

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl<sup>7</sup>

C07D405/04

A01N 43/54 A01N 43/56

A01N 43/653

# [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 00811693.8

[43] 公开日 2002 年 9 月 18 日

[11] 公开号 CN 1370160A

[22] 申请日 2000.7.28 [21] 申请号 00811693.8

[30] 优先权

[32] 1999.8.10 [33] DE [31] 19937772.3

[86] 国际申请 PCT/EP00/07263 2000.7.28

[87] 国际公布 WO01/10861 德 2001.2.15

[85] 进入国家阶段日期 2002.2.10

[71] 申请人 拜尔公司

地址 德国莱沃库森

[72] 发明人 K·H·林克 R·安德雷

K·J·罗伊布克 O·沙尔纳

M·W·德鲁斯 P·达门

D·福伊希特 R·庞岑

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

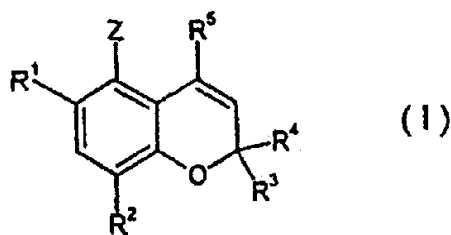
代理人 王景刚 邵红

权利要求书 11 页 说明书 29 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 取代的杂环基-2H-苯并吡喃类化合物

[57] 摘要

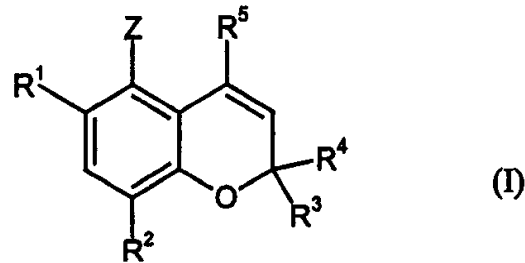
本发明涉及新的通式(I)的杂环基-2H-苯并吡喃类化合物,其中, R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和 Z 各具有说明书中给出的意义。本发明还涉及所述化合物的制备方法以及它们作为除草剂的应用。



ISSN 1008-4274

## 权 利 要 求 书

1. 通式(I)的化合物,



5 其中

$R^1$  代表氢、氟基或卤素,

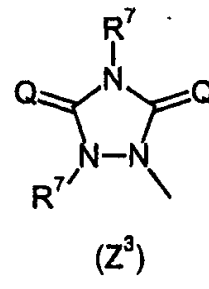
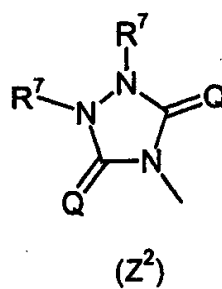
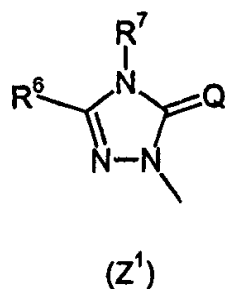
$R^2$  代表氟基、硫代氨基甲酰基、卤素或代表各自任选地被取代的烷基或烷氧基,

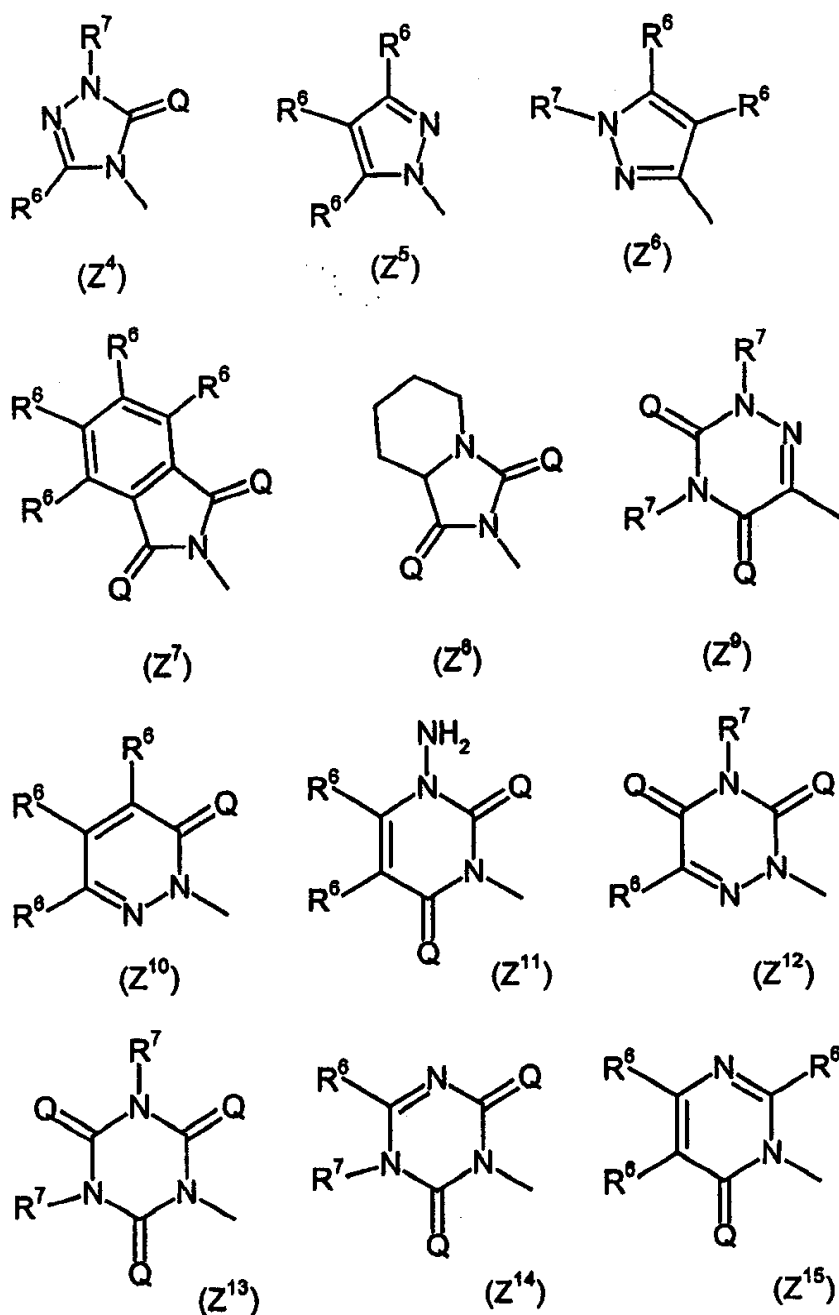
10  $R^3$  代表氢、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素,代表羟基亚氨基烷基或代表各自任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基、烷氧羰基、烷基羰基氨基、烷氧基亚氨基烷基、链烯基、链烯基氧基、链烯基硫基、炔基、炔基氧基、炔基硫基、环烷基、环烷基烷基、环烷基氧基羰基、苯基或苄基,

15  $R^4$  代表氢、卤素或任选地被取代的烷基,

$R^5$  代表氢、卤素或任选地被取代的烷基,以及

Z 代表下列杂环基团之一:





其中

Q 代表 O(氧) 或 S(硫),

5 R<sup>6</sup> 代表氢、氨基、硝基、氰基、羧基、氧甲酰基、硫代氧甲酰基、卤素, 或代表各自任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基氨基、烷氧羰基、二烷基氨基、链烯基、链烯基氧基、链烯基硫基、炔基、炔基氧基、炔基硫基、环烷基或环烷基烷基, 以及

10 R<sup>7</sup> 代表氢、羟基、氨基、氰基, 或代表各自任选地被取代的烷基、烷氧基、烷氧羰基、烷基氨基、链烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、

苯基或苯基烷基，

其中，任选地，两个相邻的基团-R<sup>6</sup>和R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>和R<sup>7</sup>或R<sup>6</sup>和R<sup>7</sup>—一起代表烷二基或链烯二基，它们各是任选地被取代的和/或任选地在开头(和/或在末尾)或在所述烃链内通过O(氧)、S(硫)或选自-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NH-和-N(烷基)-的基团间断。

2. 根据权利要求1的化合物，其特征在于，

R<sup>1</sup>代表氢、氟基、氟、氯或溴，

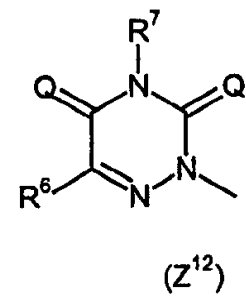
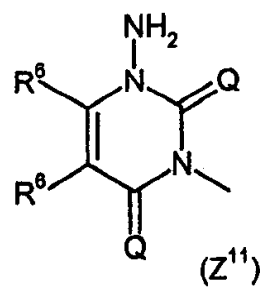
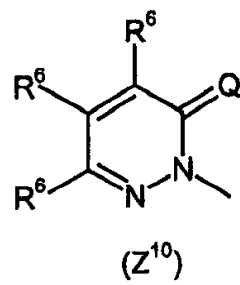
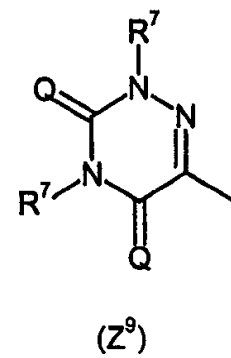
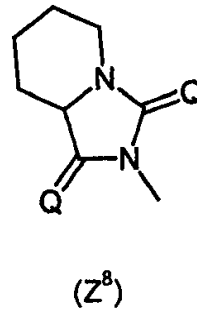
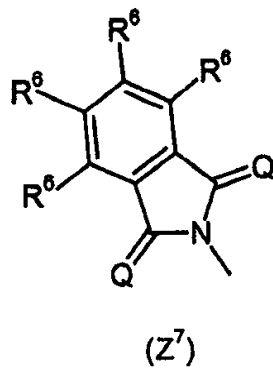
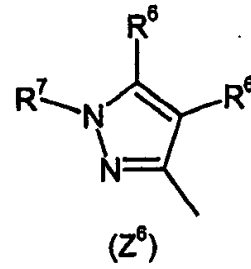
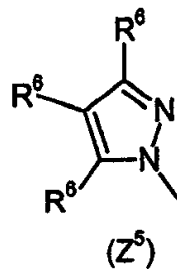
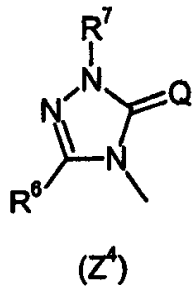
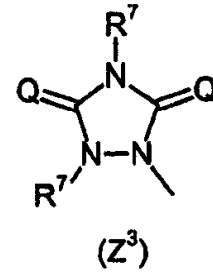
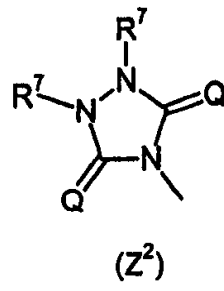
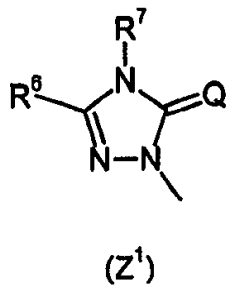
R<sup>2</sup>代表氟基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴，或代表各自任选地被氟-和/或氯-取代的各自具有1到4个碳原子的烷基或烷氧基，

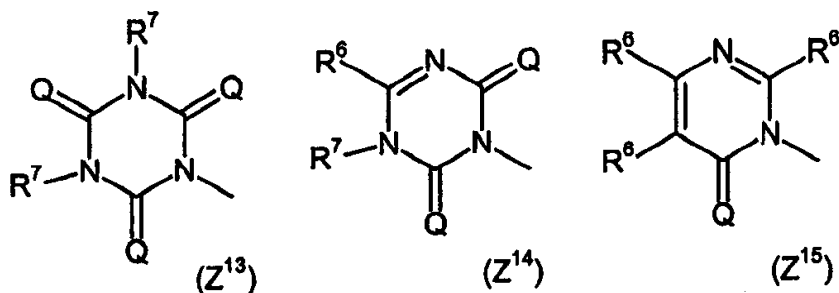
R<sup>3</sup>代表氢、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴，代表具有最多6个碳原子的羟基氨基烷基，代表各自任选地被氟基、羟基、氟、氯、溴、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基磺酰氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基羰基氧基取代的各自具有最多6个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基，代表各自任选地被氟基、氟、氯、溴或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基取代的各自具有最多6个碳原子的烷基羰基、烷氧羰基、烷基羰基氨基或烷氧基氨基烷基，代表各自任选地被氟基、氟、氯或溴取代的各自具有最多6个碳原子的链烯基、链烯基氧基、链烯基硫基、炔基、炔基氧基或炔基硫基，代表各自任选地被氟基、氟、氯、溴或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基取代的各自在环烷基中具有3到6个碳原子和任选地在烷基部分具有最多4个碳原子的环烷基、环烷基烷基或环烷基氧基羰基，或代表各自任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基取代的苯基或苄基，

R<sup>4</sup>代表氢、氟、氯、溴，或代表任选地被氟基、氟、氯或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基取代的具有1到6个碳原子的烷基，

R<sup>5</sup>代表氢、氟、氯、溴，或代表任选地被氟基、氟、氯或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基取代的具有1到6个碳原子的烷基，

Z 代表下列杂环基团之一：





其中

Q 代表 O(氧)或 S(硫),

5  $R^6$  代表氢、氨基、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素,代表各自任选地被氰基、卤素或  $C_1-C_4$ -烷氧基取代的各自具有最多 6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基氨基或烷氧基羰基,代表在各烷基中具有最多 4 个碳原子的二烷基氨基,代表各自任选地被氰基或卤素取代的各自具有最多 6 个碳原子的链烯基、炔基、链烯基氧基、炔基氧基、链烯基硫基、炔基硫基,或代表各自任选地被氰基、卤素或  $C_1-C_4$ -烷基取代的在环烷基部分各具有 3 到 6 个碳原子和任选地在烷基部分具有最多 4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基,

15  $R^7$  代表氢、羟基、氨基、氰基,代表各自任选地被氰基、卤素或  $C_1-C_4$ -烷氧基取代的各自具有最多 6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷氧羰基或烷基氨基,代表各自任选地被氰基或卤素取代的各自具有最多 6 个碳原子的链烯基或炔基,代表各自任选地被氰基、卤素或  $C_1-C_4$ -烷基取代的各自在环烷基中具有 3 到 6 个碳原子和任选地在烷基部分具有最多 4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基,或代表各自任选地被硝基、氰基、卤素、 $C_1-C_4$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基取代的苯基、苄基或苯乙基,

20 其中两个相邻的基团  $-R^6$  和  $R^6$ 、 $R^7$  和  $R^7$  或  $R^6$  和  $R^7$  一起代表各自任选地被卤素取代和/或任选地在开头(和/或在末尾)或在所述烃链内通过 O(氧)、S(硫)或选自  $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$  和  $-N(C_1-C_4-烷基)-$  的基团间断的各自具有最多 5 个碳原子的烷二基或链烯二基。

3. 根据权利要求 1 的化合物,其特征在于

25  $R^1$  代表氢、氟或氯,

$R^2$  代表氰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴、三氟甲基、二氟甲氧

基或三氟甲氧基,

$R^3$  代表氢、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氧甲酰基、硫代氧甲酰基、氟、氯、溴,代表羟基亚氨基甲基、羟基亚氨基乙基或羟基亚氨基丙基,代表各自任选地被氟基、羟基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基取代的甲基、乙基、正或异-丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异丙氧基、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、甲基磺酰基或乙基磺酰基,代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的乙酰基、丙酰基、正-或异-丁酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、乙酰氨基、丙酰氨基、正-或异丁酰氨基、甲氧基亚氨基甲基、乙氧基亚氨基甲基、甲氧基亚氨基乙基或乙氧基亚氨基乙基,代表各自任选地被氟基、氟或氯取代的丙烯基、丁烯基、丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙烯基硫基、丁烯基硫基、丙炔基、丁炔基、丙炔基氧基、丁炔基氧基、丙炔基硫基或丁炔基硫基,代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基、环丙基氧基羰基、环丁基氧基羰基、环戊基氧基羰基或环己基氧基羰基,或代表各自任选地被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基或甲氧基取代的苯基或苄基,

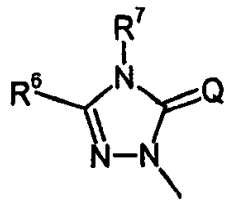
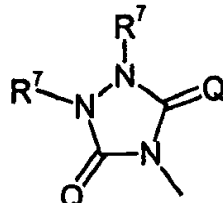
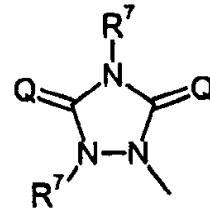
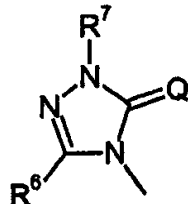
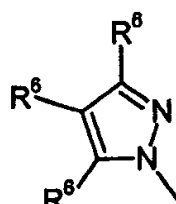
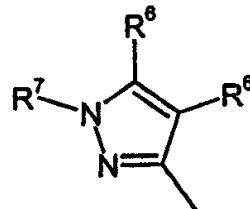
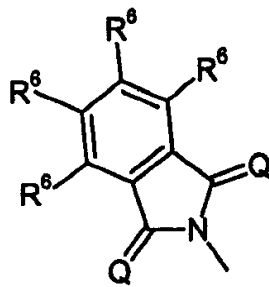
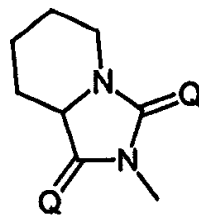
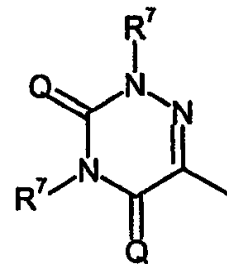
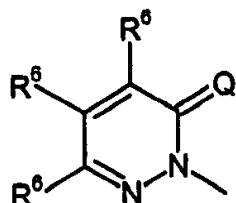
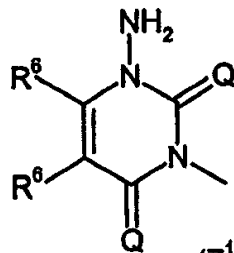
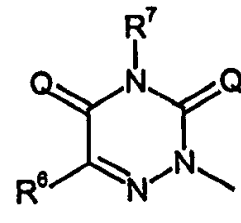
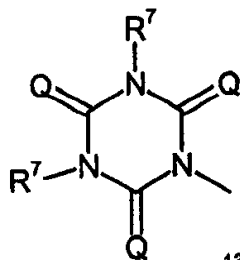
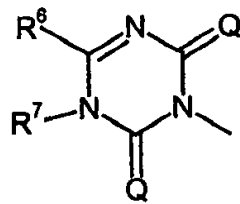
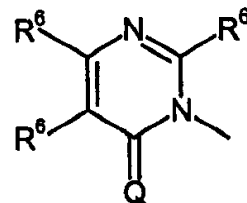
$R^4$  代表氢、氟、氯、溴,或代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基,

$R^5$  代表氢、氟、氯、溴,或代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基,

25

30

Z 代表下列杂环基团之一：

(Z<sup>1</sup>)(Z<sup>2</sup>)(Z<sup>3</sup>)(Z<sup>4</sup>)(Z<sup>5</sup>)(Z<sup>6</sup>)(Z<sup>7</sup>)(Z<sup>8</sup>)(Z<sup>9</sup>)(Z<sup>10</sup>)(Z<sup>11</sup>)(Z<sup>12</sup>)(Z<sup>13</sup>)(Z<sup>14</sup>)(Z<sup>15</sup>)



其中

Q 代表 O (氧) 或 S (硫),

5  $R^6$  代表氢、氨基、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴, 代表各自任选地被氰基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、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、甲基氨基、乙基氨基、正-或异-丙基氨基、正-、异-、仲-或叔丁基氨基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、正-、异-、仲-或叔丁氧基羰基, 代表二甲基氨基或二乙基氨基, 代表各自任选地被氰基、氟、氯或溴取代的  
10 的丙烯基、丁烯基、丙炔基、丁炔基、丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙炔基氧基、丁炔基氧基、丙烯基硫基、丁烯基硫基、丙炔基硫基或丁炔基硫基, 或代表各自任选地被氰基、氟、氯、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基,

15  $R^7$  代表氢、羟基、氨基、氰基, 代表各自任选地被氰基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基、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、正-、异-、仲-或叔丁氧基羰基、甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、正-、异-、仲-或叔丁基氨基, 代表各自任选地被氰基、氟或氯取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基, 代表各自任选地被氰基、氟、氯、甲基或乙基取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基, 或代表各自任选地被硝基、氰基、氟、氯、溴、甲基或甲氧基取代的苯基或苄基,

25 其中两个相邻的基团  $-R^6$  和  $R^6$ 、 $R^7$  和  $R^7$  或  $R^6$  和  $R^7$  一起代表丙烷-1, 3-二基 (三亚甲基)、丁烷-1, 4-二基 (四亚甲基)、戊烷-1, 5-二基 (五亚甲基)、丙烯-1, 3-二基、丁-1-烯-1, 4-二基或丁-2-烯-1, 4-二基, 它们各任选地被氟或氯取代和/或任选地在开头 (和/或末尾) 或在所述烃链内通过 O (氧)、S (硫) 或选自  $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$  和  $-N(\text{甲基})-$  的基团间  
30 断。

4. 根据权利要求 1 的化合物, 其特征在于

$R^1$  代表氢或氟,

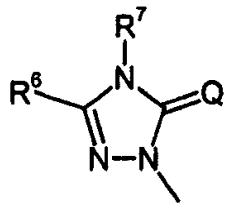
R<sup>2</sup> 代表氟基、硫代氨基甲酰基、氯或溴，

R<sup>3</sup> 代表氢、羧基、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴，  
 代表各自任选地被氟、氯、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基  
 5 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、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，代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的  
 甲氧羰基、乙氧羰基、正-或异丙氧基羰基，

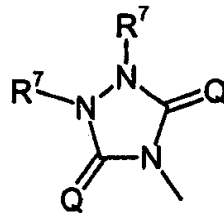
R<sup>4</sup> 代表氢、氟、氯、溴，或代表各自任选地被氟、氯、甲氧基或乙  
 10 氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基，

R<sup>5</sup> 代表氢、氟、氯、溴，或代表各自任选地被氟、氯、甲氧基或乙  
 氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基，

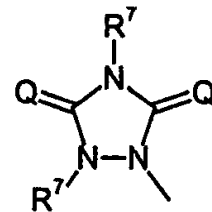
Z 代表下列杂环基团之一：



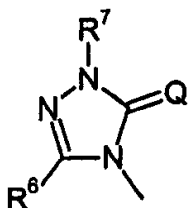
(Z<sup>1</sup>)



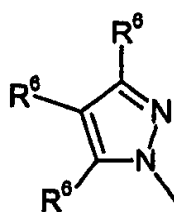
(Z<sup>2</sup>)



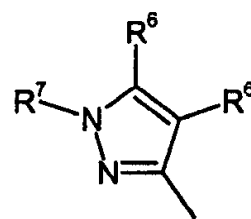
(Z<sup>3</sup>)



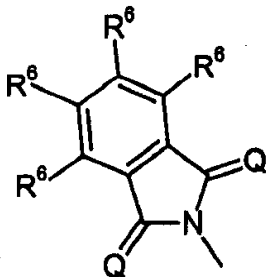
(Z<sup>4</sup>)



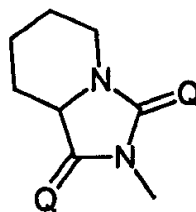
(Z<sup>5</sup>)



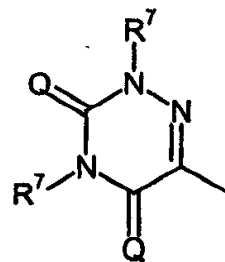
(Z<sup>6</sup>)



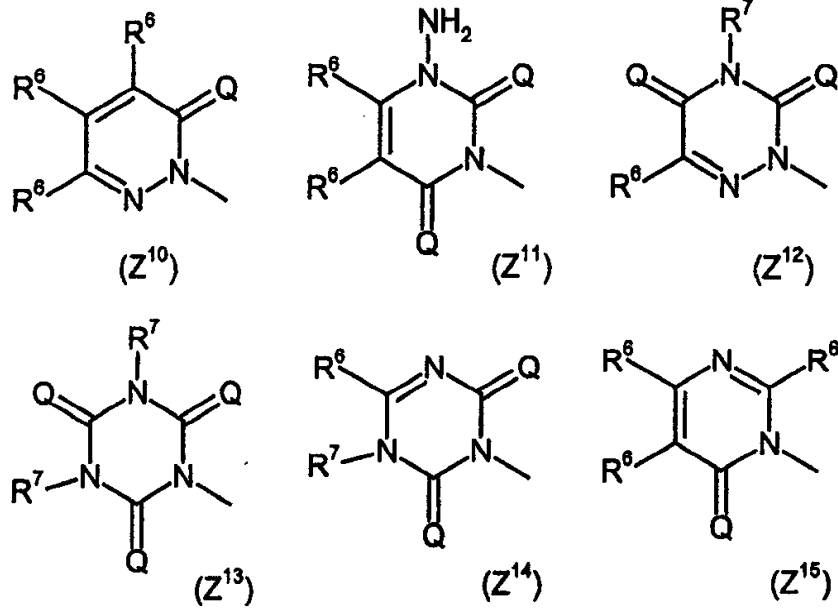
(Z<sup>7</sup>)



(Z<sup>8</sup>)



(Z<sup>9</sup>)



其中

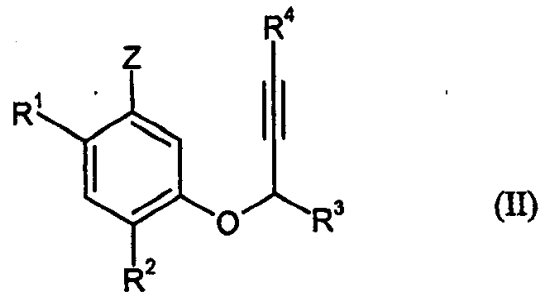
Q 代表 O(氧)或 S(硫),

- 5  $R^6$  代表氢、氟、氯、溴,代表各自任选地被氟、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、甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基,代表二甲基氨基,代表各自任选地被氟基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基、丁炔基、丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙炔基氧基、丁炔基氧基、丙烯基硫基、丁烯基硫基、丙炔基硫基或丁炔基硫基,

10  $R^7$  代表氢,代表氨基,代表各自任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基,或代表各自任选地被氟基、氟或氯取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基,

- 15 其中两个相邻的基团  $-R^6$  和  $R^6$ 、 $R^7$  和  $R^7$  或  $R^6$  和  $R^7$  一起代表丙烷-1,3-二基(三亚甲基)、丁烷-1,4-二基(四亚甲基)、戊烷-1,5-二基(五亚甲基)、丙烯-1,3-二基、丁-1-烯-1,4-二基或丁-2-烯-1,4-二基,它们各任选地被氟或氯取代和/或任选地在开头(和/或末尾)或在所述烃链内通过 O(氧)、S(硫)或选自  $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$  和  $-N(\text{甲基})-$  的基团间断。

- 20 5. 制备权利要求 1 至 4 之任一项的化合物的方法,其特征在于,在碱性氮化合物存在下热解式(II)的 3-炔基氧基-苯基杂环化合物,



其中

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 和 $Z$ 各自如上所定义。

5 6. 防治不希望的植物的方法，其特征在于，将权利要求 1 至 4 之任一项的至少一种化合物作用于不希望的植物和/或其栖生地。

7. 权利要求 1 至 4 之任一项的至少一种化合物防治不希望的植物的应用。

10 8. 除草组合物，其特征在于，它包含权利要求 1 至 4 之任一项的化合物和常规的扩充剂和/或表面活性剂。

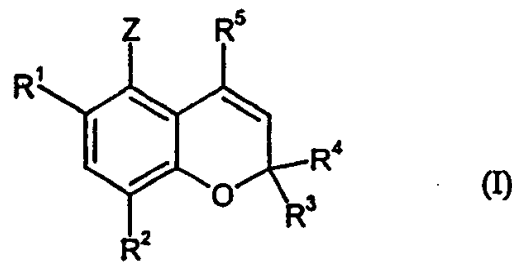
## 说 明 书

## 取代的杂环基-2H-苯并吡喃类化合物

5 本发明涉及新的取代的杂环基-2H-苯并吡喃类化合物、它们的制备方法以及它们作为除草剂的应用。

已经知道，某些取代的杂环基-2H-苯并吡喃类化合物具有除草性能(参见 JP-A-09301973--引用在化学文摘 128:34781 中)。然而，这些化合物至今并未获得任何特别的重要性。

10 因此，本发明提供了新的通式(I)的取代的杂环基-2H-苯并吡喃类化合物：



其中

$R^1$  代表氢、氟基或卤素，

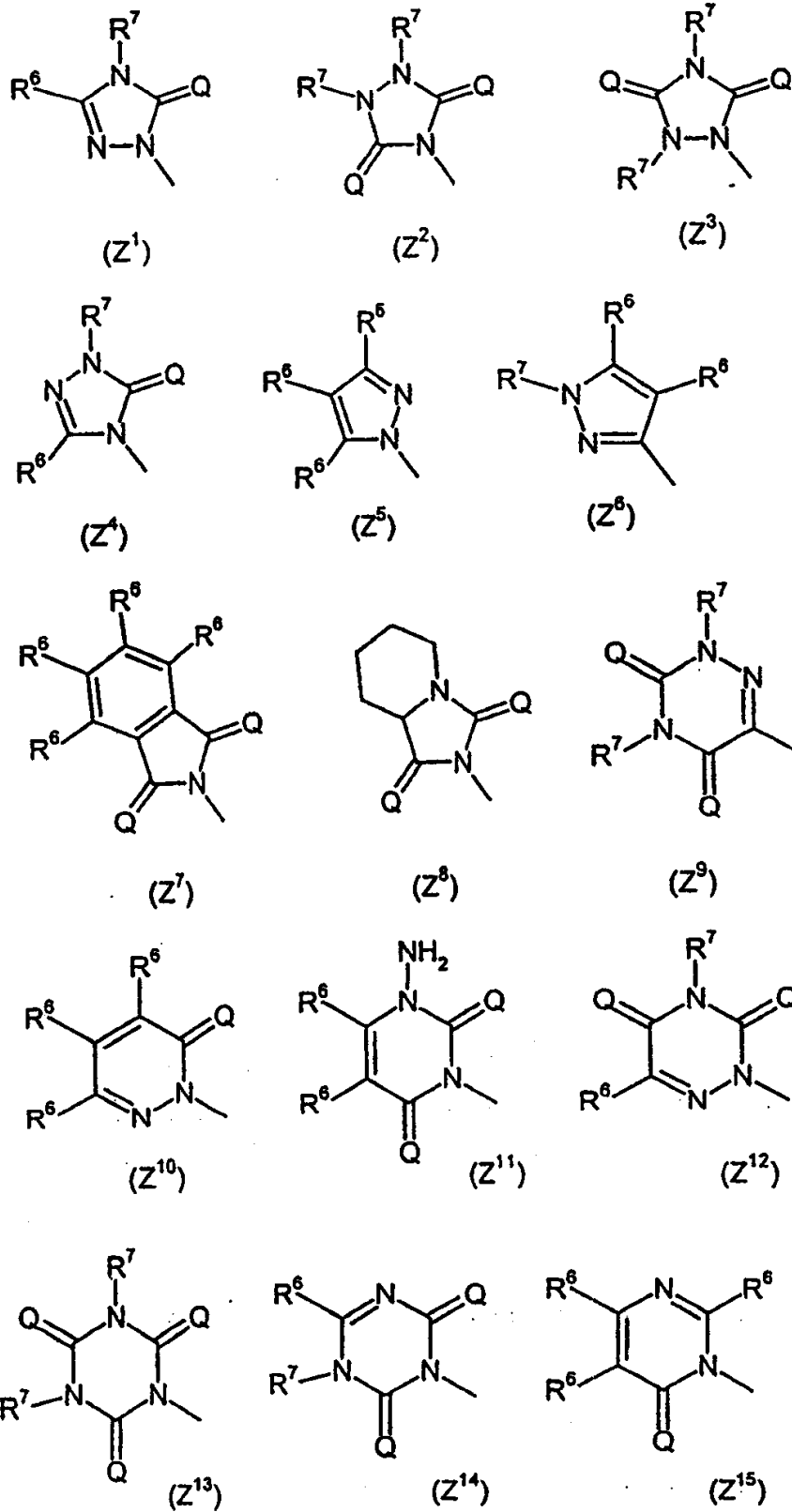
15  $R^2$  代表氟基、硫代氨基甲酰基、卤素或代表各自任选地被取代的烷基或烷氧基，

$R^3$  代表氢、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素，代表羟基亚氨基烷基或代表各自任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基、烷氧羰基、烷基羰基氨基、烷氧基亚氨基烷基、链烯基、链烯基氧基、链烯基硫基、炔基、炔基氧基、炔基硫基、环烷基、环烷基烷基、环烷基氧基羰基、苯基或苄基，

$R^4$  代表氢、卤素或任选地被取代的烷基，

$R^5$  代表氢、卤素或任选地被取代的烷基，以及

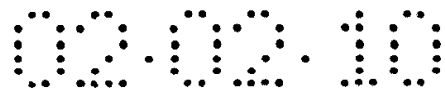
25 Z 代表下列杂环基团之一：



其中

Q 代表 O(氧) 或 S(硫),

R<sup>6</sup> 代表 氢、氨基、硝基、氰基、羧基、氨甲酰基、硫代氨甲酰基、



卤素,或代表各自任选地被取代的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基氨基、烷氧羰基、二烷基氨基、链烯基、链烯基氧基、链烯基硫基、炔基、炔基氧基、炔基硫基、环烷基或环烷基烷基,以及

5  $R^7$  代表氢、羟基、氨基、氰基,或代表各自任选地被取代的烷基、烷氧基、烷氧羰基、烷基氨基、链烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、苯基或苯基烷基,

10 其中,任选地,两个相邻的基团 $-R^6$ 和 $R^6$ 、 $R^7$ 和 $R^7$ 或 $R^6$ 和 $R^7$ 一起代表烷二基或链烯二基,它们各是任选地被取代的和/或任选地在开头(和/或在末尾)或在所述烃链内通过O(氧)、S(硫)或选自 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 和 $-N(\text{烷基})-$ 的基团间断。

在上述定义中,烃链如烷基或烷二基,也包括与杂原子结合的情况如在烷氧基中时,各自是直链或支链的。

15  $R^1$  优选代表氢、氟基、氟、氯或溴。

$R^2$  优选代表氟基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴,或代表各自任选地被氟-和/或氯-取代的各自具有1到4个碳原子的烷基或烷氧基,

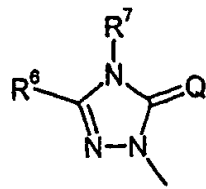
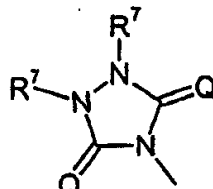
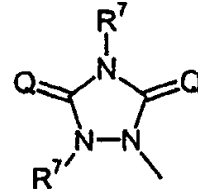
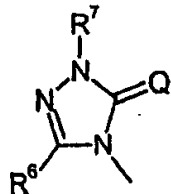
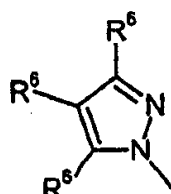
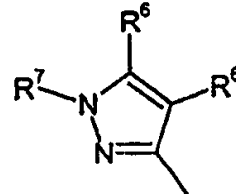
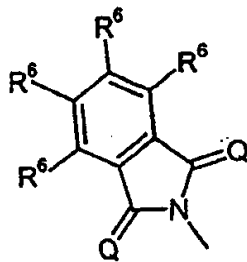
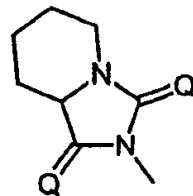
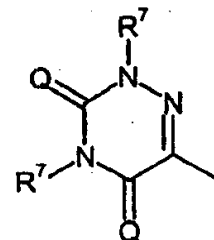
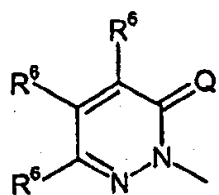
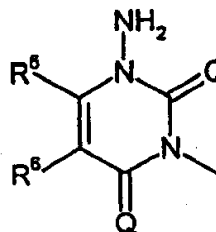
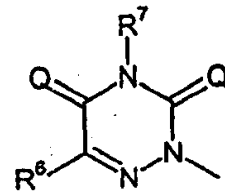
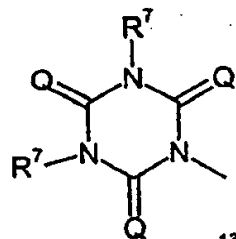
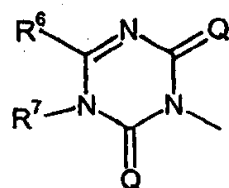
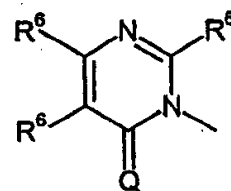
20  $R^3$  优选代表氢、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴,代表具有最多6个碳原子的羟基亚氨基烷基,代表各自任选地被氟基、羟基、氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷硫基、 $C_1-C_4$ -烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ -烷基磺酰氧基或 $C_1-C_4$ -烷基羰基氧基取代的各自具有最多6个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基,代表各自任选地被氟基、氟、氯、溴或 $C_1-C_4$ -烷氧基取代的各自具有最多6个碳原子的烷基羰基、烷氧羰基、烷基羰基氨基或烷氧基亚氨基烷基,代表各自任选地被氟基、氟、氯或溴取代的各自具有最多6个碳原子的链烯基、链烯基氧基、链烯基硫基、炔基、炔基氧基或炔基硫基,代表各自任选地被氟基、氟、氯、溴或 $C_1-C_4$ -烷基取代的各自在环烷基中具有3到6个碳原子和任选地在烷基部分具有最多4个碳原子的环烷基、环烷基烷基或  
25 环烷基氧基羰基,或代表各自任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、 $C_1-C_4$ -烷基或 $C_1-C_4$ -烷氧基取代的苯基或苄基。

30  $R^4$  优选代表氢、氟、氯、溴,或代表任选地被氟基、氟、氯或 $C_1-C_4$ -

烷氧基取代的具有 1 到 6 个碳原子的烷基。

$R^5$  优选代表氢、氟、氯、溴，或代表任选地被氟基、氟、氯或  $C_1-C_4$ -烷氧基取代的具有 1 到 6 个碳原子的烷基。

Z 优选代表下列杂环基团之一：

(Z<sup>1</sup>)(Z<sup>2</sup>)(Z<sup>3</sup>)(Z<sup>4</sup>)(Z<sup>5</sup>)(Z<sup>6</sup>)(Z<sup>7</sup>)(Z<sup>8</sup>)(Z<sup>9</sup>)(Z<sup>10</sup>)(Z<sup>11</sup>)(Z<sup>12</sup>)(Z<sup>13</sup>)(Z<sup>14</sup>)(Z<sup>15</sup>)



Q 优选代表 O(氧)或 S(硫)。

R<sup>6</sup> 优选代表氢、氨基、硝基、氰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、卤素,代表各自任选地被氰基、卤素或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基取代的各自具有最多 6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基氨基或烷氧基羰基,代表在各烷基中具有最多 4 碳原子的二烷基氨基,代表各自任选地被氰基或卤素取代的各自具有最多 6 个碳原子的链烯基、炔基、链烯基氧基、炔基氧基、链烯基硫基、炔基硫基,或代表各自任选地被氰基、卤素或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基取代的在环烷基部分各具有 3 到 6 碳原子和任选地在烷基部分具有最多 4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基。

R<sup>7</sup> 优选代表氢、羟基、氨基、氰基,代表各自任选地被氰基、卤素或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基取代的各自具有最多 6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷氧羰基或烷基氨基,代表各自任选地被氰基或卤素取代的各自具有最多 6 个碳原子的链烯基或炔基,代表各自任选地被氰基、卤素或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基取代的各自在环烷基中具有 3 到 6 个碳原子和任选地在烷基部分具有最多 4 个碳原子的环烷基或环烷基烷基,或代表各自任选地被硝基、氰基、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基取代的苯基、苄基或苯乙基。

两个相邻的基团- R<sup>6</sup> 和 R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> 和 R<sup>7</sup> 或 R<sup>6</sup> 和 R<sup>7</sup>-任选地优选一起代表各自任选地被卤素取代和/或任选地在开头(和/或在末尾)或在所述烃链内通过 O(氧)、S(硫)或选自-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NH和-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基)-的基团间断的各自具有最多 5 个碳原子的烷二基或链烯二基。

R<sup>1</sup> 特别优选代表氢、氟或氯。

R<sup>2</sup> 特别优选代表氰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴、三氟甲基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

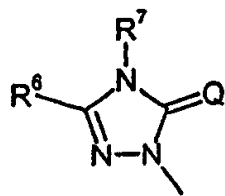
R<sup>3</sup> 特别优选代表氢、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴,代表羟基亚氨基甲基、羟基亚氨基乙基或羟基亚氨基丙基,代表各自任选地被氰基、羟基、氟、氯、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基取代的甲基、乙基、正或异-丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、正-、异-、仲-或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正-或异丙硫基、正-、异-、仲-或叔丁硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲

基磺酰基或乙基磺酰基,代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的乙酰基、丙酰基、正-或异-丁酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异丙氧基羰基、乙酰氨基、丙酰氨基、正-或异丁酰氨基、甲氧基亚氨基甲基、乙氧基亚氨基甲基、甲氧基亚氨基乙基或乙氧基亚氨基乙基,代表各自任选地被氟基、氟或氯取代的丙烯基、丁烯基、丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙烯基硫基、丁烯基硫基、丙炔基、丁炔基、丙炔基氧基、丁炔基氧基、丙炔基硫基或丁炔基硫基,代表各自任选地被氟基、氟、氯、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、环己基甲基、环丙基氧基羰基、环丁基氧基羰基、环戊基氧基羰基或环己基氧基羰基,或代表各自任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、甲基或甲氧基取代的苯基或苄基。

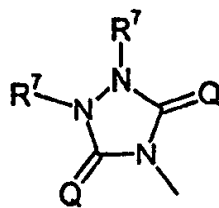
$R^4$  特别优选代表氢、氟、氯、溴,或代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基。

$R^5$  特别优选代表氢、氟、氯、溴,或代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基。

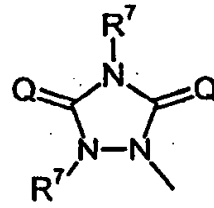
Z 特别优选代表下列杂环基团之一:



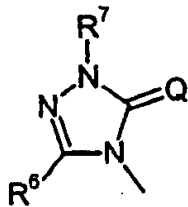
(Z<sup>1</sup>)



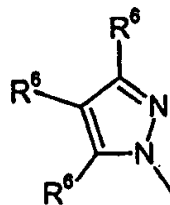
(Z<sup>2</sup>)



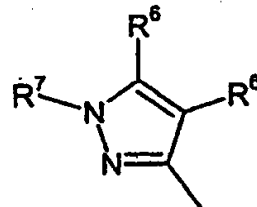
(Z<sup>3</sup>)



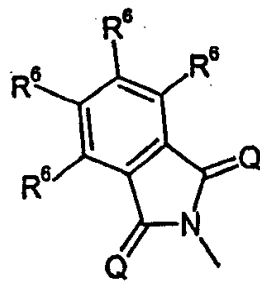
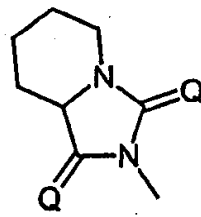
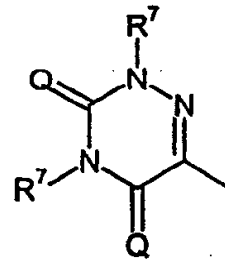
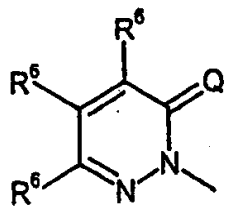
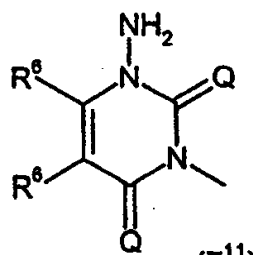
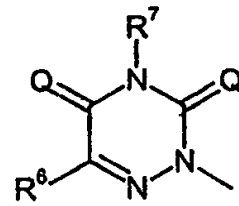
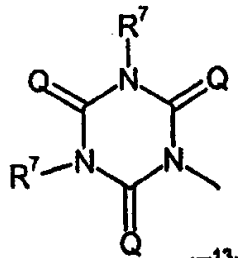
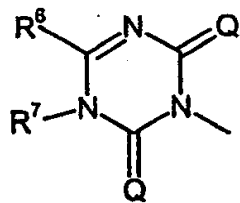
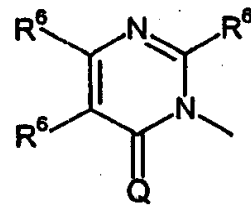
(Z<sup>4</sup>)



(Z<sup>5</sup>)



(Z<sup>6</sup>)

(Z<sup>7</sup>)(Z<sup>8</sup>)(Z<sup>9</sup>)(Z<sup>10</sup>)(Z<sup>11</sup>)(Z<sup>12</sup>)(Z<sup>13</sup>)(Z<sup>14</sup>)(Z<sup>15</sup>)

Q 特别优选代表 O (氧) 或 S (硫)。

- R<sup>6</sup> 特别优选代表氢、氨基、硝基、氟基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴, 代表各自任选地被氟基、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、甲基氨基、乙基氨基、正-或异-丙基氨基、正-、异-、仲-或叔丁基氨基、甲氧羰基、乙氧羰基、正-或异丙氧基羰基、正-、异-、仲-或叔丁氧基羰基, 代表二甲基氨基或二乙基氨基, 代表各自任选地被氟基、氯、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基、丁炔基、丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙炔基氧基、丁炔基氧基、丙烯基硫基、丁烯基硫基、丙炔基硫基或丁炔基硫基, 或代表各自任选地被氟基、氯、氯、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。

$R^7$  特别优选代表氢、羟基、氨基、氰基,代表各自任选地被氟基、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、甲氧羰基、乙氧羰基、正-或异丙氧基羰基、正-、异-、仲-或叔丁氧基羰基、甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基、正-、异-、仲-或叔丁基氨基,代表各自任选地被氟基、氟或氯取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基,代表各自任选地被氟基、氟、氯、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,或代表各自任选地被硝基、氟基、氟、氯、溴、甲基或甲氧基取代的苯基或苄基。

两个相邻的基团 $-R^6$ 和 $R^6$ 、 $R^7$ 和 $R^7$ 或 $R^6$ 和 $R^7$ -任选地特别优选一起代表丙烷-1,3-二基(三亚甲基)、丁烷-1,4-二基(四亚甲基)、戊烷-1,5-二基(五亚甲基)、丙烯-1,3-二基、丁-1-烯-1,4-二基或丁-2-烯-1,4-二基,它们各任选地被氟或氯取代和/或任选地在开头(和/或末尾)或在所述烃链内通过O(氧)S(硫)或选自 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 和 $-N(甲基)-$ 的基团间断。

$R^1$  非常特别优选代表氢或氟。

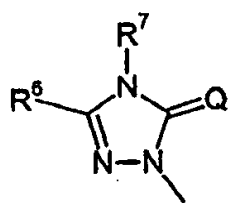
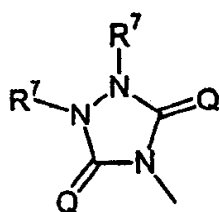
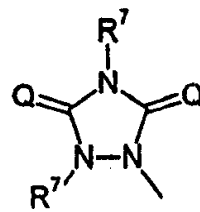
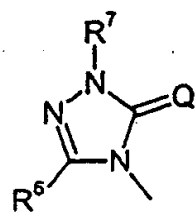
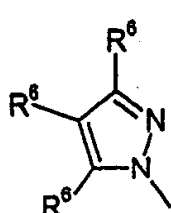
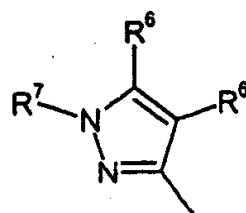
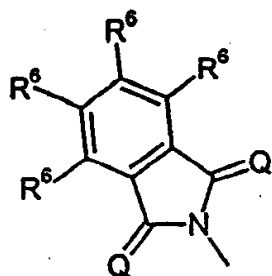
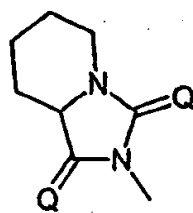
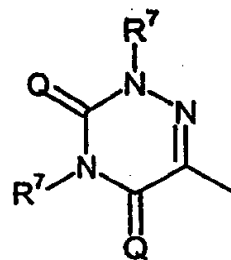
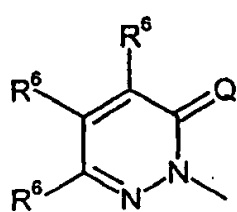
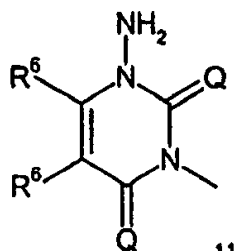
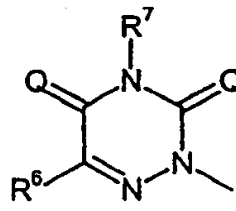
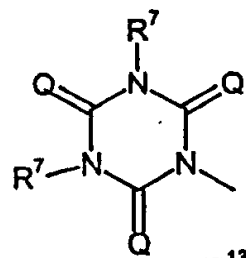
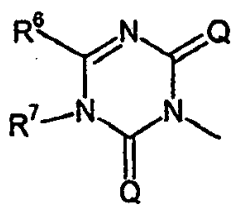
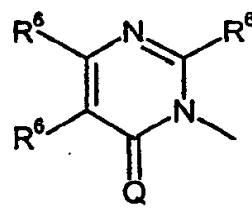
$R^2$  非常特别优选代表氟基、硫代氨基甲酰基、氯或溴。

$R^3$  非常特别优选代表氢、羧基、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、氟、氯、溴,代表各自任选地被氟、氯、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙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、甲基磺酰基或乙基磺酰基,代表各自任选地被氟基、氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲氧羰基、乙氧羰基、正-或异丙氧基羰基。

$R^4$  非常特别优选代表氢、氟、氯、溴,或代表各自任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基。

$R^5$  非常特别优选代表氢、氟、氯、溴,或代表各自任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基。

Z 非常特别优选代表下列杂环基团之一:

(Z<sup>1</sup>)(Z<sup>2</sup>)(Z<sup>3</sup>)(Z<sup>4</sup>)(Z<sup>5</sup>)(Z<sup>6</sup>)(Z<sup>7</sup>)(Z<sup>8</sup>)(Z<sup>9</sup>)(Z<sup>10</sup>)(Z<sup>11</sup>)(Z<sup>12</sup>)(Z<sup>13</sup>)(Z<sup>14</sup>)(Z<sup>15</sup>)

Q 非常特别优选代表 O(氧)或 S(硫)。

R<sup>6</sup> 非常特别优选代表氢、氟、氯、溴,代表各自任选地被氟、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、甲基氨基、乙基氨基、正-或异丙基氨基,代表二甲氨基,代表各自任选地被氟基、氟、氯或溴取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基、丁炔基、丙烯基氧基、丁烯基氧基、丙炔基氧基、丁炔基氧基、丙烯基硫基、丁烯基硫基、丙炔基硫基或丁炔基硫基。

5  $R^7$  非常特别优选代表氢,代表氨基,代表各自任选地被氟、氯、甲氧基或乙氧基取代的甲基、乙基、正-或异丙基,或代表各自任选地被氟基、氟或氯取代的丙烯基、丁烯基、丙炔基或丁炔基。

10 两个相邻的基团  $-R^6$  和  $R^6$ 、 $R^7$  和  $R^7$  或  $R^6$  和  $R^7$ -任选地非常特别优选一起代表丙烷-1,3-二基(三亚甲基)、丁烷-1,4-二基(四亚甲基)、戊烷-1,5-二基(五亚甲基)、丙烯-1,3-二基、丁-1-烯-1,4-二基或丁-2-烯-1,4-二基,它们各任选地被氟或氯取代和/或任选地在开始(和/或末尾)或在所述烃链内通过 O(氧)、S(硫)或选自  $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$  和  $-N$ (甲基)-的基团间断。

15  $R^1$  最优选代表氟。

$R^2$  最优选代表氟基、硫代氨基酰基或氯。

$R^3$  最优选代表氢或甲基。

$R^4$  和  $R^5$  各自最优选代表氢。

20 所述各基团  $R^6$  和  $R^7$ -如果他们中超过一个与同一个杂环基团相连-可以具有在上述作为优选的、特别优选的或非常特别优选的定义范围内相同的或不同的含义。

25 上述的一般的或优选的基团定义适用于式(I)的终产物和相应地适用于在所有情况下制备所需的原料或中间体。这些基团定义可以随意地彼此结合,即包括在所给定的优选的范围之间的组合。

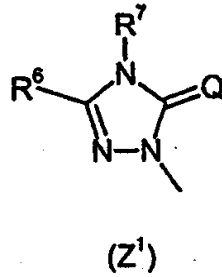
本发明优选的是含有上面所列优选含义组合的式(I)化合物。

本发明特别优选的是含有上面所列特别优选含义组合的式(I)化合物。

30 本发明非常特别优选的是含有上面所列非常特别优选含义组合的式(I)化合物。

本发明最优选的是其中一个基团具有作为最优选给出的意义的化合物。

非常特别优选的一组是那些式(I)化合物, 其中  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 和 $R^5$ 各自具有上述作为非常特别优选的含义, 和  
 $Z$ 代表下述杂环基团:



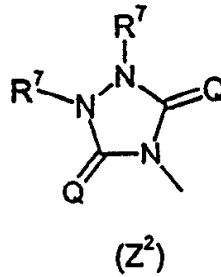
5

其中

$Q$ 、 $R^6$ 和 $R^7$ 各自具有上述作为非常特别优选的含义。

10

非常特别优选的另一组是那些式(I)化合物, 其中  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 和 $R^5$ 各自具有上述作为非常特别优选的含义, 和  
 $Z$ 代表下述杂环基团:



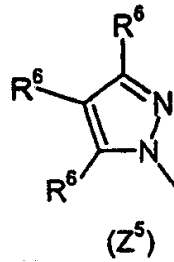
其中

15

$Q$ 和 $R^7$ 各自具有上述作为非常特别优选的含义。

非常特别优选的另一组是那些式(I)化合物, 其中  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 和 $R^5$ 各自具有上述作为非常特别优选的含义, 和  
 $Z$ 代表下述杂环基团:

20

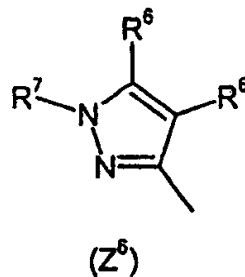


其中

R<sup>6</sup> 具有上述作为非常特别优选的含义。

5

非常特别优选的另一组是那些式(I)化合物，其中  
R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>各自具有上述作为非常特别优选的含义，和  
Z代表下述杂环基团：



10

其中

R<sup>6</sup>和R<sup>7</sup>各自具有上述作为非常特别优选的含义。

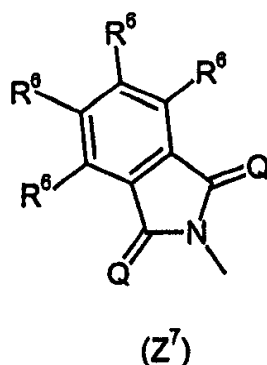
非常特别优选的另一组是那些式(I)化合物，其中

15

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>各自具有上述作为非常特别优选的含义，和  
Z代表下述杂环基团：

20



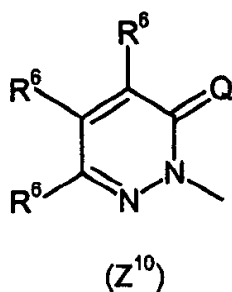


其中

Q 和 R<sup>6</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义。

5

非常特别优选的另一组是那些式 (I) 化合物，其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义，和 Z 代表下述杂环基团：



10

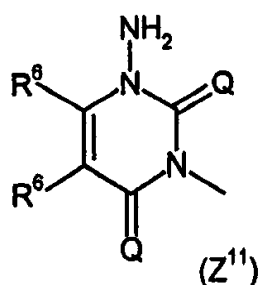
其中

Q 和 R<sup>6</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义。

15

非常特别优选的另一组是那些式 (I) 化合物，其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义，和 Z 代表下述杂环基团：

20

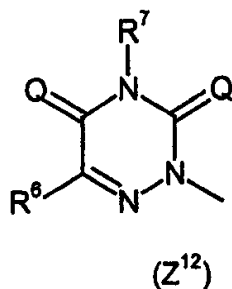


其中

Q 和 R<sup>6</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义。

5

非常特别优选的另一组是那些式 (I) 化合物，其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义，和 Z 代表下述杂环基团：



10

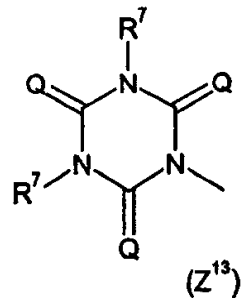
其中

Q、R<sup>6</sup> 和 R<sup>7</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义。

15

非常特别优选的另一组是那些式 (I) 化合物，其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义，和 Z 代表下述杂环基团：

20



其中

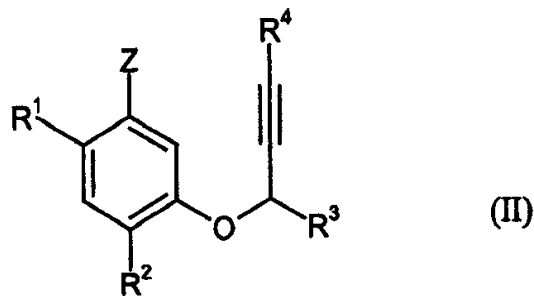
Q 和 R<sup>7</sup> 各自具有上述作为非常特别优选的含义。

5

新的通式 (I) 的取代的杂环基-2H-苯并吡喃类化合物具有令人感兴趣的生物学性能。特别地，他们具有强的除草活性。

所述的新的式 (I) 的取代的杂环基-2H-苯并吡喃类化合物可如下获得：在碱性氮化合物存在下热解式 (II) 的 3-炔基氧基-苯基杂环化合物，

10

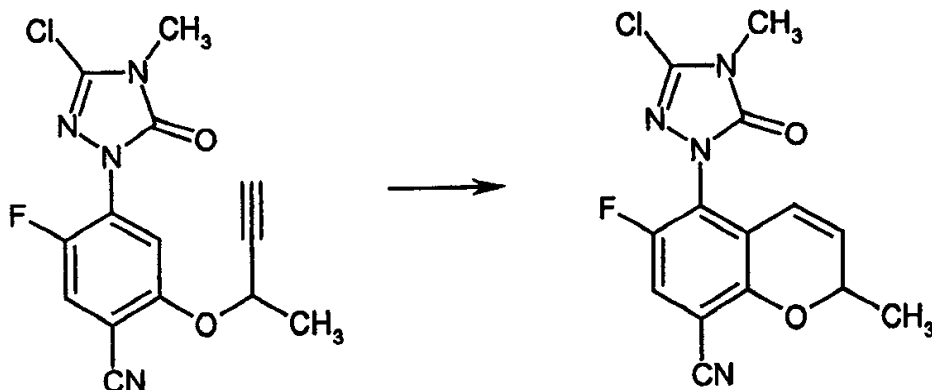


其中

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 Z 各自如上所定义。

15 用例如 4-(3-氯-4-甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-1,2,4-三唑-1-基)-5-氟-2-[(1-甲基-2-丙炔基)-氧基]-苜蓿作为原料，在本发明方法中所述的反应的过程可以用下述反应式来说明：

20



式(II)提供了在制备通式(I)化合物的本发明方法中用作起始原料的3-炔基氧基-苯基杂环化合物的一般定义。在式(II)中, R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>和Z各自优选或特别具有在上文有关本发明式(I)化合物的描述中业已提到的R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>和Z的优选或特别优选的含义。

通式(II)的原料是已知的和/或可以通过本身已知的方法制备(参见EP-A-370332、EP-A-597360、EP-A-599135、EP-A-610733、EP-A-617026、WO-A-96/18618、WO-A-97/30980、WO-A-97/26248、WO-A-97/140018、WO-A-97/46535, 制备实施例)。

制备式(I)化合物的方法用碱性有机氮化合物进行。它们优选包括三乙胺、三丙胺、三丁胺、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-二乙基苯胺、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、1,4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,5-二氮杂二环[4.3.0]壬-5-烯(DBN)和1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一-7-烯(DBU)。

制备式(I)化合物的方法任选地用金属氟化物进行。它们优选包括氟化锂、氟化钠、氟化钾、氟化铷、氟化铯、氟化镁、氟化钙、氟化钡和氟化铝。

进行本发明方法时, 反应温度可以在较宽的范围内变化。通常, 反应是在150℃至250℃, 优选在180℃至220℃间的温度下进行。

本发明的方法通常是在常压下进行的。然而, 本发明方法也可以

在加压或减压下——通常是在 0.1 巴至 10 巴间的压力下进行。

进行本发明方法时，反应组分通常在室温下混合，且反应混合物通常是在所需的温度下搅拌 1 个或多个小时。后处理是用常规方法进行(参见，制备实施例)。

5 本发明活性化合物可以用作脱叶剂、干燥剂、杀茎秆剂，和特别是用作除草剂。所谓的杂草，就其最广义而言，应理解为生长在该生长的地方的所有植物。本发明的物质是作为灭生性除草剂或是选择性除草剂基本上取决于所用的量。

本发明化合物可以与例如下列植物相关使用：

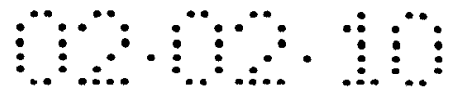
10 下列属的双子叶杂草：苘麻属、苋属、豚草属、Anoda、春黄菊属、Aphanes、滨藜属、雏菊属、鬼针草属、芥属、飞廉属、决明属、矢车菊属、藜属、蓟属、旋花属、曼陀罗属、山马蝗属、刺酸模属、糖芥属、大戟属、鼬瓣花属、牛膝菊属、猪殃殃属、木槿属、番薯属、地肤属、野芝麻属、独行草属、母草属、母菊属、薄荷属、山靛属、Mullugo、  
15 勿忘我属、罌粟属、牵牛属、车前属、蓼属、马齿苋属、毛茛属、萝卜属、蔊菜属、节节菜属、酸模属、猪毛菜属、千里光属、田菁属、黄花稔属、芥属、茄属、苦苣菜属、尖瓣花属、繁缕属、蒲公英属、遏蓝菜属、三叶草属、苧麻属、婆婆纳属、堇菜属、苍耳属。

20 下列属的双子叶作物：花生属、甜菜属、芸苔属、黄瓜属、南瓜属、向日葵属、胡萝卜属、大豆属、棉属、番薯属、莴苣属、亚麻属、番茄属、烟草属、菜豆属、豌豆属、茄属、巢菜属。

25 下列属的单子叶杂草：山羊草属、冰草属、翦股颖属、看麦娘属、Apera、燕麦属、臂形草属、雀麦属、粟草属、鸭跖草属、狗牙根属、莎草属、龙爪茅属、马唐属、稗属、荸荠属、蟋蟀草属、画眉草属、野黍属、羊茅属、飘拂草属、异蕊花属、白茅属、鸭嘴草属、千金子属、黑麦草属、雨久花属、黍属、雀稗属、藨草属、梯牧草属、早熟禾属、筒轴茅属、慈姑属、莞草属、狗尾草属、高粱属。

30 下列属的单子叶作物：葱属、凤梨属、天门冬属、燕麦属、大麦属、稻属、黍属、蔗属、黑麦属、高粱属、黑小麦、小麦属、玉蜀黍属。

然而，本发明活性化合物的应用决不限于这些属，且也可以相同的方式延伸至其它植物。



取决于其浓度，本发明的活性化合物适合于灭生性防治杂草，例如工业地域和铁道线，以及有或无种植树林的道路和广场。同样，活性化合物可以用于防治多年生作物中的杂草，例如森林、装饰树林、果园、葡萄园、柑桔林、坚果园、蕉种植园、咖啡种植园、茶园、橡胶种植园、油棕榈种植园、可可种植园、软果林和啤酒花田、草场、体育场和牧场中的杂草且用于选择性地防治一年生作物中的杂草。

本发明式(I)化合物当施于土壤或用于植物地上部分时，具有强的除草活性和宽阔的活性谱；在某种程度上，它们还适合于以芽前和芽后二种方式选择性地防治单子叶和双子叶作物中的单子叶和双子叶杂草。

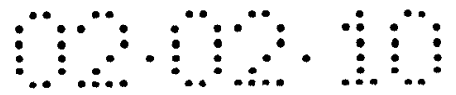
在某些浓度和施用率时，本发明的活性化合物也可以用于防治动物害虫和真菌性或细菌性植物疾病。任选地，它们也可以用作合成活性化合物的中间体或前体。

根据本发明，可以处理所有植物和植物部分。这里，植物应理解为所有植物和植物群体如希望的或不希望的野生植物或作物(包括天然存在的作物)。作物可以通过常规种植和最优化方法或通过生物技术和基因工程方法或这些方法的结合可以获得的植物，包括转基因植物，也包括植物变种，无论它们是否可以被植物品种保护权利机构保护。植物部分应被理解为意指植物的所有地上和地下部分和器官例如芽、叶、花和根，可提及的例子是叶、针叶、茎、树干、花、果体、果实和种子以及还有根、块茎和根茎。植物部分也包括收割物，以及有生长力的和有生殖能力的繁殖材料例如秧苗、块茎、根茎、切割物和种子。

根据本发明用活性化合物对植物或植物部分的处理按照常规的处理方法例如浸蘸、喷雾、蒸发、雾化、撒播、刷涂和在繁殖材料的情况下特别是种子的情况下还可以通过单-或多层涂布直接地或通过作用于它们的环境、栖生地或储存地来进行。

活性化合物可以转化成常规的制剂，如溶液、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、粉尘剂、膏剂、可溶性粉剂、颗粒剂、悬乳剂、用活性化合物浸渍的天然或合成材料，以及包在聚合物中的微细胶囊。

这些制剂可以用已知的方式生产，例如，将活性化合物与扩充剂，即液体溶剂和/或与固体载体混合，并任选使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂和/或起泡剂。



如果用水作扩充剂，也可以用有机溶剂作助溶剂。适合的液体溶剂主要有：芳族化合物，如二甲苯，甲苯或烷基苯，氯代芳族化合物或氯代脂肪烃，如氯代苯类、氯乙烯类或二氯甲烷，脂族烃，如环己烷或石蜡，例如石油馏份、矿物和植物油，醇类，如丁醇或乙二醇以及其醚和酯，酮类，如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮，强极性溶剂，如二甲基甲酰胺或二甲基亚砷，以及水。

适合的固体载体是：例如铵盐和磨碎的天然矿物质，如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石或硅藻土，和磨碎的合成矿物质，如高分散二氧化硅、矾土和硅酸盐，适合用于颗粒剂的固体载体有：例如压碎并分级的天然矿物质如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石，以及有机和无机粉的合成颗粒，和如下有机物的颗粒：锯木屑、椰壳、玉米穗轴和烟茎；适合的乳化剂和/或起泡剂是：例如非离子和阴离子乳化剂，如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如，烷基芳基聚乙二醇醚，烷基磺酸盐，烷基硫酸盐，芳基磺酸盐以及白蛋白水解产物；适合的分散剂是：例如，木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

制剂中可以使用粘合剂如羧甲基纤维素和粉状、颗粒或乳胶形式的天然和合成聚合物，如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，以及天然磷脂，如脑磷脂和卵磷脂，和合成磷脂。其它可能的添加剂是矿物油和植物油。

也可以使用着色剂，如无机颜料，例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝，和有机染料，如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料，和微量营养元素如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

制剂中通常含有按重量计 0.1 至 95% 的活性化合物，优选 0.5 至 90%。

本发明活性化合物，其原样或以其制剂形式，也可以作为与已知除草剂和/或改善植物安全性的物质（“安全剂”）一起的混合物用于防治杂草，可以是终制剂或桶混物。也可以是与包含一种或多种已知除草剂和安全剂的除草剂的混合物。

混合物的可能的共组分是已知除草剂，例如，乙草胺、三氟羧草醚（钠盐）、苯草醚、甲草胺、禾草灭（钠盐）、莠灭净、amidochlor、酰嘧黄隆、莎稗磷、磺草灵、莠去津、azafenidin、四唑嘧黄隆、草



除灵、吡草黄、苜蓿黄隆(甲酯)、灭草松、benzobicyclon、吡草酮、  
新燕灵(乙酯)、双丙氯酰磷、甲羧除草醚、双草醚、溴丁酰草胺、溴  
酚脞、溴苯腈、丁草胺、butoxydim、丁草敌、cafenstrole、caloxydim、  
5 双酰草胺、carfentrazone(-ethyl)、甲氧除草醚、草灭畏、杀草敏、  
氯嘧黄隆(乙酯)、草枯醚、绿黄隆、绿麦隆、cinidon(-ethyl)、环庚  
草醚、醚黄隆、clefoxydim、烯草酮、炔草酸、异噁草酮、氯甲酰草  
胺、二氯吡啶酸、clopyrasulfuron(-methyl)、cloransulam(-  
methyl)、cumyluron、氯草津、cybutryne、灭草特、环丙嘧磺隆、噻  
草酮、氯氟草酯、2,4-滴、2,4-滴丁酸、2,4-滴丙酸、甜菜安、燕麦  
10 敌、麦草畏、禾草灵(甲酯)、diclosulam、乙酰甲草胺、野燕枯、吡  
氯草胺、diflufenzopyr、唑隆、啶草丹、二甲草胺、二甲丙乙净、二  
甲吩草胺、dimexyflam、氯氟灵、双苯酰草胺、敌草快、氯硫草定、  
敌草隆、杀草隆、epoprodan、茵达灭、戊草丹、乙丁烯氟灵、胺苯黄  
隆(甲酯)、乙吡草黄、ethoxyfen、ethoxysulfuron、etobenzanid、  
15 噁唑禾草灵乙酯、fentrazamide、麦草伏(异丙酯)、麦草伏(异丙酯-L)、  
麦草伏(甲酯)、啶嘧黄隆、florasulam、吡氯禾草灵(丁酯)、  
fluazolate、flucarbazone、flufenacet、唑嘧磺草胺、氯烯草酸、  
丙炔氟草胺、flumipropyn、吡唑磺草胺、氯草隆、氯咯草隆、乙羧氟  
草醚(乙酯)、胺草唑、flupropacil、flurpysulfuron(-methyl、  
20 sodium)、芬丁酸、氯啶草酮、氯氟吡氧乙酸、氯嘧醇、flurtamone、  
fluthiacet(-methyl)、fluthiamide、氯黄胺草醚、草铵磷(铵盐)、  
草甘磷(异丙铵盐)、halosafen、吡氯氟禾灵(乙氧基乙酯)、精吡氯氟  
禾灵(甲酯)、环嗪酮、咪草酯(甲酯)、imazamethapyr、imazamox、  
imazapic、灭草烟、灭草嗪、咪草烟、咪唑黄隆、碘磺隆(甲酯,钠盐)、  
25 碘苯腈、异丙乐灵、异丙隆、异噁隆、异噁酰草胺、isoxachlortole、  
isoxaflutole、噁草醚、乳氟禾草灵、环草定、利谷隆、2甲4氯、2  
甲4氯丙酸、苯噻酰草胺、mesotrione、苯噻草酮、吡唑草胺、甲基  
苯噻隆、吡喃隆、秀谷隆、( $\alpha$ -)异丙甲草胺、磺草唑胺、甲氧隆、噻  
草酮、甲黄隆(甲酯)、草达灭、绿谷隆、萘丙胺、萘氧丙草胺、草不  
30 隆、烟嘧黄隆、啶草伏、坪草丹、安磺乐灵、oxadiargyl、噁草酮、  
oxasulfuron、oxaziclomefone、乙氧氟草醚、百草枯、壬酸、二甲戊  
灵、pendralin、pentoxazone、甜菜宁、啶草磷、丙草胺、氯嘧黄隆(甲



酯)、扑草净、毒草胺、敌稗、噻草酯、异丙草胺、戊炔草胺、苄草丹、  
 氟磺隆、pyraflufen(-ethyl)、吡唑特、吡嘧黄隆(乙酯)、苄草唑、  
 pyribenzoxim、稗草丹、吡草特、pyriminobac(-methyl)、噻草硫醚、  
 二氯喹啉酸、喹草酸、灭藻醌、喹禾灵(乙酯)、喹禾灵(四氢糠酯)、  
 5 砒嘧黄隆、稀禾定、西玛津、西草净、sulcitrione、甲磺草胺、噻黄  
 隆(甲酯)、草硫磷、甲噻磺隆、牧草胺、特丁噻草隆、tepraloxydim、  
 特丁津、特丁净、噻吩草胺、噻吩酰胺、噻唑烟酸、thidiazimin、噻  
 黄隆(甲酯)、杀草丹、仲草丹、脞草酮、野燕畏、醚苯黄隆、苯黄隆(甲  
 酯)、绿草定、灭草环、氟乐灵和氟胺黄隆。

10 也可以是与其它已知活性化合物如杀真菌剂、杀虫剂、杀螨剂、  
 杀线虫剂、驱鸟剂、植物养料和土壤结构改良剂一起的混合物。

活性化合物可以以其本身、以其制剂或由之经进一步稀释而制备  
 的使用形式使用，如直接可用溶液、悬浮液、乳液、粉剂、膏剂和颗  
 粒剂。它们以常规方法使用，例如浇泼、喷雾、弥雾或撒施等等。

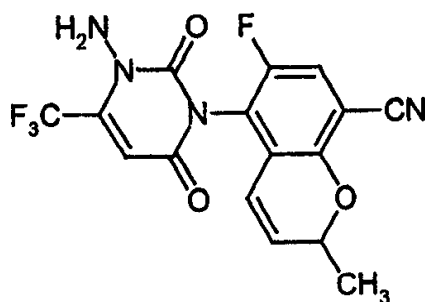
15 本发明活性化合物可以在植物萌发前或后施用。它们也可以在播  
 种前掺入土壤中。

所用的活性化合物的量可以在相当宽的范围内变化。用量基本上  
 取决于所需的效果。通常，使用量在每公顷土表面积用 1 克至 10 千克  
 之间，优选每公顷 5 克至 5 千克。

20 本发明活性化合物的制备和使用可以参见下列实施例。

制备实施例:

实施例 1



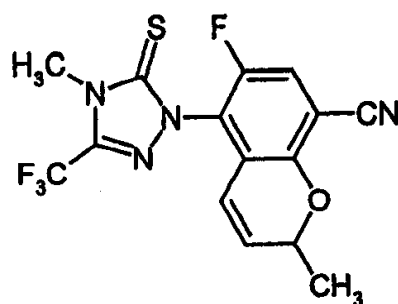
将 0.5g (1.3mmol) 的 3-[2-氟-4-氟基-5-(丁-1-炔-3-基氧基)-苯基]-1-氨基-6-三氟甲基-(1H, 3H)-嘧啶-2,4-二酮和 15ml 的 N,N-二乙基苯胺的混合物在 210℃ 下搅拌 2 小时, 冷却后与水混合。将沉淀的产物通过吸滤分离。将滤液与乙酸乙酯一起振荡, 用硫酸钠干燥有机相并过滤。将滤液在水泵真空下浓缩。将残留物和吸滤分离出来的固体合并并通过硅胶柱色谱纯化, 用环己烷/乙酸乙酯(体积比 3:1)洗脱。

由此给出了 0.20g (理论量的 40%) 的 1-氨基-6-三氟甲基-3-(6-氟-8-氟基-2-甲基-苯并吡喃-3-基)-(1H, 3H)-嘧啶-2,4-二酮。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ ): 7.80; 7.83 (d, 1H).

10

### 实施例 2



将 0.85g (2.3mmol) 的 1-[2-氟-4-氟基-5-(丁-1-炔-3-基氧基)-苯基]-4-甲基-3-三氟甲基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-5-硫酮和 12ml 的 N,N-二乙基苯胺的混合物在 210℃ 下搅拌 2 小时, 冷却后与水混合, 用浓盐酸酸化 (pH2)。将沉淀的产物通过吸滤分离, 用水洗涤, 干燥。

由此给出了 0.84g (理论量的 98%) 的 1-(8-氟基-6-氟-2-甲基-苯并吡喃-3-基)-4-甲基-3-三氟甲基-1,2,4(1H, 4H)-三唑-5-硫酮, 熔点 144℃ (logP: 3.37)。

类似于实施例 1 和 2 并依照本发明制备方法的一般性描述, 也可以制备例如列在下表 1 中的式 (I) 的化合物。

25

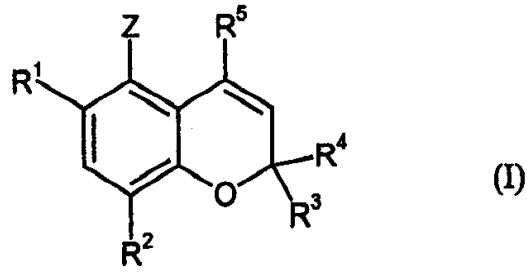
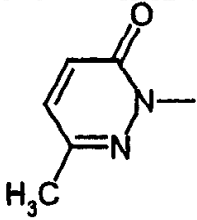
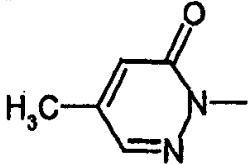
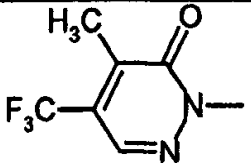
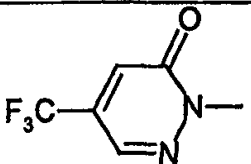
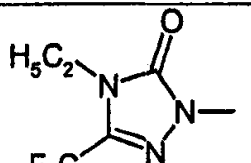
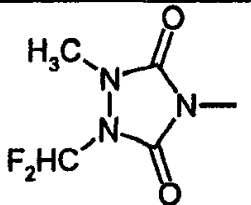
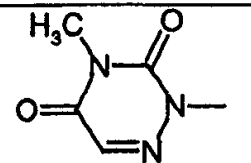
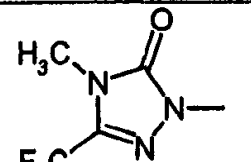


表 1: 式 (I) 化合物实例

实施例号	Z	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理数据
3		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 153°C
4		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 159°C
5		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 63°C
6		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 166°C
7		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 109°C

实施例号	Z	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	物理数据
8		F	CN	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	logP = 2.39 <sup>a)</sup>
9		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	logP = 2.07 <sup>a)</sup>
10		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 75°C
11		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 141°C
12		F	CN	H	H	H	m.p.: 147°C
13		F	Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	logP = 3.18 <sup>a)</sup>
14		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 80°C
15		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 57°C

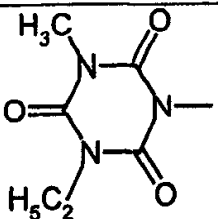
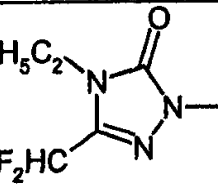
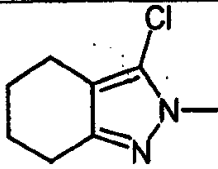
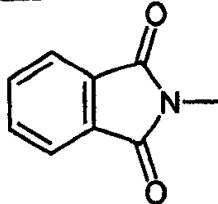
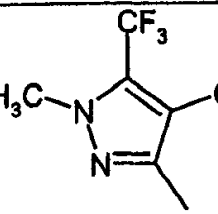
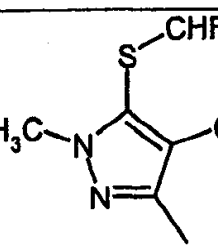
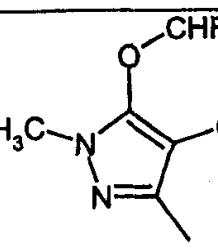
实施例号	Z	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>8</sup>	物理数据
16		F	Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 48°C
17		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 101°C
18		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	logP = 4.22 <sup>a)</sup>
19		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	m.p.: 152°C
20		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	logP = 4.11 <sup>a)</sup>
21		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	logP = 3.73 <sup>a)</sup>
22		F	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	logP = 3.49 <sup>a)</sup>

表 1 中给出的  $\log P$  值是按照 EEC Directive 79/831 Annex V.A8 通过 HPLC(高效液相色谱法)在反相柱(C18)上测定的, 温度:  $43^{\circ}\text{C}$ 。

(a) 用于在酸性范围内测定的流动相: 0.1%磷酸水溶液, 乙腈; 从 10%乙腈到 90%乙腈的线性梯度——相应的试验结果在表 1 中用 a) 标记。

(b) 用于在中性范围内测定的流动相: 0.01M 磷酸盐缓冲水溶液, 乙腈; 从 10%乙腈到 90%乙腈的线性梯度——相应的试验结果在表 1 中用 b) 标记。

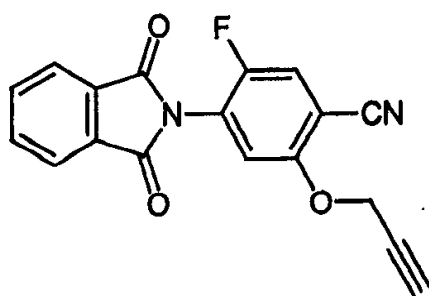
校正 10 是用具有已知  $\log P$  值的非支化的烷-2-酮(具有 3-16 个碳原子)进行的( $\log P$  值是用两个连续的烷酮之间的线性内极化通过保留时间测定的)。

$\lambda_{\max}$  值是借助在色谱信号的最大值内 200nm 到 400nm 的 UV 光谱测定的。

15

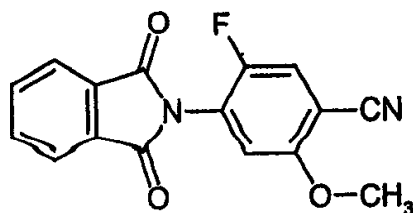
式(II)的起始原料:

实施例(II-1)



20

步骤 1



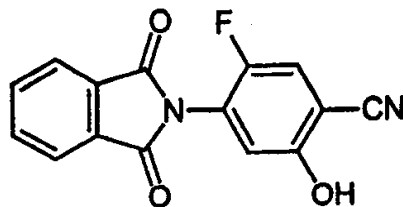
将 8.0g (50mmol) 的 4-氟基-2-氟-5-甲氧基-苯胺、7.4g (50mmol) 的邻苯二甲酸酐和 150ml 的甲醇的混合物加热回流 2 天。然后加入 0.8g 的 4-二甲基氨基-吡啶, 并将混合物再加热回流 24 小时。然后将混合物浓缩, 残留物与水和乙酸乙酯混合, 通过吸滤分离沉淀的产物, 用水洗

5

涤。  
由此给出了 11.2g (理论量的 76%) 的 N-(2-氟-4-氟基-5-甲氧基-苯基)-邻苯二甲酰亚胺, 熔点 245°C (logP:2.51)。

### 步骤 2

10



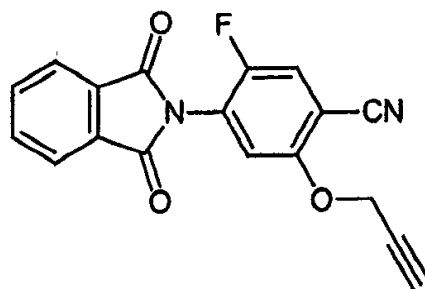
将 10.6g (35.8mmol) 的 N-(2-氟-4-氟基-5-甲氧基-苯基)邻苯二甲酰亚胺先加入到 300ml 二氯甲烷中, 在 10-20°C 下滴加 107ml (107mmol) 的三溴化硼 (1M 在二氯甲烷中)。将混合物在 250°C 搅拌 2 天, 与水混

15

合, 再搅拌 10 分钟, 并通过吸滤分离固体产物。  
由此给出了 9.2g (理论量的 91%) 的 N-(2-氟-4-氟基-5-羟基-苯基)-邻苯二甲酰亚胺, 熔点 247°C (logP:2.04)。

### 步骤 3

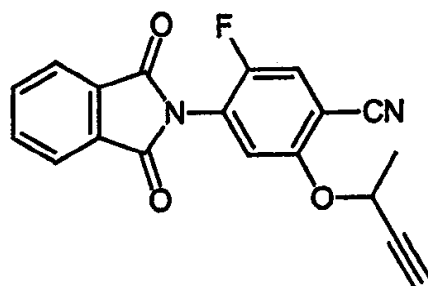
20



将 3.0g(10.6mmol)的 N-(2-氟-4-氰基-5-羟基-苯基)-邻苯二甲酰亚胺、100ml 的乙腈、1.91g(13.8mmol)的碳酸钾和 1.39g(11.7mmol)的溴丙炔的混合物加热回流 18 小时。然后将混合物浓缩,残留物与乙酸乙酯和 2N 盐酸混合,通过吸滤分离沉淀的产物。

5 由此给出了 1.8g(理论量的 52.9%)的 N-(2-氟-4-氰基-5-炔丙基氧基-苯基)-邻苯二甲酰亚胺,熔点 242℃。

### 实施例(II-2)



10

将 1.0g(3.55mmol)的 N-(2-氟-4-氰基-5-羟基-苯基)-邻苯二甲酰亚胺先与 1.02g(3.9mmol)的三苯基膦和 0.30g(4.26mmol)的丁-3-炔-2-醇加入到 40ml 的四氢呋喃中,用冰冷却(最高 20℃)下,加入 0.70g(3.9mmol)的偶氮二羧酸二乙酯(溶于 20ml 的四氢呋喃中)。将混

15

合物在 25℃ 搅拌 24 小时,浓缩,在硅胶上用环己烷/乙酸乙酯 2:1 纯化。由此给出了 0.35g(理论量的 29%)的 N-[2-氟-4-氰基-5-(丁-1-炔-3-基)-氧基-苯基]-邻苯二甲酰亚胺,熔点 170℃ (logP:2.92)。

### 应用实施例

20

#### 实施例 A

芽前试验

溶剂: 5 份重量丙酮

乳化剂: 1 份重量的烷芳基聚乙二醇醚

25

制备适合的活性化合物制剂时,将 1 份重量的活性化合物与所述的溶剂混合,将所述量的乳化剂加入,并用水将此乳油稀释至所需



浓度。

将试验植物的种子播入通常的土壤中，约 24 小时后，土壤用活性化合物制剂浇水，在每单位面积上施用特定量的活性成分。选择喷雾液的浓度，使所需的活性化合物的特定量以 1000 升水/公顷的喷雾量施用。

三周后，将植物的损害程度与未处理对照的发育相比较，目测定出损害%。

数值的含义如下：

0%=无作用(与未处理相同)

100%=完全破坏

在此试验中，例如，制备实施例 1、3、5、7、10、12、13 和 16 的化合物对杂草显示出非常强的活性，并且它们中的一些被作物如玉米、大豆和甜菜很好地耐受。

### 实施例 B

#### 芽后试验

溶剂： 5 份重量丙酮

乳化剂： 1 份重量的烷芳基聚乙二醇醚

制备适合的活性化合物制剂时，将 1 份重量的活性化合物与所述量的溶剂混合，将所述量的乳化剂加入，并用水将此乳油稀释至所需浓度。

向株高 5-15 厘米的试验植物按单位面积喷雾施用一定量的所需活性化合物制剂。选择喷雾液的浓度，使所需化合物的特定量以 1,000 升水/公顷的量施用。

三周后，将植物的损害程度与未处理对照相比较，定出损害%。

数值的含义如下：

0%=无作用(与未处理相同)

100%=完全破坏

在此试验中，制备实施例 2、3、5、10、11、13 和 16 的化合物对杂草显示出非常强的活性，并且它们中的一些被作物如小麦很好地耐受。