

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07D403/12

C07D249/12 C07D213/64

C07D207/26 C07D257/04

A01N 43/653 A01N 43/40

A01N 43/56 A01N 43/36

A01N 43/713

//(C07D403/12,249:00,

[11] 公开号 CN 1509285A



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 01803787.9

[43] 公开日 2004年6月30日

[22] 申请日 2001.1.5 [21] 申请号 01803787.9

[30] 优先权

[32] 2000.1.17 [33] DE [31] 10001588.3

[32] 2000.8.14 [33] DE [31] 10039723.9

[86] 国际申请 PCT/EP2001/000092 2001.1.5

[87] 国际公布 WO2001/053275 德 2001.7.26

[85] 进入国家阶段日期 2002.7.16

[71] 申请人 拜尔公司

地址 德国莱沃库森

共同申请人 日本拜耳农药株式会社

[72] 发明人 O·沙尔纳 S·莱尔

H·-G·施瓦茨 K·-H·米勒

D·霍伊申 M·W·德鲁斯

P·达门 D·福伊希特 R·庞岑

A·雅纳吉 S·纳拉布 T·果托

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 温宏艳 邵红

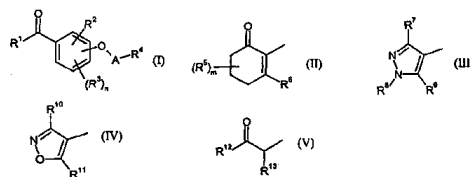
231:00)(C07D403/12,231:00,207:00)

权利要求书 19 页 说明书 60 页

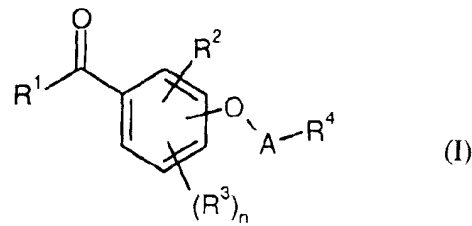
[54] 发明名称 被取代的芳基酮类

[57] 摘要

本发明涉及通式(I)的新的芳基酮类,其中 n 表示 0、1 或 2, A 表示烷二基(亚烷基), R¹ 表示下列基团之一, m、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹² 和 R¹³ 具有说明书中给出的含义, R² 表示氢、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素,或任选地取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基, R³ 表示硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素,或任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基,而且 R⁴ 表示任选地被取代的 4 至 12 元、饱和或不饱和、单环或双环的杂环基团。本发明还涉及制备所述被取代的芳基酮类的方法,涉及中间体产物并涉及这些化合物作为除草剂的用途。



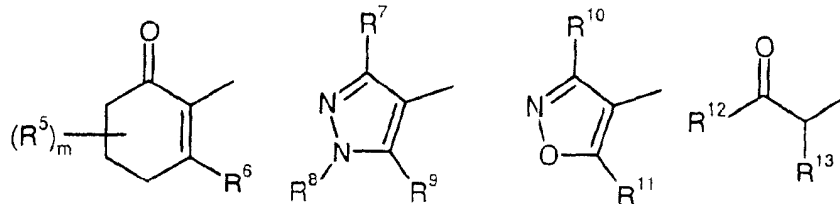
1. 通式(I)的取代的芳基酮类



5 其中

n 表示数字 0、1 和 2,

A 表示烷二基(亚烷基),

R¹ 表示下列基团之一

10

其中

m 表示数字 0 至 6,

R⁵ 表示卤素或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷硫基或芳基, 或如果 m 表示 2 则表示任选地与第二个 R⁵ 基团一起表示烷二基(亚烷基),

15

R⁶ 表示羟基、甲酰氧基、卤素, 或表示在各种情况下任选地被取代的烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷基氨基羰基氧基、烷基磺酰基氧基、链烯基氧基、链炔基氧基、芳基氧基、芳硫基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、芳基羰基氧基、芳基羰基烷氧基、芳基磺酰基氧基、芳基烷氧基、芳基烷硫基、芳基烷基亚磺酰基或芳基烷基磺酰基,

20

R⁷ 表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素, 或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、

烷基磺酰基、烷氧基羰基或环烷基，

R^8 表示氢或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、链烯基、链炔基、环烷基、环烷基烷基、芳基或芳基烷基，

5 R^9 表示羟基、甲酰氧基，或表示在各种情况下任选地被取代的烷氧基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷基氨基羰基氧基、烷基磺酰基氧基、链烯基氧基、链炔基氧基、芳基烷氧基、芳基羰基氧基、芳基羰基烷氧基或芳基磺酰基氧基，

10 R^{10} 表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷基羰基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，

R^{11} 表示氢或表示在各种情况下任选地被取代的烷基或环烷基，

R^{12} 表示氢或表示在各种情况下任选地被取代的烷基或环烷基，且

15 R^{13} 表示氢、氰基、氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，

R^7 表示氢、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，

20 R^3 表示硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基、并且

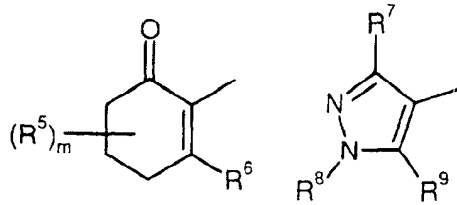
25 R^4 表示任选地被取代的 4 至 12 元、饱和或不饱和、单环或双环的杂环基团，其中含有 1 至 4 个杂原子(最多 4 个氮原子及任选地-非此即彼地或还含有-一个或两个氧原子或一个或两个硫原子，或一个或两个 S0 基团或一个或两个 SO₂ 基团)，且其中还含有 1 至 3 个氧代基团(C=O) 和/或硫羰基(C=S)作为杂环的成员，

30 包括通式(I)化合物的所有可能的互变异构体和通式(I)化合物的可能的盐及酸或碱加合物。

2. 根据权利要求 1 所述的式(I)的化合物，其特征在于

n 表示数字 0 或 1，

m 表示数字 0、1、2、3 或 4，
 A 表示具有 1 至 6 个碳原子的烷二基(亚烷基)，
 R^1 表示下列基团之一，

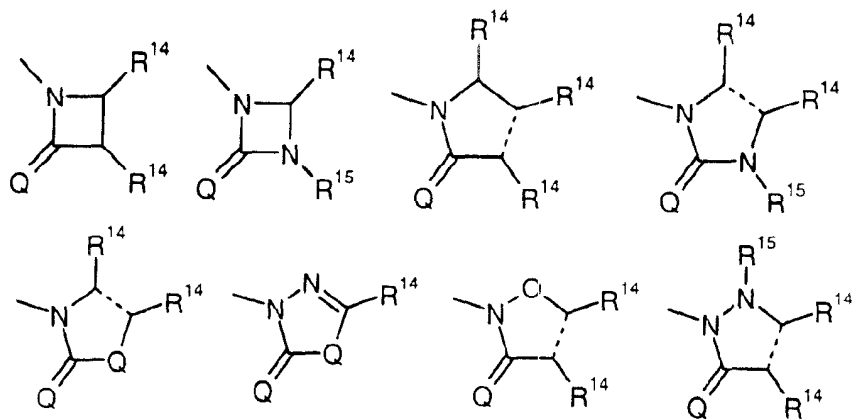


5

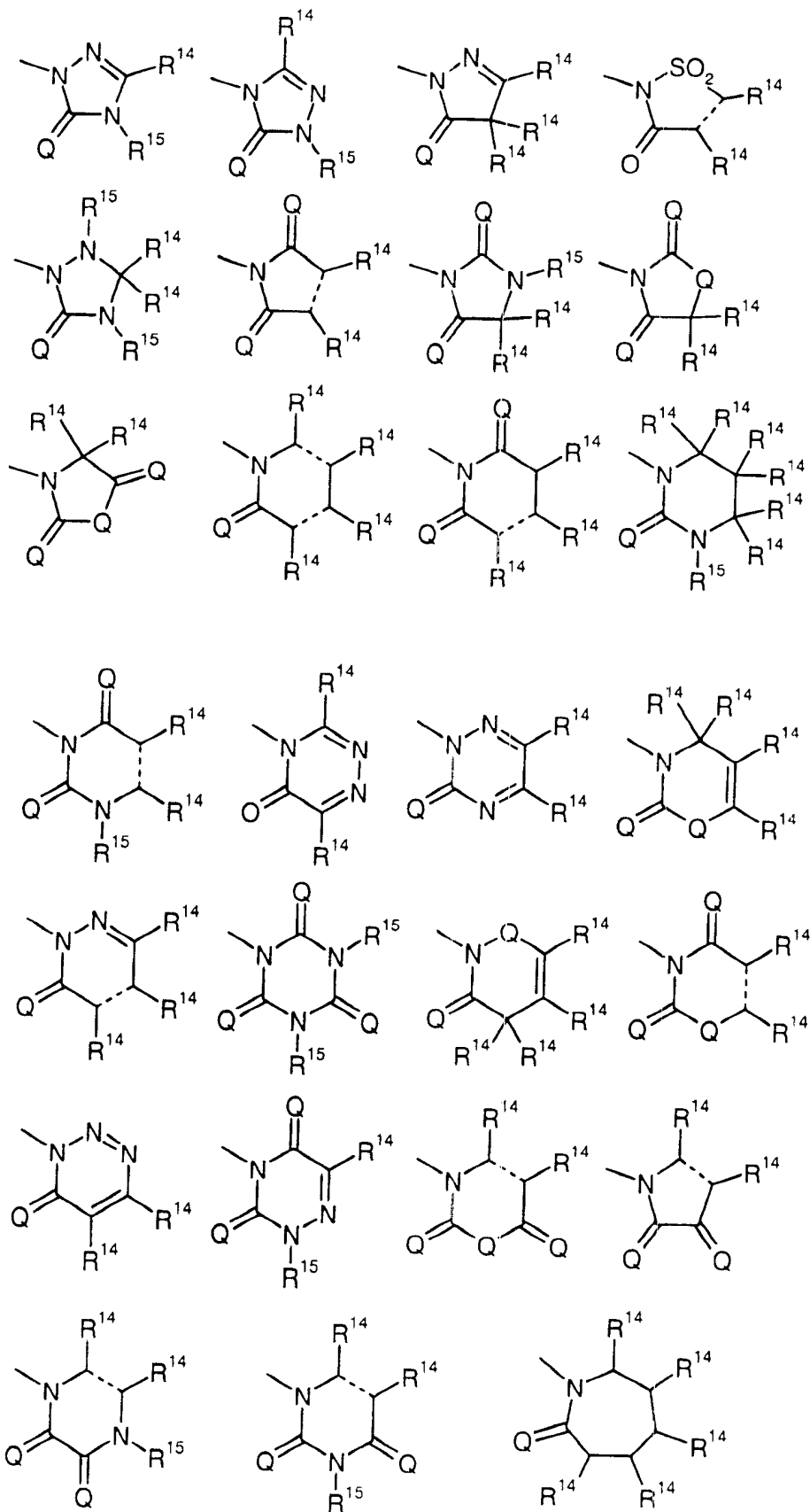
R^2 表示氢、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被氰基、卤素、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基或 C_1 - C_4 -烷基磺酰基取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子，

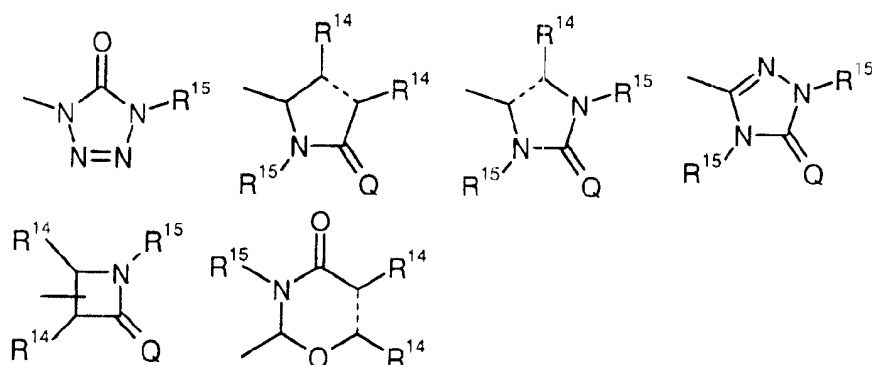
R^3 表示硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被氰基、卤素、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基或 C_1 - C_4 -烷基磺酰基取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子，

R^4 表示如下杂环基团之一：



20





其中在各种情况下虚线键为单键或双键，

Q 表示氧原子或硫原子，

- 5 R¹⁴ 表示氢、羟基、巯基、氰基、卤素，表示在各种情况下任选地被氰基、卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基或 C₁-C₄-烷基磺酰基取代的烷基、烷基羰基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的烷基氨基
- 10 或二烷基氨基，这些基团在各种情况下在烷基中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的链烯基、链炔基、链烯基氧基、链烯基硫基或链烯基氨基，这些基团在各种情况下在链烯基或链炔基中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的环烷基、环烷基氧基、环烷基硫基、环烷基氨基、环烷基烷基、环烷基烷氧基、环烷基烷硫基或环烷基烷基氨基，这些基团在各种情况下在环烷基中具有 3 至 6 个碳原子且任选地在烷基部分中最多具有 4 个碳原子，
- 15 或表示在各种情况下任选地被卤素、C₁-C₄-烷基或 C₁-C₄-烷氧基取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基氨基、苄基、苄氧基、苄硫基或苄基氨基，表示吡咯烷基、1-哌啶基或 4-吗啉基，或如果两个相邻基团 R¹⁴
- 20 和 R¹⁵ 位于双键则也可与相邻基团 R¹⁴ 一起表示苯并基团，且

- R¹⁵ 表示氢、羟基、氨基、最多具有 4 个碳原子的亚烷基氨基，表示在各种情况下任选地被卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基或烷酰基氨基，这些基团在各种情况下在烷基中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的链烯基、链炔基或链烯基氧基，这些基团在各种情况下在链烯基或链炔基
- 25

5 中最多具有 6 个碳原子, 表示在各种情况下任选地被卤素取代的环烷基、环烷基烷基或环烷基氨基, 这些基团在各种情况下在环烷基中具有 3 至 6 个碳原子且任选地在烷基部分中最多具有 3 个碳原子, 或表示在各种情况下任选地被卤素、C₁-C₄-烷基或 C₁-C₄-烷氧基取代的苯基或苄基, 或与相邻基团 R¹⁴ 或 R¹⁵ 一起表示任选地被卤素或 C₁-C₄-烷基取代的具有 3 至 5 个碳原子的烷二基,

其中如果一个以上连接在同一杂环基团上, 则各个基团 R¹⁴ 和 R¹⁵ 可以具有上述定义范围内的相同或不同的含义,

10 R⁵ 表示卤素, 表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基或烷硫基, 这些基团在各种情况下具有 1 至 6 个碳原子, 表示任选地被卤素、C₁-C₄-烷基或 C₁-C₄-烷氧基取代的苯基, 或者如果 m 表示 2 则与第二个 R⁵ 基团一起表示具有 2 至 6 个碳原子的烷二基,

15 R⁶ 表示羟基、甲酰氧基, 或表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子的烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷基氨基羰基氧基或烷基磺酰基氧基, 表示在各种情况下任选地被氰基或卤素取代的在各种情况下具有 2 至 6 个碳原子的链烯基氧基或链炔基氧基, 或表示在各种情况下任选地被硝基、氰基、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-卤代烷氧基取代的芳基氧基、芳硫基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、芳基羰基氧基、芳基羰基烷氧基、芳基磺酰基氧基、芳基烷氧基、芳基烷硫基、芳基烷基亚磺酰基或芳基烷基磺酰基, 这些基团在各种情况下在芳基中具有 6 或 10 个碳原子且任选地在烷基部分中具有 1 至 4 个碳原子,

20 R⁷ 表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素, 表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基或烷氧基羰基, 这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子, 或表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷基取代的具有 3 至 6 个碳原子的环烷基,

30 R⁸ 表示氢, 表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的具有 1 至 6 个碳原子的烷基, 表示在各种情况下任选地被氰基或卤素取代的在各种情况下具有 2 至 6 个碳原子的链烯基或链炔基, 表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷基取代的环烷基或环

烷基烷基，这些基团在各种情况下在环烷基中具有 3 至 6 个碳原子且
任选地在烷基部分中具有 1 至 4 个碳原子，或表示在各种情况下任选
地被硝基、氰基、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基
或 C₁-C₄-卤代烷氧基取代的芳基或芳基烷基，这些基团在各种情况下
5 在芳基中具有 6 或 10 个碳原子且任选地在烷基部分中具有 1 至 4 个碳
原子，

R⁹ 表示羟基、甲酰氧基，表示在各种情况下任选地被氰基、卤素
或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷氧基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷
基氨基羰基氧基或烷基磺酰基氧基，这些基团在各种情况下在烷基中
10 含有 1 至 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被氰基或卤素取代的
在各种情况下具有 2 至 6 个碳原子的链烯基氧基或链炔基氧基，或表
示在各种情况下任选地被硝基、氰基、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代
烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-卤代烷氧基取代的芳基烷氧基、芳基羰基
氧基、芳基羰基烷氧基或芳基磺酰基氧基，这些基团在各种情况下在
15 芳基中具有 6 或 10 个碳原子且任选地在烷基部分中具有 1 至 4 个碳原
子，

R¹⁰ 表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示
在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基、烷基
羰基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，这
些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子，
20

R¹¹ 表示氢，表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的具有 1
至 6 个碳原子的烷基，或表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷基取代
的具有 3 至 6 个碳原子的环烷基，

R¹² 表示氢，表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的具有 1
25 至 6 个碳原子的烷基，或表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷基取代
的具有 3 至 6 个碳原子的环烷基，且

R¹³ 表示氢、氰基、氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选
地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基、烷氧基、烷氧基羰基、
烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基
30 中含有 1 至 6 个碳原子。

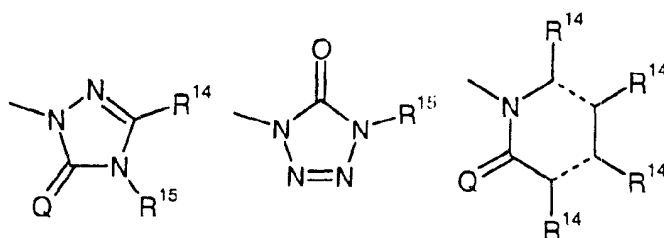
3. 根据权利要求 1 或 2 所述的式 (I) 的化合物，其特征在于
m 表示数字 0、1、2 或 3，

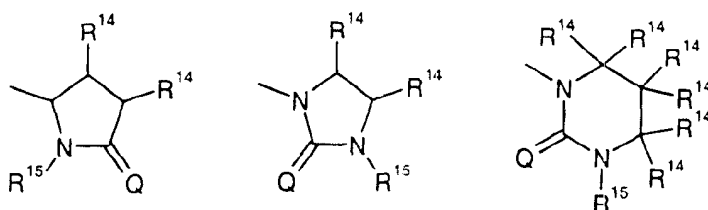
A 表示亚甲基、乙-1, 2-二基(二亚甲基)、乙-1, 1-二基、丙-1, 2-二基、丙-1, 3-二基(三亚甲基)、丁-1, 2-二基、丁-1, 3-二基或丁-1, 4-二基(四亚甲基),

R^2 表示氢、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴、碘, 或表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基, 或表示甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、二甲基氨基磺酰基或二乙基氨基磺酰基,

R^3 表示硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基, 或表示甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、二甲基氨基磺酰基或二乙基氨基磺酰基,

R^4 表示如下杂环基团之一:





R^5 表示氟、氯、溴，表示在各种情况下任选地被氟基、氯、氧、
 甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或
 叔丁基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫
 基，表示任选地被氟、氯、甲基或甲氧基取代的苯基，或者如果 m 表
 示 2 则与第二个 R^5 基团一起表示乙-1, 2-二基(二亚甲基)、丙-1, 3-二
 基(三亚甲基)或丁-1, 4-二基(四亚甲基)，

R^6 表示羟基、甲酰氧基，表示在各种情况下任选地被氟基、氯、
 氧、甲氧基或乙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、
 异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、
 仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰
 基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基、乙酰氧基、丙酰
 氧基、正-或异丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或
 异丙氧基羰基氧基、甲基氨基羰基氧基、乙基氨基羰基氧基、正-或异
 丙基氨基羰基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正-或异丙基
 磺酰基氧基，表示在各种情况下任选地被氟基、氯、氧或溴取代的丙
 烯基氧基、丁烯基氧基、丙炔基氧基或丁炔基氧基，或表示在各种情
 况下任选地被硝基、氟基、氯、氧、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、
 正-、异-、仲-或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧
 基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯氧
 基、苯硫基、苯基亚磺酰基、苯基磺酰基、苯甲酰氧基、苯甲酰基甲
 氧基、苯基磺酰基氧基、苯基甲氧基、苯基甲硫基、苯基甲基亚磺酰
 基或苯基甲基磺酰基，

R^7 表示氢、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴，表
 示在各种情况下任选地被氟基、氯、氧、甲氧基或乙氧基取代的甲基、
 乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-

或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基，或表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基，

R^8 表示氢，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基或苄基，

R^9 表示羟基、甲酰氧基，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异丙氧基羰基氧基、甲基氨基羰基氧基、乙基氨基羰基氧基、正-或异丙基氨基羰基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正-或异丙基磺酰基氧基，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯或溴取代的丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙炔基氧基或丁炔基氧基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基甲氧基、苯甲酰氧基、苯甲酰基甲氧基或苯基磺酰基氧基，

R^{10} 表示氢、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴，或表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、乙酰基、丙酰基、正-或异丁酰基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或

异丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基，

5 R^{11} 表示氢，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基，或表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基，

10 R^{12} 表示氢，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基，或表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基，

15 R^{13} 表示氢、氟基、氨基甲酰基、氟、氯、溴，或表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基，

20 R^{14} 表示氢、羟基、巯基、氟基、氟、氯、溴、碘，表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基，表示
25 甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、正-、异-、仲-或叔丁基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、二-正丙基氨基或二-异丙基氨基，表示
30 在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的乙烯基、丙烯基、丁烯基、乙炔基、丙炔基、丁炔基、丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙烯基硫基、丁烯基硫基、丙烯基氨基或丁烯基氨基，表示在各种情况下任选地被

氟和/或氯取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基氧基、环
 丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基、环丙基硫基、环丁基硫基、环戊基
 硫基、环己基硫基、环丙基氨基、环丁基氨基、环戊基氨基、环己基
 氨基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基、环丙基
 5 甲氧基、环丁基甲氧基、环戊基甲氧基、环己基甲氧基、环丙基甲硫
 基、环丁基甲硫基、环戊基甲硫基、环己基甲硫基、环丙基甲基氨基、
 环丁基甲基氨基、环戊基甲基氨基或环己基甲基氨基，或表示在各种
 情况下任选地被氟、氯、甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-
 或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的苯基、苯氧基、苯
 10 硫基、苯基氨基、苄基、苄氧基、苄硫基或苄基氨基，表示吡咯烷基、
 1-吡啶基或4-吗啉基，或如果两个相邻的基团 R^{14} 和 R^{14} 位于双键则与
 相邻的 R^{14} 基团一起也可表示苯并基团，且

R^{15} 表示氢、羟基、氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、
 甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-或仲丁基、
 15 甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲基氨基、乙基氨基或二甲基氨基，
 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的乙烯基、丙烯基、乙炔
 基、丙炔基或丙烯基氧基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代
 的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环
 20 戊基甲基、环己基甲基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲基、
 乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-
 或异丙氧基取代的苯基或苄基，或与相邻的 R^{14} 或 R^{15} 基团一起表示在
 各种情况下任选地被甲基和/或乙基取代的丙-1, 3-二基(三亚甲基)或
 丁-1, 4-二基(四亚甲基)。

4. 按照权利要求 1 至 3 任一项所述的式(I)的化合物，其特征在
 25 于

m 表示数字 0、1 或 2，

A 表示亚甲基或二亚甲基，

R^2 表示氢、硝基、氰基、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、二氟甲
 基、三氟甲基、二氯甲基、三氯甲基、甲氧基甲基、甲硫基甲基、甲
 30 基亚磺酰基甲基、甲基磺酰基甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、
 三氟甲氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基
 磺酰基、乙基磺酰基或二甲基氨基磺酰基，

R^3 表示硝基、氰基、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、二氯甲基、三氯甲基、甲氧基甲基、甲硫基甲基、甲基亚磺酰基甲基、甲基磺酰基甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基或二甲基氨基磺酰基，

R^5 表示在各种情况下任选地被氟或氯取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基，表示苯基，或者如果 m 表示 2 则与第二个 R^5 基团一起表示乙-1, 2-二基(二亚甲基)、丙-1, 3-二基(三亚甲基)或丁-1, 4-二基(四亚甲基)，

R^6 表示羟基、甲酰氧基，表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异丙氧基羰基氧基、甲基氨基羰基氧基、乙基氨基羰基氧基、正-或异丙基氨基羰基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正-或异丙基磺酰基氧基，表示丙烯基氧基或丙炔基氧基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯氧基、苯硫基、苯基亚磺酰基、苯基磺酰基、苯甲酰氧基、苯甲酰基甲氧基、苯基磺酰基氧基、苯基甲氧基、苯基甲硫基、苯基甲基亚磺酰基或苯基甲基磺酰基，

R^7 表示氢、氰基、氟、氯、溴，表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基，

R^8 表示氢，表示在各种情况下任选地被氰基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基，表示在各种情况下任选地被氟或氯取代的丙烯基或丙炔基，表示任选地被氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基或苄基，

R^9 表示羟基、甲酰氧基, 表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异丙氧基羰基氧基、甲基氨基羰基氧基、乙基氨基羰基氧基、正-或异丙基氨基羰基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正-或异丙基磺酰基氧基, 表示丙烯基氧基或丙炔基氧基, 或表示在各种情况下任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基甲氧基、苯甲酰氧基、苯甲酰基甲氧基或苯基磺酰基氧基,

R^{10} 表示氢、氟基、氟、氯、溴, 或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、乙酰基、丙酰基、正-或异丁酰基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基,

R^{11} 表示氢, 表示在各种情况下任选地被氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基, 或表示任选地被氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基,

R^{12} 表示氢, 表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基, 或表示任选地被氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基,

R^{13} 表示氢、氟基、氟、氯、溴, 或表示在各种情况下任选地被氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基,

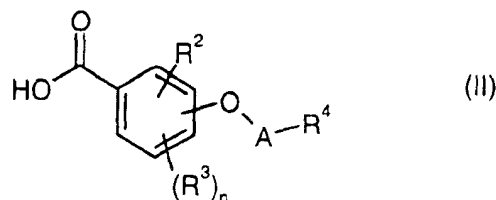
R^{14} 表示氢、羟基、巯基、氟基、氟、氯、溴、碘, 表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基取代的甲基、

乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基，表示甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、二甲基氨基或二乙基氨基，表示
 5 在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的乙烯基、丙烯基、乙炔基、丙炔基、丙烯基氧基、丙烯基硫基或丙烯基氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的环丙基、环丙基氧基、环丙基氨基、环丙基甲基、环丙基甲氧基或环丙基甲基氨基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基氨基、苄基、苄氧基、苄硫基或苄基氨基，或如果两个相邻的基团 R^{14} 和 R^{14} 位于双键则与相邻的 R^{14} 基团一起也可表示苯并基团，且

R^{15} 表示氢、羟基、氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、
 15 正-或异丙氧基、甲基氨基、乙基氨基或二甲基氨基，表示丙烯基或丙炔基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的环丙基、环丁基或环丙基甲基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的苯基或苄基，或与相邻的 R^{14} 或 R^{15} 基团一起表示在各种情况下任选地被甲基和/或乙基取代的丙-1, 3-二基(三亚甲基)或丁-1, 4-二基(四亚甲基)。
 20

5. 制备按照权利要求 1 至 4 任一项所述的式 (I) 的化合物的方法，其特征在于：

a) 通式 (II) 的被取代的苯甲酸



25

其中

n 、 A 、 R^2 、 R^3 和 R^4 具有权利要求 1 中给定的含义，或其反应性衍生物，例如，相应的酰卤化物、酸的氟化物或酯，

与通式(III)的化合物反应



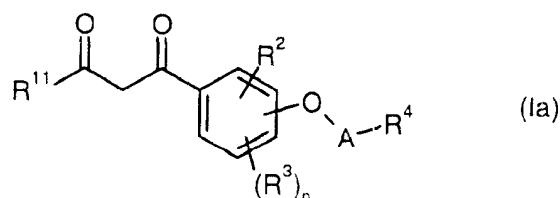
5 其中

R^1 具有权利要求 1 中给出的含义,

该反应任选在脱水剂存在下, 任选在一种或多种反应助剂存在下, 且任选在稀释剂存在下进行,

或者

10 b) 通式(Ia)的取代的苯甲酰基酮



其中

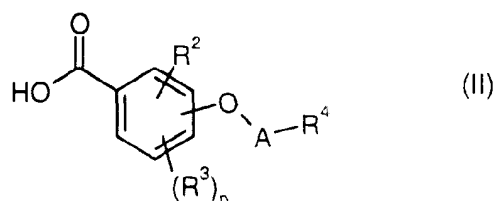
n 、 A 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^{11} 具有权利要求 1 中给定的含义,

15 与原甲酸酯或与 N,N -二甲基-甲酰胺缩醛或与氰基甲酸酯或与二硫化碳和烷基化试剂反应, 再与羟胺或其酸加合物反应,

该反应任选在一种或多种反应助剂存在下, 且任选在一种或多种稀释剂存在下进行,

20 且任选在本发明的方法(a)或(b)后, 将所得通式(I)的化合物按照常规方式在取代基定义的范围内进行取代、氧化或还原反应, 和/或将通式(I)的化合物以常规方式转化成盐类化合物。

6. 式(II)的化合物及其反应性衍生物,

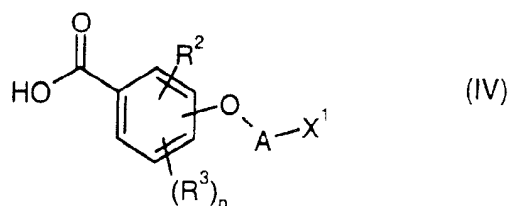


其中

n、A、R²、R³和R⁴具有权利要求1中给定的含义。

7. 制备按照权利要求6所述的式(II)化合物的方法, 其特征在于:

5 (α) 式(IV)的化合物



其中

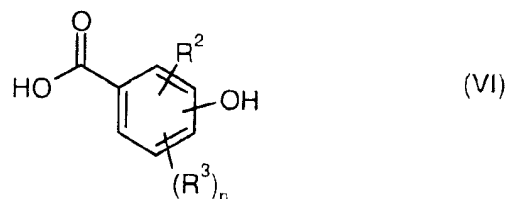
10 n、A、R²和R³具有如权利要求1中给定的含义, 而且
X¹表示卤素或表示烷基磺酰基氧基,
或其衍生物,
与通式(V)的杂环化合物反应



15

其中

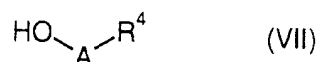
R⁴具有权利要求1中给定的含义,
该反应任选在酸接受体如碳酸钾的存在下, 且任选在稀释剂存在
下, 在温度10℃至150℃下进行, 并且任选接着在取代基的定义范围
20 内按常规进行进一步的转化反应,
或者
(β) 式(VI)的化合物



其中

n 、 R^2 和 R^3 具有如权利要求 1 中给定的含义，
或其衍生物，
与通式 (VII) 的羟基烷基杂环

5

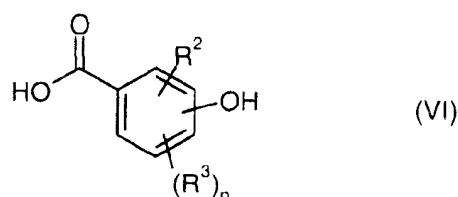


其中

A 和 R^4 具有如权利要求 1 中给定的含义，
在缩合反应助剂的存在下，并且任选在稀释剂的存在下，在温度
10 -20°C 至 $+50^\circ\text{C}$ 下反应，并且任选接着在取代基的定义范围内按常规进
行进一步的转化反应，

或者

(γ) 式 (VI) 的化合物

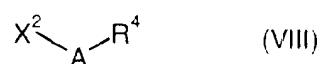


15

其中

n 、 R 和 R^3 具有权利要求 1 中给定的含义，
或其衍生物，
与通式 (VIII) 的卤代烷基杂环

20



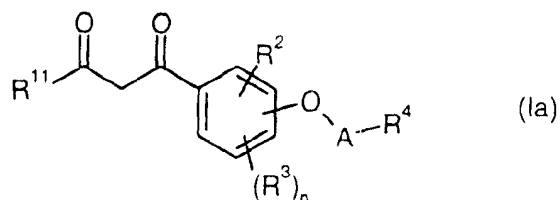
其中

A 和 R^4 具有权利要求 1 中给定的含义，且
 X^2 表示卤素，表示烷基磺酰基氧基或表示芳基磺酰基氧基，

任选在酸接受体的存在下，且任选在稀释剂的存在下，在温度 0℃ 至 150℃ 下反应，并且任选接着在取代基的定义范围内按常规进行进一步的转化反应。

8. 式 (Ia) 的化合物，

5



其中

n 、 A 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^{11} 具有权利要求 1 中给定的含义。

9. 组合物，其特征在于含有至少一种按照权利要求 1 至 4 任一项所述的式 (I) 化合物。

10. 按照权利要求 1 至 4 任一项所述的式 (I) 化合物或者按照权利要求 9 所述的组合物控制不需要的植物的用途。

11. 控制不需要的植物的方法，其特征在于将至少一种权利要求 1 至 4 任一项所述的式 (I) 化合物或者权利要求 9 所述的组合物作用于不需要的植物和/或其栖息地。

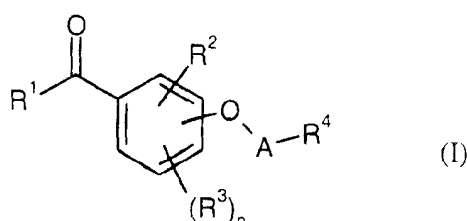
15

被取代的芳基酮类

5 本发明涉及新的被取代的芳基酮类、其制备方法及其作为除草剂的用途。

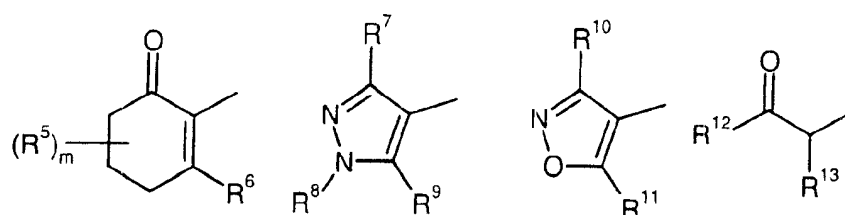
已知某些被取代的芳基酮类具有除草性质(参见 EP-A-090262、EP-A-135191、EP-A-186118、EP-A-186119、EP-A-186120、EP-A-319075、EP-A-352543、EP-A-418175、EP-A-487357、EP-A-527036、EP-A-527037、EP-A-560483、EP-A-609797、EP-A-609798、EP-A-10 625505、EP-A-625508、EP-A-636622、US-A-5804532、US-A-5834402、US-A-5846906、US-A-5863865、WO-A-96/26192、WO-A-96/26193、WO-A-96/26200、WO-A-96/26206、WO-A-97/27187、WO-A-97/35850、WO-A-97/41105、WO-A-97/41116、WO-A-97/41117、WO-A-97/41118、WO-A-97/43270、WO-A-97/46530、WO-A-98/28981、WO-A-98/31681、15 WO-A-98/31682、WO-A-99/03856、WO-A-99/07688、WO-A-99/10327、WO-A-99/10328)。但是, 这些化合物的活性还不能令人十分满意。

因此, 本发明提供了通式(I)的新的被取代的芳基酮类:



20 其中

- n 表示数字 0、1 和 2,
- A 表示烷二基(亚烷基),
- R¹ 表示下列基团之一



其中

m 表示数字 0 至 6,

- 5 R^5 表示卤素或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷硫基或芳基, 或-如果 m 表示 2-任选地与第二个 R^5 基团一起表示烷二基(亚烷基),

- R^6 表示羟基、甲酰氧基、卤素, 或表示在各种情况下任选地被取代的烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基氧基、
10 烷氧基羰基氧基、烷基氨基羰基氧基、烷基磺酰基氧基、链烯基氧基、链炔基氧基、芳基氧基、芳硫基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、芳基羰基氧基、芳基羰基烷氧基、芳基磺酰基氧基、芳基烷氧基、芳基烷硫基、芳基烷基亚磺酰基或芳基烷基磺酰基,

- R^7 表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素, 或表示
15 在各种情况下任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷氧基羰基或环烷基,

R^8 表示氢或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、链烯基、链炔基、环烷基、环烷基烷基、芳基或芳基烷基,

- R^9 表示羟基、甲酰氧基, 或表示在各种情况下任选地被取代的烷
20 氧基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷基氨基羰基氧基、烷基磺酰基氧基、链烯基氧基、链炔基氧基、芳基烷氧基、芳基羰基氧基、芳基羰基烷氧基或芳基磺酰基氧基,

- R^{10} 表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素, 或表示
25 在各种情况下任选地被取代的烷基、烷基羰基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,

R^{11} 表示氢或表示在各种情况下任选地被取代的烷基或环烷基,

R^{12} 表示氢或表示在各种情况下任选地被取代的烷基或环烷基, 而且

R^{13} 表示氢、氰基、氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，

5 R^2 表示氢、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，

10 R^3 表示硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，而且

15 R^4 表示任选地被取代的 4-至 12-元、饱和或不饱和的、单环或双环杂环基团，其中含有 1 至 4 个杂原子(最多 4 个氮原子及任选地-非此即彼地或还含有-一个或两个氧原子或者一个或两个硫原子，或一个或两个 SO 基团，或一个或两个 SO₂ 基团)，且其中还含有 1 至 3 个氧代基团 (C=O) 和/或硫羰基 (C=S) 作为杂环的成员，包括通式 (I) 化合物的所有可能的互变异构体及通式 (I) 化合物的所有可能的盐和酸或碱的加合物。

20 在这些定义中，烃链，如烷基或烷二基，包括其与杂原子的联合形式，如烷氧基，在各种情况下是直链或支链。

本发明通式 (I) 的化合物可以含有一个或多个不对称取代的碳原子，因此，它们可以以不同的对映异构体 (R-和 S-构型) 或非对映异构体的形式存在。本发明涉及通式 (I) 化合物的各种可能的单个对映异构体或立体异构体形式，以及这些立体异构化合物的混合物。

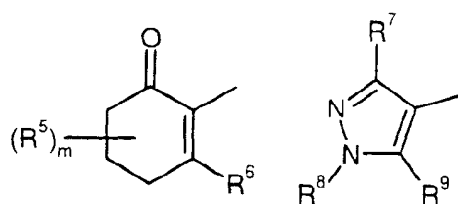
25 优选的取代基或上述及下述式中存在的基团的优选范围限定如下。

n 优选表示数字 0 或 1。

m 优选表示数字 0, 1, 2, 3 或 4。

A 优选表示具有 1 至 6 个碳原子的烷二基(亚烷基)。

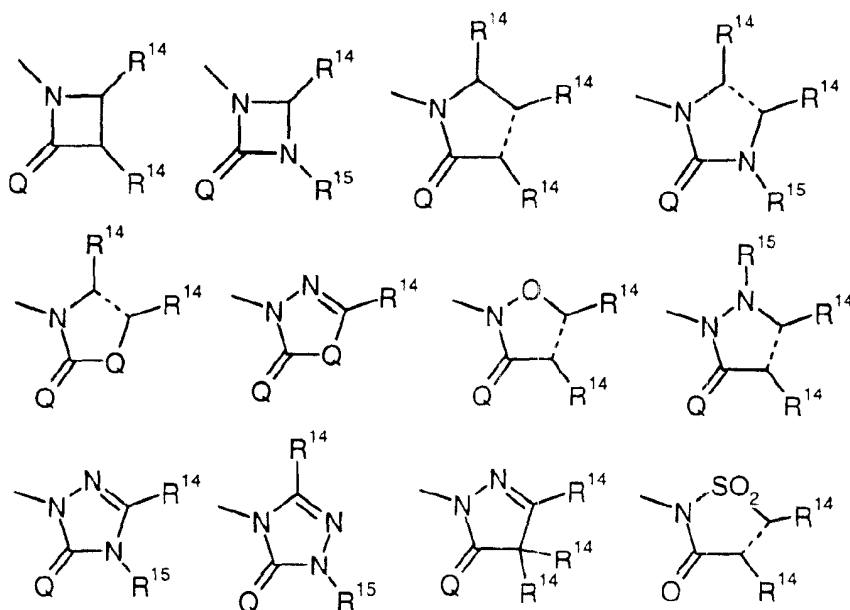
30 R^1 优选表示下列基团之一

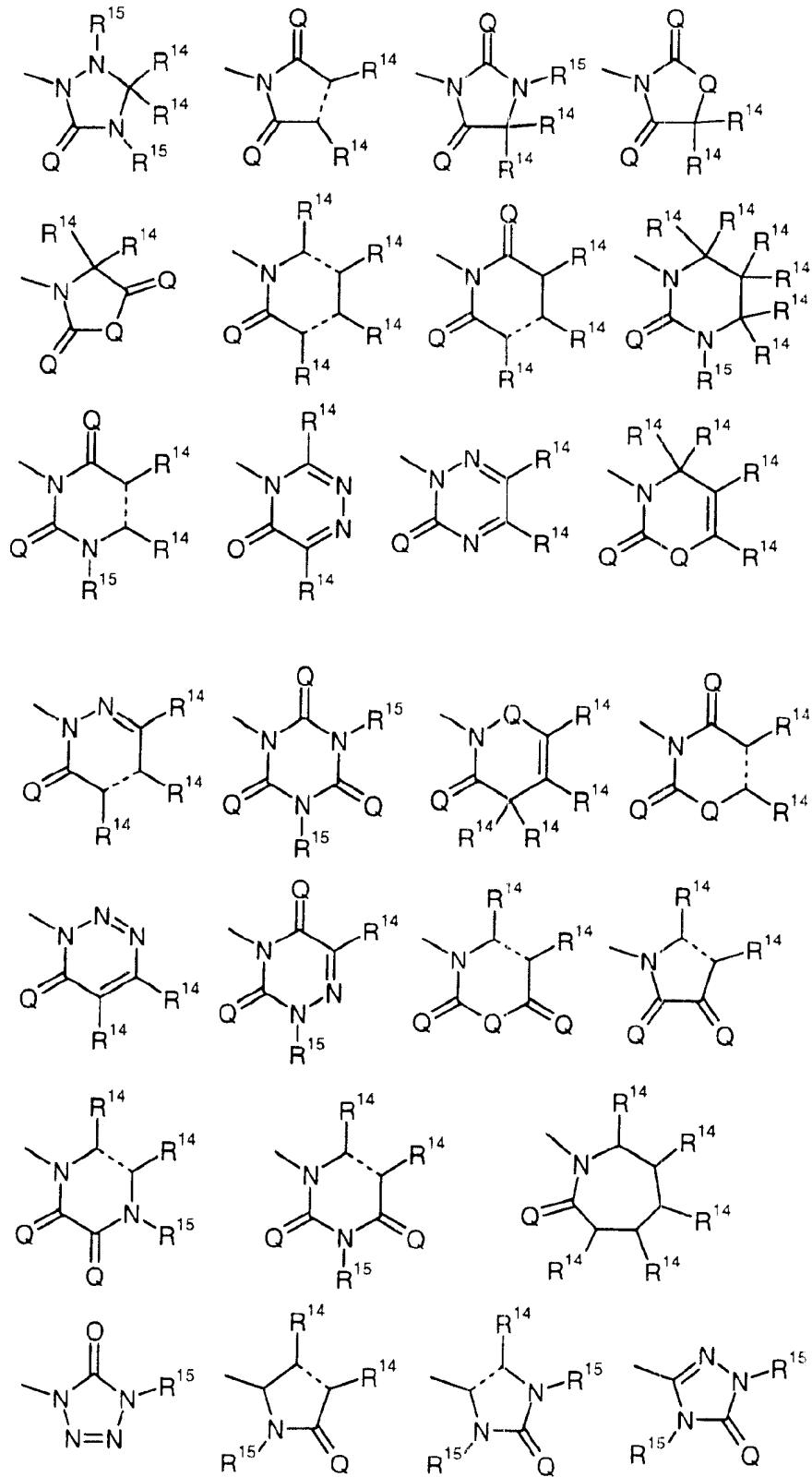


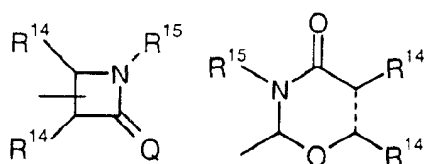
5 R^2 优选表示氢、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被氰基、卤素、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基或 C_1-C_4 -烷基磺酰基取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子。

10 R^3 优选表示硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被氰基、卤素、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基或 C_1-C_4 -烷基磺酰基取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基氨基、二烷基氨基或二烷基氨基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子。

15 R^4 优选表示如下的杂环之一







其中在各种情况下虚线表示的键是单键或双键，

Q 表示氧原子或硫原子，

- 5 R^{14} 表示氢、羟基、巯基、氰基、卤素，表示在各种情况下任选地被氰基、卤素、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基或 C_1-C_4 -烷基磺酰基取代的烷基、烷基羰基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的烷基氨基
- 10 或二烷基氨基，这些基团在各种情况下在烷基中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的链烯基、链炔基、链烯基氧基、链烯硫基或链烯基氨基，这些基团在各种情况下在链烯基或链炔基中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的环烷基、环烷基氧基、环烷基硫基、环烷基氨基、环烷基烷基、环烷基烷
- 15 氧基、环烷基烷硫基或环烷基烷基氨基，这些基团在各种情况下在环烷基中具有 3 至 6 个碳原子且任选地在烷基部分中最多具有 4 个碳原子，或表示在各种情况下任选地被卤素、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基氨基、苄基、苄氧基、苄硫基或苄基氨基，表示吡咯烷基、1-哌啶基或 4-吗啉基，或如果两个相邻基团
- 20 R^{14} 和 R^{14} 位于双键则也可与相邻基团 R^{14} 一起表示苯并基团，且

- R^{15} 表示氢、羟基、氨基、最多具有 4 个碳原子的亚烷基氨基，表示在各种情况下任选地被卤素或 C_1-C_4 -烷氧基取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基或烷酰基氨基，这些基团在各种情况下在烷基中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的链烯基、链炔基或链烯基氧基，这些基团在各种情况下在链烯基或链炔基
- 25 中最多具有 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被卤素取代的环烷基、环烷基烷基或环烷基氨基，这些基团在各种情况下在环烷基中具有 3 至 6 个碳原子且任选地在烷基部分中最多具有 3 个碳原子，或表

示在各种情况下任选地被卤素、C₁-C₄-烷基或 C₁-C₄-烷氧基取代的苯基或苄基，或与相邻基团 R¹⁴ 或 R¹⁵ 一起表示任选地被卤素或 C₁-C₄-烷基取代的具有 3 至 5 个碳原子的烷二基，

其中如果一个以上连接在同一杂环基团上，则各个基团 R¹⁴ 和 R¹⁵ 可以具有上述定义范围内的相同或不同的含义。

5 R⁵ 优选表示卤素，表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基或烷硫基，这些基团在各种情况下具有 1 至 6 个碳原子，表示任选地被卤素、C₁-C₄-烷基或 C₁-C₄-烷氧基取代的苯基，或如果 m 表示 2 则也可任选地与第二个基团 R⁵ 一起表示具有 2 至 6 个碳原子的烷二基(亚烷基)。

R⁶ 优选表示羟基、甲酰氧基，或表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子的烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷基氨基羰基氧基或烷基磺酰基氧基，表示在各种情况下任选地被氰基或卤素取代的在各种情况下具有 2 至 6 个碳原子的链烯基氧基或链炔基氧基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氰基、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-卤代烷氧基取代的芳基氧基、芳硫基、芳基亚磺酰基、芳基磺酰基、芳基羰基氧基、芳基羰基烷氧基、芳基磺酰基氧基、芳基烷氧基、芳基烷硫基、芳基烷基亚磺酰基或芳基烷基磺酰基，这些基团在各种情况下在芳基中具有 6 或 10 个碳原子且任选地在烷基部分中具有 1 至 4 个碳原子。

25 R⁷ 优选表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基或烷氧基羰基，这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子，或表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷基取代的具有 3 至 6 个碳原子的环烷基。

30 R⁸ 优选表示氢，表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的具有 1 至 6 个碳原子的烷基，表示在各种情况下任选地被氰基或卤素取代的在各种情况下具有 2 至 6 个碳原子的链烯基或链炔基，表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷基取代的环烷基或环烷基烷基，这些基团在各种情况下在环烷基中具有 3 至 6 个

碳原子且任选地在烷基部分中具有 1 至 4 个碳原子，或表示在各种情况下任选地被硝基、氰基、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-卤代烷氧基取代的芳基或芳基烷基，这些基团在各种情况下在芳基中具有 6 或 10 个碳原子且任选地在烷基部分中具有 1 至 4 个碳原子。

R⁹ 优选表示羟基、甲酰氧基，表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷氧基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷基氨基羰基氧基或烷基磺酰基氧基，这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子，表示在各种情况下任选地被氰基或卤素取代的在各种情况下具有 2 至 6 个碳原子的链烯基氧基或链炔基氧基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氰基、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-卤代烷氧基取代的芳基烷氧基、芳基羰基氧基、芳基羰基烷氧基或芳基磺酰基氧基，这些基团在各种情况下在芳基中具有 6 或 10 个碳原子且任选地在烷基部分中具有 1 至 4 个碳原子。

R¹⁰ 优选表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基、烷基羰基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子。

R¹¹ 优选表示氢，表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的具有 1 至 6 个碳原子的烷基或表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷基取代的具有 3 至 6 个碳原子的环烷基。

R¹² 优选表示氢，表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的具有 1 至 6 个碳原子的烷基，或表示任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷基取代的具有 3 至 6 个碳原子的环烷基。

R¹³ 优选表示氢、氰基、氨基甲酰基、卤素，或表示在各种情况下任选地被氰基、卤素或 C₁-C₄-烷氧基取代的烷基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，这些基团在各种情况下在烷基中含有 1 至 6 个碳原子。

m 特别优选表示数字 0、1、2 或 3。

A 特别优选表示亚甲基、乙-1, 2-二基(二亚甲基)、乙-1, 1-二基、丙-1, 2-二基、丙-1, 3-二基(三亚甲基)、丁-1, 2-二基、丁-1, 3-二基

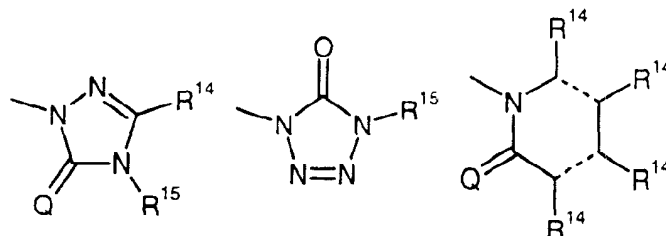
或丁-1,4-二基(四亚甲基)。

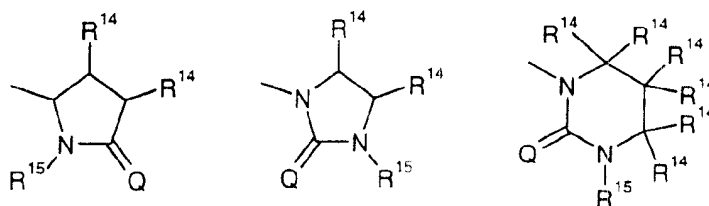
R^2 特别优选表示氢、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴、碘, 或表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基, 或表示甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、二甲基氨基磺酰基或二乙基氨基磺酰基。

R^3 特别优选表示硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基, 表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基, 或表示甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、二甲基氨基磺酰基或二乙基氨基磺酰基。

R^4 特别优选表示如下杂环基团之一:

25





5 R^5 特别优选表示氟、氯、溴，表示在各种情况下任选地被氟基、氯、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基，表示任选地被氟、氯、甲基或甲氧基取代的苯基，或者如果 m 表示 2 则与第二个 R^5 基团一起表示乙-1, 2-二基(二亚甲基)、丙-1, 3-二基(三亚甲基)或丁-1, 4-二基(四亚甲基)。

10 R^6 特别优选表示羟基、甲酰氧基，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异丙氧基羰基氧基、甲基氨基羰基氧基、乙基氨基羰基氧基、正-或异丙基氨基羰基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正-或异丙基磺酰基氧基，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯或溴取代的丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙炔基氧基或丁炔基氧基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯氧基、苯硫基、苯基亚磺酰基、苯基磺酰基、苯甲酰氧基、苯甲酰基甲氧基、苯基磺酰基氧基、苯基甲氧基、苯基甲硫基、苯基甲基亚磺酰基或苯基甲基磺酰基。

25 R^7 特别优选表示氢、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、

乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基，或表示在各种情况下任选地被氰基、氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

R^8 特别优选表示氢，表示在各种情况下任选地被氰基、氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基，表示在各种情况下任选地被氰基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基，表示在各种情况下任选地被氰基、氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基或苄基。

R^9 特别优选表示羟基、甲酰氧基，表示在各种情况下任选地被氰基、氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异丙氧基羰基氧基、甲基氨基羰基氧基、乙基氨基羰基氧基、正-或异丙基氨基羰基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正-或异丙基磺酰基氧基，表示在各种情况下任选地被氰基、氟、氯或溴取代的丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙炔基氧基或丁炔基氧基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基甲氧基、苯甲酰氧基、苯甲酰基甲氧基或苯基磺酰基氧基。

R^{10} 特别优选表示氢、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴，或表示在各种情况下任选地被氰基、氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、乙酰基、丙酰基、正-或异丁酰基、甲氧基、乙氧基、

正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基。

5 R¹¹ 特别优选表示氢，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基，或表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

10 R¹² 特别优选表示氢，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基，或表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

15 R¹³ 特别优选表示氢、氟基、氨基甲酰基、氟、氯、溴，或表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基。

20 R¹⁴ 特别优选表示氢、羟基、巯基、氟基、氟、氯、溴、碘，表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基，表示甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、正-、异-、仲-或叔丁基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、二-正丙基氨基或二-异丙基氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的乙烯基、丙烯基、丁烯基、乙炔基、丙炔基、丁炔基、丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙烯基硫

25

30

基、丁烯基硫基、丙烯基氨基或丁烯基氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基、环丙基硫基、环丁基硫基、环戊基硫基、环己基硫基、环丙基氨基、环丁基氨基、环戊基氨基、环己基氨基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基、环丙基甲氧基、环丁基甲氧基、环戊基甲氧基、环己基甲氧基、环丙基甲硫基、环丁基甲硫基、环戊基甲硫基、环己基甲硫基、环丙基甲基氨基、环丁基甲基氨基、环戊基甲基氨基或环己基甲基氨基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基氨基、苄基、苄氧基、苄硫基或苄基氨基，表示吡咯烷基、1-哌啶基或4-吗啉基，或如果两个相邻的基团 R^{14} 和 R^{14} 位于双键则与相邻的 R^{14} 基团一起也可表示苯并基团。

R^{15} 特别优选表示氢、羟基、氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-或仲丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲基氨基、乙基氨基或二甲基氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的乙烯基、丙烯基、乙炔基、丙炔基或丙烯基氧基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的苯基或苄基，或与相邻的 R^{14} 或 R^{15} 基团一起表示在各种情况下任选地被甲基和/或乙基取代的丙-1, 3-二基(三亚甲基)或丁-1, 4-二基(四亚甲基)。

A 更特别优选表示亚甲基或二亚甲基。

m 更特别优选表示数字 0、1 或 2。

R^2 更特别优选表示氢、硝基、氰基、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、二氯甲基、三氯甲基、甲氧基甲基、甲硫基甲基、甲基亚磺酰基甲基、甲基磺酰基甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基或二甲基氨基磺酰基。

R^3 更特别优选表示硝基、氰基、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、

二氟甲基、三氟甲基、二氯甲基、三氯甲基、甲氧基甲基、甲硫基甲基、甲基亚磺酰基甲基、甲基磺酰基甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基或二甲基氨基磺酰基。

- 5 R^5 更特别优选表示在各种情况下任选地被氟或氯取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基，表示苯基，或者如果 m 表示 2 则与第二个 R^5 基团一起表示乙-1, 2-二基(二亚甲基)、丙-1, 3-二基(三亚甲基)或丁-1, 4-二基(四亚甲基)。

- 10 R^6 更特别优选表示羟基、甲酰氧基，表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异丙氧基羰基氧基、甲基氨基羰基氧基、乙基氨基羰基氧基、正-或异丙基氨基羰基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正-或异丙基磺酰基氧基，表示丙烯基氧基或丙炔基氧基，或表示在各种情况下任选地被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯氧基、苯硫基、苯基亚磺酰基、苯基磺酰基、苯甲酰氧基、苯甲酰基甲氧基、苯基磺酰基氧基、
15 苯基甲氧基、苯基甲硫基、苯基甲基亚磺酰基或苯基甲基磺酰基。

- 20 R^7 更特别优选表示氢、氟基、氟、氯、溴，表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基。

- 30 R^8 更特别优选表示氢，表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基，表示在各种情况下任选地被氟或氯取代的丙烯基或丙炔基，表示任选地被氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基或苄基。

R⁹ 更特别优选表示羟基、甲酰氧基, 表示在各种情况下任选地被氟基、氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、乙酰氧基、丙酰氧基、正-或异丁酰氧基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基、正-或异丙氧基羰基氧基、甲基氨基羰基氧基、乙基氨基羰基氧基、正-或异丙基氨基羰基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正-或异丙基磺酰基氧基, 表示丙烯基氧基或丙炔基氧基, 或表示在各种情况下任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基取代的苯基甲氧基、苯甲酰氧基、苯甲酰基甲氧基或苯基磺酰基氧基。

R¹⁰ 更特别优选表示氢、氟基、氟、氯、溴, 或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、乙酰基、丙酰基、正-或异丁酰基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基。

R¹¹ 更特别优选表示氢, 表示在各种情况下任选地被氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基, 或表示任选地被氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基。

R¹² 更特别优选表示氢, 表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基, 或表示任选地被氟、氯、溴、甲基或乙基取代的环丙基。

R¹³ 更特别优选表示氢、氟基、氟、氯、溴, 或表示在各种情况下任选地被氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基。

R¹⁴ 更特别优选表示氢、羟基、巯基、氟基、氟、氯、溴、碘, 表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基

取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异丙基磺酰基，表示甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、二甲基氨基或二乙基氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的乙烯基、丙烯基、乙炔基、丙炔基、丙烯基氧基、丙烯基硫基或丙烯基氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的环丙基、环丙基氧基、环丙基氨基、环丙基甲基、环丙基甲氧基或环丙基甲基氨基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基氨基、苄基、苄氧基、苄硫基或苄基氨基，或如果两个相邻的基团 R^{14} 和 R^{14} 位于双键则与相邻的 R^{14} 基团一起也可表示苯并基团。

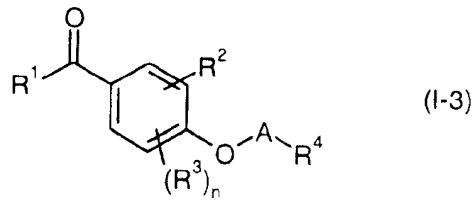
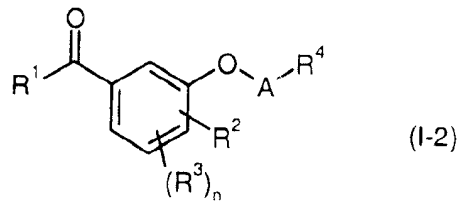
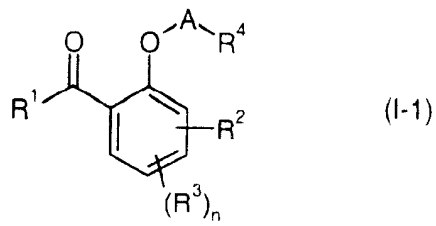
R^{15} 更特别优选表示氢、羟基、氨基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲基氨基、乙基氨基或二甲基氨基，表示丙烯基或丙炔基，表示在各种情况下任选地被氟和/或氯取代的环丙基、环丁基或环丙基甲基，或表示在各种情况下任选地被氟、氯、甲基、乙基、正-或异丙基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基取代的苯基或苄基，或与相邻的 R^{14} 或 R^{15} 基团一起表示在各种情况下任选地被甲基和/或乙基取代的丙-1, 3-二基(三亚甲基)或丁-1, 4-二基(四亚甲基)。

本发明优选具有上述优选含义的组合物(I)的化合物。

本发明特别优选具有上述特别优选含义的组合物(I)的化合物。

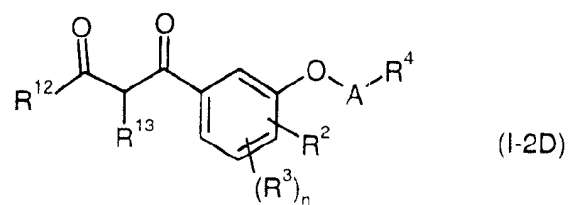
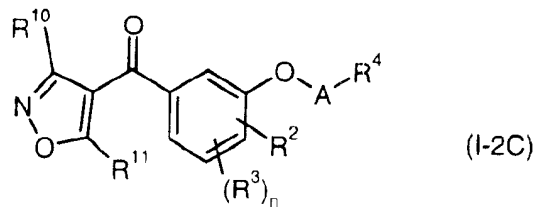
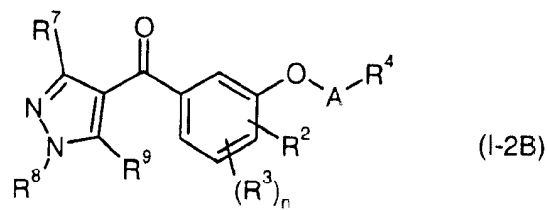
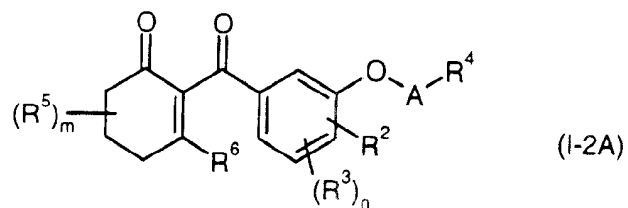
本发明更特别优选具有上述更特别优选含义的组合物(I)的化合物。

要特别强调的是通式(I-1)至(I-3)的化合物：



其中 n 、 A 、 R^1 、 R^2 、 R^3 和 R^4 在各种情况下具有优选的含义。

要更特别强调的是通式 (I-2A) 至 (I-2D) 的化合物：



其中 m 、 n 、 A 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 和 R^{13} 在各种情况下具有优选的含义。

本发明还提供了式 (I) 化合物的钠盐、钾盐、镁盐、钙盐、铵盐、 C_1 - C_4 -烷基-铵盐、二- $(C_1$ - C_4 -烷基)-铵盐、三- $(C_1$ - C_4 -烷基)-铵盐、四-
5 - $(C_1$ - C_4 -烷基)-铵盐、三- $(C_1$ - C_4 -烷基)-铊盐、 C_5 -或 C_6 -环烷基-铵盐和二- $(C_1$ - C_2 -烷基)-苄基-铵盐，其中优选 n 、 A 、 R^1 、 R^2 、 R^3 和 R^4 具有上述优选、特别优选或更特别优选的含义。

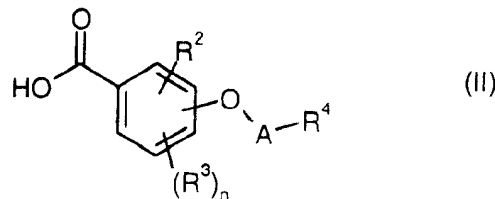
上面给出的一般性或优选的基团定义适用于式 (I) 的终产物，也相应地适用于各种情况下制备中需要的起始物或中间体。如果需要，则
10 这些基团定义可以彼此组合，即包括所给出的优选范围的任意组合。

通式 (I) 的新的被取代的芳基酮类由于除草活性强且具有选择性而出众。

通式 (I) 的新的被取代的芳基酮类可以如下制备：

a) 通式 (II) 的被取代的苯甲酸

15



其中

n 、 A 、 R^2 、 R^3 和 R^4 各定义如上，

或其反应性衍生物，例如，相应的酰卤化物、酸的氰化物
20 (Säurecyanide) 或酯，

与通式 (III) 的化合物



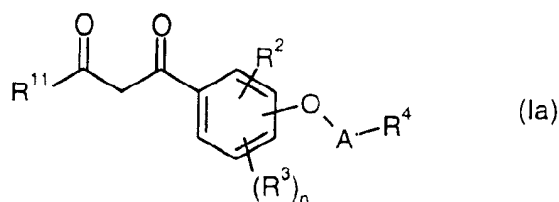
25 其中

R^1 定义如上，

任选在脱水剂存在下，任选在一种或多种反应助剂的存在下，且
任选在稀释剂存在下反应，

或者

b) 通式(Ia)的取代的苯甲酰基酮



其中

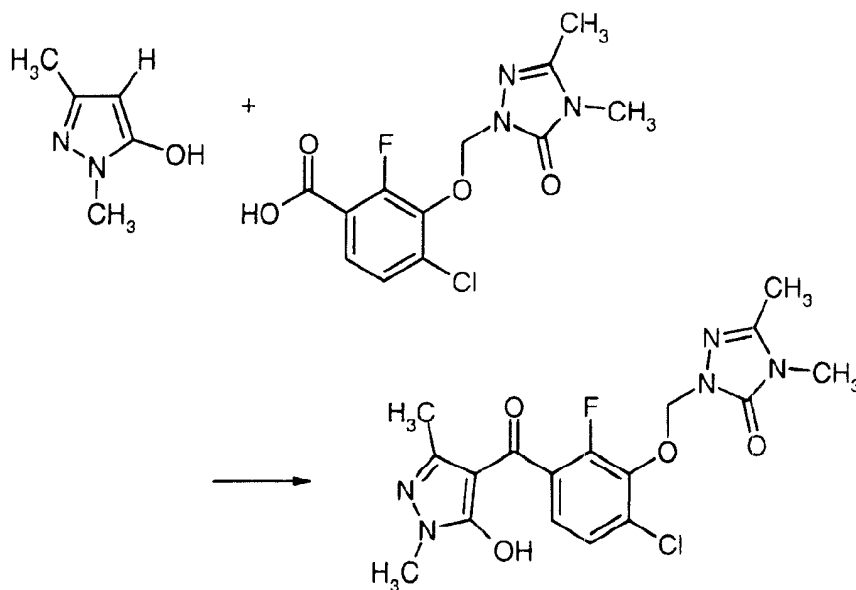
5 n、A、R²、R³、R⁴和R¹¹各定义如上，

与原甲酸酯或与N,N-二甲基-甲酰胺缩醛或与氰基甲酸酯或与二硫化碳和烷基化试剂反应，然后再与羟胺或其酸加合物反应，

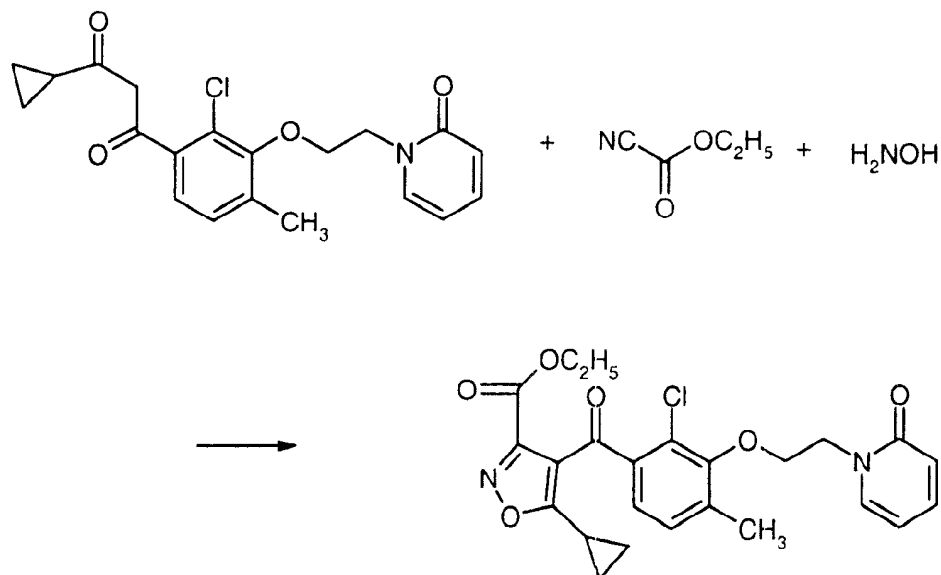
该反应任选在一种或多种反应助剂存在下，且任选在一种或多种稀释剂存在下进行，

10 且任选在本发明的方法(a)或(b)后，将所得通式(I)的化合物按照常规方式在取代基定义的范围内进行取代、氧化或还原反应，和/或将通式(I)的化合物以常规方式转变为盐类化合物。

15 如果例如，用4-氯-3-[(3,4-二甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-1,2,4-三唑-3-基)-甲氧基]-2-氟-苯甲酸和1,3-二甲基-5-羟基-吡唑作为起始物，本发明方法(a)的反应过程可以用下面的反应路线举例说明：



如果例如，用 1-[2-氯-4-甲基-3-[2-(2-氧代-1(2H)-吡啶基)-乙氧基]-苯基]-3-环丙基-1,3-丙二酮、氰基甲酸乙酯和羟胺作为起始物，本发明方法 (b) 反应过程可以用下面的反应路线举例说明：



5

在制备通式 (I) 化合物的本发明的方法 (a) 中，式 (II) 提供了用作起始物的被取代的苯甲酸的一般性定义。在通式 (II) 中， n 、 A 、 R^2 、 R^3 和 R^4 各优选具有上面已提及的含义，这些含义在本发明的通式 (I) 化合物的描述中对于 n 、 A 、 R^2 、 R^3 和 R^4 已作为优选的，特别优选的和更特别优选的含义给出。

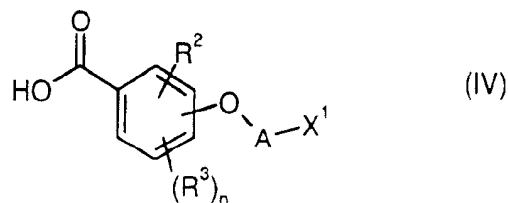
10

通式 (II) 的起始物迄今尚未在文献中公开；作为新的物质，它们也构成了本申请主题的一部分。

新的被取代的苯甲酸或其衍生物，如它们的酯，特别是甲酯和乙酯，制备如下：

15

(α) 式 (IV) 的化合物



(IV)

其中

n 、 A 、 R^2 和 R^3 各定义如上，而且

X^1 表示卤素（特别是氟、氯或溴）或表示烷基磺酰基氧基（特别是甲基磺酰基氧基或乙基磺酰基氧基），

- 5 或其衍生物，如其酯，特别是甲酯和乙酯，
与通式(V)的杂环化合物反应



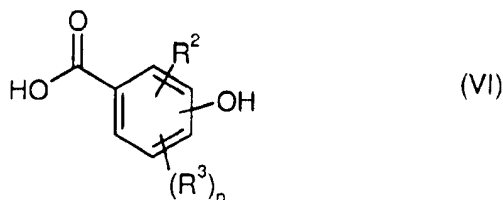
10 其中

R^4 定义如上，

- 该反应任选在酸接受体如碳酸钾的存在下，且任选在稀释剂如丙酮、丁酮、乙腈、 N,N -二甲基-甲酰胺或二甲基亚砷的存在下，在温度 10°C 至 150°C 下进行，并任选接着在取代基的定义范围内按常规方式
15 进一步进行转化反应(参见制备实施例)，

或者

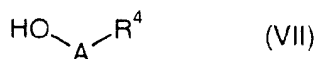
(β) 式(VI)的化合物



20 其中

n 、 R^2 和 R^3 各定义如上，

或其衍生物，如其酯，特别是甲酯和乙酯，
与通式(VII)的羟基烷基杂环



25

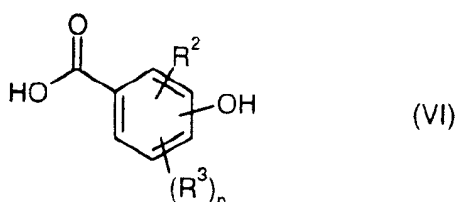
其中

A 和 R^4 各定义如上,

在缩合反应助剂如偶氮二甲酸二乙酯和三苯基膦的存在下, 任选在稀释剂如四氢呋喃的存在下, 在温度 -20°C 至 $+50^{\circ}\text{C}$ 下反应, 并且任选接着在取代基的定义范围内通过常规方式进一步进行转化反应 (参见制备实施例),

或者

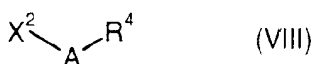
(γ) 式 (VI) 的化合物



10 其中

n 、 R 和 R^3 各定义如上,

或其衍生物, 如其酯, 特别是甲酯和乙酯, 与通式 (VIII) 的卤代烷基杂环



15

其中

A 和 R^4 各定义如上, 且

X^2 表示卤素 (特别是氟、氯或溴), 表示烷基磺酰基氧基 (特别是甲基磺酰基氧基或乙基磺酰基氧基), 或表示芳基磺酰基氧基 (特别是对甲苯磺酰基氧基),

任选在酸接受体, 如碳酸钾或三乙胺的存在下, 且任选在稀释剂, 如丙酮、丁酮、乙腈、 N,N -二甲基-甲酰胺或二甲基亚砷的存在下, 在温度 0°C 至 150°C 下反应, 并且任选接着在取代基的定义范围内通过常规方式进一步进行转化反应 (参见制备实施例)。

25 在制备通式 (I) 化合物的本发明的方法 (a) 中, 式 (III) 提供了进一步用作起始物的化合物的一般性定义。在通式 (III) 中 R^1 优选具有上

面已提及的含义，这些含义在本发明的通式(I)化合物的描述中对于R¹已作为优选的，特别优选的和更特别优选的含义给出。

通式(III)的起始物是已知的有机化合物。

在制备通式(I)化合物的本发明的方法(b)中，式(Ia)提供了用作
5 起始物的被取代的苯甲酰基酮类的一般性定义。在通式(Ia)中n、A、
R²、R³、R⁴和R¹¹各优选具有上面已提及的含义，这些含义在本发明的
通式(I)化合物的描述中对于n、A、R²、R³、R⁴和R¹¹已作为优选的，特
别优选的和更特别优选的含义给出。

通式(Ia)的起始物是本发明的新化合物；它们可以通过本发明的
10 方法(a)制备。

制备通式(I)的新的被取代的芳基酮类的本发明的方法(a)任选在
应用脱水剂的情况下进行。对此适宜的脱水剂是适于结合水的常规化
学试剂。

对此可以提及的实例为二环己基碳二亚胺和羰基二咪唑。

15 可以提及的特别适宜的脱水剂为二环己基碳二亚胺。

制备通式(I)的新的被取代的芳基酮类的本发明的方法(a)任选在
应用一种或多种反应辅剂的情况下进行。

对此可以提及的实例为氰化钠、氰化钾、丙酮氰醇、2-氰基-2-(三
甲基甲硅烷基氧基)-丙烷和三甲基甲硅烷基氰化物。

20 可以提及的特别适宜的其它的反应辅剂为三甲基甲硅烷基氰化
物。

制备通式(I)的新的被取代的芳基酮类的本发明的方法(a)任选在
应用其它反应辅剂的条件下进行。适于本发明该方法的其它反应辅剂
一般为碱性有机含氮化合物，如三甲基胺、三乙胺、三丙基胺、三丁
25 基胺、乙基-二异丙基胺、N,N-二甲基-环己基胺、二环己基胺、乙基-
二环己基胺、N,N-二甲基-苯胺、N,N-二甲基-苄基胺、吡啶、2-甲基-、
3-甲基-、4-甲基-、2,4-二甲基-、2,6-二甲基-、3,4-二甲基-和3,5-
二甲基-吡啶、5-乙基-2-甲基-吡啶、4-二甲基氨基-吡啶、N-甲基-
哌啶、1,4-二氮杂双环[2,2,2]-辛烷(DABCO)、1,5-二氮杂双环
30 [4,3,0]-壬-5-烯(DBN)或1,8-二氮杂双环[5,4,0]-十一-7-烯
(DBU)。

制备式(I)化合物的本发明的方法(b)任选在应用原甲酸酯或N,N-

二甲基-甲酰胺缩醛的条件下进行。这些化合物优选含有1至4个碳原子的烷基，特别是甲基或乙基。其可以提及的实例为原甲酸三甲酯、原甲酸三乙酯、N,N-二甲基-甲酰胺-二甲基缩醛和N,N-二甲基-甲酰胺-二乙基缩醛。

5 制备式(I)化合物的本发明的方法(b)，任选在应用氰基甲酸酯的条件下进行。这些化合物优选含有1至4个碳原子的烷基，特别是甲基或乙基。其可以提及的实例为氰基甲酸甲酯和氰基甲酸乙酯。

制备式(I)化合物的本发明的方法(b)任选在使用(二硫化碳和)烷基化试剂的情况下进行。这些化合物优选含有1至4个碳原子的烷基，特别是甲基或乙基。其可以提及的实例为甲基氯、甲基溴、甲基碘、硫酸二甲酯、乙基氯、乙基溴、乙基碘和硫酸二乙酯。

制备式(I)化合物的本发明的方法(b)在使用羟胺或其酸加合物的情况下进行。羟胺盐酸盐是可以提及的优选的酸加合物。

制备通式(I)化合物的本发明的方法优选在使用稀释剂的情况下进行。进行本发明方法(a)和(b)的适宜的稀释剂特别是惰性有机溶剂。其中特别包括脂族、脂环族和芳族的任选地被卤代的烃，例如，轻质汽油、苯、甲苯、二甲苯、氯代苯、二氯苯、石油醚、己烷、环己烷、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳；醚，如乙醚、二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃和乙二醇二甲醚或乙二醇二乙醚；酮，如丙酮、丁酮或甲基异丁基酮；腈，如乙腈、丙腈或丁腈；酰胺，如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-N-甲酰苯胺、N-甲基-吡咯烷酮或六甲基磷酸三酰胺；酯，如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亚砷，如二甲基亚砷；醇，如甲醇、乙醇、正-或异丙醇、乙二醇单甲醚、乙二醇单乙醚、二甘醇单甲醚、二甘醇单乙醚。

25 当进行本发明的方法(a)和(b)时，反应温度可以在相当宽的范围内变化。一般来说，该方法在温度0℃至150℃，优选在10℃至120℃下进行。

本发明的方法(a)和(b)一般在常压下进行。但是，也可以在升高和降低的压力下进行本发明的方法，一般来说，压力在0.1至10巴。

30 为了进行本发明的方法(a)和(b)，起始物一般约以等摩尔量使用。但是，也可能使用相对过量较多的一种组分。该反应一般在适宜的稀释剂中进行，且该反应混合物一般在所需的温度下搅拌若干小

时。用常规方法进行处理(参见制备实施例)。

制备通式(II)的化合物的本发明的方法中用作起始物的式(IV)、(V)、(VI)、(VII)和(VIII)化合物是已知的有机化合物。

5 本发明的活性化合物可以用作落叶剂、干燥剂、除稻草剂,特别是用作除杂草剂。广义来讲,应理解“杂草”指生长在在不适当位置的所有植物。本发明的物质作为全面的除草剂,还是作为选择性除草剂,这基本上依赖于用量。

本发明的活性化合物可以用于,例如,如下植物:

10 双子叶草类: 苘麻属、苋属、豚草属、单花葵属、春黄菊属、滇赤才属(Aphanes)、滨藜属、雏菊属、鬼针草属、芥属、飞廉属、决明属、矢车菊属、藜属、蓟属、旋花属、曼陀罗属、角丝鼓藻属、刺酸模属、糖芥属、大戟属、鼬瓣花属、牛溪菊属、猪殃殃属、木槿属、番薯属、地肤属、野芝麻属、独行菜属、母草属、母菊属、薄荷属、Mercurialis、Mullugo、勿忘草属、罌粟属、牵牛属、车前草属、蓼属、马齿苋属、毛茛属、萝卜属、焊菜属、节节菜属、芦莉草属、猪毛菜属、千里光属、田菁属、黄花稔属、白芥属、茄属、苦苣菜属、尖瓣花属、繁缕属、蒲公英属、苜蓿属、车轴草属、荨麻属、婆婆纳属、堇菜属、苍耳属。

20 双子叶作物类: 落花生属、甜菜属、长萼兰属、狗筋曼属、南瓜属、向日葵属、Daucus、大豆属、棉属、番薯属、莴苣属、亚麻属、番茄属、烟草属、菜豆属、豌豆属、茄属、野豌豆属。

25 单子叶草类: 山羊草属、冰草属、剪股颖属、看麦娘属、阿披拉草属、燕麦属、臂形草属、雀麦属、蒺藜草属、鸭跖草属、狗牙根属、莎草属、龙爪茅属、马唐属、稗属、Eleocharis、参属、画眉草属、野黍属、木苹果属、飘拂草属、Heteranthera、白茅属、鸭嘴草属、千金子属、黑麦草属、雨久花属、稷属、雀稗属、草芦属、梯牧草属、早熟禾属、筒轴茅属、慈姑属、莞草属、狗尾草属、蜀黍属。

30 单子叶作物类: 葱属、凤梨属、天门冬属、燕麦属、大麦属、稻属、稷属、甘蔗属、黑麦属、蜀黍属、小黑麦属、小麦属、玉蜀黍属。

但是,本发明的活性化合物绝不限于这些种类,其还可以以相同的方式延及其它植物。

根据其浓度,本发明的活性化合物适于对杂草进行全面控制,例

如，在工业地区和铁轨周围，以及小路及植树和未植树的区域。类似地，本发明的活性化合物可以用来控制常年性农作物中的杂草，例如，林区、装饰性植物、果园、葡萄园、柑橘林、坚果果园、香蕉种植园、咖啡种植园、茶叶种植园、橡胶种植园、油棕榈种植园、可可种植园、软果种植园及啤酒花藤田，在草坪、草皮和牧场上，以及用来选择性控制一年生作物中的杂草。

当施用于土壤和植物的地面以上部分时，本发明的式(I)化合物具有强且广谱的除草活性。某种程度上，不论是通过出现前施用和出现后施用的方法，它们还适于选择性地控制单子叶植物和双子叶作物中的单子叶和双子叶杂草。

以某些浓度或施用量，本发明的活性化合物还可以用来控制动物害虫和真菌或细菌植物病。它们还可以任选用作合成其它活性化合物的中间体和前体。

按照本发明，能处理所有全植物和植物的各部分。此处，将植物理解为全部植物和植物群落，如需要的和不需要的野生植物或作物(包括天然的作物)。作物可以通过常规培育和优化方法或者通过生物技术和遗传工程方法或者通过这些方法的联合来获得，包括转基因植物并包括可能和不能被植物培育者证书保护的植物栽培品种。植物的各部分理解为植物的所有地面上和地下部分及植物器官，如芽、叶、花和根，其中可以提及的实例为叶、针叶、茎、躯干、花、子实体、果实和种子以及根、块茎和根茎。植物的各部分还包括收获的植物及蔬菜和生殖繁殖的物质，例如，幼苗、块茎、根茎、插条和种子。

按照本发明用活性化合物对植物和植物的各部分的处理，按照常规方法，直接进行，或者通过作用于其环境、栖息地和保存区域来进行，例如，浸润、喷雾、蒸发、雾化、散播、涂刷，并对于繁殖物质，特别是对于种子，再通过一层和多层涂覆。

这些活性化合物可以转变为常规制剂，如溶液、乳液、可湿润粉末、混悬液、粉末、粉尘、糊、可溶性粉末、颗粒、混悬液-乳液浓缩物、含有活性化合物的天然和合成的物质，以及在聚合物中的微囊包封。

以已知的方式制备这些制剂，例如，通过将这些活性化合物与填料混合，填料即所谓的液体溶剂和/或固体载体，任选地使用表面活性

剂，即所谓的乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂。

如果使用的填料是水，则还可以用，例如，有机溶剂作为辅助溶剂。大体上适宜的液体溶剂为：芳族溶剂，如二甲苯、甲苯或烷基萘，氯代芳族和氯代脂族烃，如氯苯、二氯乙烷和二氯甲烷，脂族烃，如环己烷和石蜡，如石油馏分，矿物油和植物油，醇，如丁醇或乙二醇，及其醚和酯，酮，如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮，强极性溶剂，如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷和水。

适宜的固体载体为：例如，铵盐和天然矿物粉，如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石或硅藻土，以及合成矿物粉，如高分散的二氧化硅、氧化铝和硅酸盐粉；适宜的制粒用固体载体为：例如，研碎并分级的天然岩石，如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石和无机及有机粉的合成颗粒，以及有机物质如锯末、花生壳、玉米棒和烟叶茎的颗粒；适宜的乳化剂和/或发泡剂为：例如，非离子和阴离子乳化剂，如聚氧乙烯脂肪酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如，烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯和蛋白水解物；适宜的分散剂为：例如，木质素磺酸盐废液和甲基纤维素。

在这些制剂中可以使用增粘剂，如羧甲基纤维素，粉末、颗粒或胶乳形式的天然和合成聚合物，如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙烯乙酸酯，以及天然的磷脂，如脑磷脂和卵磷脂，以及合成的磷脂。其它可能的添加剂为矿物油和植物油。

可以使用着色剂，如无机颜料，如氧化铁、氧化钛、普鲁士兰，以及有机染料，如茜素染料、偶氮染料及金属酞菁染料，以及微量的营养剂，如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

这些制剂一般含有0.1至95%重量的活性化合物，优选0.5至90%。为了控制杂草，本发明的活性化合物本身或在其制剂中，还可以与已知的除草剂和/或改善与作物相容性的物质(防护剂)的混合物的形式使用，可以是最终的制剂或贮罐混合物的形式。另一种可能是与含有一种或多种已知除草剂和防护剂的除草剂的混合物。

对于这些混合物适合的是已知的除草剂，例如：

乙草胺、氟羧草醚、苯草醚、甲草胺、枯杀达、莠灭净、Amicarbazone、先甲草胺、磺氨黄隆、莎稗磷、黄草灵、莠去津、唑啶炔草、四唑黄隆、BAS-662H、Beflubutamid、草除灵、吡草黄、苄

噻磺隆、灭草松、Benzfendizone、Benzobicyclon、吡草酮、新燕灵、
 双丙氨酰膦、治草醚、双噻苯甲酸钠、溴丁酰草胺、杀草全、溴苯腈、
 丁草胺、Butafenacil (-allyl)、丁氧环酮、苏达灭、Cafenstrole、
 酰肼草、长杀草、氟酮唑草、氯硝醚、灭草平、杀草敏、氯噻磺隆、
 5 草枯醚、氯磺隆、氯麦隆、Cinidon (-ethyl)、环庚草醚、醚磺隆、
 Clefoxydim、烯草酮、炔草酯、异恶草酮、稗草胺、二氯吡啶酸、
 Clopyrasulfuron (-methyl)、唑噻磺胺盐、Cumyluron、草净津、
 Cybutryne、草灭特、环丙磺隆、噻草酮、氟氟草酯、2,4-D、2,4-DB、
 异苯敌草、燕麦敌、麦草畏、精2,4-滴丙酸、禾草灵、唑噻磺胺、安
 10 塔、野燕枯、吡氟草胺、二氯吡隆、丁噁隆、啶草丹、克草胺、戊草津、
 噻吩草胺、Dimexyflam、敌乐胺、草乃敌、敌草快、氟硫草定、敌草
 隆、香草隆、Epropodan、EPTC、禾草畏、丁氟消草、胺苯磺隆、乙呋
 草黄、Ethoxyfen、乙氧噻磺隆、Etobenzanid、高噁唑禾草灵、
 Fentrazamide、氟燕灵(异丙基、异丙基-L、甲基酯)、啶噻磺隆、氟
 15 鼠灵、精吡氟禾草灵、Fluazolate、Flucarbazone(-sodium)、
 Flufenacet、氟唑啶草、酰亚胺苯氧乙酸戊酯、氟噁嗪酮、
 Flumipropyn、氟唑啶草、氟草隆、氟咯草酮、乙羧氟草隆、胺草唑、
 Flupropacil、氟啶磺隆、抑草丁、氟草同、氟草烟丁氧异丙酯、氟氟
 胺啶、调噻醇、呋草酮、达草氟、Fluthiamide、氟磺胺草醚、
 20 Foramsulfuron、草铵膦、草甘膦(异丙基铵)、氟硝磺酰胺、吡氟氟禾
 灵(乙氧基乙酯、-p-甲酯)、六嗪同、咪草酸(甲酯)、Imazamethapyr、
 咪草啶酸、Imazapic、灭草烟、灭草嗪、咪草烟、啶咪磺隆、
 Iodosulfuron (-甲基、-钠)、碘苯腈、异乐灵、异丙隆、异恶隆、
 异恶草胺、Isoxachlortole、异恶氟草、恶草醚、乳氟禾草灵、环草
 25 啶、利谷隆、2甲4氯、2甲4氯丙酸、苯噻草胺、Mesosulfuron、
 Mesotrione、苯嗪草、吡草胺、噻唑隆、色满隆、秀谷隆、异丙甲草
 胺、唑草磺胺、甲氧隆、赛可津、甲磺隆(甲酯)、草达灭、绿谷隆、
 茶丙胺、草茶胺、草不隆、烟噻磺隆、达草灭、坪草丹、黄草消、炔
 丙恶唑草、恶草灵、环丙氧磺隆、氯恶嗪草、乙氧氟草醚、百草枯、
 30 壬酸、胺硝草、Pendralin、Pentoxazone、甜菜宁、Picolinafen、
 啶草磷、丙草胺、氯噻磺隆(甲酯)、Profluazol、扑草净、毒草胺、
 敌稗、啶草酸、异丙草胺、Procarbazone(-sodium)、拿草特、苜草

丹、氟丙磺隆、氟唑草酯、Pyrazogyl、吡唑特、吡嘧磺隆、苜草唑、
 嘧苯草肟、稗草畏、达草止、Pyridatol、Pyriftalid、肟啶草、嘧
 硫苯甲酸钠、二氯喹啉酸、喹草酸、灭藻醌、喹禾灵(精喹禾灵、精喹
 禾灵四氢糠基酯)、玉嘧磺隆、稀禾啶、西玛津、西草净、磺草酮、磺
 5 胺草唑、甲嘧磺隆、草硫膦、乙黄磺隆、丙戊草胺、丁唑隆、
 Tepraloxymid、特丁津、去草净、噻醚草胺、Thiafluamide、噻氟啶
 草、噻二唑胺、噻磺隆、杀草丹、丁草威、肟草酮、野麦畏、醚苯磺
 隆、苯磺隆(甲酯)、定草、灭草环、氟乐灵、Trifloxysulfuron、
 氟胺磺隆、Tritosulfuron。

10 还可能是与其它已知活性化合物的混合物，其它活性化合物如杀
 真菌剂、杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、驱鸟剂、植物营养剂以及改
 善土壤结构的组合物。

15 活性化合物可以以其本身、其制剂的形式使用，或者由其通过稀释
 制备的使用形式来使用，例如，备用溶液、混悬液、乳液、粉末、糊或
 颗粒。它们以常规方式使用，例如，通过灌溉、喷雾、雾化或散播。

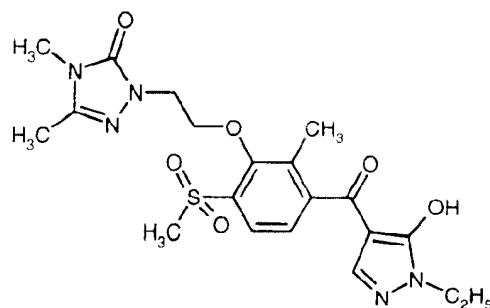
本发明的活性化合物可以在植物出现前或后使用。也开在播种前
 掺入土壤中。

20 活性化合物的量可以在相当宽的范围内变化。这基本上依赖于所
 需作用的本质。一般来说，用量为 1 g 至 10 kg 活性化合物每公顷土
 壤表面，优选 5 g 至 5 kg 每公顷。

本发明活性化合物的制备和用途通过以下实施例举例说明。

制备实施例:

实施例 1



25

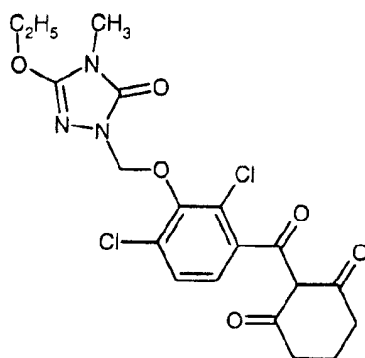
(方法(a))

将 0.3 g (2.7 mmol) 1-乙基-5-羟基-吡唑、0.8 g (8.0 mmol) 三乙胺和一滴 N,N-二甲基-甲酰胺依次加入到 1.1 g (2.7 mmol) 3-[2-(3',4'-二甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-甲基-4-甲基磺酰基-苯甲酸氯的 20ml 二氯甲烷溶液中。将此混合物室温下 (约 20℃) 搅拌 24 小时, 用 1N 盐酸和饱和氯化钠溶液依次洗涤此反应溶液, 并用硫酸镁干燥, 用真空水泵除去溶剂。将此残余物溶解于 30ml 乙腈中, 稍冷却, 并依次于 0.28 g (3.3 mmol) 2-羟基-2-甲基-丙腈和 1.4 g (14 mmol) 三乙胺混合。室温下将此混合物再搅拌 24 小时, 用真空水泵除去大部分溶剂, 并将此残余物溶解于二氯甲烷和 1N 盐酸中。分离有机相, 用水和饱和氯化钠溶液洗涤, 用硫酸镁干燥并过滤。减压下小心地蒸发掉此滤液中的溶剂。

这样得到 1.1 g (理论收率的 88%) 4-{3-[2-(3',4'-二甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙基氧基]-2-甲基-4-甲基磺酰基-苯甲酰基}-1-乙基-5-羟基-1H-吡唑, 为油状残余物。

Log P: 1.23.

实施例 2



20

(方法 (a))

将 1.95 g (5.4 mmol) 3-(3'-乙氧基-4'-甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-甲氧基-2,4-二氯-苯甲酸溶解于 75 ml 乙腈并与 0.61 g 1,3-环己二酮 (5.4 mmol) 和 1.33 g 二环己基碳二亚胺 (DCC, 1.2 当量) 混合。将此混合物在室温下 (约 20℃) 搅拌 15 小时, 然后加

- 入 1.5 ml 三乙胺 (2 当量) 和 0.29 ml 三甲基甲硅烷基氟化物 (0.4 当量)。室温下 2 小时后, 用真空水泵将此混合物浓缩, 并将此残余物与 10% 碳酸钠水溶液一起搅拌并过滤。该滤液与乙醚一起摇动并用 2N 盐酸酸化此水相。用二氯甲烷反复萃取沉淀的产物, 并用硫酸钠干燥合并的有机相、过滤并浓缩。

5 这样得到 1.3 g (理论收率的 53%) 2-[3-(3'-乙氧基-4'-甲基-1', 2', 4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-甲氧基-2, 4-二氯-苯甲酰基]-1, 3-环己二酮, 为粘稠的树脂。

LogP = 2.52。

- 10 类似于实施例 1 和 2, 并按照本发明制备方法的一般性描述, 还能制备例如下表 1 中所列的通式 (I) 的化合物。

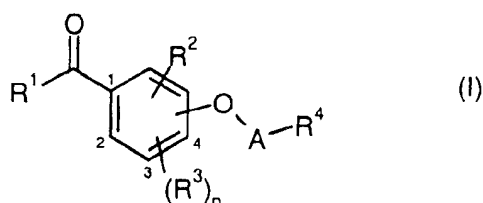
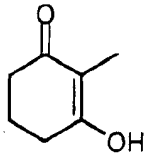
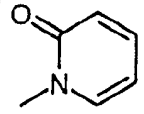
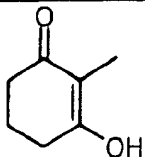
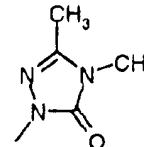
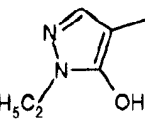
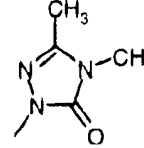
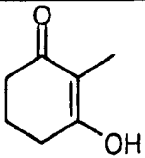
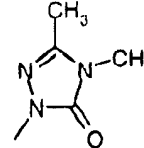
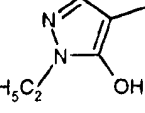
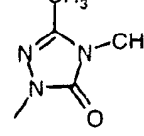
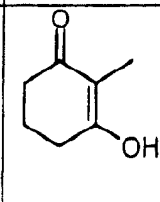
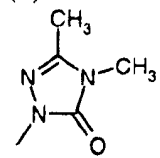
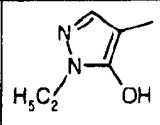
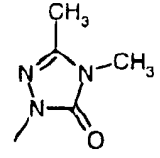
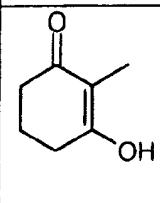
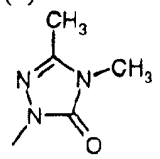
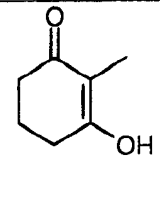
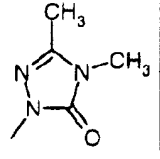
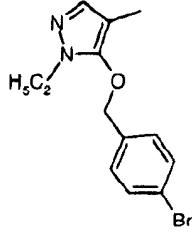
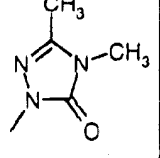
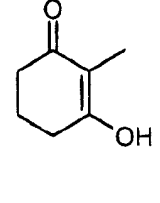
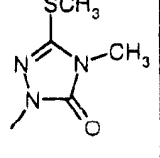
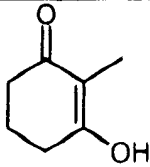
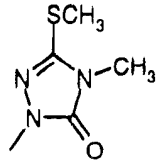
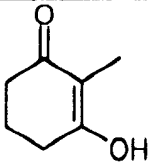
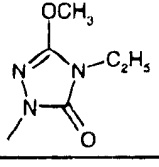
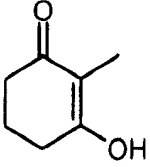
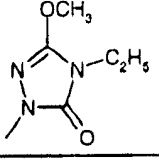
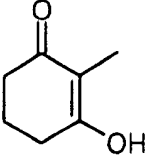
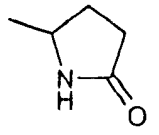
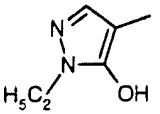
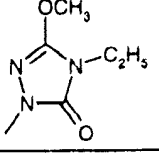
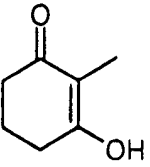
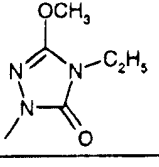
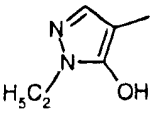
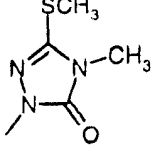


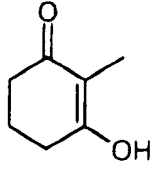
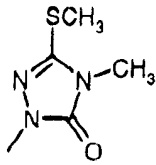
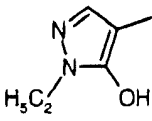
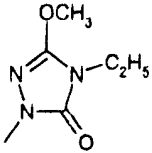
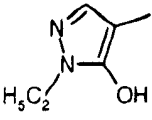
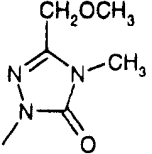
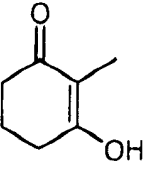
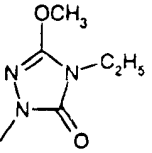
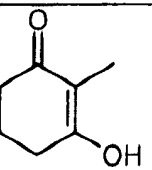
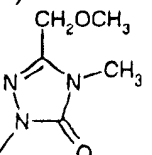
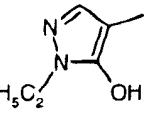
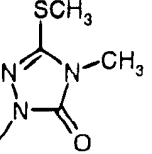
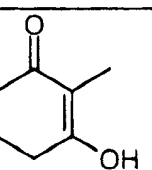
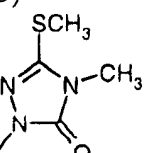
表 1：式(I)化合物的实施例

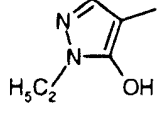
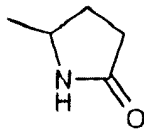
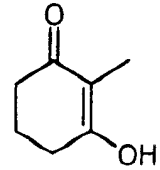
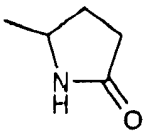
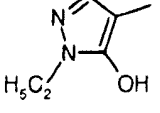
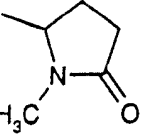
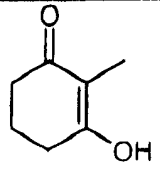
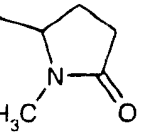
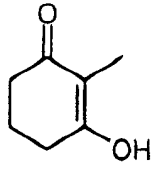
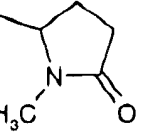
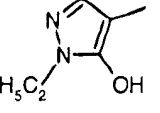
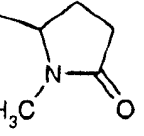
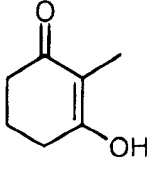
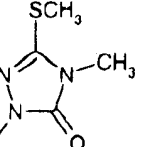
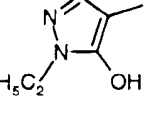
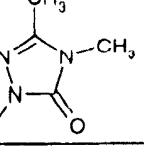
实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
3	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2.04 ^{a)}
4	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1.92 ^{a)}
5	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1.52 ^{a)}
6	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1.93 ^{a)}
7	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1.68 ^{a)}

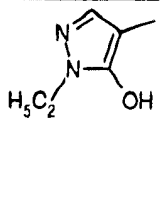
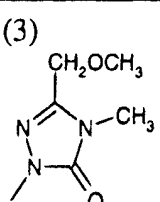
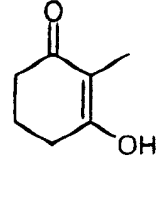
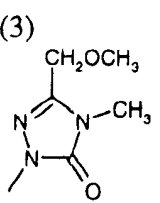
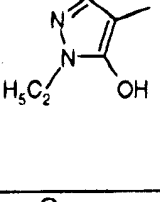
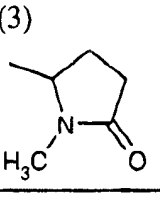
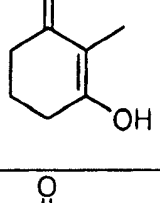
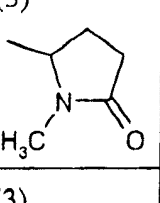
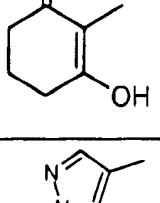
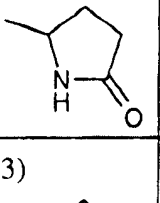
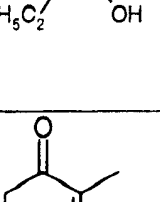
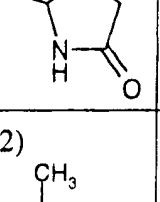
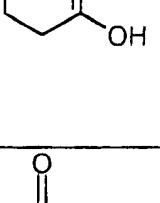
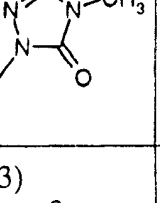
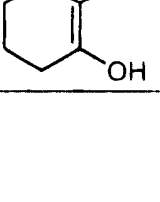
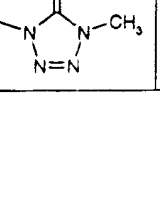
实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
8	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1.94 ^{a)}
9	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1.58 ^{a)}
10	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1.91 ^{a)}
11	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	logP = 1.65 ^{a)}
12	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2.07 ^{a)}
13	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2.44 ^{a)}

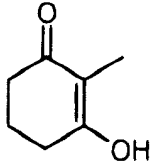
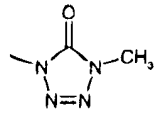
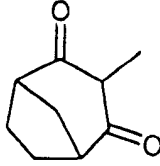
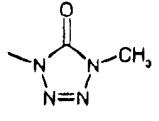
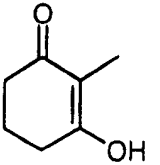
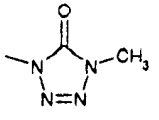
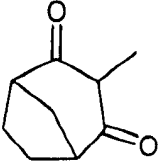
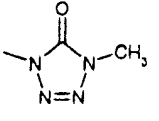
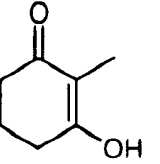
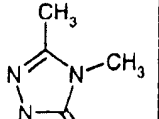
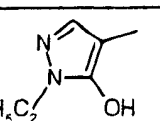
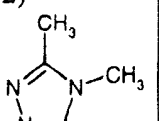
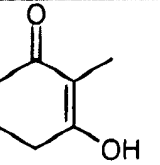
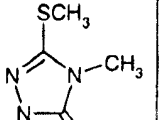
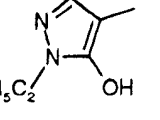
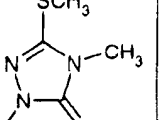
实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
14	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2.05 ^{a)}
15	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1.69 ^{a)}
16	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1.92 ^{a)}
17	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1.93 ^{a)}
18	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1.62 ^{a)}
19	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2.06 ^{a)}
20	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(S-对映体) logP = 1.60 ^{a)}

实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
21	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2.39 ^{a)}
22	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2.16 ^{a)}
23	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2.40 ^{a)}
24	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(S-对映体) logP = 1.98 ^{a)}
25	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1.88 ^{a)}
26	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2.15 ^{a)}
27	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2.11 ^{a)}

实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
28	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2.38 ^{a)}
29	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2.12 ^{a)}
30	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1.78 ^{a)}
31	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2.38 ^{a)}
32	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2.04 ^{a)}
33	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1.97 ^{a)}
34	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2.36 ^{a)}

实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
35	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(S-对映体) [α] _D ²⁰ = +2.3 logP = 1.67 ^{a)}
36	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(S-对映体) logP = 1.94 ^{a)}
37	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(S-对映体) logP = 1.85 ^{a)}
38	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(S-对映体) logP = 2.10 ^{a)}
39	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(S-对映体) logP = 2.12 ^{a)}
40	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(S-对映体) logP = 1.67 ^{a)}
41	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 2.42 ^{a)}
42	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 1.65 ^{a)}

实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
43	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	
44	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2.05 ^{a)}
45	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(S-对映体) logP = 1.68 ^{a)}
46	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(S-对映体) logP = 2.13 ^{a)}
47	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(S-对映体) logP = 1.95 ^{a)}
48	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(S-对映体) logP = 1.51 ^{a)}
49	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 1.92 ^{a)}
50	CH ₂ CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	n _D ²⁰ = 1.5970

实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
51	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	n _D ²⁰ = 1.5825
52	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	n _D ²⁰ = 1.5790
53	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	m.p.: 69°C
54	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	m.p.: 62°C
55	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
56	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
57	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
58	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	

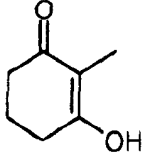
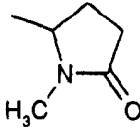
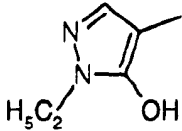
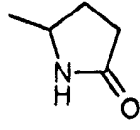
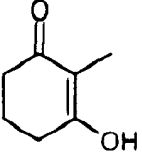
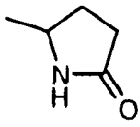
实施例 编号	A	R ¹	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	物理参数
59	CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	(S-对映体)
60	CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	(S-对映体) logP = 1.56 ^{a)}
61	CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	(S-对映体) logP = 2.02 ^{a)}

表 1 中给出的 logP 值按照 EEC Directive 79/831 Annex V. A8 通过 HPLC (高效液相色谱) 在反相柱 (C18) 上测定。温度: 43°C。

5 a) 用于在酸性范围内检测的流动相: 0.1%磷酸水溶液, 乙腈; 线性梯度 10%乙腈至 90%乙腈, 相应的数据在表 1 中标记为^{a)}。

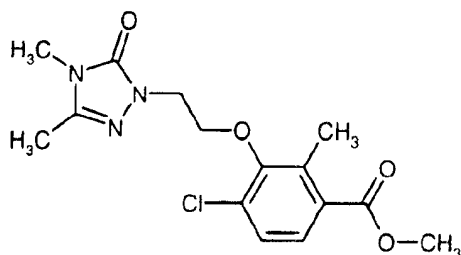
b) 用于在中性范围内检测的流动相: 0.01M 磷酸盐缓冲液, 乙腈; 线性梯度 10%乙腈至 90%乙腈, 相应的数据在表 1 中标记为^{b)}。

用 logP 值已知的非支链的烷-2-酮(具有 3 至 16 个碳原子)进行校
10 准(用在两个连续的烷酮之间的线性内推法通过保留时间确定 logP
值)。

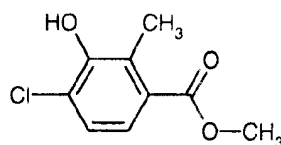
用 UV 光谱在 200nm-400nm 范围内在最大色谱信号中测定 λ_{max} 值。

式 (II) 的起始物

15 实施例 (II-1)



步骤 1



5

在 4 至 6 小时内，将 43g (0.606 mol) 的氯气通入到 100g (0.6 mol) 3-羟基-2-甲基-苯甲酸甲酯和 0.4ml 二异丙基胺的 800ml 1,2-二氯乙烷的沸腾溶液中。冷却后，各依次用 200ml 5%亚硫酸氢钠和饱和氯化钠溶液洗涤，有机相用硫酸镁干燥，并用真空水泵除去溶剂。将所得暗棕色油状残余物与 30ml 乙醚混合，并冷却至 0 至 4℃以进行结晶。抽滤沉淀的结晶，用少量冷乙醚洗涤，并在 30℃下减压干燥。

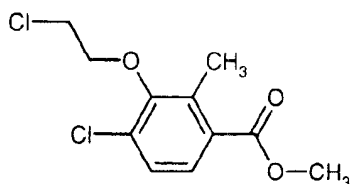
这样得到 46.6 g (理论收率的 39%) 4-氯-3-羟基-2-甲基-苯甲酸甲酯。

Log P: 2.14。

用相应的乙酯代替 3-羟基-2-甲基-苯甲酸-甲酯，通过相同的方法得到 4-氯-3-羟基-2-甲基-苯甲酸-乙酯。

熔点: 51℃

步骤 2



20

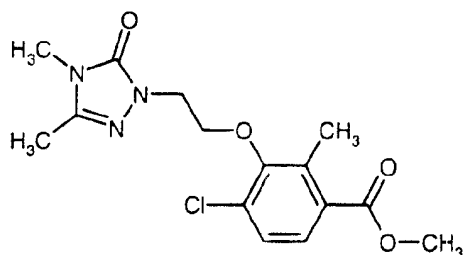
向 25g (0.125 mol) 4-氯-3-羟基-2-甲基-苯甲酸甲酯的 400ml 乙腈溶液依次加入 34.2g (0.248 mol) 粉状干燥的碳酸钾和 29.3g (0.125 mol) 2-氯乙醇-对甲苯磺酸酯。在 70℃ 下将该反应混合物加热约 7 小时，然后冷却，并用真空水泵除去大部分溶剂。将此残余物溶解于 200ml 二氯甲烷和 300ml 水中。分离有机相，用水洗涤，用硫酸镁干燥并过滤。减压下小心地蒸馏掉该滤液中的溶剂。

这样得到 32.5 g (理论收率的 99%) 4-氯-3-(2-氯-乙氧基)-2-甲基-苯甲酸甲酯，为深色油状物。

Log P = 3.52。

10

步骤 3

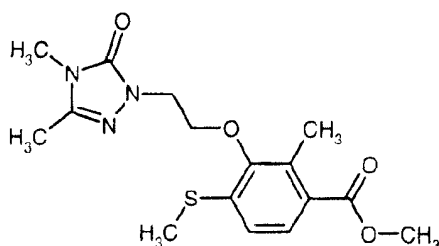


向 16.0g (60.8 mmol) 4-氯-3-(2-氯-乙氧基)-2-甲基苯甲酸甲酯的 70 ml 二甲基亚砜溶液中依次加入 18.4 g (0.133 mol) 粉状干燥碳酸钾和 6.9g (60.8 mmol) 3,4-二甲基-1,2,4-三唑啉-5-酮。在 90℃ 下将此反应混合物加热约 6 小时，然后冷却，并用真空水泵除去大部分溶剂。将此残余物溶解于 140ml 的二氯甲烷和 60ml 的水中。分离有机相，用水洗涤，用硫酸镁干燥并用真空水泵浓缩。将此油状残余物与 25ml 石油醚一起搅拌。通过抽滤分离所得结晶产物。

这样得到 18.5 g (理论收率的 80%) 4-氯-3-[2-(3',4'-二甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-甲基-苯甲酸甲酯。

Log P: 1.94。

25 实施例 (II-2)

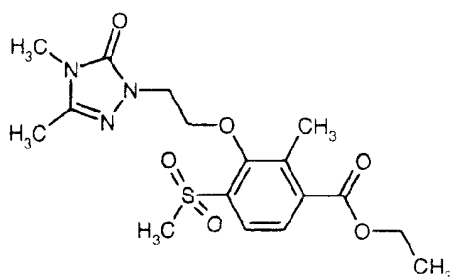


冰浴冷却下，将 3.3g (44.5mmol) 的甲基硫醇钠加入到 12.4 g (36.5 mmol) 4-氯-3-[2-(3',4'-二甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-甲基-苯甲酸甲酯的 100ml N,N-二甲基-甲酰胺溶液中。将此混合物在室温下(约 20℃)搅拌约 6 小时，并用真空水泵除去大部分溶剂。将此残余物溶解于 300ml 乙酸乙酯和 200ml 水中。分离有机相，用水洗涤，用硫酸镁干燥并过滤。减压下小心地蒸馏掉此滤液中的溶剂。

10 这样得到 5.4 g (理论收率的 42%) 3-[2-(3',4'-二甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-甲基-4-甲硫基-苯甲酸甲酯。

Log P = 1.89。

15 实施例 (II-3)



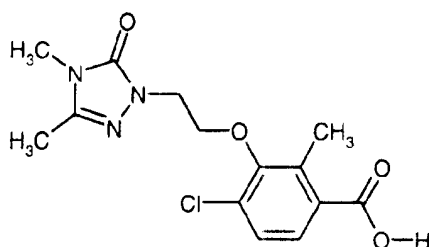
20 将 10mg 的钼酸铵四水合物和 17.3g (178mmol) 的 35%过氧化氢水溶液加入到 12.3g (33.7 mmol) 3-[2-(3',4'-二甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-甲基-4-甲硫基-苯甲酸乙酯的 40ml 乙酸溶液中。在 50 至 60℃ 下将此反应混合物加热约 6 小时，用水稀释并

用乙酸乙酯萃取。分离有机相，用水、碳酸氢钠溶液、硫代硫酸钠溶液和水依次洗涤，用硫酸镁干燥并过滤。减压下小心地蒸馏掉此滤液中的溶剂。

5 这样得到 12.3 g (理论收率的 92%) 3-[2-(3', 4'-二甲基-1', 2', 4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-甲基-4-甲基磺酰基-苯甲酸乙酯。

$$\text{Log P} = 1.76.$$

10 实施例(II-4)

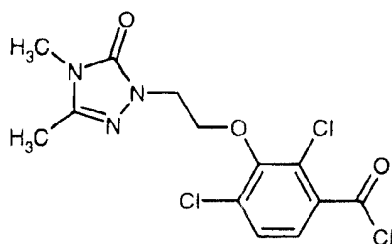


15 将 1.2g (30mmol) 氢氧化钠的 20ml 水溶液加入到 6.5g (19.0 mmol) 4-氯-3-[2-(3', 4'-二甲基-1', 2', 4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-甲基-苯甲酸甲酯的 40ml 乙醇溶液中。将此溶液在室温下(约 20 °C)搅拌约 24 小时，并用真空水泵除去大部分溶剂。将此残余物溶解于水并用盐酸酸化。将所得悬浮液用乙酸乙酯萃取，并分离有机相，用饱和氯化钠溶液洗涤，用硫酸镁干燥并过滤。减压下小心地蒸馏掉此滤液中的溶剂。

20 这样得到 5.9g (理论收率的 95%) 4-氯-3-[2-(3', 4'-二甲基-1', 2', 4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-甲基-苯甲酸。

$$\text{LogP} = 1.37.$$

实施例(II-5)



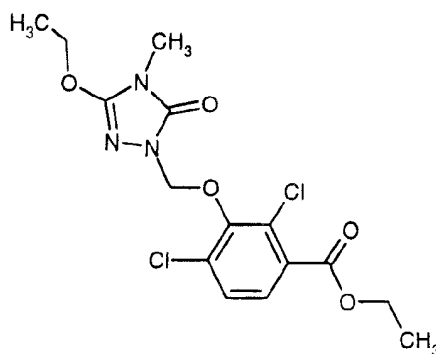
将在 10 ml 亚硫酸氯中的 2.3 g (6.65 mmol) 2,4-二氯-3-[2-(3',4'-二甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-苯甲酸
5 在 70°C 下加热约 1.5 小时。让此反应溶液冷却并减压除去过量的亚硫酸氯。

这样得到 2.4 g (理论收率的 100%) 2,4-二氯-3-[2-(3',4'-二甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-乙氧基]-2-苯甲酰氯。

LogP = 1.24。

10

实施例 (II-6)



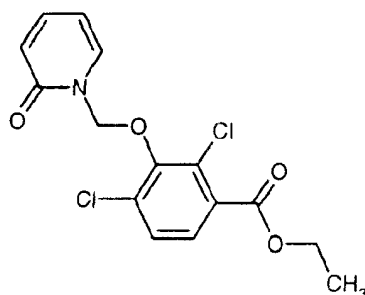
将 5g (21.3 mmol) 2,4-二氯-3-羟基-苯甲酸乙酯溶解于 200 ml
15 四氢呋喃, 并与 3.68g (21.3 mmol) 1-羟基甲基-3-乙氧基-4-甲基-1,2,4-三唑啉-5-酮混合。加入 5.58g (21.3 mmol) 三苯基膦, 并在 0°C 下滴加 4.4g 的 85% 二偶氮二甲酸二乙酯。将所得溶液搅拌过夜, 用真空水泵浓缩并通过硅胶过滤(乙酸乙酯/己烷)。将此滤液浓缩并与乙醚混合。滤出分离的固体, 并减压下小心地蒸馏掉此滤液中的溶剂。

20 这样得到 6.8g (理论收率的 82%) 3-(3'-乙氧基-4'-甲基-

1', 2', 4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-甲氧基-2, 4-二氯-苯甲酸乙酯, 为粘稠油状物。

$$\text{LogP} = 2.77.$$

5 实施例 (II-7)

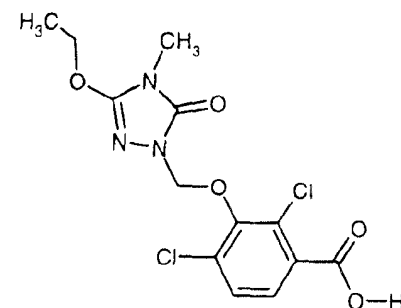


将 2g (8.5 mmol) 2, 4-二氯-3-羟基-苯甲酸乙酯溶解于 30 ml 乙腈, 并依次与 0.86g (8.5 mmol) 三乙胺和 1.2g (8.5 mmol) N-氯甲基-2-吡啶酮混合。将所得混合物在 60℃ 下搅拌 7 小时, 与水混合并用乙酸乙酯萃取。分离有机相, 用饱和氯化钠溶液洗涤, 用硫酸镁干燥并过滤。减压下小心地蒸馏掉溶剂。

这样得到 2.4g (理论收率的 82%) 2, 4-二氯-3-(1H-吡啶-2-酮-1-基)-甲氧基苯甲酸乙酯。

15

实施例 (II-8)



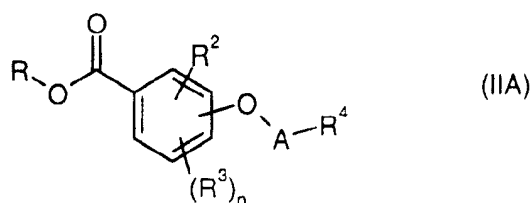
室温下(约 20℃), 在 0.91g 的粉状氢氧化钾的存在下, 将 6.4g (16.3 mmol) 3-(3'-乙氧基-4'-甲基-1', 2', 4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-

基)-甲氧基-2,4-二氯-苯甲酸乙酯在 250ml 环己烷和 25ml 乙二醇-甲醚的混合物中搅拌 15 小时。用水稀释此混合物并用 2N 盐酸酸化。抽滤分离沉淀的固体。

5 这样得到 4.05g (理论收率的 69%) 3-(3'-乙氧基-4'-甲基-1',2',4'-1H-三唑啉-5'-酮-1'-基)-甲氧基-2,4-二氯-苯甲酸。

logP: 1.74。

类似于实施例 (II-1) 至 (II-8), 还能制备例如下表 2 列出的通式 (II) 的化合物, 或其反应性衍生物, 参见式 (IIA),

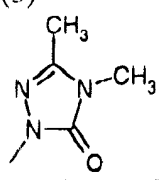
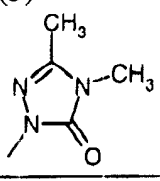
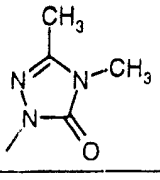
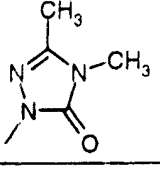
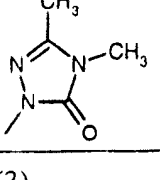
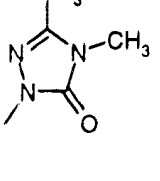
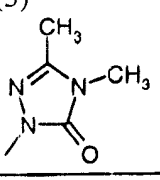


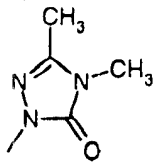
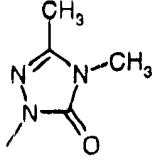
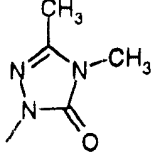
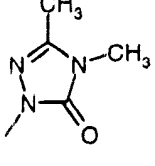
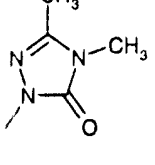
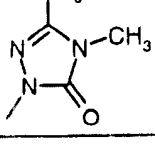
10

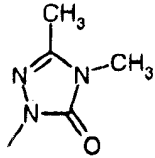
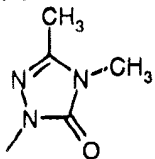
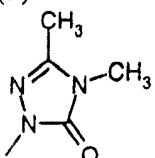
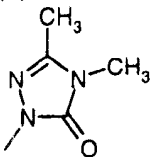
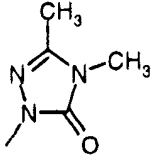
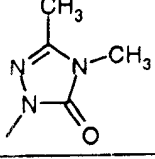
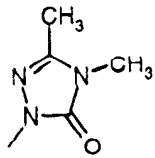
其中

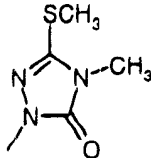
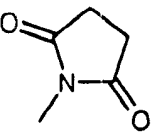
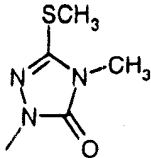
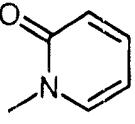
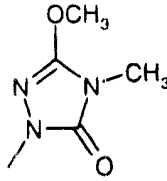
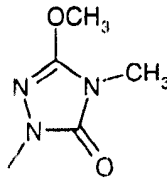
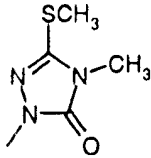
R 具有下表中给出的含义之一。

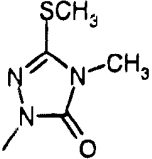
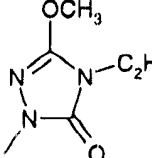
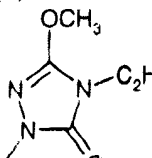
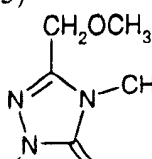
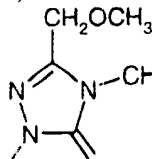
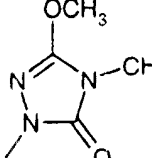
表 2: 式 (II) 或 (IIA) 的化合物的实施例

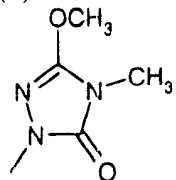
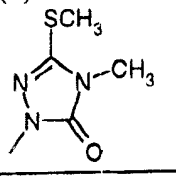
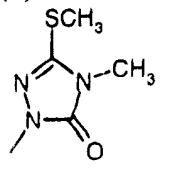
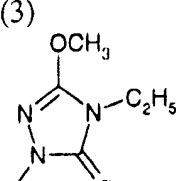
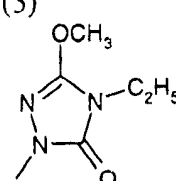
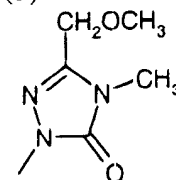
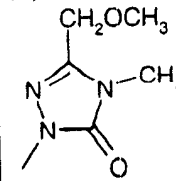
实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-9	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.25 ^{a)}
II-10	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.16 ^{a)}
II-11	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	CH ₃	logP = 1.48 ^{a)}
II-12	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1.33 ^{a)}
II-13	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0.92 ^{a)}
II-14	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.08 ^{a)}
II-15	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.23 ^{a)}

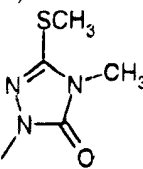
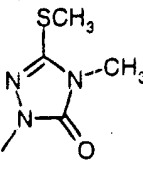
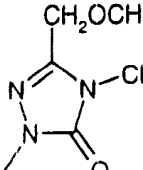
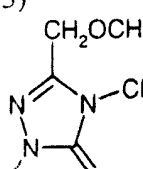
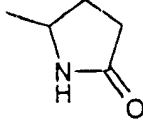
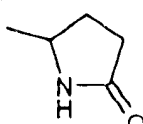
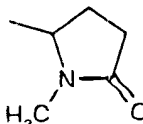
实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-16	CH ₂ CH ₂	(2) SCH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.13 ^{a)}
II-17	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.09 ^{a)}
II-18	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1.27 ^{a)}
II-19	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	H	logP = 0.59 ^{a)}
II-20	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1.72 ^{a)}
II-21	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0.77 ^{a)}

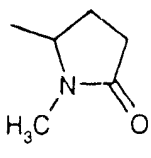
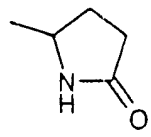
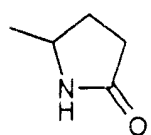
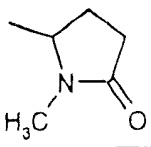
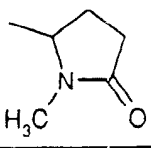
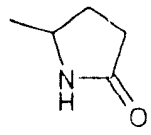
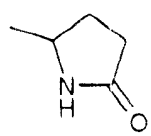
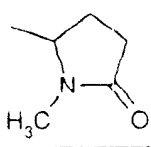
实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-22	CH ₂ CH ₂	(2) SO ₂ CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0.46 ^{a)}
II-23	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1.49 ^{a)}
II-24	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0.95 ^{a)}
II-25	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0.83 ^{a)}
II-26	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1.34 ^{a)}
II-27	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1.27 ^{a)}
II-28	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H (xHCl)	logP = 1.37 ^{a)}

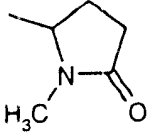
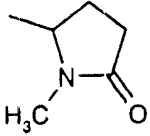
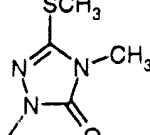
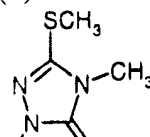
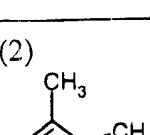
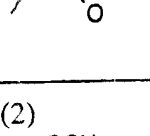
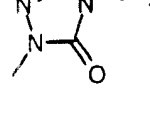
实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-29	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.69 ^{a)}
II-30	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2.13 ^{a)}
II-31	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.68 ^{a)}
II-32	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆). δ): 5.89 ppm (s, CH ₂)
II-33	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.40 ^{a)}
II-34	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.52 ^{a)}
II-35	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.66 ^{a)}

实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-36	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.72 ^{a)}
II-37	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.68 ^{a)}
II-38	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.73 ^{a)}
II-39	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.28 ^{a)}
II-40	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.45 ^{a)}
II-41	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2.17 ^{a)}

实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-42	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.78 ^{a)}
II-43	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2.44 ^{a)}
II-44	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.75 ^{a)}
II-45	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2.46 ^{a)}
II-46	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.79 ^{a)}
II-47	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2.06 ^{a)}
II-48	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1.49 ^{a)}

实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-49	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.59 ^{a)}
II-50	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1.64 ^{a)}
II-51	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2.22 ^{a)}
II-52	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1.37 ^{a)}
II-53	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	(S-对映体) logP = 2.17 ^{a)}
II-54	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	(S-对映体) logP = 1.31 ^{a)}
II-55	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	(S-对映体) logP = 2.35 ^{a)}

实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-56	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	(S-对映体) logP = 1.44 ^{a)}
II-57	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(S-对映体) logP = 1.95 ^{a)}
II-58	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	(S-对映体) logP = 1.39 ^{a)}
II-59	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(S-对映体) logP = 2.18 ^{a)}
II-60	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	(S-对映体) logP = 1.55 ^{a)}
II-61	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(S-对映体) logP = 2.15 ^{a)}
II-62	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	(S-对映体) logP = 1.28 ^{a)}
II-65	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(S-对映体)

实施例编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-64	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	CH ₃	(S-对映体) n _D ²⁰ = -20.4 logP = 2.01 ^{a)}
II-65	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	(S-对映体) logP = 1.42 ^{a)}
II-66	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	logP = 2.33 ^{a)}
II-67	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	H	logP = 1.81 ^{a)}
II-68	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	logP = 2.23 ^{a)}
II-69	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	logP = 2.07 ^{a)}
II-70	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	H	logP = 1.36 ^{a)}

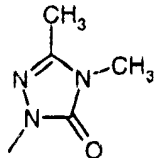
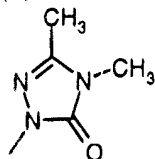
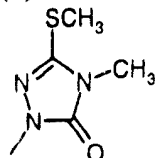
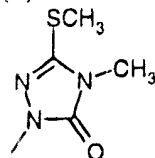
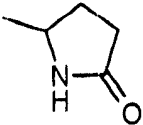
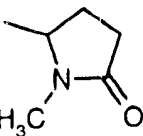
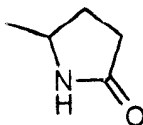
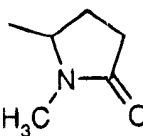
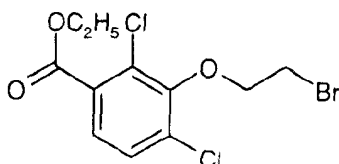
实施例 编号	A	(位置) R ²	(位置) (R ³) _n	(OAR ⁴ 的 位置) R ⁴	R	物理参数
II-71	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	CH ₃	
II-72	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	H	
II-73	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	CH ₃	
II-74	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	H	
II-75	CH ₂	(2) Br	(4) Br	(3) 	C ₂ H ₅	(S-对映体) logP = 2.20 ^{a)}
II-76	CH ₂	(2) Br	(4) Br	(3) 	C ₂ H ₅	(S-对映体) logP = 2.46 ^{a)}
II-77	CH ₂	(2) Br	(4) Br	(3) 	H	(S-对映体) logP = 1.34 ^{a)}
II-78	CH ₂	(2) Br	(4) Br	(3) 	H	(S-对映体) logP = 1.49 ^{a)}

表 2 中作为实施例 (II-35) 列出的化合物可以例如按如下制备:

实施例 (II-35)

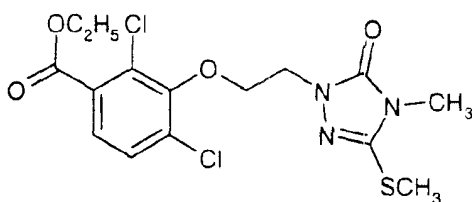
5 步骤 1



向 15g (68 mmol) 2,4-二氯-3-羟基-苯甲酸乙酯的 80 ml N,N-二甲基-甲酰胺溶液中依次加入 19g (137 mmol) 碳酸钾(粉末)、38.6g
10 (205 mmol) 1,2-二溴乙烷和 0.4g 碘化钠。在 80℃ 下将此混合物加热 2 小时, 然后让其冷却至室温, 并与 350ml 乙醚一起摇动。用水、10% 氢氧化钠水溶液和水洗涤此有机相, 然后用硫酸钠干燥并过滤。减压下小心地蒸馏掉此滤液中的溶剂。

15 这样得到 22.2g (理论收率的 95%) 2,4-二氯-3-(2-溴-乙氧基)-苯甲酸乙酯, 为油状残余物 ($\log P = 3.98^{aj}$)。

步骤 2



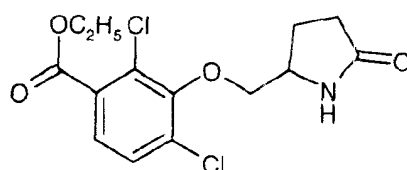
20 向 18g (93 mmol) 2,4-二氯-3-(2-溴-乙氧基)-苯甲酸乙酯的 100 ml N,N-二甲基-甲酰胺溶液中依次加入 14.6g (106 mmol) 碳酸钾(粉末)、19.3g (133 mmol) 3-甲基-4-甲基-1,2,4-三唑啉-5-酮和 0.5g 碘化钠。将此混合物在 80℃ 下加热 4 小时, 然后冷却至室温, 并与 400ml 二氯甲烷一起摇动, 并将此有机相用水, 然后用 10% 氢氧化钠水

溶液并最后用 10% 盐酸洗涤，再用硫酸钠干燥并过滤。减压下小心地蒸馏掉此滤液中的溶剂。

这样得到 17.7g (理论收率的 82%) 2,4-二氯-3-[2-(3-甲硫基-4-甲基-5-氧代-1,2,4-三唑啉-1-基)-乙氧基]-苯甲酸乙酯，为油状残余物 ($\log P = 2.66^{a1}$)。

表 2 中作为实施例 (II-61) 列出的化合物可以例如如下制备：

实施例 (II-61)



10

将 2.0g (8.5 mmol) 2,4-二氯-3-羟基-苯甲酸乙酯、3.6g (12.75 mmol) (S)-(+)-5-(对甲苯磺酰基氧基甲基)-吡咯烷-2-酮、2.3g (17 mmol) 碳酸钾和 30 ml 乙腈的混合物在 76°C 下搅拌 13 小时，冷却至室温，用水稀释至约其原体积的二倍，并与二氯甲烷一起摇动。用饱和氯化钠水溶液洗涤此有机相，用硫酸钠干燥并过滤。减压下小心地蒸馏掉此滤液中的溶剂。

这样得到 2.6g (理论收率的 92%) (S)-2,4-二氯-3-[(2-氧代-吡咯烷-5-基)-甲氧基]-苯甲酸乙酯 ($\log P = 2.14^{a1}$)。

20 用途实施例

实施例 A

芽前实验

25 溶剂：5 重量份的丙酮

乳化剂：1 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

为了制备活性化合物的适宜的制剂，将 1 重量份的活性化合物与所述量的溶剂混合，然后加入所述量的乳化剂，并将此浓缩物用水稀

释至所需的浓度。

将被测植物的种子播种在正常的土壤中。24 小时后，用活性化合物的制剂在这块土壤上喷雾，使每单位面积施用特定量的所需活性化合物。选择喷雾液体中活性化合物的浓度使每公顷施用存在于 1000 升水中的特定量的所需活性化合物。

3 周后，与未接受处理的对照组比较，计算植物损坏的百分率。数值表示：

0%=没有作用(同未接受处理的对照组一样)

100%=全部破坏

在此实验中，例如，制备实施例 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10 和 11 的化合物对杂草表现出了强活性，且其中大多数能被作物如玉米很好地耐受。

实施例 B

15

芽后实验

溶剂：5 重量份的丙酮

乳化剂：1 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

为了制备活性化合物的适宜的制剂，将 1 重量份的活性化合物与 20 所述量的溶剂混合，然后加入所述量的乳化剂，并将此浓缩物用水稀释至所需的浓度。

用活性化合物的制剂喷洒高度 5-15cm 的被测植物，使每单位面积施用特定量的所需活性化合物。选择喷雾液体中活性化合物的浓度使每公顷施用存在于 1000 升水中的特定量的所需活性化合物。

25 3 周后，与未接受处理的对照组比较，评估植物损坏的百分率。

数值表示：

0%=没有作用(同未接受处理的对照组一样)

100%=全部破坏

在此实验中，例如，制备实施例 1、2、3、4、5、6、7、8、9、30 10 和 11 的化合物对杂草表现出了强活性，且其中大多数能被作物如玉米很好地耐受。