

[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int. Cl⁶

C07C317/44

C07C323/22

A01N 41/10

[12]发明专利说明书

[21] ZL 专利号 94101552.1

[45]授权公告日 1999年2月3日

[11]授权公告号 CN 1041916C

[22]申请日 94.1.8 [24]颁证日 98.11.7

[21]申请号 94101552.1

[73]专利权人 SDS生物技术株式会社

地址 日本东京

[72]发明人 小松原宪一 佐藤正 三上宪治

山田裕司

[56]参考文献

US5089046 1992. 2.26 A01N41/04

审查员 00 00

[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事
务所

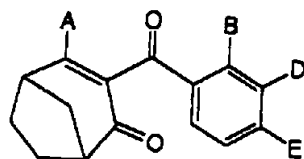
代理人 黄革生

权利要求书 5 页 说明书 38 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 取代的苯甲酰基环烯酮,制备方法和除草剂

[57]摘要

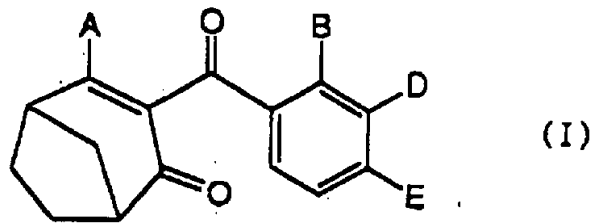
通式(I)所示的化合物,含有所说的化合物作为有效成分的除草剂和水田选择性除草剂,通过施用除草剂于需要控制的地方防治不需要植物生长的方法。



(I)

权 利 要 求 书

1. 一个通式(I)所示的取代的苯甲酰基环烯酮衍生物



在式中 A 代表一个 $-S(O)_nR^1$ 基团或一个 $-OR^2$ 基团, 其中

在 $-S(O)_nR^1$ 的基团中, n 是 0 或 2, R^1 代表一个带有 1 - 4 个碳原子的低级烷基, 其碳原子可被一个带有 2 - 3 个碳原子的低级烷氧基羰基取代;

一个带有 3-6 个碳原子的环烷基基团;

一个苄基基团, 它可被 1 至 3 个卤原子, 甲基和/或硝基取代;

一个苯基基团, 它可被 1-5 个卤原子, 带 1-4 个碳原子的 1-3 个低级烷基, 一个带 1-4 个碳原子的低级烷氧基、一个卤代甲基、一个硝基、一个氰基和/或一个被带有 1-2 个碳原子的 1 或 2 个烷基或烷基磺酰基取代的氨基取代;

在式 $-OR^2$ 基团中, R^2 代表一个被 1 至 5 个卤原子和/

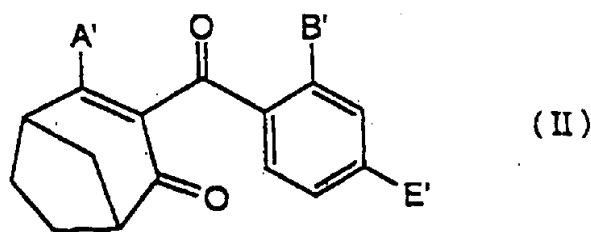
或 1 至 3 个带有 1—3 个碳原子的低级烷基取代的苯基；

B 代表一个卤原子，一个硝基，一个带有 1—2 个碳原子的低级烷基，或一个带有 1—2 个碳原子的低级烷基磺酰基；

D 代表一个氢原子，一个带有 1—2 个碳原子的低级烷基，一个带有 1—4 个碳原子的低级烷氧基，一个带有 2—4 个碳原子的低级烷氧基甲基，或一个带有 2—5 个碳原子的低级烷氧基羰基；

E 代表一个卤原子，一个带有 1—3 个碳原子的低级烷氧基，该低级烷氧基上的碳原子可被 1—3 个氟原子取代，一个带有 1—3 个碳原子的低级烷硫基，一个带有 1—3 个碳原子的低级烷基磺酰基，该烷基磺酰基上的碳原子可被 1 至 3 个氟原子取代，或一个带有 1—3 个碳原子的低级烷基磺酰基氧基。

2. 根据权利要求 1 所述的取代的苯甲酰基环烯酮衍生物，其中所述的取代的苯甲酰基环烯酮衍生物由通式 (II) 表示：



在式中

A 代表一个 $-S-(O)_nR^3$ 基团，其中 n 是 0 或 2 和 R^3 代表一个可被 1—5 个卤原子或被带有 1—4 个碳原子的 1—3 个低级

烷基取代的苯基,

B¹ 代表一个卤原子或一个硝基, 和

E¹ 代表一个卤原子或一个带有 1 - 3 个碳原子的低级烷氧基
酰基, 该基团上的碳原子可被 1 - 3 个氟原子取代。

3. 根据权利要求 1 的衍生物, 该衍生物为 3 - (2 - 氯 - 4 -
甲基磺酰基苯甲酰基) - 4 - 苯硫基双环 [3.2.1] 辛 - 3 - 烯 -
2 - 酮。

4. 根据权利要求 1 的衍生物, 该衍生物为 3 - (2 - 氯 - 4 -
甲基磺酰基苯甲酰基) - 4 - (4 - 甲基苯硫基) 双环 [3.2.1] 辛
- 3 - 烯 - 2 - 酮。

5. 根据权利要求 1 的衍生物, 该衍生物为 3 - (2 - 氯 - 4 -
甲基磺酰基苯甲酰基) - 4 - 苯基磺酰基双环 [3.2.1] 辛 - 3 -
烯 - 2 - 酮。

6. 根据权利要求 1 的衍生物, 该衍生物为 3 - (2 - 氯 - 4 -
甲基磺酰基苯甲酰基) - 4 - (2, 6 - 二甲基苯硫基) - 双环
[3.2.1] 辛 - 3 - 烯 - 2 - 酮。

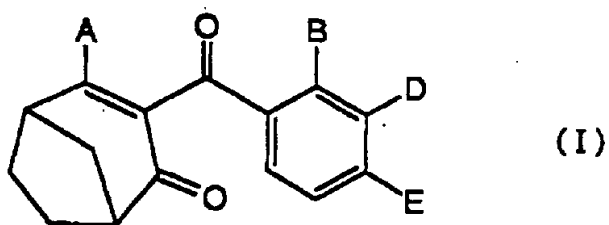
7. 根据权利要求 1 的衍生物, 该衍生物为 3 - (2 - 氯 - 4 -
甲基磺酰基苯甲酰基) - 4 - (3 - 氯代苯硫基) - 双环 [3.2.1]
辛 - 3 - 烯 - 2 - 酮。

8. 根据权利要求 1 的衍生物, 该衍生物为 3 - (2 - 硝基 - 4
- 甲基磺酰基苯甲酰基) - 4 - (2, 6 - 二氯代苯硫基) - 双
环 [3.2.1] 辛 - 3 - 烯 - 2 - 酮。

9. 一个除草组合物, 它含有如权项要求 1 中的通式 (I) 所示
的取代的苯甲酰基环烯酮衍生物和一个农业上可接受的载体。

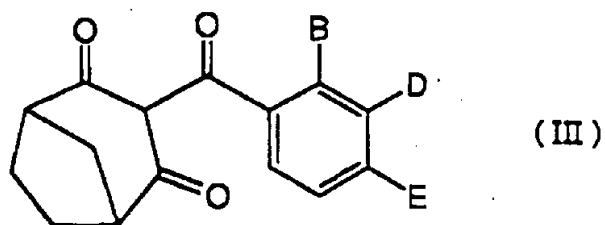
10. 一个控制水田中不需要植物生长的方法, 它包括应用一个
如权项要求 1 中通式 (I) 所示的一个有效除草剂量的取代的苯甲
酰基环烯酮衍生物。

11. 一个制备通式(I)所示的取代的苯甲酰基环烯酮衍生物的方法



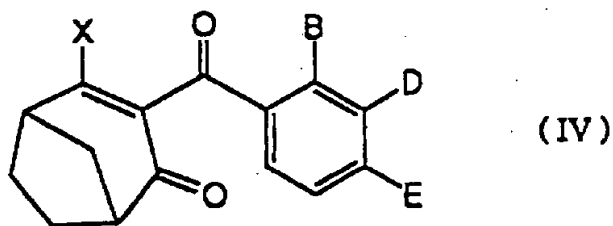
式中 A、B、D 和 E 具有在权利要求 1 中所确定的含义，
制备方法包括：

(a) 用一个卤化剂卤化通式(III)所示的一个化合物



式中 B、D 和 E 具有如在权利要求 1 中所确定的相同的含义，

得到一个通式(IV)所示的化合物



在式中 X 代表一个卤原子，B、D 和 E 具有上面所给定的相同的含义；

(b) 将所说的通式 (IV) 所示的化合物与硫醇或酚反应；或

(c) 使此产物经受氧化反应。

12. 在权利要求 11 中的方法，所说的卤化剂是亚硫酸卤和草酰卤。

说 明 书

取代的苯甲酰基环烯酮,制备方法

和除草剂

本发明是有关新的取代的苯甲酰基环烯酮衍生物,其制备方法,含有此化合物作为有效成分的除草剂组合物,和用这种除草剂组合物控制植物生长的方法。

以前在美国专利 USP5,006,158 中曾揭示了 2-取代的苯甲酰基-1,3-环己二酮化合物具有一定的除草活性。

美国专利 USP4,762,551 揭示了一些包括 3-(取代的硫代)-2-苯甲酰环己-2-酮在内的化合物,和欧洲专利 EP338,992 揭示了取代的芳基双环二酮可作为除草活性化合物。但是,本发明的化合物在它们的化学结构及其取代基的结合方面不同于先前所揭示的那些化合物。它们在以前的文献中从未涉及过,所以本发明的化合物是一些新发现的化合物。此外,上面所提到的已知化合物对水稻具有很高的植物毒性,所以它们难以作为稻田除草剂使用。

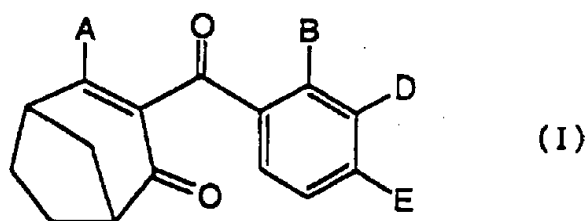
下面通式(I)所代表的本发明的化合物对很多杂草具有除草活性且对水稻的植物毒性很低,由于其在土壤中有着最佳的移动性和水溶性,所以与以前文献中所报道的其它二酮类化合物相比,从环境

保护的角度考虑，它们是被视作为可为世界所接受的更为实用的除草剂。

例如，将此化合物加到水田表面水中后，然后让稻田水按每日排放深度为 3cm 的速度排放 3 天（3 天总的排放掉深度为 9cm 的水），发现表 3 中所给的化合物在上述条件下其在土壤中运动的深度为 1 至 5cm，而相比之下，在 USP5,006,158, USP4,762,551 和 EP338,992 中所报道的已知的具除草活性的二酮化合物其在土壤中运动的深度为 6—9cm。

许多本发明的化合物还具有这样一个优良的特性，即水溶性小，只相当于上面所述的已知的具有除草活性的二酮化合物的几十分之一至几万分之一。

本发明所提供的新化合物如通式 (I) 所示



在式中 A 代表一个 $-S(O)_nR^1$ 基团或一个 $-OR^2$ 基团，

在 $-S(O)_nR^1$ 基团中， n 是 0 或 2 和 R^1 代表一个带有

1—4 个碳原子的低级烷基，其碳原子可被一个带有 2—3 个碳原子

的低级烷氧基羰基取代；

一个带有 3—6 个碳原子的环烷基基团；

一个苄基基团，它可被 1 至 3 个卤原子，甲基和/或硝基取代；

二个苯基基团，它可被 1—5 个卤原子，带 1—4 个碳原子的 1 至 3 个低级烷基，一个带 1—4 个碳原子的低级烷氧基，一个卤代甲基，一个硝基，一个氰基和/或一个被带有 1—2 个碳原子的 1 或 2 个烷

基或烷基磺酰基取代的氨基取代；

在式 -OR² 基团中，R² 代表一个被 1 至 5 个卤原子和/或 1 至 3 个带有 1—3 个碳原子的低级烷基取代的苯基；

B 代表一个卤原子，一个硝基，一个带有 1—2 个碳原子的低级烷基，或一个带有 1—2 个碳原子的低级烷基磺酰基；

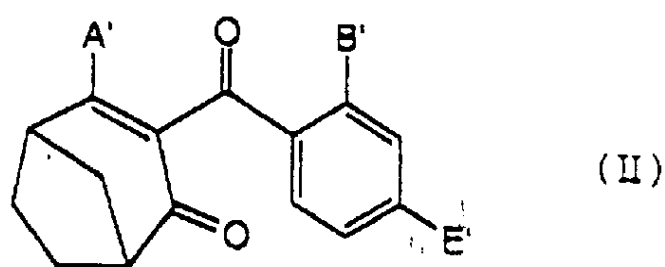
D 代表一个氢原子，一个带有 1—2 个碳原子的低级烷基，一个带有 1—4 个碳原子的低级烷氧基，一个带有 2—4 个碳原子的低级烷氧基甲基，或一个带有 2—5 个碳原子的低级烷氧基羰基；

E 代表一个卤原子，一个带有 1—3 个碳原子的低级烷氧基，该低级烷氧基上的碳原子可被 1—3 个氟原子取代，一个带有 1—3 个碳原子的低级烷硫基，一个带有 1—3 个碳原子的低级烷基磺酰基，该烷基磺酰基上的碳原子可被 1 至 3 个氟原子取代，或一个带有 1—3 个碳原子的低级烷基磺酰基氧基。

实际使用的除草剂，特别是在那些稻米是主要食品，水稻是主要农作物国家使用的除草剂必须具备下面优良的特点，例如(1)高除草

活性,(2)除草谱广,(3)对农作物(如水稻植株)低植物毒性,(4)适度的水溶性,适度的土壤流动性,(5)对鱼和哺乳动物低毒,(6)在土壤中有一定的稳定性且在一定时期之后易在自然界中分解,等等。

考虑到这些特点,所以在通式(I)所代表的化合物中优选下面通式(II)所代表的化合物。



在式中

A' 代表一个 $-S-(O)_nR^3$ 基团,其中 n 是 0 或 2 和 R^3 代表一个可被 1—5 个卤原子或被带有 1—4 个碳原子的 1—3 个低级烷基取代的苯基,

B' 代表一个卤原子或一个硝基,和

E 代表一个卤原子,或一个带有 1—3 个碳原子的低级烷基磺酰基,该基团上的碳原子可被 1—3 个氟原子取代。

大部分优选的化合物中具体的例子包括如下的化合物:

(1) 3-(2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-4-苯硫基-双环[3.2.1]-辛-3-烯-2-酮(化合物 No. 95):

(2) 3-(2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-4-(4-噻基苯硫基)-双环[3.2.1]辛-3-烯-2-酮(化合物 No. 97);

(3) 3-(2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-4-苯基磺酰基双环[3.2.1]辛-3-烯-2-酮(化合物 No. 108);

(4) 3-(2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-4-(2,6-二甲基苯硫基)-双环[3.2.1]辛-3-烯-2-酮(化合物 No. 79);

(5) 3-(2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-4-(3-氯代苯硫基)-双环[3.2.1]辛-3-烯-2-酮(化合物 No. 98); 和

(6) 3-(2-硝基-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-4-(2,6-二氯苯硫基)-双环[3.2.1]辛-3-烯-2-酮(化合物 No. 68)。

下面的表 1 中展示了那些如上面所述适于作水稻田除草剂使用的优选出的具有优良的活性和特点的化合物。

表 1

化合物号	a	b	c	d
95	A	1 cm	A	A
97	A	1 cm	A	B
108	A	> 5 cm	A	B/C
79	C	1 cm	A	B
98	B	1 cm	A	B
68	B	1 cm	A	A

a: 对稗草的除草活性, 其 EP_{90} 值

A: 32—64 克有效成分/公顷

B: 64—125 克有效成分/公顷

C: 大于 125 克有效成分/公顷

b: 在土壤中的流动性

c: 以水稻的选择性, 用 ID_{10} (水稻)/ ED_{90} (稗草) 表示

A: >8

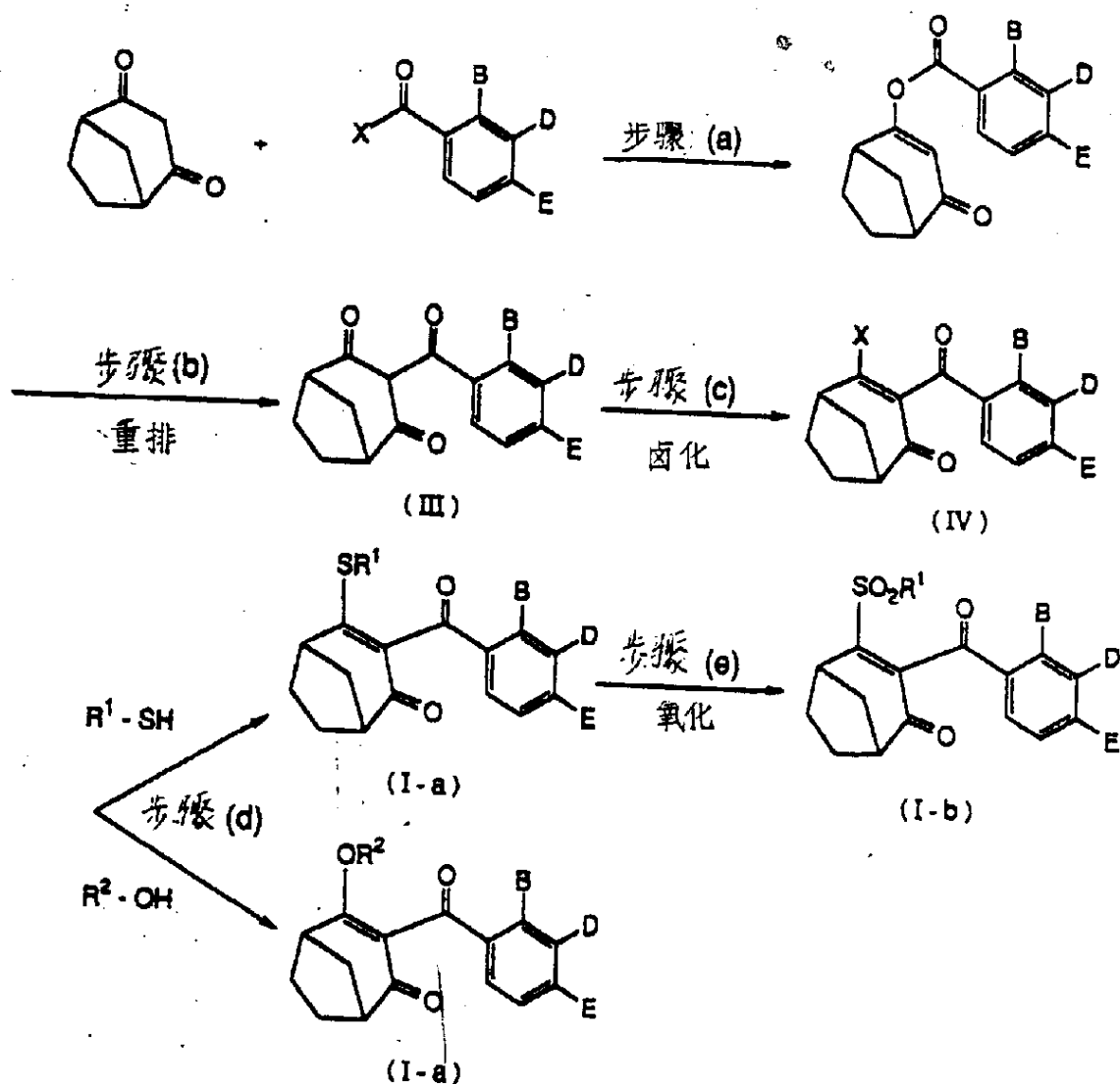
d: 鱼毒, 用 $TLm(48)$ 表示

A: $\geq 10ppm$

B: 0.5—10ppm

C: $\leq 0.5ppm$

通式 (I) 所示的化合物可以被制备, 例如按下面的反应方式制备。在后面所用的符合具有在上面所给定的含义, X 代表一个卤原子。



反应步骤(a)最好是在一个于反应条件下呈惰性的溶剂中进行，例如二氯甲烷，氯仿，四氢呋喃，甲苯，乙腈等等，反应最好在一个有机碱存在下，例如，三乙基胺。合适的反应温度是在 $0-40^{\circ}C$ 范围内，如 $20^{\circ}C$ 。

反应步骤b的重排反应有一个催化剂存在，例如4-二甲基氨基吡啶，一个路易斯酸或带有温和碱的氟化物供体。

在重排反应中所用的合适的路易斯酸性催化剂可以是，例如，氯化铝，氯化锌或氯化锡(IV)，和合适的氟化物供体可以是，例如，带三

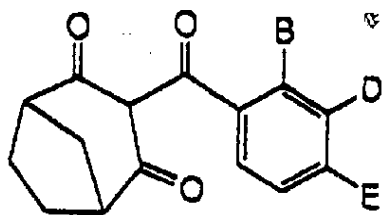
乙基胺的丙酮合氰化氢。

合适的溶剂包括例如,二氯甲烷,乙腈或甲苯。

反应温度从 0°C 至回流温度、优选室温(20°C)。

表 2 是一些苯甲酰基二酮(III),制备的中间产物的特定的例子。

表 2-1



化合物号	B	D	E	性质 (mp. °C)
1	NO ₂	H	Cl	134
2	NO ₂	H	Br	142
3	Cl	H	SO ₂ CH ₃	156~158
4	Cl	H	OSO ₂ CH ₃	
5	Cl	Cl	Cl	
6	Cl	Cl	SO ₂ CH ₃	
7	CH ₃	H	Br	92~95
8	NO ₂	H	SO ₂ CH ₃	148
9	NO ₂	OCH ₃	OSO ₂ CH ₃	
10	NO ₂	H	OSO ₂ CH ₃	140
23	NO ₂	H	SC ₂ H ₅	75
24	CH ₃	H	Cl	94
30	NO ₂	H	SCH ₃	126
31	NO ₂	OCH ₃	Cl	
32	NO ₂	OC ₂ H ₅	Cl	011

表 2-2

化合物号	B	D	E	性质 (mp. °C)
33	Cl	CH ₃	Cl	
34	Cl	H	Cl	
35	NO ₂	H	SO ₂ CHF ₂	147~150
36	NO ₂	H	SO ₂ CHF ₂	Gum
37	NO ₂	H	Bu-t	Oil
38	SCH ₃	H	SCH ₃	
44	NO ₂	H	SPr-n	117~119
45	NO ₂	H	SBu-t	
46	Cl	H	SC ₂ H ₅	Oil
47	Cl	H	SO ₂ Pr-n	101
48	Cl	H	SCH ₃	107~108
49	Cl	H	SPr-n	Gum
50	NO ₂	H	SC ₂ H ₅	77~78
51	NO ₂	H	SPr-l	
52	NO ₂	H	SO ₂ Pr-n	
53	NO ₂	H	SO ₂ C ₂ F ₅	
54	NO ₂	H	SO ₂ CF ₂ - -CHF ₂ CF ₃	

通常,在步骤(c)的卤化反应中,苯甲酰基二酮是溶在惰性溶剂,如氯仿,四氯化碳,二氯甲烷,二氯乙烷,四氢呋喃,二恶烷,苯,甲苯,二甲苯等中。然后加入过量的(通常为100—300摩尔%)亚硫酸卤或草酰卤(实际上常用亚硫酸氯或草酰氯),继之加入催化量的胺或酰胺,如二甲基甲酰胺或吡啶。反应混合物在从室温至溶点沸点温度下搅拌1小时到1天。然后用常规方法分离反应产物。

在步骤(c)中得到的上面通式(IV)所示的化合物是新的化合物,在步骤(d)中很容易将其转批为式(I)所示的本发明的化合物。

在反应步骤(d)中,符合于所要化合物的卤化物(IV)和硫醇(R^1-SH)或酚(R^2-OH)通常按化学计算量分别溶解在一个惰性溶剂中如四氢呋喃,二氯甲烷,甲苯等,然后将有机碱如三乙基胺按起始原料100—200摩尔%的量加入其中。

反应是在 $0^{\circ}C$ 至溶剂的沸点温度下(优选室温)下进行1小时至1天,然后用常规方法分离产物。

步骤(e)的氧化反应用一常规方法进行,在将硫化笺(I-a)溶在一惰性溶剂如二氯甲烷,氯仿或四氯化碳中之后使用一个氧化剂如m-氯代过苯甲酸进行氧化反应。

化学制备例

下面是从中间产物(III)制备本发明化合物的典型例子。

制备例1

3-(2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酰基)双环[3.2.1]-辛烷-2,4-二酮(0.99g)溶于15ml⁵二氯甲烷中,向此溶液中加入0.8ml草酰氯。再向其中加入一催化量的二甲基甲酰胺(1-2滴)。反应混合物在室温下搅拌30分钟,继之回流2小时。减压蒸去溶剂和过量的草酰氯,将所得到的氯化物在未经纯化的情况下溶于20ml四氢呋喃中,氯化物经纯化和分别鉴定,分析数据如下:

mp. 154-157°C

$\delta(\text{CDCl}_3)$ 7.7-8.0(3H, m), 3.05(3H, s) 2.8-3.4(2H, m), 1.6-2.3(6H, m)。

向溶液中先加入0.386g 2,6-二甲基硫代酚,然后在冰冷却之下再加入0.39ml三乙基胺。

在室温下搅拌3-4小时之后,反应混合物是被倒入水中,用乙酸乙酯萃取。分别用1N的盐酸和水洗涤有机相,然后用无水硫酸钠干燥。

经减压蒸馏蒸去溶剂后得到的粗结晶用二异丙基醚洗涤得到1.11g目标化合物(在表3中化合物编号No. 79)。(从二酮所得到的产率:83.7%)。

制备例2

将30ml四氢呋喃溶在与上面制备例1相同的方法用3-(2-硝基-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-双环-[3.2.1]辛烷-2,4-二酮所得到的氯化物中,上面所述的氯化物是分别鉴定,分析数据如

下:

mp. 120—123°C

NMR(CDCl₃)

δ 8.4(1H, d, J=2), 8.15(1H, dd, J=8.27), 7.6(1H, d, J=8),
3.1(3H, s); 1.5—3.4(8H, m)

向此溶液中加入 0.674g 4-氯代苯基硫醇, 然后加入 0.59ml 三乙基胺。

在室温下搅拌一夜之后, 反应混合物按上面制备例 1 中相同的处理步骤处理, 得到 1.6g 目标化合物(在表 3 中化合物编号 No. 63)。(产率 73.2%)。

制备例 3

将 0.8g 由制备例 2 中得到的化合物(63)溶在 20ml 二氯甲烷中, 在冰冷却之下向此溶液中分次加入 0.68g *m*-氯代过苯甲酸。反应混合物在此状况下搅拌几小时。用薄层色谱证实反应已完成之后, 用 50ml 二氯甲烷稀释反应混合物, 先用焦亚硫酸氢钠水溶液, 再用 5% 碳酸钾水溶液洗涤, 继之用无水硫酸钠干燥。

减压蒸去溶剂后得到的结晶用二异丙基醚洗涤得到 0.7g 目标化合物(在表 3 中化合物编号 No. 64)。(产率: 82.3%)。

制备例 4

除了使用与在制备例 1 相同的方法得到的 1.92g 2-氯-3-(2-硝基-4-甲基磺酰基苯甲酰基)双环[3.2.1]辛-2-烯-4-

酮, 0.9g 2,6-二氯硫代酚, 0.7ml 三乙基胺, 和 35ml 四氢呋喃外重复制备例 2 的方法。如此得到 1.85g 目标化合物(在表 3 中化合物编号 No. 68), (产率: 67.8%)。

制备例 5

除了使用与在制备例 1 相同的方法得到的 1.87g 2-氯-3-(2-硝基-4-甲基磺酰基苯甲酰基)双环[3.2.1]辛-2-烯-4-酮, 0.52g 硫代乙二醇酸甲酸, 0.68g 三乙基胺和 35ml 四氢呋喃外, 重复制备例 2 的方法, 其后反应混合物经硅胶色谱处理(洗脱剂: 乙酸乙酯/正己烷: 1:4 至 1:1) 得到 0.52g 目标化合物(在表 3 中化合物编号 No. 71)(产率: 23.4%)。

制备例 6

将按与制备例 1 相同的方法由 1.0g 3-(2-硝基-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-双环[3.2.1]辛烷-2,4-二酮得到的 1.0g 氯化物溶在 20ml 四氢呋喃中。然后分别向此溶液中加入 0.58g 2,4,6-三氯苯酚和 0.41g 三乙基胺。

在室温下搅拌一夜之后, 反应混合物按在制备例 1 中相同的处理方法进行处理, 粗萃取物用乙醚结晶得到 0.5g 目标化合物(在表 4 中化合物的编号 No. 113), (产率: 32.7%)。

制备例 7

3-(2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-双环[3.2.1]-辛烷-2,4-二酮(1.0g)是溶在 10ml 二氯甲烷中, 向此溶液中加入 0.

3ml 亚硫酸氯。再加入一催化量的二甲基甲酰胺(1—2滴),反应混合物回流6小时。减压蒸去溶剂和过量的亚硫酸氯,将得到的氯化物溶在10ml 二氯甲烷中。

在冰冷却之下向此溶液中先后加入0.31g 苯硫酚和0.392g 三乙基胺。溶液在室温下搅拌2—3小时,反应混合物分别用水和盐水洗涤,并用无水硫酸钠干燥,减压蒸去溶剂后得到的粗结晶用乙醚和/或丙酮洗涤后得到1.2g 目标化合物(在表3中化合物编号No. 95),(产率:95.2%)。

参考例

中间产物,3-(2-硝基-4-甲基-磺酰基苯甲酰基)-双环[3.2.1]辛烷-2,4-二酮的制备。

在冰冷却之下向含有10g 双环[3.2.1]辛烷-1,2,4-二酮的100ml 二氯甲烷中滴加含有19.1g 2-硝基-4-甲基磺酰基苯甲酰基氯的70ml 二氯甲烷溶液。

滴加完之后,在冰冷却下反应混合物再搅拌1小时,用二氯甲烷稀释,用水洗涤,再用无水硫酸钠干燥。

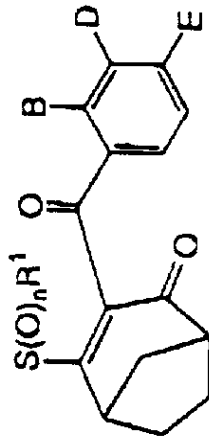
减压蒸干溶剂,得到25.2g 一个烯醇酯的粗结晶。

未纯化的烯醇酯溶在160ml 乙腈中,向此溶液中加入20ml 三乙基胺和4.3ml 丙酮合氯化氢。反应混合物在室温下搅拌一夜。减压浓缩后,反应混合物倒入水中,用二氯甲烷萃取,分别用10%的盐酸和饱和盐水洗涤,再用无水硫酸钠干燥。

减压蒸去溶剂、残渣用乙醚结晶得到 19g 目标化合物.3-(2-硝基-4-甲基磺酰基苯甲酰基)-双环[3.2.1]辛烷-4-二酮。(产率:71.8%)。

表 3-1 至 3-9 和表 4 中给出了用上面所述方法制备的化合物的具体例子。但本发明不局限于此。

表 3-1



化合物号	n	R ¹	B, D, E	性质 (mp. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
60	0	C ₂ H ₅	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	152~155	8.5(1H, d, J=2), 8.1(1H, dd, J=8, 2), 7.3(1H, d, J=8), 3.1(3H, s), 1.2 ~ 3.8(13H, m)
61	0	C ₂ H ₅	B: NO ₂ D: H E: Cl	112~113	7.9(1H, d, J=2), 7.5(1H, dd, J=8, 2), 7.1(1H, d, J=8), 1.2 ~ 3.8(13H, m)
62	0	Ph	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	O i l	7.0 ~ 8.5(8H, m), 3.1(3H, s), 1.4 ~ 3.0(8H, m)

表 3-2

化合物号	n	R ^I	B, D, E	性质 (mp, °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J(Hz)
63	0	4-Cl-PhCH ₂ -	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	195~197	7.0 ~ 8.4(7H, m), 4.2(2H, s), 3.1(3H, s), 1.4 ~ 3.8(m, 8H)
64	2	4-Cl-PhCH ₂ -	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	204~205	7.2 ~ 8.3(7H, m), 5.3(2H, s), 3.2(3H, s), 1.5 ~ 3.5(8H, m)
65	0	PhCH ₂ -	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	192~192.5	7.2 ~ 8.5(8H, m), 4.25(2H, s), 3.1(3H, s), 1.5 ~ 3.8(8H, m)
66	0	2-CH ₃ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	171~178	7.0 ~ 8.6(7H, m), 3.1(3H, s), 2.5(3H, s), 1.5 ~ 3.2(8H, m)
67	0	4-F-Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	177~179	7.0 ~ 8.6(7H, m), 3.1(3H, s), 1.5 ~ 3.0(8H, m)
68	0	2, 6-Cl ₂ -Ph	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	214~216	7.1 ~ 8.8(6H, m), 3.1(3H, s), 1.4 ~ 3.1(8H, m)

表 3-3

化合物号	n	R ¹	B, D, E	性频 (mp. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
69	0	3-Cl-Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	93 ~ 95	7.1 ~ 8.5 (7H, m), 3.1 (3H, s), 1.4 ~ 3.2 (8H, m)
70	0	4-CH ₃ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	146 ~ 148	7.0 ~ 8.6 (7H, m), 3.1 (3H, s), 2.4 (3H, s), 1.5 ~ 3.0 (8H, m)
71	0	-CH ₂ CO ₂ Me	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	80 ~ 90	7.2 ~ 8.6 (3H, m), 3.8 (3H, s), 3.75 (2H, s), 3.1 (3H, s), 1.5 ~ 3.0 (8H, m)
72	0	4-F-Ph-	B: NO ₂ D: OCH ₃ E: Cl	165	6.7 ~ 7.7 (6H, m), 3.9 (3H, s), 1.5 ~ 3.2 (8H, m)
73	0	2,6-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: OCH ₃ E: Cl	170	6.9 ~ 7.6 (5H, m), 3.9 (3H, s), 1.4 ~ 3.0 (8H, m)
74	0	4-F-Ph-	B: NO ₂ D: OC ₂ H ₅ E: Cl	154	6.8 ~ 7.6 (6H, m), 4.1 (2H, q, J-6), 1.5 ~ 3.0 (8H, m), 1.3 (3H, t, J-6)

表 3-4

化合物号	n	R ¹	B, D, E	性质 (mp. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
76	0	2, 6-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: OC ₂ H ₅ E: Cl		
76	0	2, 6-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃	125~185	7.1 ~ 7.5 (6H, m), 2.6 (3H, s), 1.5 ~ 3.0 (8H, m)
77	0	2, 6-Cl ₂ -Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	193~195	7.1 ~ 7.9 (6H, m), 3.0 (3H, s), 1.3 ~ 3.0 (8H, m)
78	0	2, 6-Me ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: OC ₂ H ₅ E: Cl	180~162	7.1 ~ 7.5 (5H, m), 4.1 (2H, q, J=7), 2.4 (6H, s), 1.5 ~ 3.0 (8H, m), 1.3 (3H, q, J=7)
79	0	2, 6-Me ₂ -Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	142~145	7.1 ~ 8.0 (6H, m), 3.1 (3H, s), 2.5 (6H, s), 1.5 ~ 3.0 (8H, m)
80	0	2, 6-Me ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: OCH ₃ E: Cl	170~172	7.1 ~ 7.7 (5H, m), 4.0 (3H, s), 2.4 (6H, s), 1.5 ~ 3.0 (8H, m)

表 3-5

化合物号	n	R ¹	B, D, E	性质 (mp. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
81	0	2, 6-Me ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃		
82	0	C ₄ H ₉ -t	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	165~188	6.5 (IH, d, J=2), 8.1 (IH, dd, J=6, 2), 7.3 (IH, d, J=8), 4.0 (IH, m), 3.1 (3H, s), 2.6 (IH, m), 1.5~2.5 (6H, m), 1.7 (9H, s)
83	2	2, 6-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃		
84	0	2, 6-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: Cl	246~247	
85	0	2, 6-Me ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: Cl	171~173	7.95 (IH, d, J=2), 7.1~7.7 (5H, m), 2.5 (6H, s), 1.0~3.1 (6H, m)
86	0	C ₄ H ₉ -t	B: NO ₂ D: H E: Cl	142~145	7.9 (IH, d, J=2), 7.6 (IH, dd, J=8, 2), 7.3 (IH, d, J=8), 3.8~4.1 (1H, m), 2.7~3.0 (1H, m), 1.6~2.3 (6H, m), 1.6 (9H, s)

表 3-6

化合物 号	n	R ¹	B, D, E	性质 (mp. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
87	0	2, 6-Me ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	166~169	8.6(1H, d, J=2), 8.2(1H, dd, J=6, 2), 7.5 (1H, d, J=6), 7.2(3H, br. s), 3.1(3H, s), 2.5(6H, br. s), 1.5~ 3.2(6H, m)
88	0	Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃	160~161	7.1 ~ 7.9(6H, m), 2.5~ 3.2(2H, m), 2.4(3H, s), 1.1 ~ 2.2(6H, m)
89	0	2-CH ₃ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃	180~184	7.0 ~ 7.9(7H, m), 2.6~ 3.25(2H, m), 2.58(3H, s), 2.5(3H, s), 1.1 ~ 2.4(6H, m)
90	0	4-CH ₃ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃	157~158	7.0 ~ 7.85(7H, m), 2.6 ~ 3.3(2H, m), 2.55(3H, s), 2.4(3H, s), 1.1 ~ 2.2(6H, m)
91	0	3-Cl-Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃	131~132	7.1 ~ 7.9(7H, m), 2.7~ 3.2(2H, m), 2.55(3H, s), 1.0~ 2.4(6H, m)
92	0	2, 5-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃	142~143	7.1 ~ 7.9(6H, m), 2.65~ 3.1(2H, m), 2.55(3H, s), 1.0~ 2.4(6H, m)

表 3-7

化合物 号	n	R ¹	B, D, E	性质 (mp. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
93	0	4-F-Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃	172~174	6.95~7.9(7H, m), 2.6~3.2(2H, m), 2.55(3H, s), 1.1~2.4(6H, m)
94	0	2, 5-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SCH ₃	232~233	
95	0	Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	164~186	7.2~7.9(8H, m), 3.05(3H, s), 1.1~3.0(6H, m)
96	0	2-CH ₃ -Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	116~118	7.1~8.0(7H, m), 3.1(3H, s), 2.5(3H, s), 1.4~3.0(8H, m)
97	0	4-CH ₃ -Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	152~153	7.1~8.0(7H, m), 3.05(3H, s), 2.4(3H, s), 1.2~3.0(8H, m)
98	0	3-Cl-Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	160~168	7.1~8.0(7H, m), 3.05(3H, s), 1.3~3.2(8H, m)

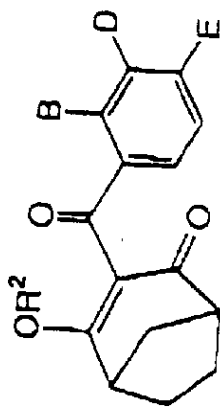
表 3-8

化合物号	n	R ¹	B, D, E	性质 (mp. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
99	0	2, 5-Cl ₂ -Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	181~182	7.2 ~ 8.0 (6H, m), 3.05 (3H, s), 1.1 ~ 3.0 (8H, m)
100	0	4-F-Ph	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	175~177	6.9 ~ 7.9 (7H, m), 3.05 (3H, s), 1.3 ~ 3.2 (8H, m)
101	0	2, 6-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: OSO ₂ CH ₃	165~166	
102	0	2, 6-Cl ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CHF ₂	73~78	7.2 ~ 8.8 (6H, m), 6.25 (1H, t, J=52), 1.0 ~ 3.4 (8H, m)
103	0	2, 6-Me ₂ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: OSO ₂ CH ₃	117~120	7.1 ~ 8.0 (6H, m), 3.2 (3H, s), 2.6 ~ 3.1 (2H, m), 2.5 (3H, s), 1.5 ~ 2.3 (6H, m)
104	0	2-(MeSO ₂) ₂ -N-Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	132~140	7.4 ~ 8.0 (7H, m), 3.5 (3H, s), 3.4 (3H, s), 3.1 (3H, s), 2.7 ~ 3.3 (2H, m), 1.2 ~ 2.6 (6H, m)

表 3-9

化合物号	n	R ¹	B, D, E	性状 (mp. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
105	0	2-(MeSO ₂) ₂ -N-Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	170~180	8.6(1H, d, J=2), 8.1(1H, dd, J=8, 2), 7.2~7.9(5H, m), 3.5(3H, s), 3.4(3H, s), 3.1(3H, s), 2.6 ~ 3.2(2H, m), 1.3 ~ 2.9(6H, m)
106	0	Ph-	B: CH ₃ D: COOCH ₃ E: SO ₂ CH ₃	164~186	7.2 ~ 7.9(7H, m), 3.95(3H, s), 3.15(3H, s), 2.7 ~ 3.8(2H, m), 2.4(3H, s), 1.5 ~ 2.4(6H, m)
107	0	シクロヘキシル	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	134~136	7.6 ~ 7.9(2H, m), 7.5(1H, d, J=8), 2.7 ~ 3.7(3H, m), 3.0(3H, s), 1.1 ~ 2.5(16H, m)
108	2	Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	211.5 ~ 213.5	7.1 ~ 8.2(8H, m), 3.0(3H, s), 1.4 ~ 3.3(8H, m)
109	0	C ₂ H ₅	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	128~184	7.3 ~ 7.9(3H, m), 3.8(1H, m), 3.0(3H, s), 2.7 ~ 3.1(3H, m), 1.5 ~ 2.2(6H, m), 1.2(3H, t, J=8.6)
110	2	4-CH ₃ -Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃	199.5 ~ 201.5	7.2 ~ 8.2(7H, m), 3.1(3H, s), 2.45(3H, s), 1.4 ~ 3.4(8H, m)

表 4



化合物号	R ²	B, D, E	性质 (m.p. °C)	NMR Data δ (ppm) from TMS in CDCl ₃ , J (Hz)
111	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: Cl	151~154	8.5 (1H, d, J=2), 8.2 (1H, dd, J=6.2), 7.6 (1H, d, J=8), 7.4 (2H, s), 3.1 (3H, s), 1.4 ~ 3.2 (8H, m)
112	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph-	B: Cl D: H E: SO ₂ CH ₃		7.2 ~ 7.9 (5H, m), 3.1 (3H, s), 1.5 ~ 3.2 (8H, m) in DMSO-d ₆
113	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph-	B: NO ₂ D: H E: SO ₂ CH ₃	214~217	8.5 (1H, d, J=2), 6.1 (1H, dd, J=8.2), 7.55 (1H, d, J=8), 7.3 (2H, s), 3.1 (3H, s), 1.3 ~ 3.2 (8H, m)

通式(I)所示的本发明的化合物可用于防除多种有害杂草。与已知的二酮类具有除草活性的化合物相比,本发明的化合物表现出了选择性除草活性同时相当大地减少了对水稻植株的植物毒性。本发明化合物的特点是对生长在水稻田中的一年生和多年生杂草都有着相当高的除草活性,例如稗草(它是水田中主要代表性杂草的通用名)、鸭舌草、(水田中一年生的危害严重的杂草),异型莎草(水田中一年生危害严重的莎草类杂草),牛毛毡(多年生莎草类杂草、生长于沼泽、水道、水田,代表性的多年生杂草),矮慈菇(生长于水田,沼泽,沟渠中的一种多年生杂草),蔗草,水莎草(属于莎草类的多年生杂草,生长在水田,沼泽,沟渠中)等,它们对水稻植株显示出了很低的植物毒性。

由于通式(I)所示的本发明的化合物对于芽前和生长期间的杂草显示出了优良的除草活性,所以它们可作为秧苗移栽前后土壤处理用的除草剂,也可作农作物移栽之前土壤处理用的除草剂和农作物移栽之前和生长期处理农作物的茎叶。

通常,含有本发明化合物作为有效成分的具有除草性能的组合物在它们应用之前是被加工成合适的剂型供使用。

那就是,上面所述的化合物是与合适的情性载体混合,如果必要,与助剂物质以一合适的比例一起使它们能被溶解,分离,悬浮,混合,浸渍,吸附或粘附,以便它们能被加工成合适的形式,例如悬浮

剂,乳剂,溶液,可湿性粉剂,干燥的可流动的粉剂,颗粒剂,片剂等。

在本发明中可作载体使用的物质既可是固体,也可是液体。固体载体物质可是大豆粉,谷粉,木粉,树皮粉,锯木,烟杆粉,胡桃壳粉,麸,纤维粉,植物粉如植物体内精华被萃取后的残渣;纤维物质如纸,波纹板,旧衣服;合成聚合物如粉状合成树脂;无机矿物粉如粘土(如,高岭土,皂土,酸性粘土),滑石(滑石,叶蜡石),硅石(硅藻土,硅砂,云母,白碳,(合成的高分散性的硅酸也称为含水的细小的硅或含水的硅酸,还有些产品含有硅酸钙为其主要成分)),活性炭,硫磺粉,浮石,煅烧的硅藻土,碎砖,飞灰,砂子,碳酸钙,磷酸钙,等等;化学肥料如硫酸铵,磷酸铵,硝酸铵,尿素,氯化铵,氯化钾,硝酸钾,复合肥等,它们也可以单独或它们中的2个或多个以混合形式使用。

液体的载体应选自于这样一些物质,即它们本身具有溶剂化能力,和那些它们本身虽不具溶剂化能力,但通过加入助剂物质能使有效成分分散开。例子包括水,醇(如甲醇,乙醇,异丙醇,丁醇,乙二醇),酮(如丙酮,甲乙酮,甲基异丁基酮,二异丁基酮,环己酮),醚(如乙醚,二恶烷,溶纤剂,二丙基醚,四氢呋喃),脂肪烃(如汽油,矿物油),芳香烃(如苯,甲苯,二甲苯,溶剂石脑油,烷基化萘),卤代烃(如二氯乙烷,氯代苯,氯仿,四氯化碳),酯(如乙酸乙酯,邻苯二甲酸二丁酯,邻苯二甲酸二异丁基酯,邻苯二甲酸二辛基酯),酸性酰胺(如二甲基甲酰胺,二乙基甲酰胺,二甲基乙酰胺),腈类(如乙腈),二甲基亚砷,等。这些可单独使用或它们中2个或更多的以混

合形式使用。

助剂包括下面物质：助剂可按目的使用。在有些情况下，2个或多个助剂混合使用。在另一些情况下，不用助剂。

表面活性剂可用于乳化，分散，增溶和/或润湿有效成分。例如，可用的表面活性剂是聚氧乙烯烷基芳基醚，聚氧乙烯烷基醚，聚氧乙烯高级脂肪酸酯，聚氧乙烯树脂酸酯，聚氧乙烯山梨糖醇酐甘油一月桂酸酯，聚氧乙烯山梨糖醇酐一油酸酯，烷基芳基硫酸酯，萘磺酸酯缩合产物，木质素磺酸酯，高级醇硫酸酯等，为了达到分散、稳定、附着、粘结等目的可以用酪蛋白，果胶，淀粉，藻酸，甲基纤维素，羧基甲基纤维素，阿拉伯胶，聚乙烯醇，松根油，蔗糖油，皂土，木质素磺酸盐等。

为了增进固体产物的流动性，可以用，例如，蜡，硬脂酸盐，烷基磷酸酯等。

作为悬浮产物的抗絮剂，可以用，例如，萘磺酸缩合产物，缩合的磷酸等。

还可能加入消泡剂如硅油。

如果需要，可以调节剂型中有效成分的量。在粉剂或颗粒剂的情况下，有效成分的量通常为0.2—20%（重量百分比），而对于乳剂和可湿性粉剂来说，大约为0.1—50%（重量百分比）。

剂型制备例

下面是按照本发明的一些典型的剂型例子。无需指出，有效成分

的含量可以在上面所述的范围内变化。下面所有数据按重量百分比

例 1 可湿性粉剂

一个表 2 中的化合物(50 份),20 份硅藻土,22 份粘土, 3 份白碳, 2 份木质素磺酸钠和 3 份烷基萘磺酸钠是被混合并研磨, 得到有效成分含量为 50%的可湿性粉剂。

例 2 颗粒剂

一个表 2 中的化合物 (0.35 份), 25 份皂土, 70.65 份滑石和 2 份十二烷基苯磺酸钠相混合。混合物与大约 20 份水在一揉合器中揉合, 然后用一造粒机造粒, 继之干燥并修整颗粒, 得到含有效成分 0.35%的颗粒剂。

本发明的除草剂可按能产生植物毒性或控制生长的量直接使用或用水或其它物质将其作适当稀释或悬浮后施用于杂草或杂草的茎叶或施用于不需要杂草生长或发芽的土壤中。

本发明除草剂的使用剂量取决于不同的因素, 例如, 目的, 被杀灭或控制的杂草种类, 杂草或农作物发芽或生长的状况, 杂草发芽的趋势, 气候, 剂型, 使用方法, 使用地点, 使用时间等。

在使用本发明的除草剂作水稻田选择性除草时, 本发明化合物的用量为 5—1000g / ha, 优选 10—500g / ha。

当本发明的除草剂与一个或多个其它除草剂混用时, 本发明化合物的用量应低于上面所述的剂量, 因为混用比它单独使用有增效

作用。

虽然本发明的除草剂特别适合于水稻田中在发芽之前和生长期间防治杂草,它也可能与其除草剂混合以便扩大杂草谱,延长药效期或减少使用剂量,此举并未超出本发明的范畴。

本发明的效果

本发明的除草剂通常可防治多种有害杂草,特别是显著地降低了对水稻植株的植物毒性,能选择性地防除水稻田杂草。

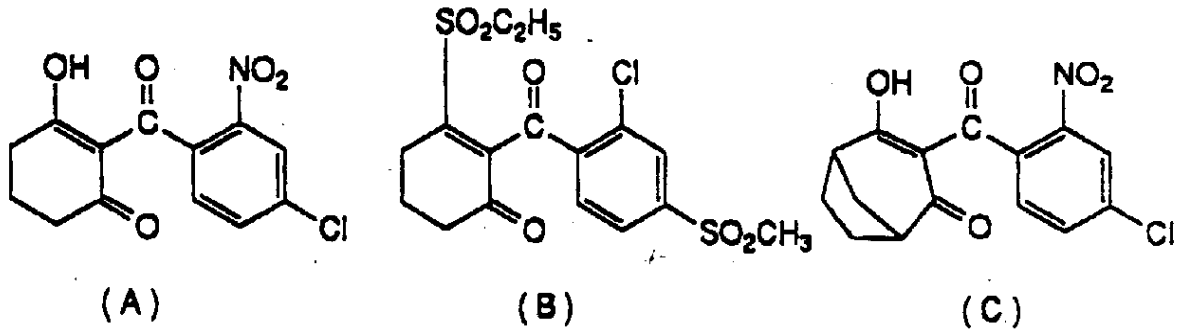
生物实施例

下面所述的生物实施例将详细地说明本发明,但是本发明不局限于此。

试验例 1 颗粒剂试验

一个 1/5000 公亩的 Wager 盆是用水稻田土装填并耕耘。水深为 4cm,播入稗草,鸭舌草, *Amonannia Multiflora* 和 *Scirpus hotarui* 的种子, *Sagittaria* 矮慈菇, *Cyperes Serotimis* *Rottb* 和 *Eleocharisf Kuroguthai* 的球茎是被种植在盆中。然后将 2 叶期的水稻植株(品种: *Koshihikari*)按每盆六株移栽至盆内(3 株栽 1cm 深,3 株栽 3cm 深)。在移栽后第 10 天,本发明化合物的颗粒剂,即将编号为 63,65,66,68,70,88,89,90,91,93,95,96,97,98,100 和 104 的化合物按例 2 方法加工成的颗粒剂和用日本专利申请公开号 152642/1986 中化合物(A),日本专利申请公开号 202755.1987 中化合物(B)和在日本专利申请 3 以开号 6425/1990 中化合物(C)所制

备的颗粒剂施用于水的表面。



在处理之后第二天和第三天,水渗漏操作其速度为 3cm/天,从处理算起第 21 天,按照下面的标准进行观察和评价,结果给在表 5-1 和 5-2 中。

0: 无效,无植物毒害

10: 全部杀死

试验例 2: 可湿性粉剂试验

一个 325cm² 的花盆用农田上装填,各种杂草的种子,即马唐,稗草,狗尾草, *Polygonum blumei*, 藜, 苘麻, 豚草, 反枝苋, *Xanthium Strumarium* 圆叶牵牛, 和各种农作物的种子,如大豆,玉米,小麦,棉花和甜草播种在盆中。在播种 1 天进行芽前土壤处理,在播种后 10 天进行叶面处理,处理用的化合物为本发明的化合物,化合物编号为 62, 64, 67, 68, 71, 90, 91, 93, 95, 97, 100 和 104, 将用这些化合物制备的可湿性粉剂的水溶液与上面提到的用来作

比较的化合物 A 的可湿性粉剂的水溶液作喷洒处理。处理后 21 天按下面标准观察和评价, 试验结果给在表 6 中。

0: 无效果, 无植物毒性

10: 全部杀死

表 5-1

除草效果和对水稻的植物毒性

化合物号	剂量 (g/ha)	水稻		ECCP.	SCHD.	CYSR.	ELXO.	NOVP.	AMOR.	SAPH.	SATL.
		1ca	3ca								
63	1000	0.0	0.0	8.5	9.0	9.5	10.0	9.0	9.0	8.5	-
	500	0.0	0.0	7.5	8.5	9.0	9.5	9.0	9.0	7.0	-
65	1000	0.5	0.0	10.0	9.0	10.0	10.0	9.5	9.5	10.0	-
	500	0.0	0.0	10.0	9.0	9.5	10.0	9.5	9.0	9.0	-
66	1000	1.5	0.5	10.0	9.0	10.0	10.0	9.5	9.5	9.5	-
	500	0.0	0.0	10.0	9.0	10.0	10.0	9.5	9.5	9.5	-
68	1000	0.0	0.0	10.0	9.0	9.5	10.0	10.0	9.5	10.0	-
	500	0.0	0.0	10.0	9.0	8.5	9.5	9.5	9.5	9.5	-
70	1000	2.0	0.0	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	9.0	10.0	-
	500	0.5	0.0	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	9.0	10.0	-
88	1000	2.5	1.5	10.0	9.0	10.0	10.0	9.8	9.5	10.0	9.5
	500	0.5	0.0	9.5	9.0	13.0	10.0	9.5	9.0	9.8	9.5
89	1000	0.0	0.0	10.0	9.0	9.8	9.5	9.5	9.0	10.0	10.0
	500	0.0	0.0	9.5	9.0	9.5	9.0	9.0	9.0	9.5	9.5
90	1000	3.5	2.5	10.0	9.5	10.0	9.8	9.5	9.5	10.0	10.0
	500	2.0	0.0	10.0	9.5	9.8	9.5	9.0	9.0	9.5	9.5
91	1000	1.5	0.0	10.0	9.0	9.8	9.8	9.5	9.0	9.5	9.0
	500	0.0	0.0	9.5	8.5	9.5	9.0	9.0	9.0	9.0	8.5
93	1000	3.5	2.0	10.0	9.0	10.0	9.8	9.8	9.5	10.0	9.5
	500	2.0	0.0	9.5	9.0	9.8	9.5	9.5	9.0	9.8	9.5

表 5-2 除草胺和对水稻的植物毒性

化合物号	剂量 (g/ha)	水稻		BOCP.	SCHD.	CYSR.	ELMO.	MOVP.	ANMR.	SAPM.	SATL.
		1ca	3ca								
95	1000	0.0	0.0	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	9.5	9.8	9.5
	500	0.0	0.0	10.0	9.5	10.0	10.0	9.8	9.0	9.0	9.0
96	1000	3.5	2.5	10.0	9.5	10.0	9.5	9.8	9.0	10.0	9.5
	500	2.0	0.0	10.0	9.5	9.8	9.5	9.0	9.0	9.5	9.0
97	1000	0.0	0.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0
	500	0.0	0.0	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	9.0	9.5	9.5
98	1000	0.0	0.0	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	9.0	9.5	9.5
	500	0.0	0.0	10.0	9.5	9.8	9.5	9.5	9.0	9.0	9.0
100	1000	3.5	2.5	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	9.8
	500	2.0	0.0	10.0	9.5	10.0	10.0	9.8	9.0	9.8	9.5
104	1000	2.5	1.5	10.0	9.5	10.0	10.0	9.8	9.5	10.0	9.5
	500	0.5	0.0	10.0	9.5	10.0	9.8	9.5	9.0	9.8	9.5
比较化合物A	000	10.0	10.0	10.0	10.0	9.8	10.0	10.0	9.5	9.5	10.0
	500	10.0	9.5	10.0	10.0	9.8	10.0	10.0	9.0	9.5	10.0
比较化合物B	1000	9.5	9.0	10.0	9.8	9.5	8.0	10.0	9.5	10.0	-
	500	9.5	8.5	9.5	9.5	8.5	6.5	9.5	9.5	9.8	-
比较化合物C	1000	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	9.8	9.8	-
	500	10.0	10.0	10.0	9.8	9.8	9.8	9.5	9.5	9.5	-

表 6-1 除草效果和植物毒性

处理	除草效果														
	植物毒性														
	MAIZE	SOYBEAN	WHEAT	BEET	COTTON	DIAM.	ECCGP.	SEVP. B.	POBME.	CHAL.	AMAL.	AMBL.	XASL.	ABTM.	PIPYO.
1000	9.5	9.0	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0	9.5	10.0	9.5	10.0	9.5
	8.0	7.5	8.5	9.5	10.0	9.5	9.0	8.0	9.5	9.0	9.0	10.0	9.0	9.5	9.0
	6.5	5.0	8.0	8.0	9.0	9.0	9.0	8.0	9.0	8.5	8.0	9.5	8.0	9.0	8.0
62	3.5	4.0	2.0	4.0	4.5	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0
	0.0	1.5	0.0	1.5	1.5	10.0	10.0	9.5	10.0	9.5	9.5	10.0	9.5	10.0	9.5
	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	9.5	9.0	8.5	9.5	9.0	9.0	9.5	9.0	9.5	9.0
64	3.0	3.5	1.5	2.5	2.5	9.5	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	9.5
	0.0	1.0	0.0	1.0	2.0	9.0	9.5	9.0	10.0	9.0	9.0	9.5	9.0	10.0	9.0
	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	8.5	8.0	8.0	9.0	8.5	8.5	9.5	9.0	9.0	8.5
67	3.5	4.5	2.0	3.0	3.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0
	1.0	1.5	0.0	1.5	1.5	9.5	9.0	9.0	9.5	9.0	9.5	9.5	9.0	9.5	9.5
	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	9.0	9.0	8.5	9.0	9.0	9.0	9.0	8.5	9.0	8.5
68	2.5	2.0	1.5	2.0	2.0	9.5	9.5	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	9.5
	0.0	0.0	0.0	0.0	1.5	9.0	9.0	9.0	9.5	9.0	9.0	9.5	9.0	9.5	9.0
	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	8.0	8.5	9.0	8.5	9.0	9.0	9.0	9.0	9.0	9.0
71	3.0	2.5	2.0	3.0	3.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0
	0.0	0.0	0.0	1.5	2.0	9.5	9.0	9.0	10.0	9.0	9.0	9.5	9.5	10.0	9.5
	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	8.5	8.0	8.0	9.0	8.5	8.5	9.0	9.0	9.0	9.0

表 6-2 除草效果和植物毒性

	剂量 (g/ha)	植物毒性							除草效果								
		MAIZE	SOYBEAN	WHEAT	BEET	COTTON	DIAM.	ECCP.	SEYP.	B.	POEME.	CHAL.	ANAL.	ANRL.	XASL.	ABTM.	PHPYO.
90	1000	2.5	3.5	3.0	4.5	3.5	10.0	9.5	9.5	8.5	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0
	500	1.0	2.0	1.5	2.0	1.5	9.5	9.0	9.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0	9.5	10.0	9.5
	250	0.0	0.5	0.0	0.5	0.0	9.0	9.0	8.5	9.5	9.5	9.5	9.5	9.5	9.0	9.5	9.5
91	1000	2.0	2.5	1.5	3.0	2.5	10.0	9.5	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5
	500	0.0	1.5	0.0	2.0	0.0	9.0	8.5	9.0	9.5	9.5	9.5	9.5	9.5	9.0	9.5	9.0
	250	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	8.5	8.0	8.0	9.0	9.0	9.0	9.0	9.5	9.0	9.0	9.0
93	1000	2.5	4.5	2.5	3.5	3.0	9.5	9.5	9.0	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	9.5
	500	1.0	2.0	1.0	2.0	1.5	9.0	9.0	9.0	9.0	9.5	9.5	9.5	9.5	9.0	9.5	9.5
	250	0.0	0.5	0.0	1.0	0.0	9.0	8.5	8.5	9.0	9.0	9.0	8.5	9.0	9.0	9.0	9.0
95	1000	0.0	1.5	0.0	3.0	2.0	9.5	9.5	9.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	9.5
	500	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	9.0	9.0	9.0	9.0	9.5	9.0	9.0	9.0	9.0	9.5	9.0
	250	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	9.0	8.5	8.5	9.0	9.0	9.0	9.0	9.0	8.5	9.0	9.0
97	1000	0.0	2.5	2.0	3.0	2.5	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	1.0	10.0
	500	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	10.0	9.5	9.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0	9.5	10.0	9.5
	250	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	9.0	9.0	9.0	9.0	9.5	9.0	9.5	9.0	9.0	9.5	9.0
100	1000	2.5	3.0	2.0	2.5	2.5	10.0	9.5	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0
	500	0.5	1.5	1.0	0.5	0.0	9.5	9.0	9.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	1.0	9.5
	250	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	9.0	9.0	8.5	9.5	9.5	9.5	9.5	9.5	9.5	9.5	9.0
104	1000	2.5	3.0	2.0	3.0	2.5	10.0	9.5	9.5	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0
	500	0.5	2.0	1.5	2.5	0.0	9.5	9.0	9.0	10.0	10.0	9.5	10.0	10.0	9.0	1.0	9.5
	250	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	9.0	8.5	9.0	9.5	9.5	9.5	9.5	9.5	9.0	9.5	9.0

缩写：

ECCP. :	稗草
SCHO. :	蔗草
CYSR. :	水莎草
ELKO. :	针蔺
MOVP.	鸭舌草
AMMR. :	多花水苋菜
SAPM. :	矮慈菇
SATL. :	野慈菇
DIAH. :	马唐
SEVP. B. :	狗尾草
POBME. :	蓼
CHAL. :	藜
AMAL. :	豚草
AMRL. :	反枝苋
XASL. :	苍耳
ABTM. :	苘麻
PHPVO. :	圆叶牵牛