

[19]中华人民共和国专利局

[51]Int.Cl⁶

A01N 47/36

C07D401/12



[12] 发明专利说明书

[21] ZL 专利号 92101031.1

[45]授权公告日 1998 年 4 月 15 日

[11] 授权公告号 CN 1038012C

[22]申请日 92.1.24 [24]颁证日 98.1.24

[21]申请号 92101031.1

[30]优先权

[32]91.1.24 [33]JP[31]85718/91

[32]91.7.12 [33]JP[31]265553/91

[73]专利权人 石原产业株式会社

地址 日本大阪市

[72]发明人 坂下信行 中岛俊雄 村井重夫

吉田常象 中村裕治 本泽彰一

[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 汪 洋

[56]参考文献

EP451468 1991.10.16 C07D401/12

EP451468 1991.10.16 C07D401/12

US4946494 1990.8.7 C07D401/12

USA946494 1990.8.7 C07D401/12

审查员 43 02

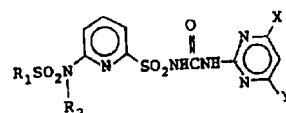
权利要求书 2 页 说明书 46 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 含有取代的吡啶磺酰胺化合物或其盐的
除草剂

[57]摘要

本发明公开了由通式 (I) 表示的取代的吡啶磺酰胺化合物或它的盐:

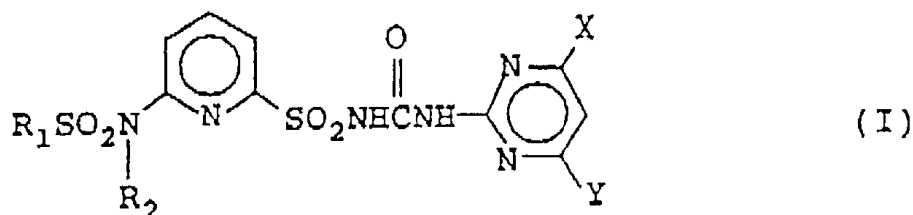
其中: R_1 和 R_2 可以各自地选自未取代或取代的烷基、未取代或取代的链烯基、未取代或取代的环烷基和未取代或取代的苯基, 或者彼此结合形成 $-(CH_2)_n-$, 其中 n 为 2—5 的整数; X 和 Y 可以各自地选自烷基和烷氧基。该化合物作为除草剂的有效成分, 即使在小的用量时就显示了广谱的杂草控制范围。



(I)

权 利 要 求 书

1.含有由下列通式(I)表示的取代的吡啶磺酰胺化合物或它的盐作为有效成份的除草剂:



其中, R_1 和 R_2 可以各自独立地选自可被一个或多个卤素或 C_{1-6} 烷氧基取代的 C_{1-6} 烷基、可被一个或多个卤素或 C_{1-6} 烷氧基取代的 C_{2-6} 链烯基、可被一个或多个卤素、 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基取代的 C_{3-6} 环烷基、可被一个或多个卤素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 卤代烷基或硝基取代的苯基、或者彼此结合形成 $-(CH_2)_n$ -基团, 其中, n 是 2-5 的整数; X 和 Y 可以各自独立地选自 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷氧基。

2.根据权利要求 1 的除草剂, 其中 R_1 和 R_2 可以各自独立地选自可被一个或多个卤素或 C_{1-6} 烷氧基取代的 C_{1-6} 烷基, 可被一个或多个卤素、 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基取代的 C_{3-6} 环烷基, X 和 Y 可以各自独立地选自 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷氧基。

3.根据权利要求 1 的除草剂, 其中 R_1 和 R_2 可以各自独立地选自 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 卤代烷基和 C_{3-6} 环烷基, X 和 Y 可以各自独立地选自 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷氧基。

4.根据权利要求 1 的除草剂, 其中所说的有效成份是 6-[(N-乙基-N-甲磺酰基)氨基]-N-[[(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]羰基]-2-吡啶磺酰胺化合物。

5.根据权利要求 1 的除草剂, 其中所说的有效成份是 6-[(N-乙基

-N-乙基磺酰基)氨基]-N-[[[4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]羰基]-2-吡啶磺酰胺化合物。

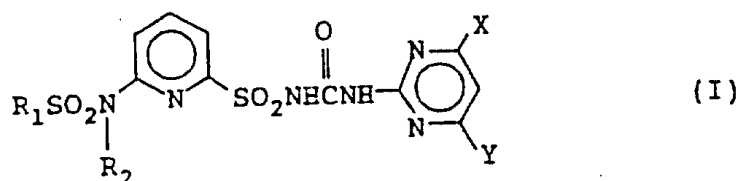
6.根据权利要求 1 的除草剂，其中所说的有效成份是 6-[(N-乙基-N-异丙基磺酰基)氨基]-N-[[[4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]羰基]-2-吡啶磺酰胺化合物。

含有取代的吡啶磺酰胺化合物或其盐的除草剂

本发明涉及一种新的吡啶磺酰胺化合物或其盐、它们的制备方法、以及含上述化合物的除草剂。

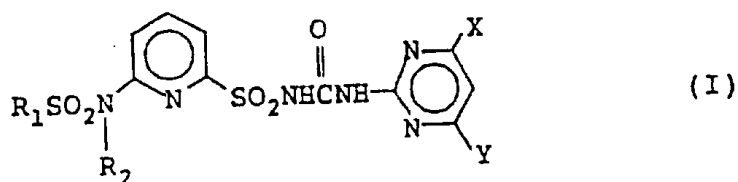
U.S. 专利NO. 4, 946, 494公开了一种吡啶磺酰脲类衍生物作为除草组合物的有效成份。该衍生物在化学结构上不同于本申请的化合物之处，在于吡啶环上6位取代基的不同。

本发明的一个方面给出了一种取代的吡啶磺酰胺化合物或它的盐，用下述通式(I)表示：

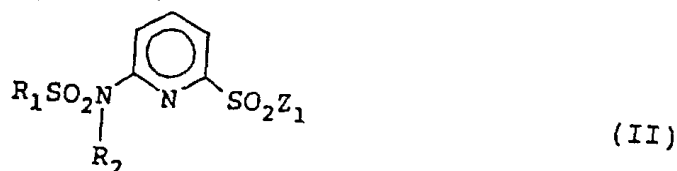


其中， R_1 和 R_2 可以各自地选自未取代或取代的烷基、未取代或取代的链烯基、未取代或取代的环烷基和未取代或取代的苯基，或者彼此结合形成 $-(\text{CH}_2)_n-$ ，其中， n 是2—5的整数； X 与 Y 可以各自地选自烷基和烷氧基。

本发明的另一方面给出了制备下述通式(I)表示的取代的吡啶磺酰胺化合物或它的盐的方法：

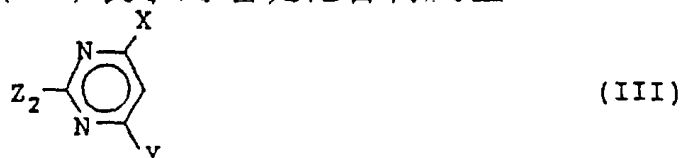


其中, R_1 和 R_2 可以各自地选自未取代或取代的烷基、未取代或取代的链烯基、未取代或取代的环烷基、未取代或取代的苯基, 或者彼此结合形成 $-(CH_2)_n-$, 其中, n 是2—5的整数; X 与 Y 可以各自地选自烷基、烷氧基。该方法包括由通式(II)表示的取代的吡啶化合物:



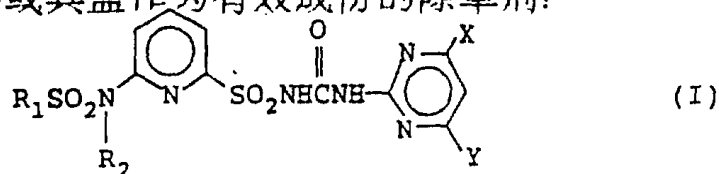
其中, R_1 、 R_2 的定义如上; Z_1 选自 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NCO}$ 和 $-\text{NHCO}_2\text{R}_3$, 其中 R_3 为烷基或芳基;

与由通式(III)表示的嘧啶化合物反应:



其中, X 和 Y 的定义如上; 当 Z_1 为 $-\text{NCO}$ 或 $-\text{NHCO}_2\text{R}_3$ 时, Z_2 为 $-\text{NH}_2$; 当 Z_1 是 $-\text{NH}_2$ 时, Z_2 选自 $-\text{NCO}$ 或者 $-\text{NHCO}_2\text{R}_3$, 其中 R_3 定义如上。

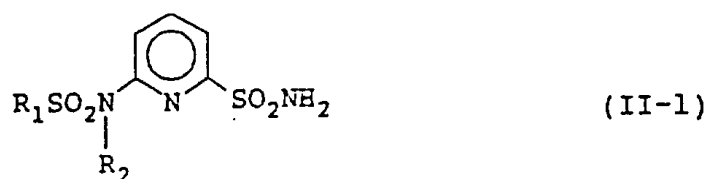
本发明的另一方面给出了含有由通式(I)表示的取代的吡啶磺酰胺化合物或其盐作为有效成份的除草剂:



其中, R_1 和 R_2 可以各自选自未取代或取代的烷基、未取代或取代的链烯基、未取代或取代的环烷基、未取代或取代的苯基, 或者彼此结合形成 $-(CH_2)_n-$ 基, 其中, n 是2—5的整数; X 和 Y 可以各自选自烷基和烷氧基。

本发明更进一步给出了一种取代的吡啶化合物, 由通式(II—1)

表示:



其中, R_1 和 R_2 可以各自选自未取代或取代的烷基、未取代或取代的链烯基、未取代或取代的环烷基、未取代或取代的苯基, 或者彼此结合形成 $-(\text{CH}_2)_n-$, 其中 n 是2—5的整数。

本发明现详述如下。

在通式(I)化合物有关 R_1 、 R_2 的定义中, 取代烷基和取代链烯基的取代基包括卤素、烷氧基等等; 取代环烷基的取代基包括卤素、烷基、烷氧基等等; 取代苯基的取代基包括卤素、烷基、卤代烷基、硝基等等。在这些被取代基团上所含取代基的数目可为1、2或更多, 在此情况下, 取代基团可以相同或不同。如果用 R_1 和 R_2 所定义的可含有如上面所提到的这些取代基中进一步含有的取代基, 这种限定同样适用于这些情况。

在通式(I)中, R_1 及 R_2 表示中包括的烷基及烷基部份、 X 和 Y 包括含1—6个碳原子, 如甲基、乙基、丙基、丁基、戊基和己基, 并且可为直链或支链的脂肪链结构异构体。有关 R_1 和 R_2 的表示中所包括链烯基是含有2—6个碳原子, 如乙烯基、丙烯基、丁烯基、戊烯基、己烯基, 并且可为直链或支链的脂肪链结构异构体。在 R_1 和 R_2 的表示中所包括环烷基有含有3—6个碳原子, 如环丙基、环丁基、环戊基、环己基。在 R_1 与 R_2 表示中所包括的卤素是氟、氯、溴、碘原子。

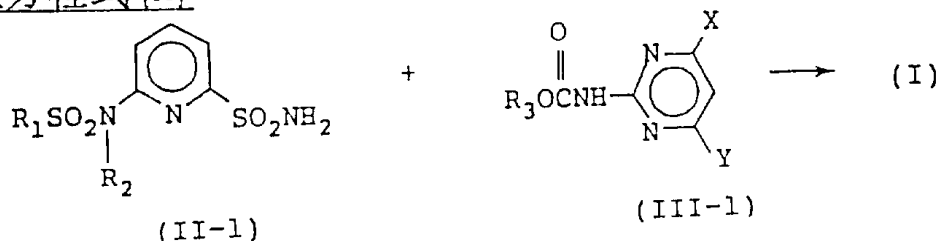
用通式(I)表示的取代的吡啶磺酰胺化合物的盐的例子包括碱

金属盐: 如钠盐和钾盐, 碱土金属盐: 如镁盐和钙盐, 以及胺盐: 如二甲胺和三乙胺。

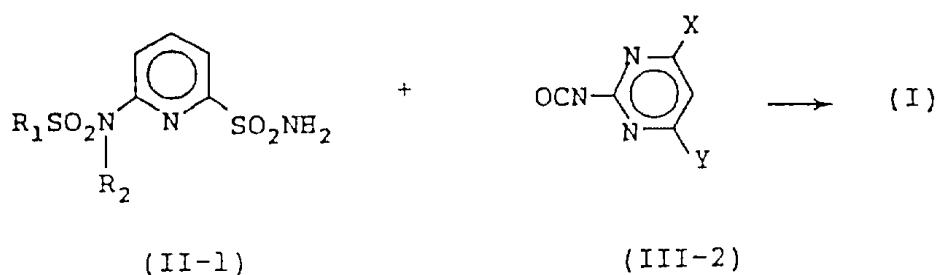
通式(I)的化合物中, 优选化合物 R_1 与 R_2 可以各自地选自未取代或取代的烷基、未取代或取代的环烷基、X与Y可以各自地选自烷基或烷氧基; 较优选的是 R_1 与 R_2 可以各自地选自烷基、卤烷基和环烷基, X与Y可以各自地选自烷基、烷氧基; 最优选的化合物指: 6-[(N-乙基-N-甲磺酰基)氨基]-N-[[(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]羰基]-2-吡啶磺酰胺 (如下面所述的化合物NO. 2), 6-[(N-乙基-N-乙磺酰基)氨基]-N-[[(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]羰基]-2-吡啶磺酰胺 (如下面所述的化合物NO. 18) 以及6-[(N-乙基-N-异丙基磺酰基)氨基]-N-[[(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]羰基]-2-吡啶磺酰胺 (如下面所述的化合物NO. 22)

可以制备用通式(I)表示的取代的磺酰胺化合物, 例如, 根据本发明的方法可用反应方程式[A]到[D]表示:

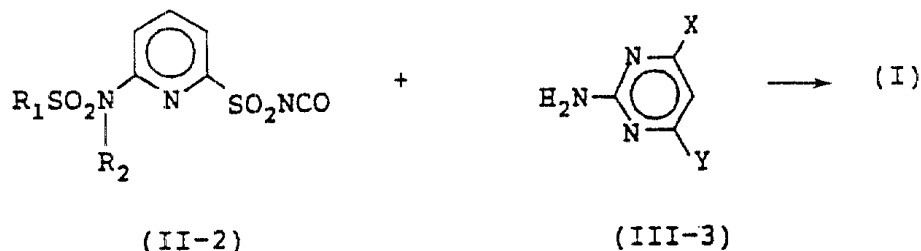
反应方程式[A]



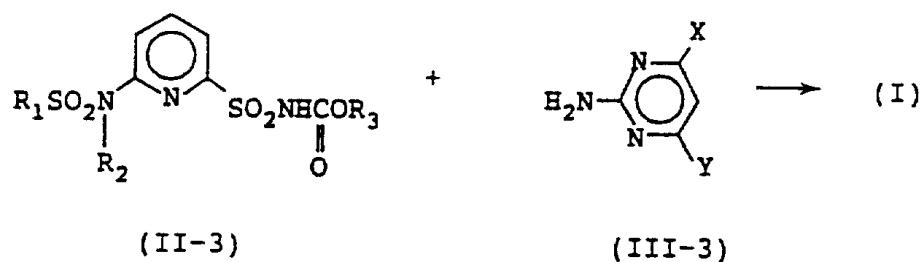
反应方程式[B]



反应方程式 [C]



反应方程式 [D]



在反应方程式 [A] 到 [D] 中， R_1 、 R_2 、 X 和 Y 定义如上， R_3 是烷基或芳基。

有关 R_3 表示中所包括的烷基，可为如上定义的与 R_1 、 R_2 、 X 与 Y 表示有关的任何烷基。 R_3 表示中的芳基，可以为苯基，至少一个氯原子取代的苯基、至少一个甲基取代的苯基、萘基等。

反应 [A] 在碱的存在下完成，而必要时，反应 [B]、[C] 和 [D] 也需在碱的存在下完成。这样的碱包括三级胺，如三乙胺和 1, 8-二氮杂双环 [5 · 4 · 0] - 7-+-碳烯。

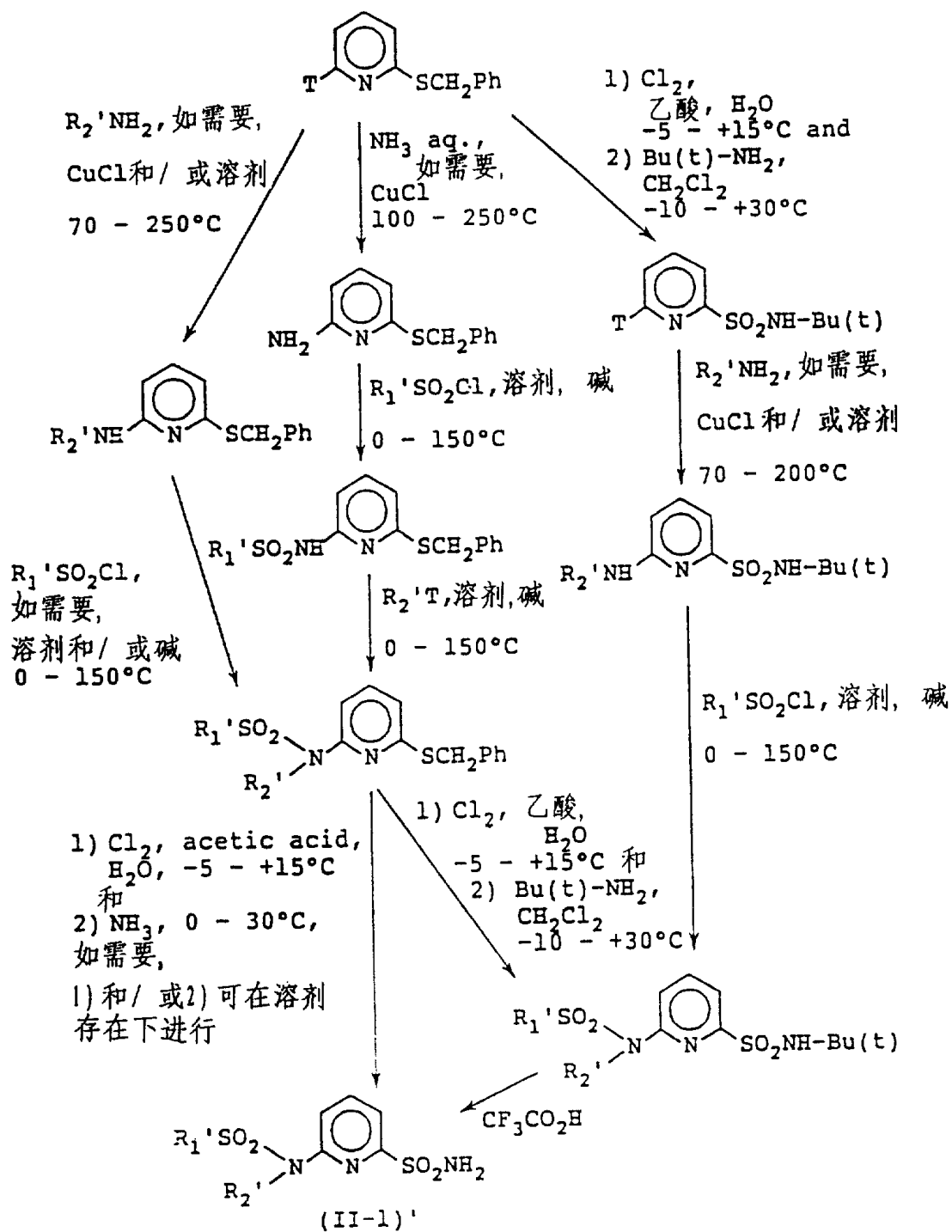
必要的话，反应 [A]、[B]、[C]、[D] 也可在溶剂的存在下进行。溶剂的例子包括未取代或取代的芳香碳氢化物如苯、甲苯、二甲苯和氯苯；未取代或取代的碳环或无环的脂肪族碳氢化物如氯仿、四氯化碳、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、环己烷；醚如：乙醚、二噁烷和四氢呋喃；腈如乙腈、丙腈和丙烯腈；酯如：乙酸

甲酯、乙酸乙酯；非质子极性溶剂如二甲亚砜和四氢噻吩砜；等

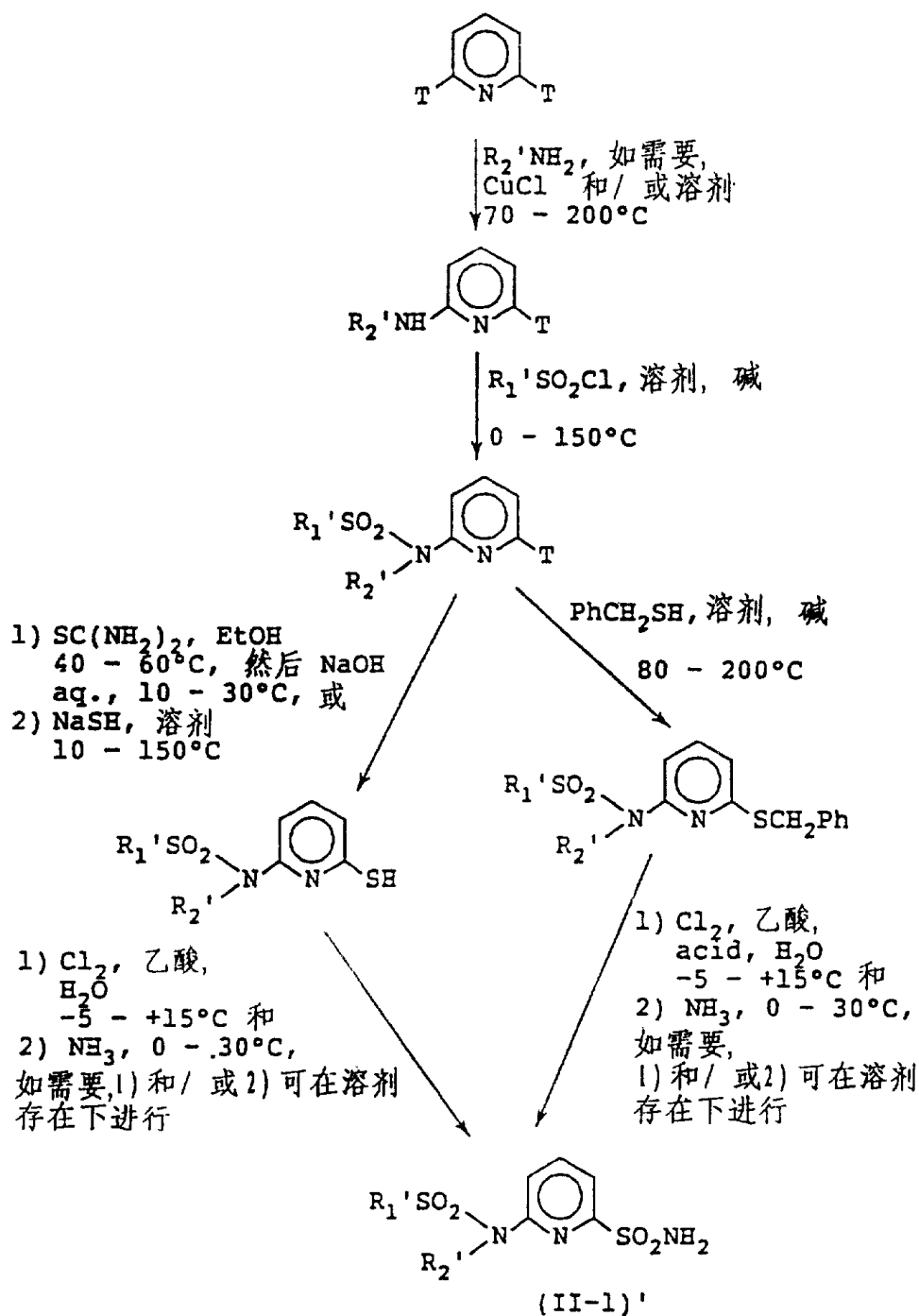
反应 [A] 的温度范围通常在 $-20-+100^{\circ}\text{C}$ ，优选范围在 $0-40^{\circ}\text{C}$ ，而反应 [A] 的反应时间通常在0.01-24小时，优选范围在0.1-1.5小时。反应 [B] 的温度范围通常在 $0-150^{\circ}\text{C}$ ，而反应 [B] 的反应时间通常在0.1-24小时。反应 [C] 的温度范围通常在 $0-150^{\circ}\text{C}$ ，而反应 [C] 的反应时间通常在0.1-24小时。反应 [D] 的温度范围通常在 $-20-150^{\circ}\text{C}$ ，而反应 [D] 的反应时间通常为0.1-24小时。

按照本发明在反应式 [A] 和 [B] 中，用通式 (II-1) 所表示的起始化合物，例如，可以按照反应方程式 [E]、[F] 和 [G] 进行合成：

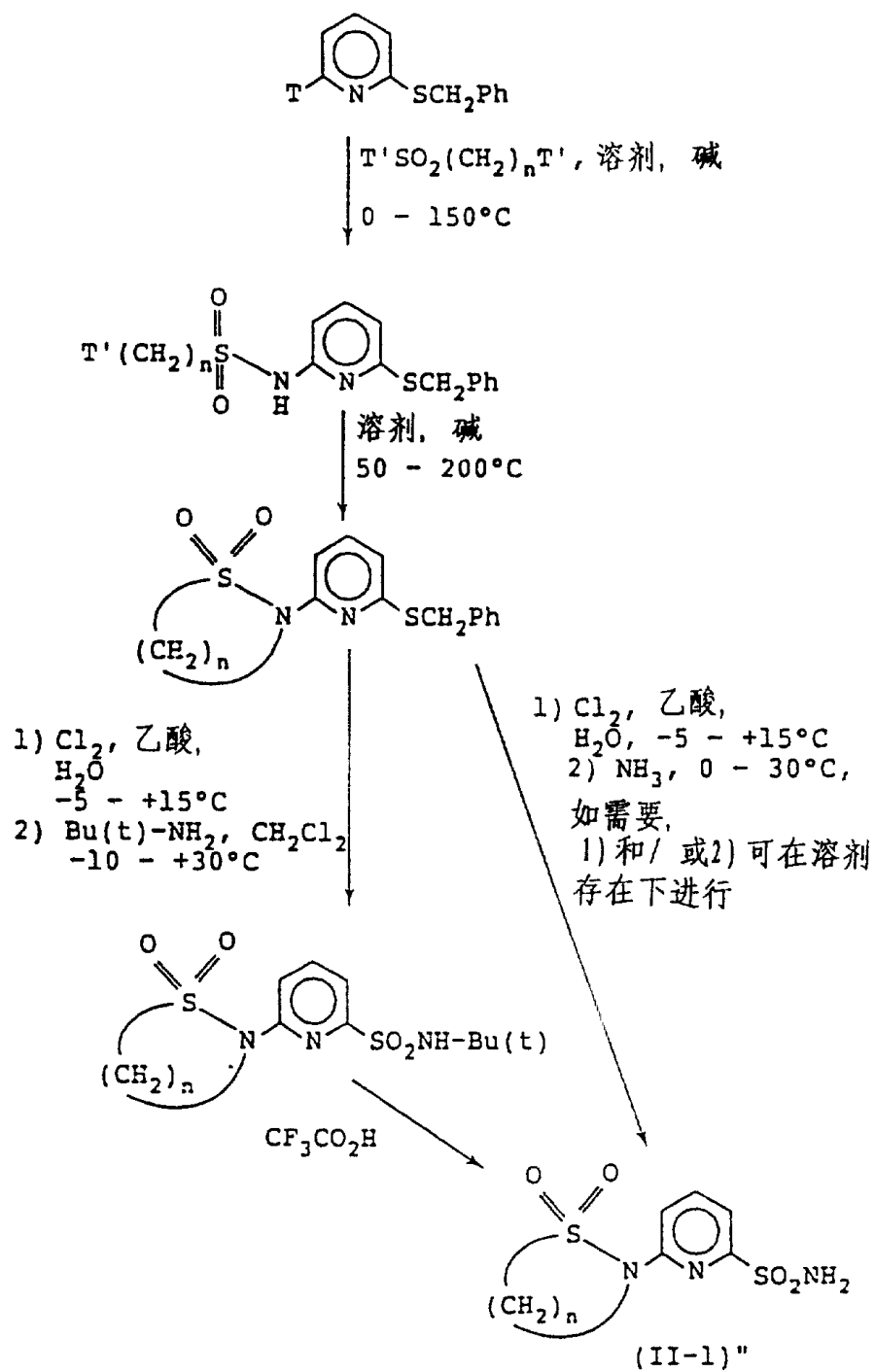
反应式 [E]



反应式 [F]



反应式 [G]

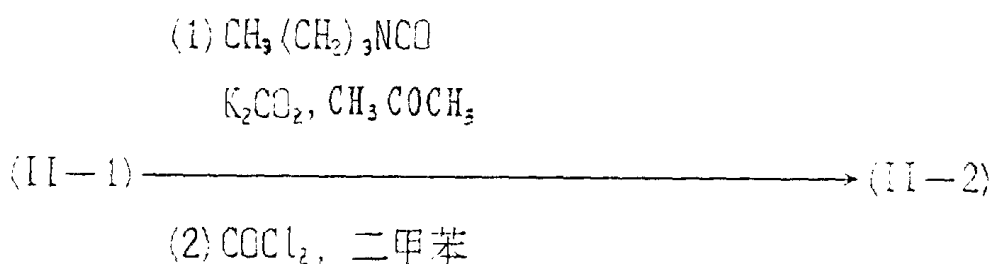


在反应式 [E]、[F] 和 [G] 中， R_1' 与 R_2' 可以各自地选自未取代或取代的烷基、未取代或取代的链烯基、未取代或取代的环烷基和未取代或取代的苯基； n 的定义同上述通式 (I) 中； T 与 T 可以各自地选自氯、溴、碘原子；Ph 代表苯基；Et 代表乙基；Bu (t) 代表叔丁基；aq. 代表水溶液。

在 R_1' 与 R_2' 表示中包括的取代烷基、链烯基、环烷基和苯基同与之相关的 R_1 与 R_2 的表示有着同样的定义。

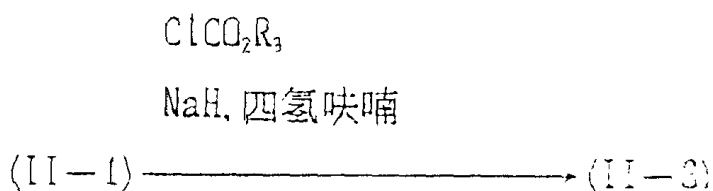
在反应式 [C] 中用式 (II-2) 所表示的起始化合物，可由下面反应式 [H] 的步骤制备：

反应式 [H]



在反应式 [D] 中由式 (II-3) 所表示的起始化合物，可由反应式 [I] 的步骤制备：

反应式 [I]



在反应式 [H] 及 [I] 中的 R_1 、 R_2 和 R_3 的定义如上所述。

反应 [E] 到 [I] 的反应条件，包括反应温度、反应时间、是否采

用溶剂、(若用的话)，所采用溶剂的数量与种类、以及所采用的碱的种类与数量，除非另外有说明，这些反应条件可以从类似的反应中作相应的选择。

以后涉及到的取代的吡啶磺酰胺化合物的盐可以按常规方法很容易地制得。

以下实施例更详细地揭示了本发明，但不应认为本发明仅限于这些实施例的范围。

合成例1

6-[(N-乙基-N-甲磺酰基)氨基]-N-[[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]羰基]-2-吡啶磺酰胺化合物的合成(即下面表2中化合物NO. 2)

1) 将13g 2-苄硫基-6-溴代吡啶，80ml氨水溶液(约40%重量)和催化量的氯化亚铜混合，在高压釜中120℃下反应4小时。

上述反应完成后，把混合物倾入水中，用二氯甲烷萃取。萃取物经水洗，无水硫酸钠干燥，减压浓缩。所得的残留物溶在展开溶剂(乙酸乙酯:己烷=1:3)中，通过硅胶色谱柱纯化，得到5.7g 2-氨基-6-苄硫基吡啶，熔点65-66℃。

2) 将5.75g 2-氨基-6-苄硫基吡啶与86ml四氢呋喃混合，再加入1.67g粉状KOH，在室温下搅拌，反应混合物用冰冷却，滴加6.10g甲基磺酰氯于冰冷的混合物，接着在室温下搅拌过夜。

上述反应完成后，把反应混合物倾入水中，用二氯甲烷萃取，萃取物用无水硫酸钠干燥，减压浓缩。所得残留物溶在一展开剂中(乙酸乙酯:己烷=1:1)，通过硅胶色谱柱纯化，得到1.5g N-(6-

苄硫基吡啶-2-基) 甲基磺酰胺化合物, 熔点123—125℃。

3) 在步骤2) 中得到的1.0gN-(6-苄硫基吡啶-2-基) 甲基磺酰胺化合物与15ml的四氢呋喃混合, 所得混合物用冰冷却, 再加入0.15g60%(重量)的氢化钠, 在室温下搅拌, 然后加入3.56g碘代乙烷于混合物中, 所得混合物在加热回流下反应过夜。

上述反应完成后, 把反应混合物倒入水中, 用盐酸轻微酸化, 用二氯甲烷萃取, 萃取物用无水硫酸钠干燥并减压浓缩。残留物溶入一展开溶剂中(乙酸乙酯: 己烷=1: 1), 通过硅胶色谱柱纯化, 得到0.8gN-(6-苄硫基吡啶-2-基)-N-乙基甲基磺酰胺化合物的白色结晶。

4) 在上述步骤3) 中得到的0.8gN-(6-苄硫基吡啶-2-基)-N-乙基甲基磺酰胺与10ml乙酸及10ml水混合, 所得混合物在-5—0℃冷却, 接着在冷的混合物中通入氯气以完成反应。

反应完成后, 把反应混合物倾入水中, 用二氯甲烷萃取。萃取物经水洗涤, 无水硫酸钠干燥后, 通入氨气, 在室温反应1小时。

反应完成后, 将反应混合物过滤。滤液经减压浓缩后静置。固体残留物用乙酸乙酯及正己烷洗涤, 得到0.62g6-[(N-乙基-N-甲基磺酰基)氨基]-2-吡啶磺酰胺化合物。(下表1给出的中间化合物NO. 2)。熔点为140—143℃。

5) 在上面步骤(4) 中得到的0.2g6-[(N-乙基-N-甲基磺酰基)氨基]-2-吡啶磺酰胺化合物与0.2g的(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基甲酸苯酯及7ml乙腈混合。所得混合物进一步与0.11g 1, 8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯混合, 在室温下反应1小时。

反应完成后，把反应混合物倾入水中，用盐酸轻微酸化。所得固体过滤，水洗、干燥，得到0.25g所要求产物(化合物NO. 2)，熔点145—147℃。

合成例2

6—[(N—乙基—N—乙基磺酰基)氨基]—N—[[(4, 6—二甲氧基嘧啶—2—基)氨基]羰基]—2—吡啶磺酰胺化合物的合成(下面给出的表2中化合物NO. 18)

1) 将2.0g 2—氨基—6—苄硫基吡啶与30ml 四氢呋喃混合，进一步加入0.52g 氢氧化钾粉末混合，在室温下搅拌。所得混合物用冰冷却。滴加入2.38g 乙磺酰氯于冷的混合物中，室温下搅拌反应30分钟。

反应完成后，把反应混合物倾入水中，用二氯甲烷萃取。萃取物用无水硫酸钠干燥，减压浓缩。所得的残留物溶入一展开溶剂中(乙酸乙酯：己烷=1：1)，通过硅胶色谱柱纯化，得到0.90g N—(6—苄硫基吡啶—2—基)乙基磺酰胺化合物，熔点87—92℃

2) 将在上面步骤1)中得到的0.85g N—(6—苄硫基吡啶—2—基)乙基磺酰胺化合物与15ml 四氢呋喃混合。所得混合物用冰冷却后加入0.13g 60重量%的氢化钠，接着在室温下搅拌。然后，向混合物中加入2.0g 碘代乙烷，得到的混合物加热回流1.5小时。

反应完成后，把反应混合物倾入水中，用二氯甲烷萃取。萃取物用无水硫酸钠干燥、减压浓缩。残留物溶入展开剂中(乙酸乙酯：己烷=1：1)，通过硅胶色谱柱纯化，得到0.75g 油状的N—(6—苄硫基吡啶—2—基)—N—乙基乙磺酰胺化合物

3) 在上面步骤2) 中得到的0.75g N-(6-苄硫基吡啶-2-基)-N-乙基乙磺酰胺化合物与20ml 乙酸及15ml 水混合。所得混合物冷却到-5-0℃，接着，向被冷却的混合物中通入氯气反应。

反应完成后，将反应混合物倾入水中，用二氯甲烷萃取，萃取物用水洗，无水硫酸钠干燥后，通入氨气在室温下反应1个小时。

反应完成后，将反应混合物过滤。滤液经减压浓缩后静置。滤渣用乙酸乙酯及正己烷洗涤，得到0.60g 6-[(N-乙基-N-乙磺酰基)氨基]-2-吡啶磺酰胺化合物(下表1给出的中间体化合物NO. 17) 熔点115-118℃。

4) 将在上面步骤3) 中得到的0.21g 6-[(N-乙基-N-乙磺酰基)氨基]-2-吡啶磺酰胺化合物与0.20g (4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)-氨基甲酸苯酯及7ml 乙腈混和。所得混合物与0.11g的1, 8-二氮双环[5.4.0]-7-+-碳烯进一步混和, 在室温下反应30分钟。

反应完成后，将反应混和物倾入水中，用盐酸轻微酸化。得到固体经过滤、水洗涤后干燥，得到0.25g所需化合物(化合物NO. 18)，熔点165-170℃。

合成例3

6-[(N-乙基-N-异丙基磺酰基)氨基]-N-[[(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]羰基]-2-吡啶磺酰胺化合物的合成(下面给出的表2中化合物NO. 22)

1) 将12g的2-苄硫基-6-溴吡啶，70ml 40重量%的乙胺水溶液及催化量的氯化亚铜混合，在加压釜中，180℃下反应4小时。

反应完成后，将反应混合物倾入水中，用二氯甲烷萃取。萃取物经水洗，无水硫酸钠干燥后，减压浓缩。残留物溶于一展开溶剂中(乙酸乙酯:己烷=1:10)，通过硅胶色谱柱纯化，得到5.5g油状的2-苄硫基-6-乙胺基吡啶。

2) 将在上面步骤1)中得到的2.0g 2-苄硫基-6-乙胺基吡啶与2.33g异丙基磺酰氯混合反应，在80-100℃下搅拌一夜。

反应完成后，二氯甲烷加到反应混合物中。所得混合物经水洗、无水硫酸钠干燥后，减压浓缩。残留物溶于一展开剂中(乙酸乙酯:己烷=1:10)，通过硅胶色谱柱纯化，得到0.20g的油状N-(6-苄硫基吡啶-2-基)-N-乙基异丙基磺酰胺化合物。

3) 在上面步骤(2)中得到的0.20g N-(6-苄硫基吡啶-2-基)-N-乙基异丙基磺酰胺化合物与25ml乙酸及20ml水混合。所得混合物冷却到-5-0℃。通入氯气到冷的混合物中进行反应。

反应完成后，反应混合物倾入水中，用二氯甲烷萃取。萃取物经水洗、无水硫酸钠干燥后，通入氨气在室温下反应30分钟。

反应完成后，将反应混合物过滤，滤液减压浓缩，所得的残留物溶于一展开剂中(乙酸乙酯:己烷=3:1)，通过硅胶色谱柱纯化，得到0.12g油状6-[(N-乙基-N-异丙基磺酰基)氨基]-2-吡啶磺酰胺化合物(下面表1给出的中间化合物NO. 21)

4) 在上面步骤3)中得到的0.12g 6-[(N-乙基-N-异丙基磺酰基)氨基]-2-吡啶磺酰胺化合物与0.11g的(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基)-氨基甲酸苯酯及7ml乙腈混合，与59mg 1, 8-二氮杂双环[5.4.0]-7-+-碳烯进一步混合，在室温下反应30分钟。

反应完成后，反应混合物倾入水中，用盐酸轻微酸化，用二氯甲烷萃取。萃取物用无水硫酸钠干燥、减压浓缩。所得残留物溶于一展开剂中(乙酸乙酯:己烷=4:1)，通过硅胶色谱柱纯化，得到0.11g所需化合物(化合物NO. 22)，其熔点为163—166℃。

由通式(II-1)表示的中间化合物的代表例在表1中给出，其制备方法与上述合成例描述实质上相同，而由通式(I)表示的本发明的取代磺酰胺化合物的代表例在表2中给出，其制备方法与上述合成例描述实质上相同。

表1

中间化合物			物理性质
No.	R ₁	R ₂	m.p. (°C)
1	CH ₃	CH ₃	118-119
2	CH ₃	C ₂ H ₅	140-143
3	CH ₃	n-C ₃ H ₇	100-104
4	C ₂ H ₅	CH ₃	
5	CF ₃	CH ₃	
6	CF ₃	C ₂ H ₅	148-151
7	CF ₃	n-C ₃ H ₇	142-145
8	CF ₃	n-C ₄ H ₉	138-140
9	CH ₃	iso-C ₃ H ₇	179-181
10	CF ₃	iso-C ₃ H ₇	
11	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	130-133
12	环丙基	CH ₃	132-134
13	CH ₃	环丙基	
14	—(CH ₂) ₃ —		224-229
15	—(CH ₂) ₄ —		175-176
16	—(CH ₂) ₅ —		
17	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	115-118
18	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇	111-115
19	n-C ₃ H ₇	CH ₃	油状物
20	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	125-128
21	iso-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	油状物

表1(继续)



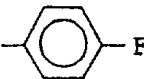
中间化合物 No.			物理性质
	R ₁	R ₂	m.p. (°C)
22	n-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	70-73
23	叔 -C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	
24	n-C ₆ H ₁₃	C ₂ H ₅	
25	CH ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	108-109
26	(CH ₂) ₃ Cl	C ₂ H ₅	oily substance
27	(CH ₂) ₃ CF ₃	C ₂ H ₅	
28	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
29	CH(CH ₃)CH ₂ OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
30	CH=CH ₂	CH ₃	
31	CH=CH ₂	C ₂ H ₅	75-79
32	CH=CHCF ₃	C ₂ H ₅	
33	环己基	C ₂ H ₅	123-124
34	环丙基	C ₂ H ₅	137-139
35	C ₂ H ₅	环丙基	
36	环戊基	C ₂ H ₅	油状物
37		CH ₃	96-99
38		C ₂ H ₅	油状物
39		CH ₃	油状物

表1(继续)

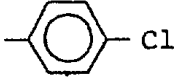
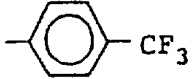
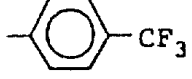
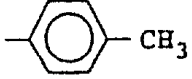
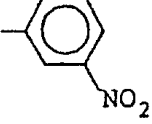
中间化合物 No.	R ₁	R ₂	物理性质 m.p. (°C)
40		C ₂ H ₅	油状物
41		CH ₃	油状物
42		C ₂ H ₅	98-100
43		C ₂ H ₅	
44		C ₂ H ₅	185-188
45	仲-C ₄ H ₉	CH ₃	95-96
46	仲-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	油状物
47	仲-C ₄ H ₉	n-C ₃ H ₇	
48	仲-C ₄ H ₉	异-C ₃ H ₇	
49	异-C ₃ H ₇	n-C ₃ H ₇	油状物
50	异-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	油状物
51	n-C ₄ H ₉	CH ₃	油状物
52	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	油状物
53	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	油状物
54	CH ₃	CHF ₂	126-128
55	C ₂ H ₅	CHF ₂	106-109
56	环己基	CH ₃	油状物

表1(继续)

中间化合物 No.	R ₁	R ₂	物理性质 m.p. (°C)
57	叔 -C ₄ H ₉	CH ₃	
58	CH ₃	CH ₂ CF ₃	
59	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃	
60	异-C ₃ H ₇	CH ₂ CF ₃	
61	C ₂ H ₅	异 -C ₃ H ₇	183-185
62	n-C ₃ H ₇	异 -C ₃ H ₇	
63	环丙基	n-C ₃ H ₇	
64	n-C ₃ H ₇	环丙基	
65	CH ₃	n-C ₄ H ₉	
66	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉	
67	n-C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	
68	异 -C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	
69	CH ₃	仲-C ₄ H ₉	
70	C ₂ H ₅	仲-C ₄ H ₉	
71	n-C ₃ H ₇	仲 -C ₄ H ₉	
72	异 -C ₃ H ₇	仲-C ₄ H ₉	
73	CH ₃	异-C ₄ H ₉	
74	C ₂ H ₅	异-C ₄ H ₉	
75	n-C ₃ H ₇	异-C ₄ H ₉	
76	异 -C ₃ H ₇	异-C ₄ H ₉	
77	n-C ₃ H ₇	n-C ₃ H ₇	
78	异 -C ₃ H ₇	异-C ₃ H ₇	

表1(继续)

中间化合物 No.	R ₁	R ₂	物理性质
			m.p. (°C)
79	环丙基	异-C ₃ H ₇	
80	异 -C ₄ H ₉	CH ₃	
81	环丁基	CH ₃	142-144
82	环丁基	C ₂ H ₅	油状物
83	环丁基	n-C ₃ H ₇	
84	环丁基	异-C ₃ H ₇	
85	异-C ₄ H ₉	n-C ₃ H ₇	
86	异-C ₄ H ₉	异 -C ₃ H ₇	
87	n-C ₄ H ₉	n-C ₃ H ₇	
88	n-C ₄ H ₉	异-C ₃ H ₇	

表2

化合物 No.	R ₁	R ₂	X	Y	物理性质 m.p. (°C)
1	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	176-177
2	CH ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	145-147
3	CH ₃	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	85-88
4	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	161-163
5	CF ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	粘性物
6	CF ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	179-180
7	CF ₃	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	159-161
8	CF ₃	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	116-118
9	CH ₃	异-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	132-138
10	CF ₃	异-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
11	异-C ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	143-146
12	环丙基	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	164-168
13	CH ₃	环丙基	OCH ₃	OCH ₃	
14	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	
15	$-(\text{CH}_2)_3-$		OCH ₃	OCH ₃	191-194
16	$-(\text{CH}_2)_4-$		OCH ₃	OCH ₃	182-185
17	$-(\text{CH}_2)_5-$		OCH ₃	OCH ₃	
18	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	165-170
19	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	140-143

表2(继续)



化合物 No.	R ₁	R ₂	X	Y	物理性质 m.p. (°C)
20	n-C ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	175-178
21	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	151-154
22	异-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	163-166
23	n-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	155-158
24	叔-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	
25	n-C ₆ H ₁₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	
26	CH ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	184-185
27	(CH ₂) ₃ Cl	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	156-159
28	(CH ₂) ₃ CF ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	
29	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	
30	CH(CH ₃)CH ₂ OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	
31	CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	150-152
32	CH=CH ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	145-148
33	CH=CHCF ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	
34	环己基	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	148-149
35	环丙基	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	169-172
36	C ₂ H ₅	环丙基	OCH ₃	OCH ₃	
37	环戊基	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	135-138
38		CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	170-174
39		C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	142-145

表2(继续)

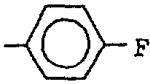
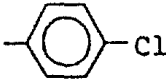
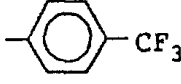
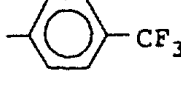
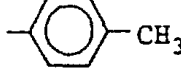
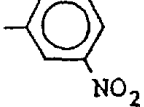
化合物 No.	R ₁	R ₂	X	Y	物理性质
					m.p. (°C)
40		CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	193-197
41		C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	166-169
42		CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	122-124
43		C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	157-160
44		C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	
45		C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	161-164
46	仲-C ₄ H ₉	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	153-154
47	仲-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	136-137
48	仲-C ₄ H ₉	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
49	仲-C ₄ H ₉	异-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
50	异-C ₃ H ₇	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	163-166
51	异-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	150-153
52	n-C ₄ H ₉	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	175-177
53	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	139-140
54	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	158-159

表2(继续)

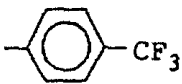
化合物 No.	R ₁	R ₂	X	Y	物理性质 m.p. (°C)
55	CH ₃	CHF ₂	OCH ₃	OCH ₃	155-157
56	C ₂ H ₅	CHF ₂	OCH ₃	OCH ₃	157-159
57	环己烷基	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	164-165
58		CH ₃	CH ₃	CH ₃	93-95
59	叔 -C ₄ H ₉	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	125-129
60	CH ₃	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	OCH ₃	
61	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	OCH ₃	
62	异 -C ₃ H ₇	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	OCH ₃	
63	C ₂ H ₅	异 C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
64	n-C ₃ H ₇	异 C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
65	环丙基	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
66	n-C ₃ H ₇	环丙基	OCH ₃	OCH ₃	
67	CH ₃	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
68	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
69	n-C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
70	异 -C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
71	CH ₃	仲-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
72	C ₂ H ₅	仲-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
73	n-C ₃ H ₇	仲-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
74	异 -C ₃ H ₇	仲-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	

表2(继续)

化合物 No.	R ₁	R ₂	X	Y	物理性质
					m.p. (°C)
75	CH ₃	异-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
76	C ₂ H ₅	异-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
77	n-C ₃ H ₇	异-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
78	异-C ₃ H ₇	异-C ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	
79	n-C ₃ H ₇	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
80	异-C ₃ H ₇	异-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
81	环丙基	异-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
82	异-C ₄ H ₉	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	
83	环丁基	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	167-169
84	环丁基	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	169-170
85	环丁基	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
86	环丁基	异-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
87	异-C ₄ H ₉	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
88	异-C ₄ H ₉	异-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
89	n-C ₄ H ₉	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
90	n-C ₄ H ₉	异-C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	
91	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	
92	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	
93	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	
94	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	
95	异-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	
96	异-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	

表 2(继续)

化合物 No.	R ₁	R ₂	X	Y	物理性质 m.p. (°C)
97	环丙基	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	
98	环丙基	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	
99	仲-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	
100	仲-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	
101	C ₂ H ₅	异-C ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	
102	C ₂ H ₅	异-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	

从下面所给的实施例中看出，本发明的取代吡啶磺酰胺化合物或它的盐，作为除草剂的有效成份，在一低剂量下，显示出广谱除草效能，并且对大豆、小麦、棉花等是安全的。

本发明的除草剂适用于很多场合，包括农田象山地、果园和桑园，非农田象森林、农场公路、操场及工场。本发明除草剂使用方法可选择施用于土壤中或施用于叶子上。本发明的除草剂可以采用粉末、颗粒、水分散性颗粒、可湿性的粉末、浓缩乳剂、可溶性浓缩物及悬浮浓缩物的形式。其制法通常为将本发明的取代吡啶磺酰胺化合物或它的盐作为有效成份与一载体混合，若必要，进一步与其它辅助剂如选自稀释剂、溶剂、乳化剂、分散剂、表面活性剂等混合。活性组份对农业辅助剂混合的适当的重量比在1：99到90：10范围内。最好在5：95到80：20范围内。有效成份合适的用量不能明确固定，这是因为用量随气候条件、土壤条件、上面所提的配方形式，杂草的种类，施用的季节等而变化。然而，有效成份通常用量范围为0.005g-50g/a (are) (公亩)，优选为0.01-10g/a (公亩)，较优选为0.05-5g/a (公亩)。

本发明的除草剂可为混合物，或与至少一种成分或组份结合，这些组份选自农药、农业辅助剂，光毒性还原剂等等，这样有时可改善效果和功能。本发明的除草剂可为一混合物，或与另一除草剂结合使用，在这种情况下，有时可起到协同作用。

另一除草剂举例如下：

苯氧基丙酸酯类化合物例如

* (±) - 2 - [4 - [(6 - 氯 - 2 - 喹喔啉基) 氧] 苯氧基] 丙酸乙酯

(俗名: quizalofop-ethyl)

* (\pm) -2-[4-[(6-氯-2-苯并噁唑基) 氧] 苯氧基] 丙酸乙酯 (俗名: fenoxaprop-ethyl)

* (\pm) -2-[4-[[5-(三氟甲基)-2-吡啶] 氧] 苯氧基] 丙酸丁酯 (俗名: fluazifop-butyl)

*2-[4-[[3-氯-5-(三氟甲基)-2-吡啶] 氧] 苯氧基] 丙酸甲酯 (俗名: haloxyfop-methyl)

*2-[4-[[3-氯-5-(三氟甲基)-2-吡啶] 氧] 苯氧基] 丙酸2-乙氧基乙酯 (俗名: haloxyfop-etotyl)

*2-[4-[6-氯-2-喹喔啉基] 氧] 苯氧基] 丙酸(R)-2-[[(1-甲基亚乙基) 氨基] 氧] 乙酯 (俗名: propaquizafop);

二苯醚化合物例如

*5-[2-氯-4-(三氟甲基) 苯氧基]-2-硝基苯甲酸钠 (俗名: acifluorfen-sodium)

* (\pm) -2-乙氧基-1-甲基-2-氧代乙基-5-[2-氯-4-(三氟甲基) 苯氧基]-2-硝基苯甲酸盐 (俗名: Lactofen)

*5-[2-氯-4-(三氟甲基) 苯氧基]-N-(甲磺酰基)-2-硝基苯甲酰胺 (俗名: fomesafen);

卤代乙酰胺化合物例如

*2-氯-N-(2-乙基-6-甲基苯基)-N-(2-甲氧基-1-甲基乙基) 乙酰胺 (俗名: metolachlor)

*2-氯-N-(2, 6-二乙基苯基)-N-(甲氧基甲基)-乙酰胺 (俗名: alachlor);

咪唑啉酮化合物例如:

* (\pm) -2-[4,5-二氢-4-甲基-4-(1-甲基乙基)-5-氧代-1H-咪唑-2-基]-5-乙基-3-吡啶羧酸(俗名: imazethapyr)

*2-[4,5-二氢-4-甲基-4-(1-甲基乙基)-5-氧代-1H-咪唑-2-基]-3-喹啉羧酸(俗名: imazaquin);

二硝基苯胺类化合物例如

*2,6-二硝基-N,N-二丙基-4-(三氟甲基)苯胺(俗名: trifluralin)

*N-(1-乙基丙基)-3,4-二甲基-2,6-二硝基苯胺(俗名: pendimethalin);

氨基甲酸酯类化合物例如

*(3-甲基苯基)-氨基甲酸3-[(甲氧基羰基)氨基]苯基酯(俗名: phenmedipham)

*[3-[(苯基氨基)羰基]氧]苯基氨基甲酸乙酯(俗名: desmedipham);

环己二酮类化合物例如

*2-[1-(乙氧基亚氨基)丁基]-5-[2-(乙硫基)丙基]-3-羟基-2-环己烯-1-酮(俗名: sethoxydim);

和其余化合物例如:

*3-(1-甲基乙基)-(1H)-2,1,3-苯并噻二嗪-4(3H)-酮-2,2-二氧化物(俗名: bentazon)

*2-[[[[(4-氯-6-甲氧基-2-嘧啶)氨基]羰基]氨基]磺酰

基] 苯甲酸乙酯 (俗名: chlorimuron-ethyl)

*4—(2, 4—二氯苯氧基) 丁酸 (俗名: 2, 4—DB)

*3—(3, 4—二氯苯基)—1—甲氧基—1—甲脲 (俗名: linuron)

*4—氨基—6—(1, 1—二甲基乙基)—3—(甲硫基)—1, 2, 4—三嗪—5(4H)—酮 (俗名: metribuzin)

*7—氧杂二环[2.2.1]庚烷—2, 3—二羧酸 (俗名: endotal)

*二丙基硫代氨基甲酸硫代—S—乙基酯 (俗名: EPTC)

* (±)—2—乙氧基—2, 3—二氢—3, 3—二甲基—5—苯并呋喃基甲基磺酸酯 (俗名: ethofumesate)

*5—氨基—4—氯—2—苯基—3(2H)—吡嗪酮 (俗名: chloridazon)

本发明取代的吡啶磺酰胺化合物或它的盐作为除草剂的有效成份的用量范围为0.05-5/a, 当与上面提到过的另一个化合物结合时, 用量范围为0.01-50g/a。

特别注意, 当与本发明的化合物及其盐结合时苯氧基丙酸类化合物、咪唑啉酮及环己二酮类化合物的用量范围为0.2-5g/a, 卤代乙酰胺及二硝基苯胺类化合物的用量范围为5-30g/a。

进一步, 下列化合物可以作为混合物中的另一除草剂或者本发明的除草剂结合使用, 也起到协同作用。

磺酰脲类化合物例如

*2—[[[(4—甲氧基—6—甲基—1, 3, 5—三嗪基—2—基)—氨基]羰基]氨基] 苯甲酸甲酯 (俗名: metsulfuron-methyl)

*2-[[[N-(4-甲氧基-6-甲基-1, 3, 5-三嗪-2-基)甲氨基]羰基]氨基]磺酰基]苯甲酸甲酯(俗名:tribenuron-methyl)

*2-氯-N-[[[4-甲氧基-6-甲基-1, 3, 5-三嗪-2-基]氨基]羰基]苯磺酰胺化合物(俗名:chlorsulfuron)

*3-[[[[4-甲氧基-6-甲基-1, 3, 5-三嗪-2-基]氨基]羰基]氨基]磺酰基]-2-噻吩羧酸甲酯(俗名:thiameturon-methyl);

苯氧基丙酸酯类化合物例如

*(±)-2-[4-(2, 4-二氯苯氧基)苯氧基]丙酸甲酯(俗名:diclofop-methyl);

咪唑啉酮类化合物例如

*6-(4-异丙基-4-甲基-5-氧代-2-咪唑啉-2-基)-间-1-甲苯甲酸甲酯与2-(4-异丙基-4-甲基-5-氧代-2-咪唑啉-2-基)-对-1-甲苯甲酸甲酯的混合物;(俗名:imazamethabenz)

和其余化合物例如

*1, 2-二甲基-3, 5-二苯基-1H-吡唑鎓基(pyrazolium)-1-甲硫酸酯(俗名:difenzoquat methylsulfate)

*3, 5-二溴-4-羟基苄腈(俗名:bromoxynil)

*4-羟基-3, 5-二碘苄腈(俗名:ioxynil)

*2, 4-二氯苯氧基乙酸(俗名:2, 4-D)

*S-(2, 3, 3-三氯-2-丙烯基)-双(1-甲基乙基)-硫代氨基甲酸硫代酯(俗名:triallate)

*4-氯-2-甲基苯氧基乙酸(俗名:MCPA)

- *3, 6-二氯-2-吡啶羧酸(俗名: clopyralid)
- *硫代碳酸硫0-(6-氯-3-苯基-4-吡嗪基)-S-辛基酯
(俗名: pyridate)
- *3, 6-二氯-2-甲氧基苯甲酸(俗名: dicamba)
- *N'-(3, 4-二氯代苯基)-N, N-二甲基脲(俗名: diuron)
- *4-氨基-3, 5, 6-三氯-2-吡啶羧酸(俗名: picloram)
- *N, N-二甲基N'-[3-(三氟甲基)苯基]脲(俗名: fluometuron)
- *2-[4-氯-6-(乙氨基)-1, 3, 5-三嗪-2-基]-氨基]
-2-甲基丙腈(俗名: cyanazine)
- *N, N'-双(1-甲基乙基)-6-(甲硫基)-1, 3, 5-三嗪基
-2, 4-二胺(俗名: prometryn)
- *N-(3, 4-二氯代苯基)丙酰胺(俗名: propanil)
- *甲砷酸二钠盐(俗名: DSMA)
- *甲砷酸一钠盐(俗名: MSMA)
- *2-氯-1-(3-乙氧基-4-硝基苯氧基)-4-(三氟甲基)苯
(俗名: oxyfluorfen)
- *S-[2-[(苯磺酰基)氨基]乙基]二硫代磷酸0, 0-双(1-甲
基乙基)酯(俗名: bensulide)
- *2-(3, 4-二氯苯基)-4-甲基-1, 2, 4-噁二唑烷-3,
5-二酮(俗名: methazole)
- *4-氯-5-(甲氨基)-2-[3-(三氟甲基)-苯基]-3(2H)-
吡嗪酮(俗名: norflurazon)
- *2-氯-6-(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基硫代)苯甲酸酯(JP)

-A-1-230561) (这里的"JP-A"意味着"未经审查出版的日本专利申请)"。

*2-氯-6-(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基硫代)-苯甲酸乙酯
(JP-A-1-230561)

*2-氯-6-(4, 6-二甲氧基嘧啶-2-基硫代)-苯甲酸钠
(JP-A-1-230561)

本发明的取代的吡啶磺酰胺化合物或它的盐作为除草剂的有效成份, 用量范围为0.05-5g/a, 与之混合的, 前面强调过的另一化合物的使用范围为0.01-50g/a。

下面给出以本发明化合物作除草剂的实验例

实验例1

在1/1, 500公亩(公亩(a)=100平方米)装填高地土的盆中, 播种各种植物种子, 对生长的植物计数

名 称	缩 写
稻(Oryza Sativa)	OR
大豆(Glycine max)	GL
玉米(Zea mays)	ZE
棉花(Gossypium)	GO
小麦(Triticum)	TR
苍耳子(Xanthium Strumarium)	XA
牵牛花(Ipomoea purpurea)	IP
刺黄花稔(Sida Spinosa)	SI
小苋属植物(Amaranthus Viridis)	AM

稗子 (*Echinochloa Crus-galli*)

EC

红色马唐 (*Digitaria adscendens*)

DI

当各种植物生长到一定的程度(稻长到1.3-3.0叶期,大豆首叶到—1.2叶期,玉米长到2.3-4.1叶期,棉花子叶到1.1叶期,小麦长到2.2—3.0叶期,苍耳子长到1.0-3.2叶期,牵牛花长到0.3-2.0叶期,刺黄花稔长到0.1—1.8叶期,小苋属植物长到0.3-2.4叶期,稗子长到1.7—3.3叶期,红色马唐长到1.4—3.1叶期。本发明的除草剂,以可湿性粉末的形式,称出预定的量,按5升/公亩水量稀释,加入体积0.2%(在最终组成的基础上)的农业铺展剂之后,用小喷枪施放到植物的叶子上。施放后,目视观察植物的生长过程17—29天,按十个等级评估控制植物生长的程度(1:没有施药的情况—10:生长完全控制的情况)。结果在表3中列出。

表 3

化合物 NO.	有效成份用量 (g/a)	OR	GL	ZE	GO	TR	XA	IP	SI	AM	EC	DI	Day*
1	1.25	8	7	10	8		9	7	7	7	5		18
2	1.25	8	3	10		5	10	8	5	6	9	9	29
	0.31	7	2	9		1	6	5	3	3	7	2	
3	1.25	7	3	10		8	9	7	6	9	9	8	22
	0.31	5	3	8		5	4	5	5	8	10	7	
4	0.31	8	4	9		4	8	8	8	9	8	10	22

表3(继续)

化合物 NO.	有效成份用量 (g/a)	OR	GL	ZE	GO	TR	XA	IP	SI	AM	EC	DI	Day ^{1*}	
5	1.25	8	10	10	9		10	9	6	10	7		24	
	0.31	8	10	10	8		10	9	6	9	5			
6	1.25	9	9	9	9		10	9	8	10	9		20	
	0.31	7	10	8	9		10	9	7	10	7			
7	1.25	7	9	9	9		10	10	8	10	7		20	
	0.31	6	9	8	8		10	7	6	9	7			
8	1.25	6	7	9	7		10	10	5	9	7		20	
	0.31	6	5	8	5		10	3	4	7				
11	1.25	8	7	10			10	10	6	10	10	3	21	
	0.31	7	6	10			10	10	5	10	10	3		
15	1.25	2	3	3		4	9	6	6	9	4	4	29	
	0.31	2	2	2		3	7	5	6	8	3	3		
18	1.25	9	3	10			5	9	9	5		9	10	29
	0.31	7	2	10			4	9	7	3	7	7	9	
19	1.25	6	5	10			4	10	7	6	9	10	9	23
	0.31	5	5	10			2	9	6	3	5	9	9	
20	1.25	7	4	7			2	9	8	5	5	1	5	21
	0.31	7	1	7			1	8	7	3	3	1	1	

表3(继续)

化合物 NO.	有效成份用量 (g/a)	OR	GL	ZE	GO	TR	XA	IP	SI	AM	EC	DI	Day*
21	1.25	6	7	10		2	10	7	3	7	6	4	23
	0.31	5	7	9		1	9	6	2	6	4	3	
22	1.25	6	3	10		6	10	9	8	10	8	5	20
	0.31	6	2	10		5	10	8	6	10	8	3	
23	1.25	1	4	3		2	7	5	6	9	2	2	20
26	1.25	2	3	3		3	5	6	7	6	3	3	20
	0.31	2	2	1		3	4	5	5	5	2	2	
27	1.25	2	1	3		3	9	3	4	7	4	3	20
	0.31	1	1	2		3	8	1	2	6	3	3	
31	1.25	7	7	10		4	9	10	6	9	5	3	18
	0.31	6	7	9		2	9	9	3	9	3	2	
32	1.25	3	6	4		4	9	9	7	10	3	3	18
	0.31	1	6	4		3	9	9	6	10	1	3	
34	1.25	8	6	10	9		7	9	7	9	10	4	24
	0.31	6	5	10	4		6	7	6	9	9	4	
37	1.25	8	9	10	6		10	7	10	10	10	6	21
	0.31	7	9	10	5		10	6	10	10	10	5	
38	1.25	1	4	3		3	10	8	3	5	1	2	18

表3(继续)

化合物 NO.	有效成份用量 (g/a)	OR	GL	ZE	GO	TR	XA	IP	SI	AM	DI	Day*	
	0.31	1	3	1		2	8	7	1	5	1	2	
39	1.25	1	6	1		1	9	4	6	9	4	1	20
	0.31	1	3	1		1	9	3	5	8	2	1	
40	1.25	5	4	1		3	10	10	5	10	1	5	22
	0.31	4	1	1		2	7	7	2	7	1	4	
41	1.25	1	3	1		2	9	6	6	8	1	2	20
	0.31	1	2	1		1	6	4	4	6	1	1	
42	1.25	7	10	10		7	10	9	6	10	1	2	22
	0.31	6	10	6		4	10	9	4	10	1	2	
43	1.25	4	9	6		3	10	9	7	10	4	4	22
	0.31	4	9	4		2	9	6	6	10	4	2	
45	1.25	3	3	3		3	8	7	3	7	3	3	23
46	1.25	5	5	10	3		10	10	6	10	10	3	26
	0.31	4	4	10	2		9	8	4	10	10	1	
47	1.25	5	8	10	4		9	7	6	9	9	5	17
	0.31	5	6	10	3		9	6	5	9	8	4	
50	1.25	7	4	10	6		10	10	6	10	10	4	21
	0.31	6	3	10	5		10	10	5	10	10	3	

52	1.25	5	1	3	4	7	6	6	9	4	6	21
	0.31	4	1	1	3	6	3	5	7	3	5	
53	1.25	2	4	4	3	10	4	3	6	4	2	26
55	1.25	4	3	3	4	7	3	4	7	3	4	17
56	1.25	6	7	9	6	10	4	6	9	6	6	17
	0.31	5	7	10	6	9	3	5	7	5	6	
57	1.25	5	8	10	5	7	6	4	9	8	3	21
	0.31	4	6	10	4	7	5	4	8	7	2	
58	1.25	7	6	4	6	6	6	2	6	3	6	22

* 施用于叶后观察天数

实验例2

在1/10,000公亩(a)装填高地土的盆子,播种各种植物的种子,生长的植物计数如下。

名 称	缩 写
大豆(Glycine max)	GL
印度苘麻(Abutilon avicennae)	AB
东方决明属植物(cassia obtusifolia)	CA

当各种植物生长到一定程度(大豆长到0.1叶期,印度苘麻长到1.1叶期,东方决明属植物长到0.1叶期),本发明的除草剂,以可湿性粉末的形式,称出预定的量,用5升/a水稀释,再加入体积0.2%(在最终组成的基础上)的农业铺展剂,之后用小喷枪施用到植物的叶上,施用后目视观察植物的生长过程28天,按实验例1中的同

样十个等级评估植物生长控制的程度，结果如表4。

表 4

化合物 NO.	有效成分的量 (g/a)	GL	AB	CA
2	5	4	10	9—10
	1.25	3	9	8

实验例3

在1/3, 000公亩 (a) 及1/10, 000亩 (a) 装填了高地土的盆中，播种各种植物的种子，生长的植物计数如下。

盆	名 称	缩 写
1/3, 000a	大豆 (Glycine max)	GL
1/10, 000a	苍耳子 (Xanthium strumarium)	XA
1/10, 000a	牵牛花 (Ipomoea purpurea)	IP
1/10, 000a	小苋属植物 (Amaranthus viridis)	AM
1/10, 000a	印度苘麻 (Abutilon avicennae)	AB
1/10, 000a	东方决明属植物 (Cassia obtusifolia)	CA

当各种植物生长到一定程度 (大豆长到0.5叶期，苍耳子长到1.0叶期，牵牛花长到1.1叶期，小苋属植物长到1.4叶期，印度苘麻长到1.2叶期，东方决明属植物长到0.2叶期)，本发明的除草剂，以可湿性粉末的形式，按预定量称出，按5升/公亩的水量稀释，加入体积0.2% (在最终组成的基础上) 的农业铺展剂，之后用小喷枪施放到植物。施放后目视观察大豆和其余植物的生长情况18—24天，根据实验例1中的同样十个等级评估植物生长控制的程度。结果在

表5中给出。

		表 5					
化合物	有效成份用量	GL	XA	IP	AM	AB	CA
NO.	(g/a)						
18	1.25	2	9	8	6	9	6

实验例4

在1/3,000公亩(a)及1/10,000公亩(a)装填了高地土的盆中,播种各种植物的种子,生长的植物计数如下。

盆	名 称	缩 写
1/3,000a	大豆(Glycine max)	GL
1/10,000a	苍耳子(Xanthium strumarium)	XA
1/10,000a	牵牛花(Ipomoea purpurea)	IP
1/10,000a	小苋属植物(Amaranthus viridis)	AM
1/10,000a	印度苘麻(Abutilon avicennae)	AB
1/10,000a	东方决明属植物(Cassia obtusifolia)	CA

当各种植物生长到一定程度时(大豆长到首叶期,苍耳子长到2.0叶期,牵牛花长到1.2叶期,小苋属植物长到1.2叶期,印度苘麻长到1.3叶期,东方决明属长到0.2叶期),本发明的除草剂,以可湿性粉末的形式,称出预定量。按5升/公亩的水量稀释,再加入0.2体积%的农业展开剂,之后用小喷枪施放到植物叶上。施用后,目视观察大豆和其余植物的情况20—25天,按实验例1中的同样十个等级评估植物生长控制的程度。结果在表6中列出。

表6

化合物	有效成份用量	GL	XA	IP	AM	AB	CA
NO.	g/a	—	—	—	—	—	—
22	1.25	3	9-10	9-10	7	10	6-7

实验例5

大1/10,000公亩(a)的盆中装填高地土,接着播种各种植物的种子,生长的植物计数如下。

名 称	缩 写
小麦(Triticum)	TR
野燕麦(Avena fatua)	AV

当各种植物生长到一定的程度(小麦长到2.1叶期,野燕麦长到1.0叶期),本发明的除草剂,以可湿性粉末的形式,按预定量称出,按5升/公亩的水量稀释,再加入0.2体积%(在最终组成的基础上)的农业铺展剂,之后用小喷枪施放到植物叶上,施用后,目视观察植物的生长情况19天,按实验例1中给出的同样10个等级,评估对植物生长控制的程度。结果在表7中列出。

表 7

化合物	有效成份的用量	TR	AV
NO.	(g/a)	—	—
47	1.25	3	8-9
	0.31	2-3	8
	0.08	2	7

实验例6

在1/10,000公亩(a)装填了高地土的盆, 播种一系列植物的种子, 生长出的植物计数如下

名 称	缩 写
棉花 (Gossypium)	GO
东方决明属植物 (Cassia obtusifolia)	CA
红色马唐 (Digitaria adscendens)	DI

当各种植物生长到一定的程度(棉花长到一个子叶期, 东方决明属植物长到0.2个叶期, 红色马唐长到2.9叶期), 本发明的除草剂, 以可湿性粉末的形式, 称出预定的量, 按5升/公亩的水量稀释, 加入0.2体积%(在最终组成的基础上)的农业展开剂, 之后用小喷枪施放到植物的叶上, 施放后目视观察植物的生长情况28天, 按实验例1中的同样十个等级评估对植物生长控制的程度。结果在表8中列出。

表 8

化合物 NO.	有效成份的用量 (g/a)	GO	CA	DI
19	1.25	3	8-9	8-9
	0.31	2	7-8	7-8
	0.08	1	6	6-7

本发明除草剂配方实施例详述如下。

配方例1

- (1) 粘土(商品名称 Newlite 97重量份
- (2) 预先与白碳混合的聚氧乙烯辛基苯基醚 2重量份

(商品名: Dikssol W-92)

(3) 化合物NO. 18 1重量份

将上面提到的各组份混合, 磨成粉状, 使成粉剂。

配方例2

(1) 化合物NO. 22 75重量份

(2) 聚羧酸类型的聚合物 13.5重量份

(商品名: Demol EP powder)

(3) NaCl 10重量份

(4) 糊精 0.5重量份

(5) 磺酸烷基酯(商品名: TP-89121) 1重量份

上述提到的各组份在高速成粒机中混合, 进一步加入20重量%的水, 继续成粒, 干燥, 形成水分散性颗粒。

配方例3

(1) 高岭土 78重量份

(2) 萘磺酸钠盐与甲醛的缩合物

(商品名: LavelinFAN) 2重量份

(3) 聚氧乙烯烷芳醚硫酸钠与

白碳予混合(商品名: Sorpol 5039)

(4) 白碳(商品名: Carplex) 15重量份

上面提到的组份(1) — (4), 与化合物NO. 2以9:1的重量比混合, 形成可湿性粉末。

配方例4

(1) 硅藻土 63重量份

(2) 聚氧乙烯烷基苯基醚硫酸铵 5重量份

与白碳予混合(商品名: Dikssol W-66)

(3) 双烷基硫代丁二酸酯与白 2重量份

碳混合(商品名: Dikssol W-09B)

(4) 化合物No. 18 30重量份

将上面提到的组份混合, 形成可湿性粉末。

配方例5

(1) 滑石粉(商品名: Hi-Filler No. 10) 33重量份

(2) 双烷基硫代的丁二酸酯与白碳 3重量份

予混合(商品名: Sorpol 5050)

(3) 聚氧乙烯烷芳醚硫酸酯与聚氧乙烯 4重量份

单甲醚碳酸酯及白碳予混合(商品名:

Sorpol 5073)

(4) 化合物No. 22 60重量份

将上述提到的各组份混合, 形成可湿性粉末。

配方例6

(1) 化合物No. 2 4重量份

(2) 玉米油 79重量份

(3) 双烷基硫代丁二酸酯, 聚氧乙烯 15重量份

壬基苯基醚, 聚氧乙烯氢化蓖麻油和

脂肪酸的聚甘油酯的混合物(商品名:

Sorpol 3815)

(4) 膨润土与烷基胺复合体 2重量份

上面提到的各组份均匀混合，用一Dyno磨(由Willey et Barhofen Co. 制造)磨成粉末，形成一悬浮的浓缩物。

到这里，我们已对本发明作了详细描述，并具体指明特殊之处。对本领域熟练技术人员来说，可以在本发明的精神和范围之内作出各变化和调整是很明显的。