diflufenzopyr)、二氟吡隆钠盐(diflufenzopyr-sodium)、噁唑隆(dimefuron)、哌草丹(dimepiperate)、dimesulfazet、二甲草胺(dimethachlor)、异戊乙净(dimethametryn)、二甲吩草胺(dimethenamid)、精二甲吩草胺(dimethenamid-P)、dimetrasulfuron、氨氟灵(dinitramine)、特乐酚(dinoterb)、特乐酚乙酯(dinoterb-acetate)、双苯酰草胺(diphenamid)、敌草快(diquat)、二溴敌草快(diquat-dibromid)、二氯敌草快(diquat-dichloride)、氟硫草定(dithiopyr)、敌草隆(diuron)、二硝基甲酚(DNOC)、二硝基甲酚铵(DNOC-ammonium)、二硝基甲酚钾(DNOC-potassium)、二硝基甲酚钠(DNOC-sodium)、茵多酸(endothal)、茵多酸二铵(endothal-diammonium)、茵多酸二钾(endothal-dipotassium)、茵多酸二钠(endothal-disodium)、epyrifenacil(S-3100)、茵草敌(EPTC)、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟灵(ethalfluralin)、胺苯磺隆(ethametsulfuron)、胺苯磺隆(ethametsulfuron-methyl)、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-5231(即N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧代-1H-四唑-1-基]-苯基]乙磺酰胺)、F-7967(即3-[7-氯-5-氟-2-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑-4-基]-1-甲基-6-(三氟甲基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮)、噁唑禾草灵(fenoxaprop)、精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P)、噁唑禾草灵乙酯(fenoxaprop-ethyl)、精噁唑禾草灵乙酯(fenoxaprop-P-ethyl)、芬诺杀磺隆(fenoxasulfone)、fenpyrazone、fenquinotrione、四唑酰草胺(fentrazamide)、麦草氟(flamprop)、麦草氟异丙酯(flamprop-isoproyl)、麦草氟甲酯(flamprop-methyl)、高效麦草氟异丙酯(flamprop-M-isopropyl)、高效麦草氟甲酯(flamprop-M-methyl)、啶嘧磺隆(flazasulfuron)、双氟磺草胺(florasulam)、氯氟吡啶酯(florpyrauxifen)、氯氟吡啶苄基酯(florpyrauxifen-benzyl)、吡氟禾草灵(fluazifop)、吡氟禾草灵丁酯(fluazifop-butyl)、吡氟禾草灵甲酯(fluazifop-methyl)、精吡氟禾草灵(fluazifop-P)、精吡氟禾草灵丁酯(fluazifop-P-butyl)、氟酮磺隆(flucarbazone)、氟酮磺隆钠盐(flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氯乙氟灵(fluchloralin)、氟噻草胺(flufenacet)、氟哒嗪草酯(flufenpyr)、氟哒嗪草酯(flufenpyr-ethyl)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟烯草酸(flumiclorac)、氟烯草酸戊酯(flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、氟草隆(fluometuron)、抑草丁(flurenol)、芴醇丁酯(flurenol-butyl)、芴醇二甲基铵盐(flurenol-dimethylammonium)和芴醇甲酯(flurenol-methyl)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen)、乙羧氟草醚乙酯(fluoroglycofen-ethyl)、四氟丙酸(flupropanate)、四氟丙酸钠(flupropanat-sodium)、氟啶嘧磺隆(flupyrsulfuron)、氟啶嘧磺隆甲酯(flupyrsulfuron-methyl)、氟啶嘧磺隆甲酯钠盐(flupyrsulfuron-methyl-sodium)、氟啶草酮(fluridon)、氟咯草酮(flurochloridon)、氯氟吡氧乙酸(fluroxypyr)、氯氟吡氧乙酸辛酯(fluroxypyr-butometyl)、氯氟吡氧乙酸甲酯(fluroxypyr-meptyl)、呋草酮(flurtamon)、嗪草酸(fluthiacet)、嗪草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、氟磺胺草醚(fomesafen)、氟磺胺草醚钠盐(fomesafen-sodium)、甲酰氨磺隆(foramsulfuron)、甲酰氨磺隆钠盐(foramsulfuron-sodium)、杀木膦(fosamine)、杀木膦铵盐(fosamine-ammonium)、草铵膦(glufosinate)、草铵膦铵盐(glufosinate-ammonium)、草铵膦钠盐

(glufosinate-sodium)、L-草铵膦铵盐(L-glufosinate-ammonium)、L-草铵膦钠盐(L-glufosinate-sodium)、精草铵膦钠盐(glufosinate-P-sodium)、精草铵膦铵盐(glufosinate-P-ammonium)、草甘膦(glyphosate)、草甘膦铵盐(glyphosate-ammonium)、草甘膦异丙基铵盐(glyphosate-isopropylammonium)、草甘膦二铵盐(glyphosate-diammonium)、草甘膦二甲基铵盐(glyphosate-dimethylammonium)、草甘膦钾盐(glyphosate-potassium)、草甘膦钠盐(glyphosate-sodium)、增甘膦钠(glyphosate-sesquisodium)和草甘膦三甲基硫盐(glyphosate-trimesium)、H-9201(即O-(2,4-二甲基-6-硝基苯基)O-乙基异丙基硫代磷酰胺酯)、氟氯吡啶酸(halauxifen)、氟氯吡啶酯(halauxifen-methyl)、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron)、氯吡嘧磺隆甲酯(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)、精氟吡禾灵乙氧基乙酯(haloxyfop-P-ethoxyethyl)、氟吡禾灵甲酯(haloxyfop-methyl)、精氟吡禾灵甲酯(haloxyfop-P-methyl)、氯氟乙禾灵(haloxifop-sodium)、环嗪酮(hexazinon)、(HNPC-A8169)、(即丙-2-炔-1-基(2S)-2-{3-[(5-叔丁基吡啶-2-基)氧基]苯氧基}丙酸酯)、HW-02(即1-(二甲氧基磷酰基)乙基(2,4-二氯苯氧基)乙酸酯)、hydantocidin、咪草酸(imazamethabenz)、咪草酸甲酯(imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟(imazamox)、甲氧咪草烟铵盐(imazamox-ammonium)、甲咪唑烟酸(imazapic)、甲咪唑烟酸铵盐(imazapic-ammonium)、咪唑烟酸(imazapyr)、咪唑烟酸异丙基铵盐(imazapyr-isopropylammonium)、咪唑喹啉酸(imazaquin)、咪唑喹啉酸铵盐(imazaquin-ammonium)、咪唑喹啉酸甲酯(imazaquin-methyl)、咪唑乙烟酸(imazethapyr)、咪唑乙烟酸铵(imazethapyr-ammonium)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、茚草酮(indanofan)、茚嗪氟草胺(indaziflam)、碘磺隆(iodosulfuron)、碘甲磺隆(iodosulfuron-methyl)、碘甲磺隆钠盐(iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(ioxynil)、碘苯腈锂盐(ioxynil-lithium)、辛酰碘苯腈(-octanoate)、碘苯腈钾盐(ioxynil-potassium)和碘苯腈钠盐(ioxynil-sodium)、三唑酰草胺(ipfencarbazon)、异丙隆(isoproturon)、异噁隆(isouron)、异噁酰草胺(isoxaben)、异噁唑草酮(isoxaflutole)、特胺灵(karbutilat)、KUH-043(即3-({[5-(二氟甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基]甲基}磺酰基)-5,5-二甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑)、ketospiradox、ketospiradox-potassium、乳氟禾草灵(lactofen)、环草定(lenacil)、利谷隆(linuron)、MCPA、MCPA-丁氧基乙酯、MCPA-丁酯、MCPA-二甲基铵盐、MCPA-二乙醇胺盐、MCPA-2-乙基己基、MCPA-乙酯、MCPA-异丁酯、MCPA-异辛酯、MCPA-异丙酯、MCPA-异丙基铵、MCPA-甲酯、MCPA醇铵盐、MCPA钾盐、MCPA钠盐、MCPA三乙醇铵盐、MCPB、MCPB-甲酯、MCPB-乙酯和MCPB-钠盐、甲基氯苯氧基丙酸(mecoprop)、甲基氯苯氧基丙酸丁氧基乙酯(mecoprop-butotyl)、甲基氯苯氧基丙酸二甲铵盐(mecoprop-dimethylammonium)、甲基氯苯氧基丙酸二乙醇铵盐(mecoprop-diolamine)、甲基氯苯氧基丙酸乙基己酯(mecoprop-etexyl)、mecoprop-ethadyl、甲基氯苯氧基丙酸异辛酯(mecoprop-isoctyl)、甲基氯苯氧基丙酸甲酯(mecoprop-methyl)、甲基氯苯氧基丙酸钾盐(mecoprop-potassium)、甲基氯苯氧基丙酸钠盐(mecoprop-sodium)和甲基氯苯氧基丙酸三乙醇铵盐(mecoprop-trolamine)、精甲基氯苯氧基丙酸(mecoprop-P)、精甲基氯苯氧基丙酸丁氧基乙酯(mecoprop-P-butotyl)、精甲基氯苯氧基丙酸二甲基铵盐(mecoprop-P-dimethylammonium)、精甲基氯苯氧基丙酸-2-

乙基己酯(mecoprop-P-2-ethylhexyl)和精甲基氯苯氧基丙酸钾盐(mecoprop-P-potassium)、苯噻酰草胺(mefenacet)、氟磺酰草胺(mefluidid)、mefluidid-diolamine、mefluidid-potassium,二磺隆(mesosulfuron)、甲基二磺隆(mesosulfuron-methyl)、二磺隆钠盐(mesosulfuron-sodium)、甲基磺草酮(mesotrion)、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)、嗪吡嘧磺隆(metazosulfuron)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、甲硫嘧磺隆(methiopyrsulfuron)、methiozolin、甲基异硫氰酸酯、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)、甲磺隆(metsulfuron-methyl)、禾草敌(molinat)、绿谷隆(monolinuron)、单嘧磺隆(monosulfuron)、单嘧磺酯(monosulfuron-ester)、MT-5950(即N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺)、NGGC-011、敌草胺(napropamide)、NC-310(即4-(2,4-二氯苯甲酰)-1-甲基-5-苄氧基吡唑)、NC-656(即3-[(异丙基磺酰基)甲基]-N-(5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基)-5-(三氟甲基)[1,2,4]三唑并-[4,3-a]吡啶-8-甲酰胺)、草不隆(neburon)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、壬酸(nonanoic acid(pelargonic acid))、氟草敏(norflurazon)、油酸(脂肪酸)、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)、噁嗪草酮(oxaziclomefone)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、百草枯(paraquat)、二氯百草枯(paraquat dichloride)、百草枯硫酸二甲酯、克草猛(pebulate)、二甲戊灵(pendimethalin)、五氟磺草胺(penoxsulam)、五氯苯酚(pentachlorphenol)、环戊噁草酮(pentoxazone)、烯草胺(pethoxamid)、矿物油、苯敌草(phenmedipham)、乙基苯敌草(phenmedipham-ethyl)、氨氯吡啶酸(picloram)、氨氯吡啶酸二甲铵盐(picloram-dimethylammonium)、氨氯吡啶酸乙基己酯(picloram-etexyl)、氨氯吡啶酸异丙酯(picloram-isoctyl)、氨氯吡啶酸甲酯(picloram-methyl)、氨氯吡啶酸醇胺(picloram-olamine)、氨氯吡啶酸钾盐(picloram-potassium)、氨氯吡啶酸三乙胺(picloram-triethylammonium)、氨氯吡啶酸三丙胺(picloram-tripromine)、氨氯吡啶酸三乙醇胺(picloram-trolamine)、氟吡酰草胺(picolinafen)、唑啉草酯(pinoxaden)、哌草磷(piperophos)、丙草胺(pretilachlor)、氟嘧磺隆(primisulfuron)、甲基氟嘧磺隆(primisulfuron-methyl)、氨氟乐灵(prodiamine)、环苯草酮(profoxydim)、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)、丙苯磺隆钠盐(propoxycarbazone-sodium)、丙嗪嘧磺隆(propyrisulfuron)、炔苯酰草胺(propyzamid)、苄草丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、双唑草腈(pyraclonil)、吡草醚(pyraflufen)、吡草醚(pyraflufen-ethyl)、磺酰草吡唑(pyrasulfotol)、吡唑特(pyrazolynat(pyrazolat))、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron)、吡嘧磺隆乙酯(pyrazosulfuron-ethyl)、苄草唑(pyrazoxyfen)、pyribambenz、异丙酯草醚(pyribambenz-isopropyl)、丙酯草醚(pyribambenz-propyl)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、达草止(pyridafol)、哒草特(pyridat)、环酯草醚(pyriftalid)、嘧草醚(pyriminobac)、嘧草醚(pyriminobac-methyl)、pyrimisulfan、嘧

草硫醚(pyrithiobac)、嘧草硫醚钠盐(pyrithiobac-sodium)、砜吡草唑(pyroxasulfon)、甲氧磺草胺(pyroxsulam)、二氯喹啉酸(quinclorac)、二氯喹啉酸二甲铵(quinclorac-dimethylammonium)、二氯喹啉酸甲酯(quinclorac-methyl)、氯甲喹啉酸(quinmerac)、灭藻醌(quinoclamin)、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)、精喹禾糠酯(quizalofop-P-tefuryl)、QYM201(即1-{2-氯-3-[(3-环丙基-5-羟基-1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-6-(三氟甲基)苯基}哌啶-2-酮)、砜嘧磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、烯禾啶(sethoxydim)、环草隆(siduron)、西玛津(simazine)、西草净(simetryn)、SL-261、磺草酮(sulcotrione)、甲磺草胺(sulfentrazone)、甲嘧磺隆(sulfometuron)、甲嘧磺隆甲酯(sulfometuron-methyl)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、SYP-249(即1-乙氧基-3-甲基-1-氧代丁-3-烯-2-基5-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝基苯甲酸酯)、SYP-300(即1-[7-氟-3-氧代-4-(丙-2-炔-1-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯并噁嗪-6-基]-3-丙基-2-硫代咪唑烷-4,5-二酮)、2,3,6-TBA、TCA(三氯乙酸)及其盐,例如TCA-铵盐、TCA-钙盐、TCA-乙酯、TCA-镁盐、TCA-钠盐、丁噻隆(tebuthiuron)、呋喃磺草酮(tefuryltrione)、环磺酮(tembotrione)、吡喃草酮(tepraloxydim)、特草定(terbacil)、特草灵(terbucarb)、特丁通(terbumeton)、特丁津(terbuthylazine)、特丁净(terbutryn)、tetflupyrolimet、thaxtomin、噻吩草胺(thenylchlor)、噻唑烟酸(thiazopyr)、噻酮磺隆(thiencarbazone)、噻酮磺隆甲酯(thiencarbazone-methyl)、噻吩磺隆(thifensulfuron)、噻吩磺隆甲酯(thifensulfuron-methyl)、禾草丹(thiobencarb)、tiafenacil、tolpyralat、苯吡唑草酮(topramezon)、三甲苯草酮(tralkoxydim)、氟酮磺草胺(triafamon)、野麦畏(triallate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、三唑氟草胺(triaziflam)、苯磺隆母酸(tribenuron)、苯磺隆甲酯(tribenuron-methyl)、绿草定(triclopyr)、绿草定丁氧乙酯(triclopyr-butotyl)、绿草定胆碱(triclopyr-choline)、绿草定乙酯(triclopyr-ethyl)、绿草定三乙胺(triclopyr-triethylammonium)、草达津(trietazine)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、三氟啶磺隆钠盐(trifloxysulfuron-sodium)、trifludimoxazin、氟乐灵(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、氟胺磺隆甲酯(triflusulfuron-methyl)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、硫酸脲、灭草敌(vernolate)、XDE-848、ZJ-0862(即3,4-二氯-N-{2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧基]苄基}苯胺)、3-(2-氯-4-氟-5-(3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)苯基)-5-甲基-4,5-二氢异噁唑-5-羧酸乙酯、[(3-{2-氯-4-氟-5-[3-甲基-2,6-二氧-4-(三氟甲基)-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基]苯氧基}吡啶-2-基)氧]乙酸乙酯、3-氯-2-[3-(二氟甲基)异噁唑-5-基]苯基5-氯嘧啶-2-基醚、2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-[(2-羟基-6-氧代环己-1-烯-1-基)羰基]-6-甲基哒嗪-3(2H)-酮、2-({2-[(2-甲氧乙氧基)甲基]-6-甲基吡啶-3-基}羰基)环己烷-1,3-二酮、(5-羟基-1-甲基-1H-吡唑-4-基)(3,3,4-三甲基-1,1-二氧代-2,3-二氢-1-苯并噻吩-5-基)甲酮、1-甲基-4-[(3,3,4-三甲基-1,1-二氧代-2,3-二氢-1-苯并噻吩-5-基)羰基]-1H-吡唑-5-基丙烷-1-磺酸盐、4-{2-氯-3-[(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)甲基]-4-(甲基磺酰基)苯甲酰基}-1-甲基-1H-吡唑-5-基1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酸酯;4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸氰基甲基酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸丙-2-炔-1-基酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸甲

酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸苄酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸乙酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1-异丁基-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸甲酯、6-(1-乙酰-7-氟-1H-吲哚-6-基)-4-氨基-3-氯-5-氟吡啶-2-甲酸甲酯、4-氨基-3-氯-6-[1-(2,2-二甲基丙酰基)-7-氟-1H-吲哚-6-基]-5-氟吡啶-2-甲酸甲酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-[7-氟-1-(甲氧基乙酰氯)-1H-吲哚-6-基]吡啶-2-甲酸甲酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸钾盐、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲基钠盐、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吲哚-6-基)吡啶-2-甲酸丁酯、4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]咪唑烷-2-酮、3-(5-叔丁基-1,2-噁唑-3-基)-4-羟基-1-甲基咪唑烷-2-酮、3-[5-氯-4-(三氟甲基)吡啶-2-基]-4-羟基-1-甲基咪唑烷-2-酮、4-羟基-1-甲氧基-5-甲基-3-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]咪唑烷-2-酮、6-[(2-羟基-6-氧代环己-1-烯-1-基)羰基]-1,5-二甲基-3-(2-甲基苯基)喹唑啉-2,4(1H,3H)-二酮、3-(2,6-二甲基苯基)-6-[(2-羟基-6-氧代环己-1-烯-1-基)羰基]-1-甲基喹唑啉-2,4(1H,3H)-二酮、2-[2-氯-4-(甲基磺酰基)-3-(吗啉-4-基甲基)苯甲酰]-3-羟基环己-2-烯-1-酮、1-(2-羧乙基)-4-(嘧啶-2-基)哒嗪-1-鎓盐(与适当的阴离子,例如氯化物、醋酸根或三氟醋酸根)、1-(2-羧乙基)-4-(哒嗪-3-基)哒嗪-1-鎓盐(与适当的阴离子,如氯化物、醋酸根或三氟醋酸根)、4-(嘧啶-2-基)-1-(2-磺乙基)哒嗪-1-鎓盐(与适当的阴离子,如氯化物、醋酸根或三氟醋酸根)、4-(哒嗪-3-基)-1-(2-磺乙基)哒嗪-1-鎓盐(与适当的阴离子,如氯化物、醋酸根或三氟醋酸根)、1-(2-羧乙基)-4-(1,3-噻唑-2-基)哒嗪-1-鎓盐(与适当的阴离子,如氯化物、醋酸根或三氟醋酸根)、1-(2-羧乙基)-4-(1,3-噻唑-2-基)哒嗪-1-鎓盐(与适当的阴离子,如氯化物、醋酸根或三氟醋酸根)、(2R)-2-{[(E)-({2-氯-4-氟-5-[3-甲基-2,6-二氧-4-(三氟甲基)-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基]苯基}亚甲基)氨基]氧基}丙酸甲酯、(E)-2-(三氟甲基)苯甲醛O-{2,6-双[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧基]苯甲酰}肟、2-氟-N-(5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基)-3-[(R)-丙基亚磺酰基]-4-(三氟甲基)苯甲酰胺、(2R)-2-[(4-氨基-3,5-二氯-6-氟-2-吡啶基)氧基]丙羧酸。

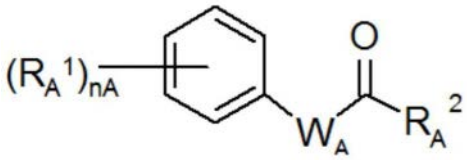
[0072] 作为可能的混合配对物的植物生长调节剂的实例为:

[0073] 脱落酸及相关类似物[如(2Z,4E)-5-[6-乙炔基-1-羟基-2,6-二甲基-4-氧代环己-2-烯-1-基]-3-甲基戊-2,4-二烯酸、(2Z,4E)-5-[6-乙炔基-1-羟基-2,6-二甲基-4-氧代环己基-2-烯-1-基]-3-甲基戊-2,4-二烯甲酯、(2Z,4E)-3-乙基-5-(1-羟基-2,6,6-三甲基-4-氧代环己基-2-烯-1-基)戊-2,4-二烯酸、(2E,4E)-5-(1-羟基-2,6,6-三甲基-4-氧代环己基-2-烯-1-基)-3-(三氟甲基)戊-2,4-二烯酸、(2E,4E)-5-(1-羟基-2,6,6-三甲基-4-氧代环己基-2-烯-1-基)-3-(三氟甲基)戊-2,4-二烯甲酯、(2Z,4E)-5-(2-羟基-1,3-二甲基-5-氧代二环[4.1.0]庚-3-烯-2-基)-3-甲基戊-2,4-二烯酸]、活化酯(acibenzolar)、苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、s-腺苷高半胱氨酸、尿囊素(allantoin)、2-氨基乙氧基乙烯甘氨酸(AVG)、氨基氧醋酸及衍生酯类[例如(亚异丙基)氨基氧醋酸2-(甲氧基)-2-氧代乙基酯、氨基氧醋酸2-(己基氧基)-2-氧代乙基(亚异丙基)酯、氨基氧醋酸-2-(异丙氧基)-2-氧代乙基(亚环己基)酯]、1-氨基环丙基-1-基羧酸N-甲基-1-氨基环丙基-1-羧酸、1-氨基环丙基-1-甲酰胺、取代的1-氨基环丙基-1-羧酸衍生物如DE3335514、EP30287、DE2906507或US5123951中所述、1-氨基环丙基-1-异羟肟酸、5-氨基乙酰丙酸、嘧啶醇

(ancymidol)、6-苄基氨基嘌呤、bikinin、芸苔素内酯(brassinolide)、芸苔素内酯-乙基、L-缬氨酸、儿茶酚及儿茶酚类(例如(2S,3R)-2-(3,4-二羟基苯基)-3,4-二羟基-2H-苯并吡喃-3,5,7-三醇)、甲壳低聚糖(CO;CO类与LCO类的不同之处在于它们没有LCO类特有的脂肪酸侧链。CO类(在某些情况下被称为N-乙酰甲壳低聚糖)也由GlcNAc单元构成,但其侧链使其有别于几丁质分子[$(C_8H_{13}NO_5)_n$、CAS编号1398-61-4]和壳聚糖分子[$(C_5H_{11}NO_4)_n$、CAS编号9012-76-4])、几丁质类化合物、矮壮素(chlormequat chloride)、调果酸(cloprop)、环丙酰胺酸(cyclanilide)、3-(环丙-1-烯基)丙酸、1-[2-(4-氰基-3,5-二环丙基苯基)乙酰胺基]环己烷羧酸、1-[2-(4-氰基-3-环丙基苯基)乙酰胺基]环己烷羧酸、1-环丙烯甲醇、丁酰肼(daminozid)、棉隆(dazomet)、棉隆钠盐、正癸醇、调呋酸(dikegulac)、调呋酸钠(dikegulac-sodium)、茵多酸(endothal)、茵多酸二钾(endothal-dipotassium)、茵多酸二钠(endothal-disodium)和茵多酸单(N,N-二甲基烷基铵)、乙烯利(ethephon)、1-乙基环丙烯、氟节胺(flumetralin)、抑草丁(flurenol)、芴醇丁酯(flurenol-butyl)、芴醇甲酯(flurenol-methyl)、呋嘧醇(flurprimidol)、氯吡脲(forchlorfenuron)、赤霉酸(gibberellic acid)、抗倒胺(inabenfid)、吲哚-3-乙酸(IAA)、4-吲哚-3-基丁酸、稻瘟灵(isoprothiolane)、烯丙苯噻唑(probenazole)、茉莉酸(jasmonic acid)、茉莉酯或其他衍生物(例如茉莉酸甲酯、茉莉酸乙酯)、脂质几丁寡糖类(LCOs(在某些情况下也称为共生结节信号(Nod或Nod因子)或Myc因子),由寡糖骨架组成,寡糖骨架由β-1,4-键合的N-乙酰-D-氨基葡萄糖胺残基("GlcNAc")和融合在非还原端上的N-键合脂肪酸侧链组成。从文献中可以推断出,LCO类在于以下不同:在骨架结构中GlcNAc单元的数量、脂肪酸链的长度和饱和度、还原糖和非还原糖单元的取代程度方面),亚油酸或其衍生物、亚麻酸或其衍生物、马来酰肼、助壮素(mepiquat chloride)、助壮素五硼酸盐(mepiquat pentaborate)、1-甲基环丙烯、3-甲基环丙烯、甲氧基乙烯甘氨酸(MVG)、3'-甲基脱落酸、1-(4-甲基苯基)-N-(2-氧代-1-丙基-1,2,3,4-四氢喹啉-6-基)甲磺酰胺及相关取代的(四氢喹啉-6-基)甲磺酰胺类化合物、(3E,3aR,8bS)-3-({[(2R)-4-甲基-5-氧代-2,5-二羟基呋喃-2-基]氧基}亚甲基)-3,3a,4,8b-四氢-2H-茚并[1,2-b]呋喃-2-酮及相关内酯,如EP2248421所述,2-(1-萘基)乙酰胺、1-萘乙酸、2-萘氧乙酸、硝基苯醚混合物、4-氧代-4[(2-苯基乙基)氨基]丁酸、多效唑(paclobutrazole)、4-苯基丁酸及其盐类(例如4-苯基丁酸钠、4-苯基丁酸钾)、苯基丙氨酸(phenylalanine)、N-苯基邻氨甲酰苯甲酸(N-phenylphthalamic acid)、调环酸(prohexadione)、调环酸钙盐(prohexadione-calcium)、1-n-丙基环丙烯、腐胺(putrescine)、茉莉酮(prohydrojasmone)、根瘤菌素(rhizobitoxin)、水杨酸及水杨酸甲酯、肌氨酸(sarcosine)、环丙-1-烯-1-基乙酸钠、环丙-2-烯-1-基乙酸钠、3-(环丙-2-烯-1-基)丙酸钠盐、3-(环丙-1-烯-1-基)丙酸钠盐、sidefungin、亚精胺(spermidine)、精胺(spermine)、独角金内酯(strigolactone)、四氯硝基苯(tecnazene)、噻苯隆(thidiazuron)、三十烷醇(triacontanol)、抗倒酯(trinexapac)、抗倒酯乙酯(trinexapac-ethyl)、色氨酸(tryptophan)、tsitodef、烯效唑(uniconazole)、精烯效唑(uniconazole-P)、2-氟-N-(3-甲氧基苯基)-9H-嘌呤-6-胺。

[0074] 可与本发明的式(I)化合物结合以及任选与其他活性成分(如如上文所列的杀虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂)结合使用的安全剂,优选自以下组别:

[0075] S1)式(S1)的化合物

[0076] 

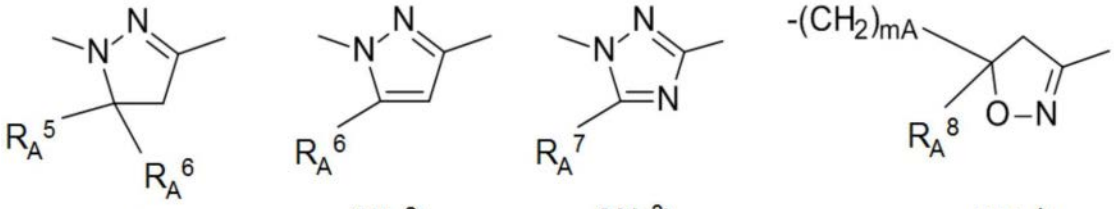
(S1)

[0077] 其中符号和下标定义如下：

[0078] n_A为0至5的自然数，优选为0至3；

[0079] R_A^1为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、硝基或(C_1-C_4)-卤代烷基；

[0080] W_A为未取代或取代的二价杂环基，选自部分不饱和或芳香族五元杂环基团，具有1至3个来自N和O基团的环杂原子，其中环中存在至少一个氮原子和至多一个氧原子，优选为(W_A^1)至(W_A^4)组中的一个团，

[0081] 

(W_A^1) (W_A^2) (W_A^3) (W_A^4)

[0082] m_A为0或1；

[0083] R_A^2为OR_A^3、SR_A^3或$NR_A^3R_A^4$或饱和或不饱和的3至7元杂环，该杂环具有至少一个氮原子和最多3个杂原子，优选选自O和S，其通过氮原子与(S1)中的羰基相连，且未被取代或被(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基或任选取代的苯基取代，优选为式OR_A^3、NHR_A^4或$N(CH_3)_2$，特别为式OR_A^3的基团；

[0084] R_A^3为氢或未取代或取代的脂族烃基，优选具有总共1至18个碳原子；

[0085] R_A^4为氢、(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷氧基或取代或未取代的苯基；

[0086] R_A^5为氢、(C_1-C_8)-烷基、(C_1-C_8)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_8)-烷基、氰基或$COOR_A^9$，其中R_A^9为氢、(C_1-C_8)-烷基、(C_1-C_8)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_6)-羟基烷基、(C_3-C_{12})-环烷基或三-(C_1-C_4)-烷基硅烷基；

[0087] R_A^6、R_A^7、R_A^8相同或不同，并且为氢、(C_1-C_8)-烷基、(C_1-C_8)-卤代烷基、(C_3-C_{12})-环烷基或取代或未取代的苯基；

[0088] 优选地：

[0089] a)二氯苯基吡唑啉-3-羧酸类化合物($S1^a$)，优选为1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-羧酸、1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-羧酸乙酯(S1-1)(“吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)”)，以及WO-A-91/07874中所述的相关化合物；

[0090] b)二氯苯基吡唑羧酸的衍生物($S1^b$)，优选化合物如1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基吡唑-3-羧酸乙酯(S1-2)、1-(2,4-二氯苯基)-5-异丙基基吡唑-3-羧酸乙酯(S1-3)、1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)吡唑-3-羧酸乙酯(S1-4)以及EP-A-333 131和EP-A-269 806中所述的相关化合物；

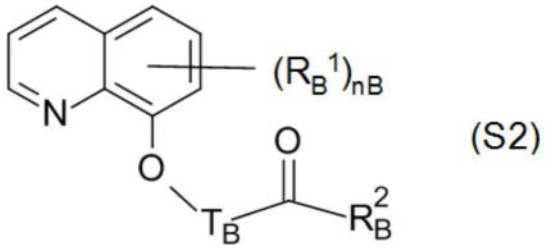
[0091] c)1,5-二苯基吡唑-3-羧酸的衍生物($S1^c$)，优选如1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基吡唑-3-羧酸乙酯(S1-5)、1-(2-氯苯基)-5-苯基吡唑-3-羧酸甲酯(S1-6)和例如EP-A-268

554所述的相关化合物；

[0092] d)三唑羧酸类化合物(S1[d])，优选如解草唑(fenchlorazole)(-乙酯)，即1-(2,4-二氯苯基)-5-三氯甲基-(1H)-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯(S1-7)，以及EP-A-174 562和EP-A-346 620中所述的相关化合物；

[0093] e)5-苄基或5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸类化合物(S1[e])，优选化合物如5-(2,4-二氯苄基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-8)或5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-9)以及WO-A-91/08202中所述的相关化合物、或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-10)或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-11)(“双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)”)或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸正丙基酯(S1-12)或5-(4-氟苯基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-13)，如专利申请WO-A-95/07897中所述。

[0094] S2)式(S2)的喹啉衍生物

[0095] 

(S2)

[0096] 其中符号和下标定义如下：

[0097] R_B^1为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、硝基或(C_1-C_4)-卤代烷基；

[0098] n_B为0至5的自然数，优选为0至3；

[0099] R_B^2为OR_B^3、SR_B^3或$NR_B^3R_B^4$或饱和的

[0100] 或不饱和的3至7元杂环，该杂环具有至少一个氮原子和最多3个杂原子，优选来自O和S的杂原子，其通过氮原子与(S2)中的羰基相连，且为未被取代或被来自(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基或任选取代的苯基的基团取代，优选为式OR_B^3、NHR_B^4或$N(CH_3)_2$，特别为式OR_B^3的基团；

[0101] R_B^3为氢或未取代或取代的脂族烃基，优选总共具有1至18个碳原子；

[0102] R_B^4为氢、(C_1-C_6)-烷基、(C_1-C_6)-烷氧基或取代或未取代的苯基；

[0103] TB为$(C_1$或$C_2)$-烷二基链，其未被取代或被一个或两个(C_1-C_4)-烷基或[(C_1-C_3)-烷氧基]羰基取代；

[0104] 优选地

[0105] a)8-喹啉氧基乙酸类化合物(S2[a])，优选为

[0106] 1-甲基己基(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸酯(“解毒喹(cloquintocet-mexyl)”)(S2-1)、

[0107] (1,3-二甲基丁-1-基)(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸酯(S2-2)、

[0108] 4-烯丙氧基丁基(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸酯(S2-3)、

[0109] 1-烯丙氧基丙-2-基(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸酯(S2-4)、

[0110] (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸乙酯(S2-5)、

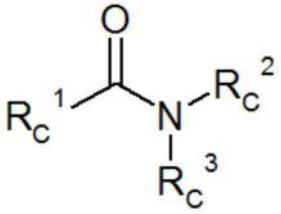
[0111] (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸甲酯(S2-6)、

[0112] (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸烯丙酯(S2-7)、

[0113] 2-(2-亚丙基亚氨基氧基)-1-乙基(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸酯(S2-8)、2-氧代丙基-1-基(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸酯(S2-9)及相关化合物,如EP-A-86 750、EP-A-94 349和EP-A-191 736或EP-A-0 492 366中所述,以(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸(S2-10),其水合物和盐,例如锂、钠、钾、钙、镁、铝、铁、铵、季铵盐、锍盐或鏻盐,如WO-A-2002/34048中所述;

[0114] b)(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸类化合物($S2^b$),优选化合物例如(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二乙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二烯丙基酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸甲乙酯及相关化合物,如EP-A-0 582 198中所述。

[0115] S3)式(S3)的化合物

[0116]  **(S3)**

[0117] 其中符号和下标定义如下:

[0118] R_C^1为(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_2-C_4)-烯基、(C_2-C_4)-卤代烯基、(C_3-C_7)-环烷基,优选为二氯甲基;

[0119] R_C^2、R_C^3相同或不同,并且为氢、(C_1-C_4)-烷基、(C_2-C_4)-烯基、(C_2-C_4)-炔基、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_2-C_4)-卤代烯基、(C_1-C_4)-烷基氨基甲酰基-(C_1-C_4)-烷基、(C_2-C_4)-烯基氨基甲酰基-(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基、二氧戊环-(C_1-C_4)-烷基、噻唑基、呋喃基、呋喃烷基、噻吩基、哌啶基、取代或未取代的苯基,或R_C^2和R_C^3一起形成取代或未取代的杂环,优选为噁唑烷、噻唑烷、哌啶、吗啉、六氢嘧啶或苯并噁嗪环;

[0120] 优选为

[0121] 二氯乙酰胺类活性成分,经常用作苗前安全剂(土壤作用安全剂),例如

[0122] "二氯丙烯胺(dichlormid)"(N,N-二烯丙基-2,2-二氯乙酰胺)(S3-1),

[0123] 来自Stauffer的"R-29148"(3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基-1,3-噁唑烷)(S3-2),

[0124] 来自Stauffer的"R-28725"(3-二氯乙酰基-2,2-二甲基-1,3-噁唑烷)(S3-3),

[0125] "解草嗪(benoxacor)"(4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪)(S3-4),

[0126] PPG工业公司的"PPG-1292"(N-烯丙基-N-[(1,3-二氧戊环-2-基)甲基]二氯乙酰胺)(S3-5),

[0127] Sagro-Chem公司的"DKA-24"(N-烯丙基-N-[(烯丙基氨基羰基)甲基]二氯乙酰胺)(S3-6),

[0128] Nitrokemia或Monsanto公司的"AD-67"或"MON 4660"(3-二氯乙酰基-1-氧杂-3-氮杂螺[4.5]癸烷)(S3-7),

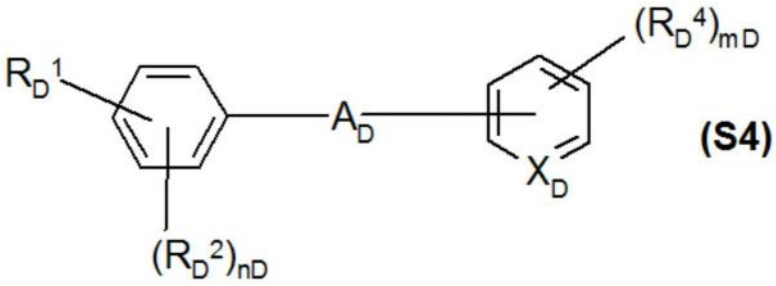
[0129] TRI-Chemical RT公司的"TI-35"(1-二氯乙酰基氮杂环庚烷)(S3-8),

[0130] "diclonon"(dicyclonon)或"BAS145138"或"LAB145138"(S3-9)

[0131] 巴斯夫的((RS)-1-二氯乙酰基-3,3,8a-三甲基全氢吡咯并[1,2-a]嘧啶-6-酮),

[0132] "解草噁唑(furilazole)"或"MON 13900"((RS)-3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷)(S3-10);及其(R)异构体(S3-11)。

[0133] S4)式(S4)的N-酰基磺酰胺及其盐

[0134] 

(S4)

[0135] 其中符号和下标定义如下:

[0136] A_D为SO_2-NR_D^3-CO或CO-NR_D^3-SO_2

[0137] X_D为CH或N;

[0138] R_D^1为CO-$NR_D^5R_D^6$或NHCO-R_D^7;

[0139] R_D^2为卤素、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基、硝基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷基磺酰基、(C_1-C_4)-烷氧基羰基或(C_1-C_4)-烷基羰基;

[0140] R_D^3为氢、(C_1-C_4)-烷基、(C_2-C_4)-烯基或(C_2-C_4)-炔基;

[0141] R_D^4为卤素、硝基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基、(C_3-C_6)-环烷基、苯基、(C_1-C_4)-烷氧基、氰基、(C_1-C_4)-烷硫基、(C_1-C_4)-烷基亚磺酰基、(C_1-C_4)-烷基磺酰基、(C_1-C_4)-烷氧基羰基或(C_1-C_4)-烷基羰基;

[0142] R_D^5为氢、(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基、(C_2-C_6)-烯基、(C_2-C_6)-炔基、(C_5-C_6)-环烯基、苯基或含有选自氮、氧和硫的v_D个杂原子的3至6元杂环基,其中后七个基团被选自以下的v_D个取代基取代:卤素、(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_6)-卤代烷氧基、(C_1-C_2)-烷基亚磺酰基、(C_1-C_2)-烷基磺酰基、(C_3-C_6)-环烷基、(C_1-C_4)-烷氧基羰基、(C_1-C_4)-烷基羰基和苯基,并且在环状基团的情况下,还包括(C_1-C_4)-烷基和(C_1-C_4)-卤代烷基;

[0143] R_D^6为氢、(C_1-C_6)-烷基、(C_2-C_6)-烯基或(C_2-C_6)-炔基,其中后三个基被选自以下的v_D个基团取代:卤素、羟基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基和(C_1-C_4)-烷硫基,或

[0144] R_D^5和R_D^6与带有它们的氮原子一起形成吡咯烷基或哌啶基;

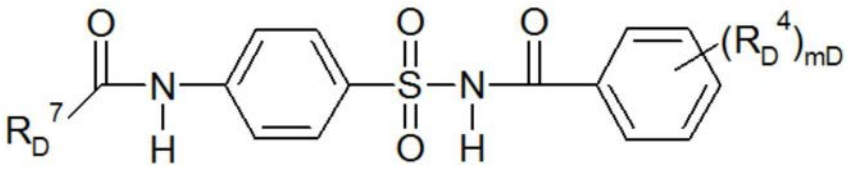
[0145] R_D^7为氢、(C_1-C_4)-烷基氨基、二-(C_1-C_4)-烷基氨基、(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基,其中后两种基团被选自卤素、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_6)-卤代烷氧基和(C_1-C_4)-烷硫基的v_D个取代基取代,在环状基团的情况下,还被(C_1-C_4)-烷基和(C_1-C_4)-卤代烷基取代;

[0146] n_D为0、1或2;

[0147] m_D为1或2;

[0148] v_D为0、1、2或3;

[0149] 在这些中,优先N-酰基磺酰胺类化合物,例如下式($S4^a$)的化合物,其例如已知于WO-A-97/45016

[0150] 

($S4^a$)

[0151] 其中

[0152] R_D^7为(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基,其中后两种基团被选自卤素、(C_1-C_4)-烷氧

基、(C_1-C_6)-卤代烷氧基和(C_1-C_4)-烷硫基的v_D个取代基取代,在环状基团的情况下,也被(C_1-C_4)-烷基和(C_1-C_4)-卤代烷基取代;

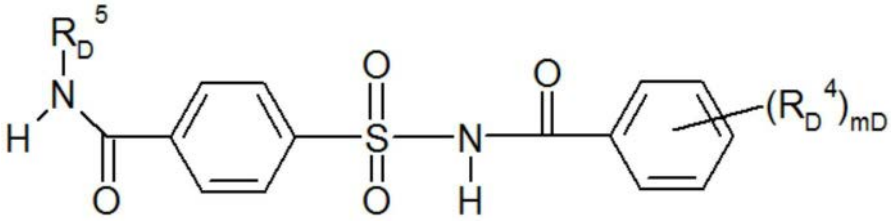
[0153] R_D^4为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、CF_3;

[0154] m_D为1或2;

[0155] v_D为0、1、2或3;

[0156] 以及

[0157] 酰基氨磺酰基苯甲酰胺,例如下式$(S4^b)$的,其例如已知于WO-A-99/16744

[0158] 

$(S4^b)$

[0159] 例如,这些化合物,其中

[0160] R_D^5=环丙基和(R_D^4)=2-OMe(“环丙磺酰胺(cyprosulfamide)”,S4-1),

[0161] R_D^5=环丙基和(R_D^4)=5-Cl-2-OMe(S4-2),

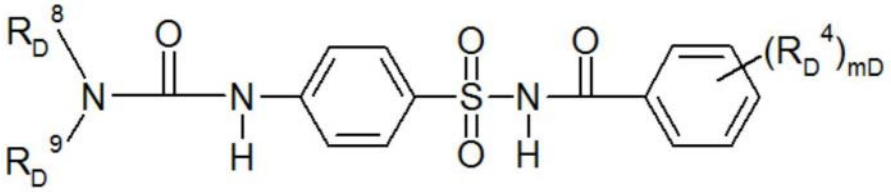
[0162] R_D^5=乙基和(R_D^4)=2-OMe(S4-3),

[0163] R_D^5=异丙基和(R_D^4)=5-Cl-2-OMe(S4-4)以及

[0164] R_D^5=异丙基和(R_D^4)=2-OMe(S4-5)

[0165] 以及

[0166] 式$(S4^c)$的N-酰基氨磺酰苯基脲类化合物,其例如已知于EP-A-365484

[0167] 

$(S4^c)$

[0168] 其中

[0169] R_D^8和R_D^9独立地为氢、(C_1-C_8)-烷基、(C_3-C_8)-环烷基、(C_3-C_6)-烯基、(C_3-C_6)-炔基,

[0170] R_D^4为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、CF_3,

[0171] m_D为1或2;

[0172] 例如

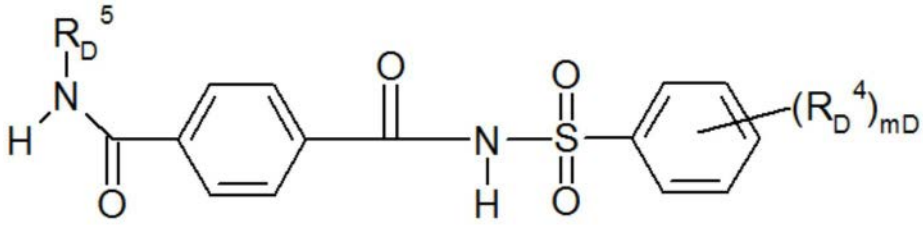
[0173] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲(“metcamifen”,S4-6),

[0174] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲,

[0175] 1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲,

[0176] 以及

[0177] 式$(S4^d)$的N-苯磺酰基对苯二甲酰胺,其例如已知于CN 101838227,

[0178] 

(S4d)

[0179] 例如,这些化合物,其中

[0180] R_D^4为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、CF3;

[0181] m_D为1或2;

[0182] R_D^5为氢、(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基、(C_2-C_6)-烯基、(C_2-C_6)-炔基、(C_5-C_6)-环烯基。

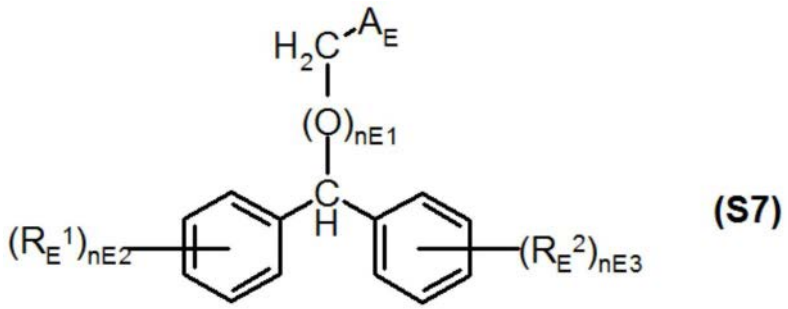
[0183] S5)羟基芳香族和芳香族-脂族羧酸衍生物类活性成分(S5),例如

[0184] 3,4,5-三乙酰氧基苯甲酸乙酯、3,5-二甲氧基-4-羟基苯甲酸、3,5-二羟基苯甲酸、4-羟基水杨酸、4-氟水杨酸、2-羟基肉桂酸、2,4-二氯肉桂酸,如WO-A-2004/084631、WO-A-2005/015994、WO-A-2005/016001中所述。

[0185] S6)1,2-二氢喹喔啉-2-酮类活性成分(S6),例如

[0186] 1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹喔啉-2-酮、1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹喔啉-2-硫酮、1-(2-氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹喔啉-2-酮盐酸盐、1-(2-甲磺酰胺乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹喔啉-2-酮,如WO-A-2005/112630所述。

[0187] S7)式(S7)的化合物,如WO-A-1998/38856中所述,

[0188] 

(S7)

[0189] 其中符号和下标定义如下:

[0190] R_E^1、R_E^2独立地为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷基氨基、二-(C_1-C_4)-烷基氨基、硝基;

[0191] AE为$COOR_E^3$或$COSR_E^4$

[0192] R_E^3、R_E^4独立地为氢、(C_1-C_4)-烷基、(C_2-C_6)-烯基、(C_2-C_4)-炔基、氰基烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、苯基、硝基苯基、苄基、卤代苄基、吡啶基烷基和烷基铵,

[0193] n_E^1为0或1

[0194] n_E^2、n_E^3独立地为0、1或2,

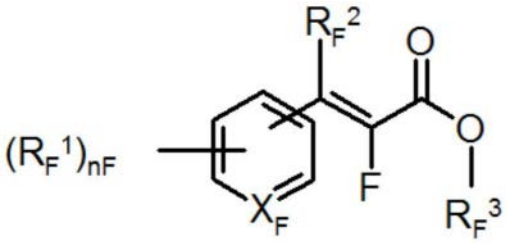
[0195] 优选为

[0196] 二苯甲氧基乙酸

[0197] 二苯基甲氧基乙酸乙酯

[0198] 二苯基甲氧基乙酸甲酯(CAS登记号:41858-19-9)(S7-1)。

[0199] S8)式(S8)的化合物,如WO-A-98/27049中所述

[0200] 

(S8)

[0201] 其中

[0202] XF为CH或N,

[0203] 在X_F=N的情况下,n_F为0至4的整数;在X_F=CH的情况下,n_F为0至5的整数。

[0204] R_F^1为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基、硝基、(C_1-C_4)-烷硫基、(C_1-C_4)-烷基磺酰基、(C_1-C_4)-烷氧基羰基、任选取代的苯基、任选取代的苯氧基,

[0205] R_F^2为氢或(C_1-C_4)-烷基,

[0206] R_F^3为氢、(C_1-C_8)-烷基、(C_2-C_4)-烯基、(C_2-C_4)-炔基或芳基,其中每个上述含碳基团未被取代或被一个或多个,优选为最多达三个相同或不同的选自卤素和烷氧基的基团取代;或其盐,

[0207] 优选化合物,其中

[0208] X_F为CH

[0209] n_F为0到2的整数,

[0210] R_F^1为卤素、(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,

[0211] R_F^2为氢或(C_1-C_4)-烷基,

[0212] R_F^3为氢、(C_1-C_8)-烷基、(C_2-C_4)-烯基、(C_2-C_4)-炔基或芳基,其中每个上述含碳基未被取代或被一个或多个,优选至多三个相同或不同的选自卤素和烷氧基的基团取代,

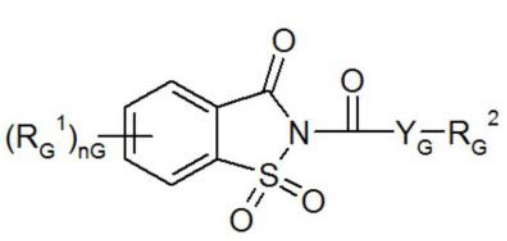
[0213] 或其盐。

[0214] S9)3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮类(S9)的活性成分,例如

[0215] 1,2-二氢-4-羟基-1-乙基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮(CAS登记号219479-18-2),1,2-二氢-4-羟基-1-甲基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮(CAS登记号95855-00-8),如WO-A-1999/000020中所述。

[0216] S10)式($S10^a$)或($S10^b$)的化合物

[0217] 如WO-A-2007/023719和WO-A-2007/023764中所述

[0218] 

($S10^a$)



($S10^b$)

[0219] 其中

[0220] R_G^1为卤素、(C_1-C_4)-烷基、甲氧基、硝基、氰基、CF_3、OCF_3,

[0221] Y_G、Z_G各自代表O或S，

[0222] n_G为0至4的整数，

[0223] R_G^2为(C_1-C_{16})-烷基、(C_2-C_6)-烯基、(C_3-C_6)-环烷基、芳基；苄基、卤代苄基，

[0224] R_G^3为氢或(C_1-C_6)-烷基。

[0225] S11)氧亚氨基化合物类型(S11)的活性成分，其已知为拌种剂，例如

[0226] “解草腈(oxabetrinil)”((Z)-1,3-二氧戊环-2-基甲氧基亚氨基(苯基)乙腈)(S11-1)，其已知为小米/高粱防止异丙甲草胺(metolachlor)损害的拌种安全剂，

[0227] “氟草肟(fluxofenim)”(1-(4-氯苯基)-2,2,2-三氟-1-乙酮O-(1,3-二氧戊环-2-基甲基)肟)(S11-2)，其已知为用于小米/高粱防止异丙甲草胺危害的拌种安全剂，以及

[0228] “解草胺腈(cyometrinil)”或“CGA-43089”((Z)-氰基甲氧基亚氨基(苯基)乙腈)(S11-3)，其已知为小米/高粱防止异丙甲草胺危害的拌种安全剂。

[0229] S12)异硫代苯并二氢吡喃类(S12)的活性成分，例如[(3-氧代-1H-2-苯并噻喃-4(3H)-亚基)甲氧基]乙酸甲酯(CAS登记号205121-04-6)(S12-1)和WO-A-1998/13361中的相关化合物。

[0230] S13)(S13)组中的一种或多种化合物：

[0231] “萘酐”(1,8-萘二羧酸酐)(S13-1)，其已知为玉米拌种安全剂，可防止硫代氨基甲酸酯除草剂的损害，

[0232] “解草啶(fenclorim)”(4,6-二氯-2-苯基嘧啶)(S13-2)，其已知为播种水稻中丙草胺(pretilachlor)安全剂，

[0233] “解草胺(flurazole)”(2-氯-4-三氟甲基-1,3-噻唑-5-羧酸苄酯)(S13-3)，其已知为小米/高粱防止甲草胺(alachlor)和异丙甲草胺危害的拌种安全剂，

[0234] “CL 304415”(CAS登记号31541-57-8)

[0235] 来自American Cyanamid的(4-羧基-3,4-二氢-2H-1-苯并吡喃-4-乙酸)(S13-4)，其已知为一种防止咪唑啉酮对玉米造成损害的安全剂；

[0236] 来自Nitrokemia的“MG 191”(CAS登记号:96420-72-3)(2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环)(S13-5)，其已知为玉米安全剂，

[0237] “MG 838”(CAS登记号:133993-74-5)

[0238] 来自Nitrokemia的(2-丙烯基1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷-4-二硫代碳酸酯)(S13-6)，“乙拌磷(disulfoton)”(O,O-二乙基S-2-乙硫基乙基二硫代磷酸酯)(S13-7)，

[0239] “dietholate”(O,O-二乙基O-苯基硫代磷酸酯)(S13-8)，

[0240] “mephenate”(4-氯苯基甲基氨基甲酸酯)(S13-9)。

[0241] S14)活性成分除了对有害植物有除草作用外，还对作物植物例如水稻有安全作用，例如

[0242] “哌草丹(Dimepiperate)”或“MY 93”(S-1-甲基1-苯基乙基哌啶-1-硫代甲酸酯)，其已知为可防止除草剂草达灭(molinate)对水稻损害的安全剂；

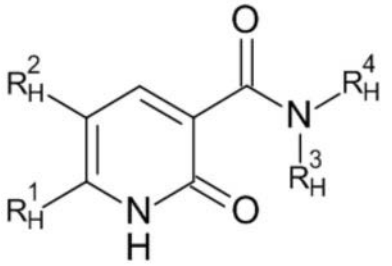
[0243] “杀草隆(daimuron)”或“SK 23”(1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-对甲苯脲)，其已知为用于防止除草剂唑吡嘧磺隆对水稻造成损害的安全剂；

[0244] “苄草隆(cumyluron)”＝“JC 940”(3-(2-氯苯基甲基)-1-(1-甲基-1-苯基乙基)脲，见JP-A-60087254)，其已知为防止某些除草剂对水稻的损害的安全剂，

[0245] “甲氧基苯甲酮”或“NK 049”(3,3’-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮),其已知为防止某些除草剂对水稻的损害的安全剂,

[0246] 来自Kumia的“CSB”(1-溴-4-(氯甲基磺酰基)苯)(CAS登记号:54091-06-4),其已知为防止某些除草剂对水稻的损害的安全剂。

[0247] S15)式(S15)化合物或其互变异构体

[0248]  (S15)

[0249] 如WO-A-2008/131861和WO-A-2008/131860中所述

[0250] 其中

[0251] R_H^1为(C_1-C_6)-卤代烷基,以及

[0252] R_H^2为氢或卤素,以及

[0253] R_H^3、R_H^4独立地为氢、(C_1-C_{16})-烷基、(C_2-C_{16})-烯基或(C_2-C_{16})-炔基,

[0254] 其中后3个基团各自未被取代或被选自卤素、羟基、氰基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基、(C_1-C_4)-烷硫基、(C_1-C_4)-烷氨基、二[(C_1-C_4)-烷基]氨基、(C_1-C_4)-烷氧基]羰基、[(C_1-C_4)-卤代烷氧基]羰基、未取代或取代的(C_3-C_6)-环烷基、未取代或取代的苯基以及未取代或取代的杂环烷基中的一个或多个基团取代,

[0255] 或(C_3-C_6)-环烷基、(C_4-C_6)-环烯基、在环的一侧与4至6元饱和或不饱和碳环稠合的(C_3-C_6)-环烷基,或在环的一侧与4至6元饱和或不饱和碳环稠合的(C_4-C_6)-环烯基,

[0256] 其中后4个基各自未被取代或被选自卤素、羟基、氰基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基、(C_1-C_4)-烷硫基、(C_1-C_4)-烷基氨基、二[(C_1-C_4)-烷基]氨基、[(C_1-C_4)-烷氧基]羰基、[(C_1-C_4)-卤代烷氧基]羰基、未取代或取代的(C_3-C_6)-环烷基、未取代或取代的苯基以及未取代或取代的杂环烷基中的一个或多个基团取代,

[0257] 或

[0258] R_H^3为(C_1-C_4)-烷氧基、(C_2-C_4)-烯氧基、(C_2-C_6)-炔氧基或(C_2-C_4)-卤代烷氧基,以及

[0259] R_H^4为氢或(C_1-C_4)-烷基,或

[0260] R_H^3和R_H^4与直接键合的氮原子一起为四至八元杂环,其除氮原子外,还可能含有其他环杂质原子,优选最多两个选自N、O和S的其他环杂质原子,且其未被取代或被选自卤素、氰基、硝基、(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)-卤代烷氧基和(C_1-C_4)-烷硫基中的一个或多个基团取代。

[0261] S16)

[0262] 主要用作除草剂但对作物植物也具有安全作用的活性成分,例如

[0263] (2,4-二氯苯氧基)乙酸(2,4-D),

[0264] (4-氯苯氧基)乙酸,

[0265] (R,S)-2-(4-氯-邻甲苯氧基)丙酸(甲基氯苯氧基丙酸),

[0266] 4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸(2,4-DB),

[0267] (4-(4-氯--邻甲苯氧基)乙酸(MCPA),

[0268] 4-(4-氯-邻甲苯氧基)丁酸,

[0269] 4-(4-氯苯氧基)丁酸,

[0270] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸(麦草畏),

[0271] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸1-(乙氧基羰基)乙基酯(lactidichlor-ethyl)。

[0272] 特别优选的安全剂有吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)、解毒喹(cloquintocet-mexyl)、解草嗪(benoxacor)、二氯丙烯胺(dichlormid)和metcamifen。

[0273] 可湿性粉剂是可在水中均匀分散的制剂,其除活性成分和除稀释剂或惰性物质外,还包括离子型和/或非离子型表面活性剂(润湿剂、分散剂),例如聚乙氧基化烷基酚、聚乙氧基化脂肪醇、聚乙氧基化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基苯磺酸盐、木质素磺酸钠、2,2'-二萘甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰亚甲基酸钠以及油酰基甲基牛磺酸钠。为了生产可湿性粉剂,可将活性除草剂成分在例如常规设备,如锤磨机、鼓风磨机和喷气磨机中,精细研磨,并同时或随后与制剂助剂相混合。

[0274] 可乳化浓缩剂通过如下制备:将活性成分溶解在有机溶剂中,例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或其他沸点较高的芳烃或碳氢化合物或这些有机溶剂的混合物,再加入一种或多种离子和/或非离子表面活性剂(乳化剂)。可使用的乳化剂的实例为:烷基芳基磺酸钙盐,如十二烷基苯磺酸钙;或非离子乳化剂,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、山梨糖醇酯(如山梨糖醇脂肪酸酯)或聚氧乙烯山梨糖醇酯(如聚氧乙烯山梨糖醇脂肪酸酯)。

[0275] 粉剂可通过将活性化合物与细分散的固体物质一起研磨而制备,所述固体物质例如滑石、天然粘土(例如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。

[0276] 悬浮浓缩剂可为水基或油基的。它们可以通过例如使用市售的球磨机湿法研磨而制备,并可以任选地加入上文已列出的例如用于其他剂型的表面活性剂。

[0277] 乳剂例如水包油乳剂(EW),可以借助例如搅拌器、胶体磨机和/或静态混合器制备,使用水性有机溶剂以及任选地加入上文已列出的例如用于其他剂型的表面活性剂。

[0278] 颗粒剂可以通过将所述活性成分喷洒在能够吸附到颗粒状惰性物质上、或通过使用粘合剂将活性成分浓缩物施用到载体表面而制备,所述载体例如砂、高岭土或颗粒状惰性材料,所述粘合剂例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油。合适的活性成分也可以以制备肥料颗粒的常规方式制备成颗粒——如果需要,可以制备为与肥料的混合物。

[0279] 水分散性颗粒剂通常可以通过常规方法制备,所述常规方法例如喷雾干燥法、流化床制粒法、盘式制粒法、使用高速混合器的混合法以及不使用固体惰性物质的挤出法。

[0280] 关于盘式颗粒、流化床颗粒、挤出法颗粒和喷雾法颗粒的制备,参见例如:"Spray-Drying Handbook"第三版,1979,G.Goodwin Ltd.,London;J.E.Browning,"Agglomeration",Chemical and Engineering 1967,第147页及后文;"Perry's Chemical Engineer's Handbook",第5版,McGraw-Hill,New York 1973,第8-57页中的方法。

[0281] 关于作物保护组合物制剂的更多细节,参见例如G.C.Klingman,"Weed Control

as a Science",John Wiley and Sons.,Inc.,New York,1961,81-96页;和J.D.Freyer,S.A.Evans,"Weed Control Handbook",第5版,Blackwell Scientific Publications,Oxford,1968,第101-103页。

[0282] 所述农业化学制剂通常含有0.1至99重量%、特别地为0.1至95重量%的本发明的化合物。在可湿性粉剂中,活性成分的浓度例如为约10至90重量%,剩余至100重量%的部分由常规制剂成分组成。在可乳化浓缩剂中,活性成分的浓度可为约1至90重量%,优选地为5至80重量%。粉剂形式的制剂中含有1至30重量%的活性成分,优选地通常含有5至20重量%的活性成分;可喷洒溶液中含有约0.05至80重量%、优选地为2至50重量%的活性成分。对于水分散性颗粒剂,活性成分的含量部分地取决于所述活性化合物以液体形式还是固体形式存在,以及所使用的粒化助剂和填料等。在水分散性颗粒剂中,活性成分的含量例如为1至95重量%,优选地为10至80重量%。

[0283] 此外,所述活性成分的制剂中任选含有各自常用的粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、抗冻剂和溶剂、填料、载体和染料、消泡剂、蒸发抑制剂、pH值和粘度调节剂。

[0284] 基于上述制剂,可以生产与其它农药活性物质——例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂和杀真菌剂——以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物,例如以成品制剂或桶混物的形式。

[0285] 为了使用,如果合适,将以市售形式存在的制剂以常规方式稀释,如在可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、分散剂、水分散性颗粒剂的情况下用水稀释。粉剂、土壤颗粒剂、用于播撒的颗粒剂和可喷洒溶液形式的制剂在使用前通常不用其他惰性物质进一步稀释。

[0286] 式(I)化合物及其盐所需的施用率因外部条件而异,尤其如温度、湿度和所用除草剂的类型。它可以在很大的范围内变化,例如活性物质的施用量在0.001至10.0千克/公顷或更多之间,但优选在0.005至5千克/公顷之间,更优选在0.01至1.5千克/公顷之间,更优选在0.05至1千克/公顷之间。这既适用于出苗前施药,也适用于出苗后施用。

[0287] 载体是一种天然的或合成的、有机的或无机的物质,将活性成分与载体混合或组合在一起,以提高适用性,特别是用于植物或植物部分或种子。载体可以是固体或液体,一般为惰性,并应适合在农业中使用。有用的固体或液体载体包括:例如铵盐和天然岩石粉尘,如高岭土、粘土、滑石粉、白垩、石英、芒硝、蒙脱石或硅藻土,以及合成岩石粉尘,如细硅石、氧化铝和天然或合成硅酸盐、树脂、蜡、固体肥料、水、醇类(尤其是丁醇)、有机溶剂、矿物油和植物油,及其衍生物。同样,也可以使用这些载体的混合物。有用的用于颗粒的固体载体包括:粉碎和分级的天然岩石,如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石,无机和有机粉的合成颗粒,以及有机材料的颗粒,如锯末、椰子壳、玉米棒和烟草杆。

[0288] 合适的液化气体增量剂或载体是在标准温度和大气压力下为气态的液体,例如气溶胶推进剂,如卤代烃,或者丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0289] 在制剂中,可以使用增粘剂,如羧甲基纤维素,粉末、颗粒或胶状的天然和合成聚合物,如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚醋酸乙烯酯,或者天然磷脂,如脑磷脂和卵磷脂,以及合成磷脂。其他添加剂可以是矿物油和植物油。

[0290] 当使用的增量剂是水时,也可以使用例如有机溶剂作为辅助溶剂。有用的液体溶剂主要有芳烃,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯化芳烃或氯化脂族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲

烷;脂族烃,如环已烷或石蜡,如矿物油馏分、矿物油和植物油;醇类,如丁醇或乙二醇及其醚和酯;酮类,如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环已酮;强极性溶剂,如二甲基甲酰胺和二甲亚砜,以及水。

[0291] 本发明的组合物还可以包含其他成分,例如表面活性剂。有用的表面活性剂是具有离子或非离子特性的乳化剂和/或泡沫形成剂、分散剂或润湿剂,或这些表面活性剂的混合物。其实例为聚丙烯酸盐、木质素磺酸盐、酚磺酸或萘磺酸盐、环氧乙烷与脂肪醇或脂肪酸或脂肪胺的缩聚物、取代酚(优选是烷基酚或芳基酚)、磺基琥珀酸酯盐、牛磺酸衍生物(优选是牛磺酸烷基酯)、聚乙氧基化醇或酚的磷酸酯、多元醇的脂肪酸酯,以及含有硫酸盐、磺酸盐和磷酸盐的化合物衍生物,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、蛋白质水解物、木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。如果其中一种活性成分和/或一种惰性载体不溶于水,并且在水中使用时,表面活性剂的存在是必要的。表面活性剂的比例为本发明组合物的5重量%至40重量%。可以使用染料,如无机颜料,如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝,以及有机染料,如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料,以及微量营养素,如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

[0292] 在适当的情况下,还可以存在其他成分,例如保护胶体、粘合剂、胶黏剂、增稠剂、触变物质、渗透剂、稳定剂、螯合剂、络合剂。一般来说,活性成分可与配方中常用的任何固体或液体添加剂结合。一般来说,本发明的组合物和制剂含有0.05%至99重量%、0.01%至98重量%、优选0.1%至95重量%、更优选0.5%至90重量%、最优选10%至70重量%的活性成分。本发明的活性成分或组合物可以本身使用,或者根据其各自的物理和/或化学性质,以其制剂的形式或由其制备的使用形式使用,如气溶胶、胶囊悬浮液、冷雾化浓缩物、温雾化浓缩物,胶囊颗粒、细颗粒、用于种子处理的可流动浓缩物、即用溶液、可撒粉粉末、可乳化浓缩物、水包油乳剂、油包水乳剂、大颗粒、微粒、油分散性粉末、混油可流动浓缩物、混油液体、泡沫、糊剂、农药包衣种子、悬浮浓缩物、悬乳浓缩物、可溶性浓缩物、悬浮剂、可喷洒粉末、可溶性粉末、粉尘和颗粒、水溶性颗粒或片剂、用于种子处理的水溶性粉剂、可湿性粉末、浸渍活性成分的天然产品和合成物质,以及聚合物物质和种子包衣材料中的微胶囊,还有ULV冷雾化和热雾化制剂。

[0293] 上述制剂可以用本身已知的方式生产,例如将活性成分与至少一种常用的增量剂、溶剂或稀释剂、乳化剂、分散剂和/或粘合剂或固定剂、润湿剂、防水剂、任选的干燥剂和紫外线稳定剂以及任选的染料和颜料、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、增粘剂、赤霉素和其他加工助剂混合。

[0294] 本发明的组合物不仅包括已经可以使用并可以用合适的设备施用到植物或种子上的制剂,也包括使用前必须用水稀释的市售浓缩物。

[0295] 本发明的活性成分可以以本身或以其(商用标准)制剂存在,或者以由这些制剂制备的与其他(已知)活性成分的混合物的使用形式存在,活性成分例如杀虫剂、引诱剂、不育剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、肥料、安全剂或化学信息素。

[0296] 用活性成分或组合物对植物和植物部位的本发明处理是通过常规处理方法直接进行或通过作用于其环境、生境或贮存空间而进行,所述常规处理方法例如浸渍、喷雾、雾化、灌溉、蒸发、撒粉、弥雾、撒播、发泡、涂抹、涂布、浇水(浇灌)、滴灌,并且,对于繁殖材料,

特别是对于种子,还可通过干处理种子、湿处理种子、浆料处理、包外衣(incrustation)、涂布一层或多层包衣等来处理。还可通过超低容量法施用活性成分,或将活性成分制剂或活性成分本身注入土壤。

[0297] 本发明的活性成分具有良好的植物相容性、有利的恒温毒性和环境相容性,适用于保护植物和植物器官、提高收获产量和改善收获作物的质量。它们优选用作作物保护组合物。它们对通常敏感和抗性物种以及所有或特定发育阶段都具有活性。

[0298] 根据本发明可以处理的植物包括以下主要农作物:玉米、大豆、棉花、芸苔属油料种子,如芸薹属油菜(Brassica napus)(如Canola)、芜菁(Brassica rapa)、芸薹属芥菜(B.juncea)(如芥菜)和芸薹属亚芥(Brassica carinata)、水稻、小麦、甜菜、甘蔗、燕麦、黑麦、大麦、小米和高粱、黑小麦、亚麻、葡萄和各种植物类群的各种水果和蔬菜,如蔷薇科(Rosaceae sp.)(例如苹果和梨等核果类水果,也包括杏、樱桃、杏仁和桃等核果类水果,以及草莓等浆果类水果)、茶藨子科(Ribesioidae sp)、胡颓子科(Juglandaceae sp.)、桦木科(Betulaceae sp)、无患子科(Anacardiaceae sp.)、椆科(Fagaceae sp.)、桑科(Moraceae sp.)、油橄榄科(Oleaceae sp.)、放线菌科(Actinidaceae sp.)、月桂科(Lauraceae sp.)、蘑香草科(Musaceae sp.)(例如香蕉树和人工林)、茜草科(Rubiaceae sp.)(例如咖啡)、山茶科(Theaceae sp)、梧桐科(Sterculicea)、芸香科(Rutaceae sp)(例如柠檬、橙子和葡萄柚)、茄科(Solanaceae sp.)(如西红柿、马铃薯、辣椒、茄子)、百合科(Liliaceae sp.)、菊科(Compositae sp.)(例如莴苣、朝鲜蓟和菊苣--包括根菊苣、苣荬菜或普通菊苣)、伞形科(Umbelliferaesp.)(例如胡萝卜、欧芹、芹菜和芹菜)、葫芦科(Cucurbitaceae sp.)(例如黄瓜--包括小黄瓜、南瓜、西瓜、花萼瓜和甜瓜)、葱科(Alliaceaesp.)(例如韭菜和洋葱)、十字花科(例如白甘蓝、红甘蓝、西兰花、花椰菜、球芽甘蓝、小白菜、大头菜、萝卜、辣根、水芹和大白菜)、豆科(Leguminosae sp.)(例如花生、豌豆和豆类--例如普通豆类和蚕豆)、藜科(Chenopodiaceae sp.)(例如瑞士甜菜、饲料甜菜、菠菜、甜菜根)、锦葵科(Malvaceae)(例如秋葵)、天门冬科(Asparagaceae)(例如芦笋);花园和林木中的有用植物和观赏植物;以及在每种情况下这些植物的转基因类型。

[0299] 如上所述,根据本发明可以处理所有植物及其部分。在一个优选的实施方案中,可处理野生植物物种和植物栽培品种,或通过常规生物育种技术(如杂交或原生质体融合)获得的植物及其部分。在另一个优选的实施方案中,可处理通过基因工程方法获得的转基因植物和植物栽培品种(如适当结合常规方法(转基因生物))及其部分。术语“部分”或“植物的部分”或”植物部分”已在上文解释。根据本发明,特别优选处理各自的商业习惯植物栽培品种或正在使用的植物栽培品种植物。植物栽培品种是指通过常规育种、诱变或DNA重组技术培育出的具有新特性(“性状”)的植物。它们可以是栽培品种、变种、生物型和基因型。

[0300] 本发明的处理方法可用于处理转基因生物(GMOs),如植物或种子。基因改性植物(或转基因植物)是指异源基因已稳定整合到基因组中的植物。术语“异源基因”主要是指在植物外部提供或组装的基因,这种基因在导入核基因组、叶绿体基因组或线粒体基因组时,由于该基因能表达植物体内存在的某种蛋白质或多肽或另一种基因,或植物体内存在的其他基因被下调或关闭(例如通过反义技术、共抑制技术或RNAi技术[RNA干扰]),从而赋予被转化的植物具有新的或改良的农艺性状或其他性状。位于基因组中的异源基因也称为转基因。转基因在植物基因组中的特定存在称为转化或转基因事件。

[0301] 根据植物物种或植物栽培品种、其生长地点和生长条件(土壤、气候、植被期、营养)的不同,本发明的处理方法也可能产生超叠加("协同")效应。例如,可能会产生以下超出实际预期效果的效果:根据本发明使用的活性成分和组合物的施用率降低和/或活性谱扩大和/或功效提高、植物生长更好、对高温或低温的耐受性提高、对干旱或水或土壤盐分的耐受性提高、开花性能提高、收获更容易、成熟更快、收获产量更高、果实更大、株高更高、叶色更绿、开花更早、收获产品的质量更高和/或营养价值更高、果实中的糖分浓度更高、收获产品的储藏稳定性和/或加工性更好。

[0302] 根据本发明可处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)是耐除草剂植物,即对一种或多种给定除草剂具有耐受性的植物。这种植物可以通过基因转化获得,也可以通过选择含有赋予这种除草剂耐受性的突变的植物获得。

[0303] 耐除草剂植物是指耐受草甘膦的植物,即耐受除草剂草甘膦或其盐类的植物。可以通过各种方法使植物耐受草甘膦。例如,可以用编码5-烯醇丙酮基莽草酸酯-3-磷酸合酶(EPSPS)的基因转化植物,从而获得耐草甘膦植物。此类EPSPS基因的例子包括鼠伤寒沙门氏菌的AroA基因(突变体CT7)(Comai等人,1983年,Science,221,370-371)、农杆菌属的CP4基因(Barry等人,1992年,Cur、1992,Curr.Topics Plant Physiol.7,139-145)、编码矮牵牛花EPSPS的基因(Shah等人,1986,Science 233,478-481)、编码番茄EPSPS的基因(Gasser等人,1988,J.Biol.Chem.263,4280-4289)或编码Eleusine EPSPS的基因(WO 01/66704)。它也可以是一种突变的EPSPS。耐草甘膦植物也可以通过表达编码草甘膦氧化还原酶的基因来获得。还可以通过表达编码草甘膦乙酰转移酶的基因来获得耐草甘膦植物。耐草甘膦植物还可以通过选择含有上述基因自然发生突变的植物来获得。已经描述了表达EPSPS基因的植物,这些基因可赋予植物耐草甘膦的能力。此外,还描述了表达赋予耐草甘膦的其他基因(例如脱羧酶基因)的植物。

[0304] 其他抗除草剂植物是指能耐受抑制谷氨酰胺合成酶的除草剂(如双丙氨膦、草丁膦或草铵膦)的植物。这种植物可以通过表达对除草剂有解毒作用的酶或对抑制作用有抗性的谷氨酰胺合成酶突变体来获得。这种有效的解毒酶的一个例子是编码草丁膦乙酰转移酶的酶(如来自链霉菌属的bar或pat蛋白)。已描述过表达外源草丁膦乙酰转移酶的植物。

[0305] 此外,耐除草剂植物还包括耐受抑制羟苯基丙酮酸二氧酶(HPPD)的除草剂的植物。羟苯基丙酮酸二氧酶是一种催化对羟苯基丙酮酸(HPP)转化为尿黑酸反应的酶。如WO 96/38567、WO 99/24585、WO 99/24586、WO 2009/144079、WO 2002/046387或US 6,768,044所述,可以用编码天然存在的抗性HPPD酶的基因或编码突变的或嵌合的HPPD酶的基因转化耐受HPPD抑制剂的植物。对HPPD抑制剂的耐受性也可通过采用编码某些酶的基因转化植物获得,尽管HPPD抑制剂抑制了原生HPPD酶,但仍能形成尿黑酸。WO 99/34008和WO 02/36787中描述了这种植物。植物对HPPD抑制剂的耐受性也可以通过转化植物来提高,除了编码耐受HPPD的酶的基因外,还带有编码预苯甲酸脱氢酶的基因,如WO 2004/024928所述,。此外,通过在植物基因组中插入编码可代谢或降解HPPD抑制剂的酶的基因,例如CYP450酶,可使植物对HPPD抑制剂的耐受性更强(见WO 2007/103567和WO 2008/150473)。

[0306] 其他抗除草剂植物是指对乙酰乳酸合成酶(ALS)抑制剂具有耐受性的植物。已知的ALS抑制剂包括磺酰脲类、咪唑啉酮类、三唑并嘧啶类、嘧啶氧(硫)苯甲酸酯类和/或磺酰氨基羰基三唑啉酮类除草剂等。众所周知,ALS酶(又称乙酰羟基酸合成酶,AHAS)的不同突

变会产生对不同除草剂和除草剂组的耐受性,如Tranel和Wright所述(Weed Science,2002年,50期,700-712页)。生产耐磺酰脲类植物和耐咪唑啉酮类植物的情况已经有所描述。此外,还描述了其他耐磺酰脲和咪唑啉酮的植物。

[0307] 其他耐咪唑啉酮和/或磺酰脲的植物可通过诱导突变、在除草剂存在下的细胞培养物中选择或突变育种获得(例如,参考大豆US 5,084,082、水稻WO 97/41218、甜菜US 5,773,702和WO 99/057965、莴苣US 5,198,599或向日葵WO 01/065922)。

[0308] 根据本发明还可以处理的植物或植物品种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)是抗虫转基因植物,即能抵抗某些目标昆虫攻击的植物。这种植物可以通过基因转化获得,或通过选择含有赋予这种抗虫性的突变的植物获得。

[0309] 在本上下文中,术语"抗虫转基因植物"包括任何含有至少一个转基因的植物,该转基因包含编码以下内容的编码序列:

[0310] 1)来自苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis)的杀虫晶体蛋白或其杀虫部分,例如Crickmore等人汇编的杀虫晶体蛋白(Microbiology and Molecular Biology Reviews 1998,62,807-813),由Crickmore等人(2005年)在苏云金芽孢杆菌毒素命名法中更新,在线网址:http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/),

[0311] 或其杀虫部分,例如Cry蛋白类Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1B、Cry1C、Cry1D、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Aa或Cry3Bb蛋白或其杀虫部分(例如EP-A 1999141和WO 2007/107302),或美国专利申请12/249,016中所述合成基因编码的蛋白质;或

[0312] 2)苏云金芽孢杆菌的晶体蛋白或其一部分,在苏云金芽孢杆菌或其一部分以外的第二种晶体蛋白存在的情况下具有杀虫作用,例如由Cy34和Cy35晶体蛋白组成的二元毒素(Nat.Biotechnol.2001,19,668-72;Applied Environm.Microbiol.2006,71,1765-1774)或由Cry1A或Cry1F蛋白和Cry2Aa或Cry2Ab或Cry2Ae蛋白组成的二元毒素(美国专利申请12/214,022和EP08010791.5);或

[0313] 3)包含来自苏云金芽孢杆菌两种不同杀虫晶体蛋白部分的杂交杀虫蛋白,例如上述1)蛋白的杂交或上述2)蛋白的杂交,例如玉米事件MON98034产生的Cry1A.105蛋白(WO 2007/027777);或

[0314] 4)上述1)至3)中任何一项的蛋白质,其中一些氨基酸,特别是1至10个氨基酸被另一种氨基酸取代,以获得对目标昆虫物种更高的杀虫活性,和/或扩大受影响的目标昆虫物种的范围,和/或由于在克隆或转化过程中引入编码DNA的变化,如玉米事件MON863或MON88017中的Cry3Bb1蛋白,或玉米事件MIR 604中的Cry3A蛋白;或

[0315] 5)来自苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌(Bacillus cereus)的杀虫分泌蛋白或其杀虫部分,如http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html中列出的无性系杀虫蛋白(VIP),例如VIP3Aa蛋白类别中的蛋白;或

[0316] 6)苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的分泌蛋白,在苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的第二种分泌蛋白存在的情况下具有杀虫作用,例如由VIP1A和VIP2A蛋白组成的二元毒素(WO 94/21795);或

[0317] 7)包含由苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的不同分泌蛋白部分的杂交杀虫蛋白,如上述1)中蛋白的杂交或上述2)中蛋白的杂交;或

[0318] 8)上文第5)至7)项中任一项的蛋白质,其中一些氨基酸,特别是1至10个氨基酸被

另一种氨基酸取代,以获得对目标昆虫种类更高的杀虫活性,和/或扩大受影响的目标昆虫种类的范围,和/或由于在克隆或转化过程中编码DNA诱导的变化(同时仍编码杀虫蛋白),例如棉花事件COT102中的VIP3Aa蛋白;或

[0319] 9)苏云金芽孢杆菌或蜡样芽孢杆菌的分泌蛋白,在苏云金芽孢杆菌的晶体蛋白存在下具有杀虫作用,如由VIP3蛋白和Cry1A或Cry1F蛋白组成的二元毒素(美国专利申请61/126083和61/195019),或由VIP3蛋白和Cry2Aa或Cry2Ab或Cry2Ae蛋白组成的二元毒素(美国专利申请12/214,022和EP08010791.5);或

[0320] 10)根据上述第9)项的蛋白质,其中一些氨基酸,特别是1至10个氨基酸被另一种氨基酸取代,以获得对目标昆虫种类更高的杀虫活性,和/或扩大受影响的目标昆虫种类的范围,和/或由于在克隆或转化过程中编码DNA诱导的变化(同时仍编码杀虫蛋白)。

[0321] 当然,本文所用的抗虫转基因植物也包括任何含有编码上述1至10项中任何一项蛋白质的基因组合的植物。在一个实施方案中,抗虫植物含有一个以上编码上述1至10项中任何一项蛋白质的转基因,以通过使用对同一目标昆虫种类具有杀虫作用但作用方式不同的不同蛋白质,如与昆虫体内不同的受体结合位点结合,来扩大受影响的目标昆虫种类的范围或延缓昆虫对植物的抗性发展。

[0322] 在本发明中,“抗虫转基因植物”还包括任何含有至少一个转基因的植物,该转基因包含产生双链RNA的序列,该序列在害虫食用后可阻止害虫生长。

[0323] 根据本发明还可处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)对非生物胁迫因素具有耐受性。这种植物可以通过基因转化获得,也可以通过选择含有赋予这种抗逆性的突变基因的植物获得。特别有用的抗逆性植物包括以下几种:

[0324] a.含有能降低植物细胞或植株中多(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因表达和/或活性的转基因的植物;

[0325] b.含有能降低植物或植物细胞中PARG编码基因的表达和/或活性的抗逆性增强转基因的植物;

[0326] c.含有增强抗逆性转基因的植物,该转基因编码烟酰胺腺嘌呤二核苷酸挽救生物合成途径的植物功能酶,包括烟酰胺酶、烟酸磷酸核糖基转移酶、烟酸单核苷酸腺苷基转移酶、烟酰胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或烟酰胺磷酸核糖基转移酶。

[0327] 也可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)显示出收获物的数量、质量和/或贮存稳定性的改变和/或收获物特定成分特性的改变,如,例如:

[0328] 1)合成变性淀粉的转基因植物,与野生型植物细胞或植物中合成的淀粉相比,其理化特性,特别是直链淀粉含量或直链淀粉/支链淀粉比例、分支程度、平均链长、侧链分布、粘度行为、胶凝强度、淀粉颗粒大小和/或淀粉颗粒形态都发生变化,因此这种变性淀粉更适合特定应用。

[0329] 2)合成非淀粉碳水化合物聚合物或合成非淀粉碳水化合物聚合物的转基因植物,与未进行基因改造的野生型植物相比,其特性有所改变。实例为生产聚果糖(尤其是菊粉和果聚糖)的植物、生产α-1,4-葡聚糖的植物、生产α-1,6-支链α-1,4-葡聚糖的植物以及生产交替糖的植物。

[0330] 3)产生透明质酸的转基因植物。

[0331] 4)具有例如“高可溶性固形物含量”、“低刺激性”(LP)和/或“长贮藏”(LS)特殊特性的转基因植物或杂交植物,如洋葱。

[0332] 根据本发明还可处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)是具有改变纤维特性的植物,如棉花。此类植物可通过基因转化或选择含有突变的植物获得,突变的植物可赋予此类改变的纤维特性,包括

[0333] a)含有改变形式的纤维素合成酶基因的植物,如棉花植物;

[0334] b)含有改变形式的rsw2或rsw3同源核酸的植物,如棉花植物,如蔗糖磷酸合成酶表达量增加的棉花植物;

[0335] c)蔗糖合成酶表达量增加的植物,如棉花植物;

[0336] d)植物,如棉花植物,其中纤维细胞底部的胞间膜门控的时间被改变,例如通过下调纤维选择性β-1,3-葡聚糖酶;

[0337] e)例如通过表达N-乙酰葡糖胺转移酶基因(包括nodC)和几丁质合成酶基因,使纤维的反应性发生改变的植物,如棉花植株。

[0338] 根据本发明还可以处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)是具有改变的油脂特征的植物,如油菜或相关的芸苔属植物。这些植物可以通过基因转化或选择含有突变的植物来获得,突变的植物可赋予植物这些改变的油脂特性,包括

[0339] a)产生高油酸含量油脂的植物,如油菜植物;

[0340] b)生产亚麻酸含量低的油脂的植物,如油菜植物;

[0341] c)生产饱和脂肪酸含量低的油脂的植物,如油菜植物。

[0342] 根据本发明还可处理的植物或植物栽培品种(可通过植物生物技术方法如基因工程获得)包括抗病毒植物如马铃薯,例如抗马铃薯病毒Y(阿根廷Tecnoplant公司的SY230和SY233)的植物,或例如抗马铃薯晚疫病病害的植物(如RB基因),或表现出冷诱导甜度降低(带有Nt-Inh和II-INV基因),或表现出矮小表型(A-20氧化酶基因)。

[0343] 根据本发明还可以处理的植物或植物栽培品种(通过植物生物技术方法如基因工程获得)是具有改变的种子破碎特性的植物,如油菜或相关的芸苔属植物。这类植物可通过基因转化或通过选择含有突变基因的植物获得,突变基因可赋予植物这类改变的特性,并包括种子破碎延迟或减少的植物,例如油菜。

[0344] 根据本发明可以处理的特别有用的转基因植物是具有转化事件或转化事件组合的植物,这些转化事件或转化事件组合是美国农业部(USDA)动植物卫生检验局(APHIS)已批准或待批的美国非管制地位申请的主题。有关信息可随时向APHIS(4700River Road Riverdale,MD20737,USA)索取,例如通过网站http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html。在本申请提交之日,APHIS批准或正在处理包含以下信息的申请:

[0345] 申请:申请的识别号。关于转化事件的技术描述,可通过申请编号从网站上的APHIS获取具体的申请文件。这些说明在此作为参考披露。

[0346] 申请延期:指请求延长范围或期限的早期申请。

[0347] 机构:提交申请者的名称。

[0348] 受管制物品:有关植物物种。

[0349] 转基因表型:转化事件赋予植物的性状。

[0350] 转化事件或品系:申请非管制地位的事件名称(有时也称为品系)。

[0351] APHIS文件:由APHIS发布的与申请有关的各种文件,或可向APHIS申请获得的文件。

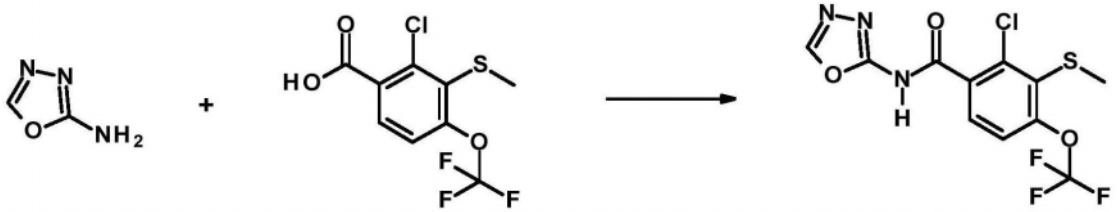
[0352] 可根据本发明进行处理的特别有用的转基因植物是含有一个或多个编码一种或多种毒素的基因的植物,例如以下列商品名称出售的转基因植物:**YIELDGARD®**(例如玉米、棉花、大豆),**KnockOut®**(例如玉米),**BiteGard®**(例如玉米),**BT-Xtra®**(例如玉米),**StarLink®**(例如玉米),**Bollgard®**(棉花),**Nucotn®**(棉花),**Nucotn33B®**(棉花),**NatureGard®**(例如玉米),**Protecta®**和**NewLeaf®**(马铃薯)。可提及的耐除草剂植物包括玉米品种、棉花品种和大豆品种,其可通过如下商品名称获得:Roundup **Ready®**(耐草甘膦,例如玉米、棉花和大豆)、Liberty **Link®**(耐草丁膦,例如油菜)、**IMI®**(耐咪唑啉酮)和**SCS®**(耐磺酰脲),例如玉米。可以提及的抗除草剂植物(以传统方式培育的耐除草剂植物)包括以**Clearfield®**名称销售的品种(例如玉米)。

[0353] 根据本发明可以处理的特别有用的转基因植物是含有转化事件或转化事件组合的植物,这些植物已被列入各国家或地区监管机构的数据库中(例如,参见http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx和http://cera-gmc.org/index.php?evidcode=&hstIDXCode=&gType=&Abbr Code=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gm_crop_database&mo de=Submit)。

[0354] A.化学实施例

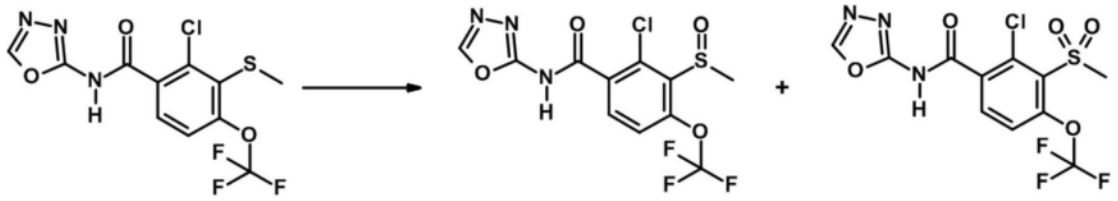
[0355] 以下实施例对本发明进行说明。

[0356] 2-氯-3-(甲硫基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺的合成(实施例1-31)

[0357] 

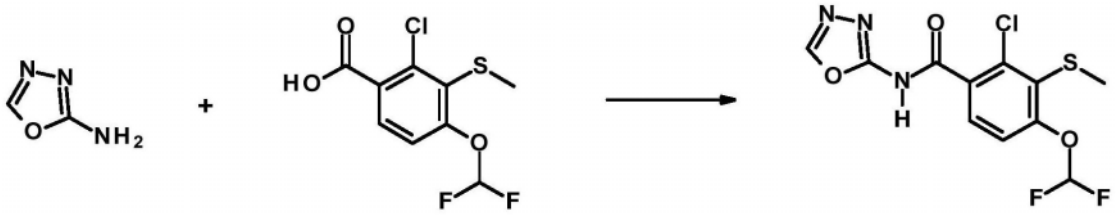
[0358] 向653mg(7.68mmol)1,3,4-噁二唑-2-胺和2.00克(6.98mmol)2-氯-3-(甲硫基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酸的50ml乙腈中,加入2.67ml(33.49mmol)1-甲基-1H-咪唑。混合物冷却至0℃-5℃。分次加入0.91ml(10.47mmol)草酰氯。然后将反应混合物升温至室温,并在该温度下搅拌3.5小时。对于后处理,反应混合物在旋转蒸发器上脱除溶剂,残留物用二氯甲烷和水吸收。相分离后,浓缩有机相,将残留物用水吸收。加入6M氢氧化钠溶液,然后用二氯甲烷反复洗涤混合物。之后,水相用6M盐酸酸化。过滤并干燥得到的固体。之后,再次用二氯甲烷和碳酸氢钠水溶液吸取固体。相分离后,有机相在旋转蒸发仪上去除溶剂。分离出910mg所需的产品,纯度为85%(按重量计)。

[0359] 合成2-氯-3-(甲基亚磺酰基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺(实施例1-32)和2-氯-3-(甲基磺酰基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺(实施例1-35)

[0360] 

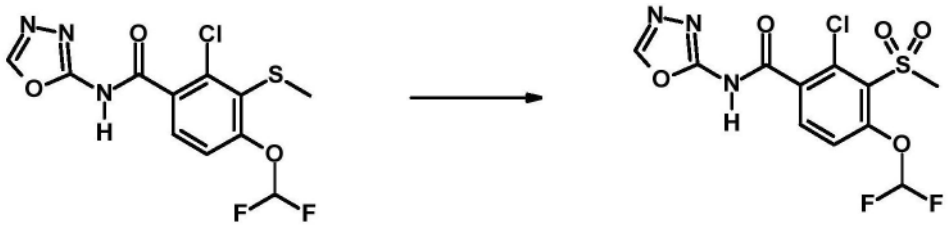
[0361] 向室温下25ml二氯甲烷中的750mg(85％重量;1.80mmol)2-氯-3-(甲硫基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺中加入713mg(77％重量;3.18mmol)3-氯过氧苯甲酸。将混合物在室温下搅拌6天。随后,再加入119mg(77％重量比;0.53mmol)3-氯过氧苯甲酸,将混合物在室温下搅拌,直到反应监测显示出大量的砜和亚砜。对于后处理,加入焦亚硫酸钠水溶液。混合物搅拌几分钟,相分离后,有机相在旋转蒸发器上去除溶剂。残留物经色谱纯化,得到112mg2-氯-3-(甲亚磺酰基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺,纯度为90重量％;和68mg2-氯-3-(甲基磺酰基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)-4-(三氟甲氧基)苯甲酰胺,纯度为90重量％。

[0362] 合成2-氯-4-(二氟甲氧基)-3-(甲硫基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)苯甲酰胺(实施例编号1-21)

[0363] 

[0364] 向697mg(8.19mmol)1,3,4-噁二唑-2-胺和2.00克(7.44mmol)2-氯-4-(二氟甲氧基)-3-(甲硫基)苯甲酸的50ml乙腈中,加入2.85ml(35.73mmol)1-甲基-1H-咪唑。混合物冷却至0℃-5℃。分次加入0.97ml(11.17mmol)草酰氯。然后将反应混合物升温至室温,并在该温度下搅拌16小时。对于后处理,在旋转蒸发器上去除反应混合物中的溶剂,并将残留物在二氯甲烷和水中吸收。相分离后,浓缩有机相,将残留物在水中吸收。加入6M氢氧化钠溶液,然后用二氯甲烷反复洗涤混合物。之后,水相用6M盐酸酸化。将混合物过滤,并将所得固体干燥。之后,再次用二氯甲烷和碳酸氢钠水溶液吸收固体。相分离后,有机相在旋转蒸发器上去除溶剂。残留物用少量二氯甲烷搅拌,然后将混合物过滤。干燥固体,分离出605mg所需产品,纯度为80％(按重量计)。

[0365] 合成2-氯-4-(二氟甲氧基)-3-(甲基磺酰基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)苯甲酰胺(实施例1-25)

[0366] 

[0367] 向室温下36ml二氯甲烷中的600mg(80％重量;1.43mmol)2-氯-4-(二氟甲氧基)-3-(甲硫基)-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)苯甲酰胺中加入1001mg(77％重量;4.47mmol)3-氯过氧苯甲酸。混合物在室温下搅拌7天。随后,为完成反应,两次分别加入123mg(77％重量比;0.55mmol)3-氯过氧苯甲酸和5ml乙腈。混合物在室温下搅拌,直到反应监测显示完全转化

为砜。对于后处理,加入焦亚硫酸钠水溶液。将混合物搅拌几分钟,相分离后,有机相在旋转蒸发器上去除溶剂。用叔丁基甲基醚吸收残留物,然后过滤混合物,干燥分离出的固体。分离出的固体为427mg所需产品,纯度为90%(按重量计)。

[0368] 下表列出的实例是按类似上述方法制备的,或可按类似上述方法获得的。这些化合物是特别优选的。

[0369] 使用到的缩写含义如下:

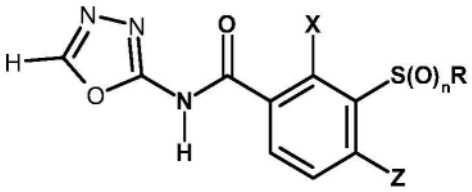
[0370] Me=甲基Et=乙基MeO=甲氧基

[0371] EtO=乙氧基$MeOCH_2$=甲氧基甲基MeS=甲硫基

[0372] HF_2CO=二氟甲氧基F_3CO=三氟甲氧基

[0373] 表1:通式(I)的发明化合物,其中取代基的定义如下。

[0374] 在“n=1”的情况下,化合物是手性亚砜。在这种情况下,“亚砜构型”一栏说明亚砜是以(R)构型、(S)构型还是以两种构型的外消旋形式存在。

[0375] 

[0376]

编号	X	Z	n	亚砜构型	R
1-1	F	HF_2CO	0		Me
1-2	F	HF_2CO	1	外消旋	Me
1-3	F	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-4	F	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-5	F	HF_2CO	2		Me
1-6	F	HF_2CO	0		Et
1-7	F	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-8	F	HF_2CO	1	(*R*)	Et
1-9	F	HF_2CO	1	(*S*)	Et
1-10	F	HF_2CO	2		Et
1-11	F	F_3CO	0		Me
1-12	F	F_3CO	1	外消旋	Me
1-13	F	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-14	F	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-15	F	F_3CO	2		Me
1-16	F	F_3CO	0		Et

[0377]

编号	X	Z	n	亚砜构型	R
1-17	F	F_3CO	1	外消旋	Et
1-18	F	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-19	F	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-20	F	F_3CO	2		Et
1-21	Cl	HF_2CO	0		Me
1-22	Cl	HF_2CO	1	外消旋	Me
1-23	Cl	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-24	Cl	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-25	Cl	HF_2CO	2		Me
1-26	Cl	HF_2CO	0		Et
1-27	Cl	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-28	Cl	HF_2CO	1	(*R*)	Et
1-29	Cl	HF_2CO	1	(*S*)	Et
1-30	Cl	HF_2CO	2		Et
1-31	Cl	F_3CO	0		Me
1-32	Cl	F_3CO	1	外消旋	Me
1-33	Cl	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-34	Cl	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-35	Cl	F_3CO	2		Me
1-36	Cl	F_3CO	0		Et
1-37	Cl	F_3CO	1	外消旋	Et
1-38	Cl	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-39	Cl	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-40	Cl	F_3CO	2		Et
1-41	Br	HF_2CO	0		Me
1-42	Br	HF_2CO	1	外消旋	Me
1-43	Br	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-44	Br	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-45	Br	HF_2CO	2		Me
1-46	Br	HF_2CO	0		Et
1-47	Br	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-48	Br	HF_2CO	1	(*R*)	Et
1-49	Br	HF_2CO	1	(*S*)	Et

[0378]

编号	X	Z	n	亚砜构型	R
1-50	Br	HF_2CO	2		Et
1-51	Br	F_3CO	0		Me
1-52	Br	F_3CO	1	外消旋	Me
1-53	Br	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-54	Br	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-55	Br	F_3CO	2		Me
1-56	Br	F_3CO	0		Et
1-57	Br	F_3CO	1	外消旋	Et
1-58	Br	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-59	Br	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-60	Br	F_3CO	2		Et
1-61	Me	HF_2CO	0		Me
1-62	Me	HF_2CO	1	外消旋	Me
1-63	Me	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-64	Me	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-65	Me	HF_2CO	2		Me
1-66	Me	HF_2CO	0		Et
1-67	Me	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-68	Me	HF_2CO	1	(*R*)	Et
1-69	Me	HF_2CO	1	(*S*)	Et
1-70	Me	HF_2CO	2		Et
1-71	Me	F_3CO	0		Me
1-72	Me	F_3CO	1	外消旋	Me
1-73	Me	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-74	Me	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-75	Me	F_3CO	2		Me
1-76	Me	F_3CO	0		Et
1-77	Me	F_3CO	1	外消旋	Et
1-78	Me	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-79	Me	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-80	Me	F_3CO	2		Et
1-81	Et	HF_2CO	0		Me
1-82	Et	HF_2CO	1	外消旋	Me

[0379]

编号	X	Z	n	亚砜构型	R
1-83	Et	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-84	Et	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-85	Et	HF_2CO	2		Me
1-86	Et	HF_2CO	0		Et
1-87	Et	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-88	Et	HF_2CO	1	(*R*)	Et
1-89	Et	HF_2CO	1	(*S*)	Et
1-90	Et	HF_2CO	2		Et
1-91	Et	F_3CO	0		Me
1-92	Et	F_3CO	1	外消旋	Me
1-93	Et	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-94	Et	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-95	Et	F_3CO	2		Me
1-96	Et	F_3CO	0		Et
1-97	Et	F_3CO	1	外消旋	Et
1-98	Et	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-99	Et	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-100	Et	F_3CO	2		Et
1-101	MeO	HF_2CO	0		Me
1-102	MeO	HF_2CO	1	外消旋	Me
1-103	MeO	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-104	MeO	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-105	MeO	HF_2CO	2		Me
1-106	MeO	HF_2CO	0		Et
1-107	MeO	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-108	MeO	HF_2CO	1	(*R*)	Et
1-109	MeO	HF_2CO	1	(*S*)	Et
1-110	MeO	HF_2CO	2		Et
1-111	MeO	F_3CO	0		Me
1-112	MeO	F_3CO	1	外消旋	Me
1-113	MeO	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-114	MeO	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-115	MeO	F_3CO	2		Me

[0380]

编号	X	Z	n	亚砜构型	R
1-116	MeO	F_3CO	0		Et
1-117	MeO	F_3CO	1	外消旋	Et
1-118	MeO	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-119	MeO	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-120	MeO	F_3CO	2		Et
1-121	EtO	HF_2CO	0		Me
1-122	EtO	HF_2CO	1	外消旋	Me
1-123	EtO	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-124	EtO	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-125	EtO	HF_2CO	2		Me
1-126	EtO	HF_2CO	0		Et
1-127	EtO	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-128	EtO	HF_2CO	1	(*R*)	Et
1-129	EtO	HF_2CO	1	(*S*)	Et
1-130	EtO	HF_2CO	2		Et
1-131	EtO	F_3CO	0		Me
1-132	EtO	F_3CO	1	外消旋	Me
1-133	EtO	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-134	EtO	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-135	EtO	F_3CO	2		Me
1-136	EtO	F_3CO	0		Et
1-137	EtO	F_3CO	1	外消旋	Et
1-138	EtO	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-139	EtO	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-140	EtO	F_3CO	2		Et
1-141	$MeOCH_2$	HF_2CO	0		Me
1-142	$MeOCH_2$	HF_2CO	1	外消旋	Me
1-143	$MeOCH_2$	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-144	$MeOCH_2$	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-145	$MeOCH_2$	HF_2CO	2		Me
1-146	$MeOCH_2$	HF_2CO	0		Et
1-147	$MeOCH_2$	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-148	$MeOCH_2$	HF_2CO	1	(*R*)	Et

[0381]

编号	X	Z	n	亚砜构型	R
1-149	$MeOCH_2$	HF_2CO	1	(*S*)	Et
1-150	$MeOCH_2$	HF_2CO	2		Et
1-151	$MeOCH_2$	F_3CO	0		Me
1-152	$MeOCH_2$	F_3CO	1	外消旋	Me
1-153	$MeOCH_2$	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-154	$MeOCH_2$	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-155	$MeOCH_2$	F_3CO	2		Me
1-156	$MeOCH_2$	F_3CO	0		Et
1-157	$MeOCH_2$	F_3CO	1	外消旋	Et
1-158	$MeOCH_2$	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-159	$MeOCH_2$	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-160	$MeOCH_2$	F_3CO	2		Et
1-161	MeS	HF_2CO	0		Me
1-162	MeS	HF_2CO	1	外消旋	Me
1-163	MeS	HF_2CO	1	(*R*)	Me
1-164	MeS	HF_2CO	1	(*S*)	Me
1-165	MeS	HF_2CO	2		Me
1-166	MeS	HF_2CO	0		Et
1-167	MeS	HF_2CO	1	外消旋	Et
1-168	MeS	HF_2CO	1	(*R*)	Et
1-169	MeS	HF_2CO	1	(*S*)	Et
1-170	MeS	HF_2CO	2		Et
1-171	MeS	F_3CO	0		Me
1-172	MeS	F_3CO	1	外消旋	Me
1-173	MeS	F_3CO	1	(*R*)	Me
1-174	MeS	F_3CO	1	(*S*)	Me
1-175	MeS	F_3CO	2		Me
1-176	MeS	F_3CO	0		Et
1-177	MeS	F_3CO	1	外消旋	Et
1-178	MeS	F_3CO	1	(*R*)	Et
1-179	MeS	F_3CO	1	(*S*)	Et
1-180	MeS	F_3CO	2		Et

[0382] 选定实施例的NMR数据

[0383] NMR峰列表法

[0384] 所选示例的1H NMR数据以1H NMR峰列表的形式记录。对于每个信号峰,首先列出

以ppm为单位的δ值,然后用圆括号列出信号强度。不同信号峰的δ值/信号强度数对用分号隔开。

[0385] 因此,一个示例的峰值列表形式为

[0386] δ1(强度$_1$);δ2(强度$_2$);.....;δi(强度$_i$);.....;δn(强度$_n$)

[0387] 尖锐信号的强度与NMR光谱打印示例中信号的高度相关,单位为厘米,并显示信号强度的真实比率。在宽信号的情况下,可将几个峰或信号的中间部分及其相对强度与光谱中最强烈的信号进行对比显示。

[0388] 为了校准1HNMR光谱的化学位移,我们使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移,特别是在DMSO中测量的光谱。因此,四甲基硅烷峰可能但不必出现在NMR峰列表中。

[0389] 1HNMR峰列表类似于传统的1HNMR打印输出,因此通常包含传统NMR解释中列出的所有峰。

[0390] 此外,与传统的1HNMR打印输出一样,它们可能会显示溶剂信号、目标化合物立体异构体(同样构成本发明主题的一部分)的信号和/或杂质峰。

[0391] 在报告溶剂和/或水的δ范围内的化合物信号时,我们的1HNMR峰列表会显示通常的溶剂峰,例如DMSO-D_6中的DMSO峰和水峰,这些峰的平均强度通常较高。

[0392] 目标化合物的立体异构体峰和/或杂质峰的平均强度通常低于目标化合物峰(例如纯度大于90%)。

[0393] 这些立体异构体和/或杂质可能是特定制备工艺的典型特征。因此,在这种情况下,它们的峰值可以帮助我们参照"副产品指纹"来识别制备过程的重现。

[0394] 如果需要,通过已知方法(MestreC、ACD模拟,但也可使用经验评估的预期值)计算目标化合物峰值的专家可以分离出目标化合物的峰值,可任选使用额外的强度过滤器。这种分离类似于传统1H NMR解释中的相关峰拾取。

[0395] 有关1HNMR峰列表的更多详情,请参阅编号为564025的研究披露数据库。

[0396]

1-31: ^{1}H-NMR(400.6 MHz, CDCl3): δ= 8.1731 (2.7); 7.6629 (1.7); 7.6414 (2.0); 7.3533 (1.0); 7.3498 (1.1); 7.3319 (0.9); 7.3283 (0.9); 7.2619 (14.1); 2.4906 (0.6); 2.4651 (16.0); 0.0080 (0.6); -0.0002 (18.8); -0.0085 (0.5)
1-21: ^{1}H-NMR(400.6 MHz, CDCl3): δ= 8.2180 (0.5); 7.7136 (0.9); 7.6922 (0.9); 7.2606 (42.9); 7.2510 (2.0); 7.2293 (1.2); 6.8380 (1.1); 6.6559 (2.3); 6.4739 (1.2); 2.4937 (1.9); 2.4744 (16.0); 1.5691 (1.0); 0.0079 (1.9); -0.0002 (60.1); -0.0085 (3.0); -0.0284 (0.5); -0.0410 (0.7)
1-32: ^{1}H-NMR(400.6 MHz, CDCl3): δ= 7.5186 (1.1); 7.4207 (0.7); 7.3963 (0.7); 7.2602 (212.2); 6.9966 (1.1); 3.1170 (1.4); 3.1079 (16.0); 1.5462 (4.8); 1.2551 (1.3); 0.1458 (1.0); 0.0080 (8.1); -0.0002 (311.2); -0.0085 (10.1); -0.1495 (0.9)
1-35: ^{1}H-NMR(400.6 MHz, CDCl3): δ= 7.8896 (0.6); 7.8679 (0.7); 7.5011 (0.5); 7.2605 (40.1); 3.3588 (16.0); 0.0079 (1.5); -0.0002 (60.1); -0.0060 (0.6); -0.0085 (1.8)
1-22: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, CD3CN): δ= 8.4638 (2.4); 7.7968 (1.5); 7.7754 (1.7); 7.4144 (1.4); 7.3930 (1.3); 7.0952 (1.3); 6.9171 (1.1); 6.9050 (1.2); 6.7270 (1.3); 3.0905 (16.0); 2.1649 (4.1); 2.1355 (1.1); 2.1292 (0.8); 1.9923 (2.2); 1.9861 (1.6); 1.9804 (20.1); 1.9742 (40.6); 1.9680 (57.6); 1.9619 (41.1); 1.9557 (20.8)
1-25: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, CD3CN): δ= 8.4656 (1.7); 7.8657 (1.2); 7.8442 (1.4); 7.4762 (0.7); 7.4738 (1.3); 7.4714 (0.8); 7.4548 (0.7); 7.4524 (1.2); 7.4500 (0.7); 7.0819 (1.3); 6.8997 (2.7); 6.7174 (1.3); 3.3750 (16.0); 3.1600 (0.8); 1.9922 (1.2); 1.9862 (0.7); 1.9803 (10.5); 1.9742 (20.5); 1.9679 (30.1); 1.9618 (20.0); 1.9556 (10.3); 1.1635 (2.4)

[0397] B.制剂实施例

[0398] a)将10重量份的式(I)化合物和/或其盐与90重量份作为惰性物质的滑石粉混合,并在锤磨机中粉碎混合物,即可得到粉剂。

[0399] b)将25重量份的式(I)化合物和/或其盐、64重量份作为惰性物质的含高岭土石英、10重量份的木质素磺酸钾和1重量份的作为润湿剂和分散剂的油酰甲基牛磺酸钠混合,并在针盘磨中研磨,可得到易水分散的可湿性粉剂。

[0400] c)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(®TritonX207)、3重量份异十三醇聚乙二醇醚(8EO)和71重量份石蜡矿物油(沸点范围如约255℃至超过255℃)混合,并用耐磨球磨机研磨至细度5微米以下,得到易在水中分散的可分散浓缩剂。

[0401] d)由15重量份的式(I)化合物和/或其盐,75重量份作为溶剂的环已酮和10重量份作为乳化剂的氧化乙基壬基酚制成可乳化浓缩剂。

[0402] e)水分散颗粒剂的如下获得:将以下物质混合,在针盘磨机中研磨该混合物,并在流化床中将水作为造粒液喷洒将粉末造粒:

[0403] 75重量份式(I)化合物和/或其盐、

[0404] 10重量份木质素磺酸钙、

[0405] 5重量份十二烷基硫酸钠、

[0406] 3重量份聚乙烯醇和

[0407] 7份重量高岭土。

[0408] f)水分散颗粒剂也可以如下获得:通过在胶体磨中均化和预粉碎以下物质,然后在珠磨机中研磨混合物,并通过单相喷嘴在喷雾塔中雾化和干燥得到的悬浮液:

[0409] 25重量份的式(I)化合物和/或其盐、

[0410] 5重量份2,2'-二萘甲烷-6,6'-二磺酸钠、

[0411] 2重量份油酰甲基牛磺酸钠

[0412] 1重量份聚乙烯醇、

[0413] 17重量份碳酸钙和

[0414] 50重量份水。

[0415] C.生物数据

[0416] 下文中使用的缩略语含义如下:

[0417] ALOMY:大穗看麦娘(Alopecurus myosuroides) SETVI:狗尾草(Setaria viridis)

[0418] AMARE:反枝苋(Amaranthus retroflexus) AVEFA:野燕麦(Avena fatua)

[0419] LOLRI:硬直黑麦草(Lolium rigidum) ECHCG:稗草(Echinochloa crus-galli)

[0420] VERPE:阿拉伯婆婆纳(Veronica persica) VIOTR:三色堇(Viola tricolor)

[0421] POLCO:卷茎蓼(Polygonum convolvulus) ABUTH:苘麻(Abutylon threophrasti)

[0422] PHBPU:圆叶牵牛(Pharbitis purpurea) MATIN:淡甘菊(Matricaria inodora)

[0423] DIGSA马唐(Digitaria sanguinalis) KCHSC:地肤(Kochia scoparia)

[0424] 1.出苗后对有害植物的除草作用

[0425] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子置于木纤维盆中的砂壤土中,盖上土壤,在生长条件良好的温室中培育。播种2至3周后,在试验植物的单叶期对其进行处理。本发明的化合物以可湿性粉剂(WP)或可乳化浓缩剂(EC)的形式配制,然后以水性悬浮剂或乳剂的形式喷洒在植物的绿色部分,水施用量相当于600至800l/ha,并添加0.2%的润湿剂。在最佳生长条件下,将试验植物在温室中放置约3周后,与未处理的对照组相比,目测评估制剂的作用(除草作用百分比(%)):活性100%=植物死亡,活性0%=与对照植物相同)。

[0426] 表1a:在20g/ha下对ABUTH的出苗后效果,以百分比计

[0427]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-32	20	90
1-35	20	80
1-22	20	100
1-25	20	100

[0428] 表1b:在80g/ha下对ABUTH的出苗后效果,以百分比计

[0429]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-31	80	90
1-21	80	80
1-32	80	100
1-35	80	90
1-22	80	100
1-25	80	100

[0430] 表2a:在20g/ha下对ALOMY的出苗后效果,以百分比计

[0431]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ALOMY
1-32	20	80

[0432] 表2b:在80g/ha下对ALOMY的出苗后效果,以百分比计

[0433]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ALOMY
1-32	80	90

[0434] 表3a:在20g/ha下对AMARE的出苗后效果,以百分比计

[0435]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-31	20	100
1-21	20	100
1-32	20	100
1-35	20	90
1-22	20	100
1-25	20	100

[0436] 表3b:在80g/ha下对AMARE的出苗后效果,以百分比计

[0437]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-31	80	100
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	90
1-22	80	100
1-25	80	100

[0438] 表4a:在20g/ha下对DIGSA的出苗后效果,以百分比计

[0439]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-31	20	90
1-21	20	90
1-32	20	90
1-35	20	90
1-22	20	100
1-25	20	100

[0440] 表4b:在80g/ha下对DIGSA的出苗后效果,以百分比计

[0441]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-31	80	90
1-21	80	90
1-32	80	90
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0442] 表5:在20g/ha下对LOLRI的出苗后效果,以百分比计

[0443]

实施例编号	剂量 [g/ha]	LOLRI
1-32	80	90
1-35	80	80
1-22	80	90

[0444] 表6a:在20g/ha下对MATIN的出苗后效果,以百分比计

[0445]

实施例编号	剂量 [g/ha]	MATIN
1-31	20	80
1-32	20	100
1-35	20	90
1-22	20	100
1-25	20	100

[0446] 表6b:在80g/ha下对MATIN的出苗后效果,以百分比计

[0447]

实施例编号	剂量 [g/ha]	MATIN
1-31	80	90
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0448] 表7a:在20g/ha下对PHBPU的出苗后效果,以百分比计

[0449]

实施例编号	剂量 [g/ha]	PHBPU
1-31	20	90
1-32	20	90
1-35	20	90
1-25	20	100

[0450] 表7b:在80g/ha下对PHBPU的出苗后效果,以百分比计

[0451]

实施例编号	剂量 [g/ha]	PHBPU
1-31	80	90
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0452] 表8a:在20g/ha下对POLCO的出苗后效果,以百分比计

[0453]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POLCO
1-32	20	90
1-35	20	80

[0454] 表8b:在80g/ha下对POLCO的出苗后效果,以百分比计

[0455]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POLCO
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	90

[0456] 表9a:在20g/ha下对SETVI的出苗后效果,以百分比计

[0457]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-31	20	80
1-21	20	80
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	100
1-25	20	100

[0458] 表9b:在80g/ha下对SETVI的出苗后效果,以百分比计

[0459]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-31	80	90
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0460] 表10a:在20g/ha下对VERPE的出苗后效果,以百分比计

[0461]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-32	20	90
1-35	20	90
1-22	20	90
1-25	20	90

[0462] 表10b:在80g/ha下对VERPE的出苗后效果,以百分比计

[0463]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-31	80	80
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0464] 表11a:在20g/ha下对VIOTR的出苗后效果,以百分比计

[0465]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VIOTR
1-31	20	90
1-21	20	100
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	100
1-25	20	100

[0466] 表11b:在80g/ha下对VIOTR的出苗后效果,以百分比计

[0467]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VIOTR
1-31	80	100
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0468] 表12a:在20g/ha下对KCHSC的出苗后效果,以百分比计

[0469]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-31	20	100
1-21	20	90
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	100
1-25	20	100

[0470] 表12b:在80g/ha下对KCHSC的出苗后效果,以百分比计

[0471]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-31	80	100
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0472] 表13a:在20g/ha下对AVEFA的出苗后效果,以百分比计

[0473]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AVEFA
1-22	20	90

[0474] 表13b:在80g/ha下对AVEFA的出苗后效果,以百分比计

[0475]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AVEFA
1-22	80	100
1-25	80	100

[0476] 表14a:在20g/ha下对ECHCG的出苗后效果,以百分比计

[0477]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-22	20	100
1-25	20	80

[0478] 表14b:在80g/ha下对ECHCG的出苗后效果,以百分比计

[0479]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-22	80	100
1-25	80	100

[0480] 由表1a/b、2a/b、3a/b、4a/b、5、6a/b、7a/b、8a/b、9a/b、10a/b、11a/b、12a/b、13a/b和14a/b中的结果所示,本发明化合物对广谱的禾本科杂草和阔叶杂草具有良好的出苗后效果。例如,所列实施例在施用量为80/20g/ha下,除其他植物外,对大穗看麦娘、马唐、狗尾草、阿拉伯婆婆纳和三色堇显示出活性为80-100%。因此,本发明的化合物适用于通过苗后法防治不想要的植物生长。

[0481] 2.出苗前除草效果和作物植物相容性

[0482] 将单子叶和双子叶杂草植物和作物植物的种子置于木纤维盆中的砂壤土中,并用土覆盖。本发明的化合物以可湿性粉剂(WP)或可乳化浓缩剂(EC)的形式配制,然后以水性悬浮剂或乳剂的形式施用于覆盖土壤的表面,水施用量相当于600至8001/ha,并添加0.2%的润湿剂。

[0483] 处理后,将盆放入温室,使试验植物保持良好的生长条件。试验期3周后,通过与未处理的对照组进行比较,对试验植物的损害情况进行目测评分(除草活性百分比(%):100%活性=植物死亡,0%活性=与对照植物相同)。

[0484] 表1a:在20g/ha下对ABUTH的出苗前效果,以百分比计

[0485]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-31	20	90
1-35	20	90
1-22	20	80
1-25	20	100

[0486] 表1b:在80g/ha下对ABUTH的出苗前效果,以百分比计

[0487]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-31	80	100
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0488] 表2a:在20g/ha下对ALOMY的出苗前效果,以百分比计

[0489]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ALOMY
1-32	20	80

[0490] 表2b:在80g/ha下对ALOMY的出苗前效果,以百分比计

[0491]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ALOMY
1-32	80	100
1-35	80	80
1-22	80	80

[0492] 表3a:在20g/ha下对AMARE的出苗前效果,以百分比计

[0493]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-21	20	90
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	100
1-25	20	100

[0494] 表3b:在80g/ha下对AMARE的出苗前效果,以百分比计

[0495]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-31	80	100
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0496] 表4a:在20g/ha下对AVEFA的出苗前效果,以百分比计

[0497]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AVEFA
1-32	20	80
1-35	20	90

[0498] 表4b:在80g/ha下对AVEFA的出苗前效果,以百分比计

[0499]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AVEFA
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	80
1-25	80	90

[0500] 表5a:在20g/ha下对DIGSA的出苗前效果,以百分比计

[0501]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-31	20	90
1-21	20	90
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	100
1-25	20	100

[0502] 表5b:在80g/ha下对DIGSA的出苗前效果,以百分比计

[0503]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-31	80	100
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0504] 表6a:在20g/ha下对ECHCG的出苗前效果,以百分比计

[0505]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	90
1-25	20	100

[0506] 表6b:在80g/ha下对ECHCG的出苗前效果,以百分比计

[0507]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-31	80	100
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0508] 表7a:在20g/ha下对LOLRI的出苗前效果,以百分比计

[0509]

实施例编号	剂量 [g/ha]	LOLRI
1-32	20	90
1-35	20	80

[0510] 表7b:在80g/ha下对LOLRI的出苗前效果,以百分比计

[0511]

实施例编号	剂量 [g/ha]	LOLRI
1-32	80	90
1-35	80	90
1-25	80	90

[0512] 表8a:在20g/ha下对MATIN的出苗前效果,以百分比计

[0513]

实施例编号	剂量 [g/ha]	MATIN
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	100
1-25	20	100

[0514] 表8b:在80g/ha下对MATIN的出苗前效果,以百分比计

[0515]

实施例编号	剂量 [g/ha]	MATIN
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0516] 表9a:在20g/ha下对PHBPU的出苗前效果,以百分比计

[0517]

实施例编号	剂量 [g/ha]	PHBPU
1-35	20	80

[0518] 表9b:在80g/ha下对PHBPU的出苗前效果,以百分比计

[0519]

实施例编号	剂量 [g/ha]	PHBPU
1-32	80	90
1-35	80	100
1-22	80	80
1-25	80	90

[0520] 表10a:在20g/ha下对POLCO的出苗前效果,以百分比计

[0521]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POLCO
1-32	20	90
1-35	20	90

[0522] 表10b:在80g/ha下对POLCO的出苗前效果,以百分比计

[0523]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POLCO
1-21	80	100
1-32	80	90
1-35	80	100
1-22	80	90

[0524] 表11a:在20g/ha下对SETVI的出苗前效果,以百分比计

[0525]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-32	20	90
1-35	20	100
1-22	20	90
1-25	20	100

[0526] 表11b:在80g/ha下对SETVI的出苗前效果,以百分比计

[0527]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-31	80	100
1-21	80	90
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0528] 表12a:在20g/ha下对VERPE的出苗前效果,以百分比计

[0529]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-32	20	80
1-22	20	80
1-25	20	90

[0530] 表12b:在80g/ha下对VERPE的出苗前效果,以百分比计

[0531]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-32	80	90
1-35	80	100
1-22	80	90
1-25	80	100

[0532] 表13a:在20g/ha下对VIOTR的出苗前效果,以百分比计

[0533]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VIOTR
1-31	20	90
1-21	20	100
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	100
1-25	20	100

[0534] 表13b:在80g/ha下对VIOTR的出苗前效果,以百分比计

[0535]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VIOTR
1-31	80	90
1-21	80	100
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0536] 表14a:在20g/ha下对KCHSC的出苗前效果,以百分比计

[0537]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-31	20	90
1-21	20	90
1-32	20	100
1-35	20	100
1-22	20	100
1-25	**20**	**100**

[0538] 表14b:在80g/ha下对KCHSC的出苗前效果,以百分比计

[0539]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-31	80	100
1-21	80	90
1-32	80	100
1-35	80	100
1-22	80	100
1-25	80	100

[0540] 由表1a/b、2a/b、3a/b、4a/b、5a/b、6a/b、7a/b、8a/b、9a/b、10a/b、11a/b、12a/b、13a/b和14a/b的结果所示,本发明化合物对广谱的禾本科杂草和阔叶杂草具有良好的出苗前除草效果。例如,所述化合物在80/20g/ha的施用量下,除其他植物外,对大穗看麦娘、野燕麦、马唐、稗草、硬直黑麦草、狗尾草、反枝苋、三色堇和阿拉伯婆婆纳显示出活性为80-100%。因此,本发明的化合物适用于通过苗前法防治不想要的植物生长。