



(10) 授权公告号 CN 110944987 B

(45) 授权公告日 2023. 09. 15

(21) 申请号 201880049300.5

(22) 申请日 2018.05.30

(65) 同一申请的已公布的文献号

申请公布号 CN 110944987 A

(43) 申请公布日 2020.03.31

(30) 优先权数据

62/512,685 2017.05.30 US

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2020.01.22

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/US2018/035017 2018.05.30

(87) PCT国际申请的公布数据

W02018/222647 EN 2018.12.06

(73) 专利权人 FMC公司

地址 美国宾夕法尼亚

(72) 发明人 M·J·坎贝尔

(74) 专利代理机构 永新专利商标代理有限公司

72002

专利代理师 安琪 张晓威

(51) Int. Cl.

C07D 401/04 (2006.01)

A01N 43/36 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

A01N 43/60 (2006.01)

C07D 403/04 (2006.01)

C07D 405/04 (2006.01)

C07D 409/04 (2006.01)

C07D 207/22 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 405/14 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 403/14 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 409/14 (2006.01)

(56) 对比文件

AU 2003274037 A1, 2004.05.13

CN 106715412 A, 2017.05.24

CN 106414403 A, 2017.02.15

WO 2015/084796 A1, 2015.06.11

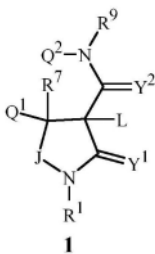
审查员 董淑君

权利要求书4页 说明书65页

(54) 发明名称

除草3-取代内酰胺

(57) 摘要

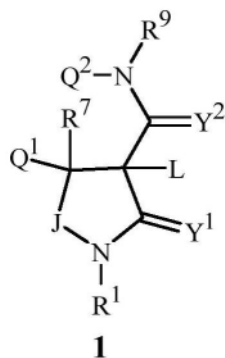


本发明部分地涉及式1的化合

的植被的方法,所述方法包括使所述不期望的植被或其环境与有效量的本发明的化合物或组合物接触。

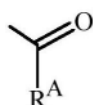
物(包括所有立体异构体)、此类化合物的N-氧化物,以及此类化合物和N-氧化物的盐,其中L、Y¹、R¹、J、Q¹、R⁷、Y²、R⁹和Q²如本发明所定义。本发明还公开了包含式1的化合物的组合物和控制不期望

1. 选自式1和其盐的化合物，



其中

L为



L-1

RA是C1-C7烷基、C1-C7卤代烷基、C3-C9环烷基、C3-C9卤代环烷基、C1-C7烷氧基、C1-C7卤代烷氧基、C3-C9环烷氧基、C3-C9卤代环烷氧基、C2-C8烯基、C2-C8卤代烯基、甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基、C1-C7卤代烷基氨基、C2-C9二烷基氨基、C2-C9卤代二烷基氨基、C3-C9环烷基氨基或C3-C9卤代环烷基氨基；或者

RA与R9一起为-C(RI)(RJ)C(=O)-；

RI是H、C1-C4烷氧基、C1-C4卤代烷基或C1-C4烷基；

RJ是H、C1-C4烷氧基、C1-C4卤代烷基或C1-C4烷基；

Q1是苯环，所述苯环被至多4个独立地选自R10的取代基取代或未被取代；

Q2是苯环，所述苯环被至多4个独立地选自R11的取代基取代或未被取代；

J是-CR2R3-；

Y1和Y2各自独立地是O或S；

其中R1是H、C3-C8烷基羰基烷基、C1-C6烷基、C1-C6卤代烷基、C2-C6氰基烷基、C3-C6环烷基、C4-C8环烷基烷基、C2-C8烷氧基烷基、C2-C8卤代烷氧基烷基、C2-C8烷基羰基、C2-C8卤代烷基羰基、C4-C10环烷基羰基、C2-C8烷氧基羰基或C2-C8卤代烷氧基羰基；

R2和R3各自独立地是H、卤素、羟基、C1-C4烷基、C1-C4卤代烷基或C1-C4烷氧基；或者

R7是H、卤素、羟基、C1-C4烷氧基、C1-C4卤代烷基或C1-C4烷基；

R9是H、羟基、氨基、C1-C6烷基、C1-C6卤代烷基、C2-C6烯基、C3-C6炔基、C2-C8烷氧基烷基、C2-C8卤代烷氧基烷基、C2-C8烷硫基烷基、C2-C8烷基亚磺酰基烷基、C2-C8烷基磺酰基烷基、C2-C8烷基羰基、C2-C8卤代烷基羰基、C4-C10环烷基羰基、C2-C8烷氧基羰基、C2-C8卤代烷氧基羰基、C4-C10环烷氧基羰基、C2-C8烷基氨基羰基、C3-C10二烷基氨基羰基、C4-C10环烷基氨基羰基、C1-C6烷氧基、C1-C6烷硫基、C1-C6卤代烷硫基、C3-C8环烷硫基、C1-C6烷基亚磺酰基、C1-C6卤代烷基亚磺酰基、C3-C8环烷基亚磺酰基、C1-C6烷基磺酰基、C1-C6卤代烷基磺酰基、C3-C8环烷基磺酰基、C1-C6烷基氨基磺酰基、C2-C8二烷基氨基磺酰基或C3-

C10三烷基甲硅烷基；

R10和R11各自独立地是卤素、羟基、氰基、硝基、氨基、C1-C8烷基、C1-C8氰基烷基、C1-C8氰基烷氧基、C1-C8卤代烷基、C1-C8羟基烷基、C1-C8硝基烷基、C2-C8烯基、C2-C8卤代烯基、C2-C8硝基烯基、C2-C8炔基、C2-C8卤代炔基、C2-C8烷氧基烷基、C3-C8烷氧基烷氧基烷基、C2-C8卤代烷氧基烷基、C2-C8卤代烷氧基卤代烷氧基、C3-C6环烷基、环丙基甲基、1-甲基环丙基、2-甲基环丙基、C4-C10环烷基烷基、C4-C10卤代环烷基烷基、C5-C12烷基环烷基烷基、C5-C12环烷基烯基、C5-C12环烷基炔基、C3-C8环烷基、C3-C8卤代环烷基、C4-C10烷基环烷基、C6-C12环烷基环烷基、C3-C8环烯基、C3-C8卤代环烯基、C2-C8卤代烷氧基烷氧基、C2-C8烷氧基烷氧基、C4-C10环烷氧基烷基、C2-C8烷硫基烷基、C2-C8烷基亚磺酰基烷基、C2-C8烷基磺酰基烷基、C2-C8烷基氨基、C2-C8二烷基氨基、C2-C8卤代二烷基氨基、C2-C8烷基氨基烷基、C2-C8卤代烷基氨基烷基、C4-C10环烷基氨基烷基、C3-C10二烷基氨基烷基、-CH₃、C2-C8烷基羰基、C2-C8卤代烷基羰基、C4-C10环烷基羰基、-C(=O)OH、C2-C8烷氧基羰基、C2-C8卤代烷氧基羰基、C4-C10环烷氧基羰基、C5-C12环烷基烷氧基羰基、-C(=O)NH₂、C2-C8烷基氨基羰基、C4-C10环烷基氨基羰基、C3-C10二烷基氨基羰基、C1-C8烷氧基、C1-C8卤代烷氧基、C2-C8烯氧基、C2-C8卤代烯氧基、C3-C8炔氧基、C3-C8卤代炔氧基、C3-C8环烷氧基、C3-C8卤代环烷氧基、C4-C10环烷基烷氧基、C3-C10烷基羰基烷氧基、C2-C8烷基羰氧基、C2-C8卤代烷基羰氧基、C4-C10环烷基羰氧基、C1-C8烷基磺酰氧基、C1-C8卤代烷基磺酰氧基、C1-C8烷硫基、C1-C8卤代烷硫基、C3-C8环烷硫基、C1-C8烷基亚磺酰基、C1-C8卤代烷基亚磺酰基、C1-C8烷基磺酰基、C1-C8卤代烷基磺酰基、C3-C8环烷基磺酰基、甲酰氨基、C2-C8烷基羰基氨基、C2-C8卤代烷基羰基氨基、C3-C8环烷基氨基、C2-C8烷氧基羰基氨基、C1-C6烷基磺酰氨基、C1-C6卤代烷基磺酰氨基、-SF₅、-SCN、SO₂NH₂、C3-C12三烷基甲硅烷基、C4-C12三烷基甲硅烷基烷基或C4-C12三烷基甲硅烷基烷氧基。

2. 根据权利要求1所述的化合物，其中

RA是C1-C7烷基、C1-C7卤代烷基、C3-C9环烷基、C1-C7烷氧基或C1-C7卤代烷氧基、C3-C9环烷氧基；

R2和R3各自独立地是H或C1-C4烷基；

R4和R5各自独立地是H、卤素、C1-C4烷基或C1-C4烷氧基；

R7是H、卤素、C1-C4烷氧基或C1-C4烷基；

R9是H、C1-C6烷基、C2-C8烷氧基烷基、C2-C8烷硫基烷基、C2-C8烷基亚磺酰基烷基、C2-C8烷基磺酰基烷基、C2-C8烷基羰基、C4-C10环烷基羰基、C2-C8烷氧基羰基或C4-C10环烷氧基羰基；

R10和R11各自是卤素、硝基、C1-C8烷基、C1-C8氰基烷基、C1-C8氰基烷氧基、C1-C8卤代烷基、C1-C8硝基烷基、C2-C8烯基、C2-C8卤代烯基、C2-C8硝基烯基、C2-C8烷氧基烷基、C3-C8烷氧基烷氧基烷基、C2-C8卤代烷氧基烷基、C2-C8卤代烷氧基卤代烷氧基、C4-C10环烷基烷基、C4-C10卤代环烷基烷基、C5-C12烷基环烷基烷基、C5-C12环烷基烯基、C3-C8环烷基、C3-C8卤代环烷基、C4-C10烷基环烷基、C6-C12环烷基环烷基、C3-C8环烯基、C3-C8卤代环烯基、C2-C8卤代烷氧基烷氧基、C2-C8烷氧基烷氧基、C4-C10环烷氧基烷基、C2-C8烷基羰基、C2-C8卤代烷基羰基、C4-C10环烷基羰基、-C(=O)OH、C2-C8烷氧基羰基、C2-C8卤代烷氧基羰基、C4-C10环烷氧基羰基、C5-C12环烷基烷氧基羰基、-C(=O)NH₂、C1-C8烷氧基、C1-C8卤

代烷氧基、C2-C8烯氧基、C2-C8卤代烯氧基、C3-C8环烷氧基、C3-C8卤代环烷氧基、C4-C10环烷基烷氧基、C3-C10烷基羰基烷氧基、C2-C8烷基羰基氧基、C2-C8卤代烷基羰基氧基、C4-C10环烷基羰基氧基、C1-C8烷基磺酰氧基、C1-C8卤代烷基磺酰氧基、C1-C8烷基磺酰基、C1-C8卤代烷基磺酰基或C3-C8环烷基磺酰基。

3. 根据权利要求2所述的化合物, 其中

RA是C1-C7烷基、C1-C7卤代烷基、C1-C7烷氧基或C1-C7卤代烷氧基;

Y1和Y2各自独立地是O;

R2和R3各自独立地是H或CH₃;

R4和R5各自独立地是H、卤素或C1-C4烷基;

R7是H、F、Cl或CH₃;

R9是H、C1-C6烷基、C2-C8烷氧基烷基、C2-C8烷基羰基或C2-C8烷氧基羰基;

R10和R11各自独立地是卤素、C1-C8烷基、C1-C8卤代烷基、C2-C8烷氧基烷基、C3-C8烷氧基烷基、C4-C10环烷基烷基、C5-C12烷基环烷基烷基、C3-C8环烷基、C3-C8卤代环烷基、C6-C12环烷基环烷基、C3-C8卤代环烯基、C2-C8卤代烷氧基烷基、C2-C8烷氧基烷基、C4-C10环烷氧基烷基、C2-C8烷基羰基、C2-C8卤代烷基羰基、C4-C10环烷基羰基、C2-C8烷氧基羰基、C4-C10环烷氧基羰基、C5-C12环烷基烷氧基羰基、C1-C8烷氧基、C1-C8卤代烷氧基、C2-C8卤代烯氧基、C3-C8环烷氧基、C3-C8卤代环烷氧基、C4-C10环烷基烷氧基、C3-C10烷基羰基烷氧基或C2-C8卤代烷基羰基氧基。

4. 根据权利要求3所述的化合物, 其中

RA是C1-C7烷基或C1-C7烷氧基;

R1是H、C1-C6烷基、C1-C6卤代烷基、C2-C6氰基烷基、C3-C6环烷基、C4-C8环烷基烷基、C2-C8烷氧基烷基、C2-C8卤代烷氧基烷基或C2-C8烷氧基羰基;

Q1是被至多3个独立地选自R10的取代基取代的或未被取代的苯环;

Q2是被至多3个独立地选自R11的取代基取代的或未被取代的苯环;

R2和R3各自独立地是H;

R7是H或CH₃;

R9是H、C1-C6烷基或C2-C8烷氧基羰基; 且

R10和R11各自独立地是卤素、C1-C8烷基、C1-C8卤代烷基、C2-C8烷氧基烷基、C4-C10环烷基烷基、C5-C12烷基环烷基烷基、C3-C8环烷基、C3-C8卤代环烷基、C2-C8卤代烷氧基烷基、C1-C8烷氧基、C1-C8卤代烷氧基或C2-C8烷氧基烷基。

5. 根据权利要求4所述的化合物, 其中

RA是被至多2个独立地选自R8的取代基取代的或未被取代的C1-C3烷基;

R8各自独立地是C1-C6烷氧基;

R1是H、C1-C6烷基、C3-C6环烷基、C4-C8环烷基烷基或C2-C8烷氧基烷基;

Q1是被至多2个独立地选自R10的取代基取代的或未被取代的苯环;

Q2是被至多2个独立地选自R11的取代基取代的或未被取代的苯环;

R7是H;

R9是H、CH₃或-C(=O)CH₃; 且

R10和R11各自独立地是卤素、C1-C8烷基、C1-C8卤代烷基、C3-C8环烷基、C1-C8烷氧基

或C1-C8卤代烷氧基。

6. 根据权利要求4所述的化合物, 其中

RA是C1-C3烷氧基;

R1是H、CH₃、CH₂CH₃、环丙基、环丙基甲基或CH₂OCH₃;

Q1是被至多2个独立地选自R10的取代基取代的或未被取代的苯环;

Q2是被至多2个独立地选自R11的取代基取代的或未被取代的苯环;

R7是H;

R9是H; 且

R10和R11各自独立地是卤素、C1-C8烷基、C1-C8卤代烷基、C1-C8烷氧基或C1-C8卤代烷氧基。

7. 根据权利要求1所述的化合物, 其为(3S, 4R) -3-乙酰基-N-(2,3-二氟苯基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)-3-吡咯烷甲酰胺]。

8. 除草剂组合物, 所述除草剂组合物包含根据权利要求1所述的化合物和至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的组分。

9. 除草剂组合物, 所述除草剂组合物包含根据权利要求1所述的化合物、至少一种选自其它除草剂和除草剂安全剂的附加活性成分, 和至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的组分。

10. 除草剂混合物, 所述除草剂混合物包含 (a) 根据权利要求1所述的化合物, 和 (b) 至少一种附加活性成分, 所述附加活性成分选自 (b1) 光系统II抑制剂, (b2) 乙酰羟酸合酶抑制剂, (b3) 乙酰-CoA羧化酶抑制剂, (b4) 生长素模拟物, (b5) 5-烯醇-丙酮酰莽草酸-3-磷酸酯合酶抑制剂, (b6) 光系统I电子转向剂, (b7) 原卟啉原氧化酶抑制剂, (b8) 谷氨酰胺合成酶抑制剂, (b9) 极长链脂肪酸延伸酶抑制剂, (b10) 生长素运输抑制剂, (b11) 八氢番茄红素去饱和酶抑制剂, (b12) 4-羟基苯基-丙酮酸双氧化酶抑制剂, (b13) 尿黑酸茄尼酯转移酶抑制剂, (b14) 纤维素生物合成抑制剂, (b15) 其它除草剂, 包括有丝分裂干扰剂、有机砷化合物、黄草灵、溴丁酰草胺、环庚草醚、苄草隆、棉隆、野燕枯、杀草隆、乙氧苯草胺、抑草丁、杀木膦、调节膦、hydantocidin、威百亩、甲基杀草隆、油酸、恶嗪草酮、壬酸和稗草畏, (b16) 除草剂安全剂; 以及 (b1) 至 (b16) 的化合物的盐。

11. 控制不期望的植被生长的方法, 所述方法包括使所述植被或其环境与除草有效量的根据权利要求1所述的化合物接触。

除草3-取代内酰胺

技术领域

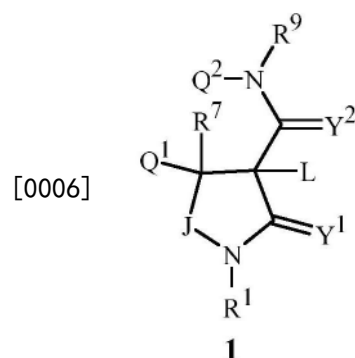
[0001] 本发明涉及某些除草3-取代内酰胺、它们的N-氧化物、盐和组合物,以及它们用于控制不期望的植被的方法。

[0002] 发明背景

[0003] 控制不期望的植被对于实现高作物效益是极其重要的。实现选择性控制杂草的生长是非常令人期望的,特别是在有用的作物,如稻、大豆、糖用甜菜、玉米、马铃薯、小麦、大麦、西红柿和种植性作物等中。在此类有用作物中未受控制的杂草生长可引起产量的显著减少,由此导致消费者成本上升。在非耕作区控制不期望的植被也是重要的。为此目的,许多产品可商购获得,但是持续需要更有效、更经济、毒性更小、对环境更安全或具有不同作用位点的新型化合物。WO 2015/084796、WO 2016/003997和WO 2016/196593公开了作为除草剂的环状酰胺。本发明的化合物不同于这些申请公开文件中所描述的化合物。本发明的这些除草3-取代内酰胺并未在这些公开文件中公开。

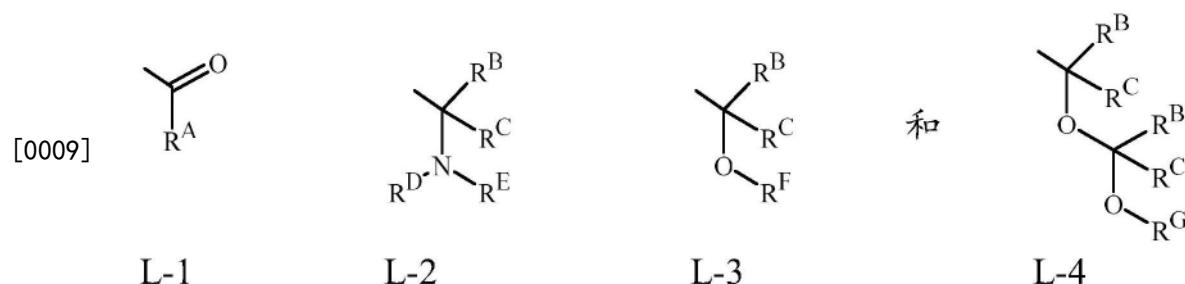
[0004] 发明概述

[0005] 本发明部分地涉及式1的化合物(包括所有立体异构体)、此类化合物的N-氧化物,以及此类化合物和N-氧化物的盐:



[0007] 其中

[0008] L选自



[0010] R^A 是 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 卤代烷基、 C_3 - C_9 环烷基、 C_3 - C_9 卤代环烷基、 C_1 - C_7 烷氧基、 C_1 - C_7 卤代烷氧基、 C_3 - C_9 环烷氧基、 C_3 - C_9 卤代环烷氧基、 C_2 - C_8 烯基、 C_2 - C_8 卤代烯基、 C_1 - C_7 烷基氨基、 C_1 - C_7 卤代烷基氨基、 C_2 - C_9 二烷基氨基、 C_2 - C_9 卤代二烷基氨基、 C_3 - C_9 环烷基氨基或 C_3 - C_9 卤代环烷基氨基,其各自被至多3个独立地选自 R^8 或 G^1 的取代基取代或未被取代;或者

[0011] R^A 是 G^1 或 OG^1 ;或者

[0012] R^A 与 R^9 一起为 $-C(R^I)(R^J)C(=O)-$ (即,以形成环);

[0013] R^B 是 H 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_1-C_4 烷基;或者被卤素或 C_1-C_4 烷基取代的或未被取代的苯基;

[0014] R^C 是 H 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_1-C_4 烷基;或者被卤素或 C_1-C_4 烷基取代的或未被取代的苯基;

[0015] R^D 是 H 、 C_1-C_4 烷基或 C_2-C_4 烷基羰基;

[0016] R^E 是 H 、羟基、氨基、氰基、甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 氰基烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_2-C_8 烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2-C_8 烯基、 C_2-C_8 卤代烯基、 C_2-C_8 烯基烷基、 C_2-C_8 卤代烯基烷基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基、 C_5-C_{10} 环烷基羰基烷基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_2-C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3-C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3-C_8 环烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰基或 C_2-C_8 二烷基氨基磺酰基;或者 G^E 或 $W^E G^E$;

[0017] R^F 是 H 、甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_2-C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3-C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3-C_8 环烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰基、 C_2-C_8 二烷基氨基磺酰基、 $-P(=O)(OH)_2$ 、 C_1-C_6 二烷基磷酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磷酰基、 C_3-C_8 环烷基磷酰基、 C_2-C_8 二烷氧基磷酰基、 C_6-C_{14} 二环烷氧基磷酰基、 C_8-C_{16} 二环烷基烷氧基磷酰基、 C_2-C_{12} 双(烷基氨基)磷酰基、 C_4-C_{24} 双(二烷基氨基)磷酰基;或者 G^F 或 $W^F G^F$;

[0018] R^G 是甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_2-C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3-C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3-C_8 环烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰基、 C_2-C_8 二烷基氨基磺酰基、 $-P(=O)(OH)_2$ 、 C_1-C_6 二烷基磷酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磷酰基、 C_3-C_8 环烷基磷酰基、 C_2-C_8 二烷氧基磷酰基、 C_6-C_{14} 二环烷氧基磷酰基、 C_8-C_{16} 二环烷基烷氧基磷酰基、 C_2-C_{12} 双(烷基氨基)磷酰基、 C_4-C_{24} 双(二烷基氨基)磷酰基;或者被 R^{16} 取代的或未被取代的苯基;或者 $W^G G^G$;

[0019] R^I 是 H 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_1-C_4 烷基;或者被卤素或 C_1-C_4 烷基取代的或未被取代的苯基;

[0020] R^J 是 H 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_1-C_4 烷基;或者被卤素或 C_1-C_4 烷基取代的或未被取代的苯基;

[0021] Q^1 是苯环或萘环系统,每个环或环系统被至多5个独立地选自 R^7 的取代基取代或未被取代;或者4-7元杂环;或者8-10元双环系统,每个环或环系统包含选自碳原子和1-5个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多5个N原子,其中至多3个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{14})_v$,每个环或环系统被至多5个取代基取代或未被取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{10} 和选自氮原子环成员上的 R^{12} ;或者

[0022] Q^2 是苯环或萘环系统, 每个环或环系统被至多5个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代; 或者4-7元杂环; 或者8-10元双环系统, 每个环或环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员, 所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多5个N原子, 其中至多3个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$, 并且硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, 每个环或环系统被至多5个取代基取代或未被取代, 所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{11} 和选自氮原子环成员上的 R^{13} ; 或者

[0023] J 是 $-CR^2R^3-$ 、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ 、 $-NR^6-$ 或 $-O-$;

[0024] Y^1 和 Y^2 各自独立地是O、S或 NR^{15} ;

[0025] R^1 是H、羟基、氨基、氰基、甲酰基、 C_3-C_8 烷基羰基烷基、 $-C(C_1-C_4\text{烷基})=N-O(C_1-C_4\text{烷基})$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_2-C_6 氰基烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_8 环烯基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_2-C_8 烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烯基烷基、 C_2-C_8 烷硫基烷基、 C_2-C_8 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_8 烷基磺酰基烷基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基、 C_5-C_{10} 环烷基羰基烷基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_2-C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 卤代烷硫基、 C_3-C_8 环烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3-C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3-C_8 环烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰基、 C_2-C_8 二烷基氨基磺酰基、 C_3-C_{10} 三烷基甲硅烷基; 或 $-CPh=N-O(C_1-C_4\text{烷基})$, 其各自在环成员上被至多5个独立地选自 R^{13} 的取代基取代或未被取代; 或者 G^1 ;

[0026] R^2 和 R^3 各自独立地是H、卤素、羟基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_1-C_4 烷氧基; 或者

[0027] R^2 和 R^3 与它们所连接的碳原子一起形成 C_3-C_7 环烷基环;

[0028] R^4 和 R^5 各自独立地是H、卤素、羟基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_1-C_4 烷氧基;

[0029] R^6 是 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基或 C_1-C_6 烷氧基; 或者

[0030] R^1 和 R^6 一起作为 C_3-C_6 亚烷基或 $-CH_2OCH_2-$;

[0031] R^7 是H、卤素、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_1-C_4 烷基;

[0032] R^8 各自独立地是氰基、羟基、氨基、硝基、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_5-C_{12} 环烷基烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 C_2-C_8 烷基羰氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 卤代烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰基、 C_2-C_8 二烷基氨基磺酰基、 C_3-C_{10} 三烷基甲硅烷基、 C_1-C_6 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_2-C_8 烷基羰基氨基或 C_1-C_6 烷基磺酰基氨基;

[0033] R^9 是H、羟基、氨基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_2-C_8 烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2-C_8 烷硫基烷基、 C_2-C_8 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_8 烷基磺酰基烷基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_2-C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 卤代烷硫基、 C_3-C_8 环烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3-C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3-C_8 环烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰基、 C_2-C_8 二烷基氨基磺酰基或 C_3-C_{10} 三烷基甲硅烷基, 或

者 G^1 ;

[0034] R^{10} 和 R^{11} 各自独立地是卤素、羟基、氰基、硝基、氨基、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_8 氰基烷基、 C_1 - C_8 氰基烷氧基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 C_1 - C_8 羟基烷基、 C_1 - C_8 硝基烷基、 C_2 - C_8 烯基、 C_2 - C_8 卤代烯基、 C_2 - C_8 硝基烯基、 C_2 - C_8 炔基、 C_2 - C_8 卤代炔基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基卤代烷氧基、 C_3 - C_6 环烷基、环丙基甲基、1-甲基环丙基、2-甲基环丙基、 C_4 - C_{10} 环烷基烷基、 C_4 - C_{10} 卤代环烷基烷基、 C_5 - C_{12} 烷基环烷基烷基、 C_5 - C_{12} 环烷基烯基、 C_5 - C_{12} 环烷基炔基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_3 - C_8 卤代环烷基、 C_4 - C_{10} 烷基环烷基、 C_6 - C_{12} 环烷基环烷基、 C_3 - C_8 环烯基、 C_3 - C_8 卤代环烯基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷氧基、 C_2 - C_8 烷氧基烷氧基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烷硫基烷基、 C_2 - C_8 烷基亚磺酰基烷基、 C_2 - C_8 烷基磺酰基烷基、 C_2 - C_8 烷基氨基、 C_2 - C_8 二烷基氨基、 C_2 - C_8 卤代二烷基氨基、 C_2 - C_8 烷基氨基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷基氨基烷基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基烷基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基烷基、-CHO、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、-C(=O)OH、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_5 - C_{12} 环烷基烷氧基羰基、-C(=O)NH₂、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_1 - C_8 烷氧基、 C_1 - C_8 卤代烷氧基、 C_2 - C_8 烯氧基、 C_2 - C_8 卤代烯氧基、 C_3 - C_8 炔氧基、 C_3 - C_8 卤代炔氧基、 C_3 - C_8 环烷氧基、 C_3 - C_8 卤代环烷氧基、 C_4 - C_{10} 环烷基烷氧基、 C_3 - C_{10} 烷基羰基烷氧基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_1 - C_8 烷基磺酰氧基、 C_1 - C_8 卤代烷基磺酰氧基、 C_1 - C_8 烷硫基、 C_1 - C_8 卤代烷硫基、 C_3 - C_8 环烷硫基、 C_1 - C_8 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_8 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_8 烷基磺酰基、 C_1 - C_8 卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基磺酰基、甲酰氨基、 C_2 - C_8 烷基羰基氨基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基氨基、 C_3 - C_8 环烷基氨基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基氨基、 C_1 - C_6 烷基磺酰氨基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰氨基、-SF₅、-SCN、SO₂NH₂、 C_3 - C_{12} 三烷基甲硅烷基、 C_4 - C_{12} 三烷基甲硅烷基烷基或 C_4 - C_{12} 三烷基甲硅烷基烷氧基;或者 G^2 ;或者 $R^{20}S(=O)=N$ -、 $R^{20}S(=O)_2NR^{19}-C(=O)-$ 或 $R^{20}(R^{19}N=)_qS(=O)_p$ -,其中向右突出的自由键表示与 Q^1 的连接点;或者

[0035] R^{12} 和 R^{13} 各自独立地是氰基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_8 羟基烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_2 - C_3 烷氧基烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基、 C_2 - C_3 烷基氨基烷基或 C_3 - C_4 二烷基氨基烷基;

[0036] R^{14} 各自独立地是H、氰基、 C_2 - C_3 烷基羰基或 C_2 - C_3 卤代烷基羰基;

[0037] R^{15} 各自独立地是H、氰基、羟基、CHO、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_2 - C_6 烷基羰基、 C_2 - C_6 卤代烷基羰基、-C(=O)CH₃或-C(=O)CF₃;

[0038] G^1 各自独立地是苯基;或者5元或6元杂环,其各自在环成员上被至多5个独立地选自 R^{17} 的取代基取代或未被取代;

[0039] W^E 、 W^F 和 W^G 各自独立地是-C(=O)-、-C(=O)O-、-C(=O)NH-或-S(=O)₂-;

[0040] G^E 、 G^F 和 G^G 各自独立地是被 R^{16} 取代的或未被取代的苯基;或者5元或6元杂环,每个杂环在环成员上被至多5个独立地选自 R^{16} 的取代基取代或未被取代;

[0041] G^2 各自独立地是苯基、苯甲基(即苄基)、吡啶基甲基、苯基羰基(即苯甲酰基)、苯氧基、苯基乙炔基、苯磺酰基或者5元或6元杂环,其各自在环成员上被至多5个独立地选自 R^{18} 的取代基取代或未被取代;

[0042] R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自独立地是卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、-SO₂NH₂、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷

基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₅-C₁₂环烷基烷氧基羰基、C₂-C₈烷基氨基羰基、C₃-C₁₀二烷基氨基羰基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、C₂-C₈烷基羰氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆卤代烷硫基、C₁-C₆烷基亚磺酰基、C₁-C₆卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆烷基磺酰基、C₁-C₆卤代烷基磺酰基、C₁-C₆烷基氨基磺酰基、C₂-C₈二烷基氨基磺酰基、C₃-C₁₀三烷基甲硅烷基、C₁-C₆烷基氨基、C₂-C₈二烷基氨基、C₂-C₈烷基羰基氨基、C₁-C₆烷基磺酰氨基、苯基、吡啶基或噻吩基；

[0043] R¹⁹各自独立地是H、氰基、C₂-C₃烷基羰基或C₂-C₃卤代烷基羰基；

[0044] R²⁰各自独立地是H、C₁-C₆烷基、C₃-C₈环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₁-C₆卤代烷基、C₂-C₆烯基、C₃-C₆炔基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₂-C₈烷硫基烷基、C₂-C₈烷基亚磺酰基烷基、C₂-C₈烷基磺酰基烷基、C₁-C₆烷氧基、C₃-C₁₀三烷基甲硅烷基；或G¹；

[0045] 在S(=O)_u(=NR¹⁴)_v的每种情况下，u和v各自独立地是0、1或2，条件是u和v的总和是0、1或2；且

[0046] 在R²⁰(R¹⁹N=)_qS(=O)_p的每种情况下，p和q各自独立地是0、1或2，条件是u和v的总和是0、1或2，并且当p是0时，q不是1或2。

[0047] 更具体地，本发明涉及式1的化合物（包括所有立体异构体）、其N-氧化物或其盐。本发明还涉及除草剂组合物，所述除草剂组合物包含本发明的化合物（即，以除草有效量）和至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的组分。本发明还涉及控制不期望的植被生长的方法，所述方法包括使所述植被或其环境与除草有效量的本发明化合物（例如为本文所述的组合物形式）接触。

[0048] 本发明还包括一种除草剂混合物，所述除草剂混合物包含（a）选自式1的化合物、其N-氧化物及其盐的化合物，和（b）至少一种附加活性成分，所述附加活性成分选自（b1）至（b16）以及（b1）至（b16）的化合物的盐，如下所述。

[0049] 发明详述

[0050] 如本文所用，术语“包含（comprises, comprising）”、“包括（includes, including）”、“具有（has, having）”、“含有（contains, containing）”、“特征在于（characterized by）”或其任何其它变型旨在涵盖非排它性的包括，以任何明确指明的限定为条件。例如，包含一系列要素的组合物、混合物、工艺或方法不必仅限于那些要素，而是可以包括其它未明确列出的要素，或此类组合物、混合物、工艺或方法固有的其它要素。

[0051] 连接短语“由…组成”不包括任何未指定的要素、步骤或成分。如果是在权利要求中，则此类短语会限制权利要求，以不包含除了通常与之伴随的杂质以外不是所述那些的材料。当短语“由…组成”出现在权利要求的主体的子句中而非紧接前序时，其仅限制在该子句中提到的要素；其它要素不会从权利要求整体中被排除。

[0052] 连接短语“基本上由…组成”用于限定包括除了字面公开的那些以外的物质、步骤、部件、组分或要素的组合物或方法，前提条件是，这些附加的物质、步骤、部件、组分或元素不会实质上影响所保护发明的基本特征和新颖特征。术语“基本上由…组成”居于“包括（包含）”和“由…组成”中间。

[0053] 当申请人使用开放式术语（例如“包括（包含）”）来限定发明或其部分时，应当容易地理解（除非另有指明），该描述应被解释为也使用了术语“基本上由…组成”或“由…组成”来描述这一发明。

[0054] 此外,除非明确指明相反,“或”是指包含性的“或”而非排他性的“或”。例如,条件A或B满足下列中的任一项:A为真实的(或存在的)且B为虚假的(或不存在的),A为虚假的(或不存在的)且B为真实的(或存在的),以及A和B均为真实的(或存在的)。

[0055] 另外,在本发明的要素或组分之前的不定冠词“a”、“an”无意于限制该要素或组分的实例(即出现)的数量。因此,“a”、“an”应理解为包括一个/种或至少一个/种,并且要素或组分的单数词语形式还包括复数,除非该数值明显意指单数。

[0056] 如本文所指,术语“幼苗”可单独使用或以词组形式使用,是指由种子的胚芽发育的幼小植物。

[0057] 如本文所指,术语“阔叶”可单独使用或以词语诸如“阔叶杂草”形式使用,是指双子叶或双子叶植物,双子叶植物是用于描述一类被子植物的术语,其以具有两个子叶的胚为特征。

[0058] 如本文所用,术语“烷化剂”是指其中含碳基团通过碳原子与离去基团诸如卤素或磺酸酯键合的化合物,所述离去基团可通过亲核试剂与所述碳原子键合而置换。除非另外指明,术语“烷基化”并未将含碳基团限制为烷基。

[0059] 在上述表述中,单独使用或在复合词如“烷硫基”或“卤代烷基”中使用的术语“烷基”包括直链或支链的烷基,如甲基、乙基、正丙基、异丙基或不同的丁基、戊基或己基异构体。“烯基”包括直链或支链的烯烃,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基以及不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。“烯基”还包括多烯,如1,2-丙二烯基和2,4-己二烯基。“炔基”包括直链或支链的炔烃,如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基以及不同的丁炔基、戊炔基和己炔基异构体。“炔基”还可包括包含多个三键的基团,例如2,5-己二炔基。“亚烷基”表示直链或支链烷烃二基(alkanediyl)。“亚烷基”的实例包括 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ 以及不同的亚丁基、亚戊基和亚己基异构体。

[0060] “烷氧基”包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基以及不同的丁氧基、戊氧基和己氧基异构体。“烷氧基烷基”表示烷基上的烷氧基取代。“烷氧基烷基”的实例包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。“烷氧基烷氧基烷基”表示烷氧基烷基基团的烷氧基部分上的至少烷氧基取代。“烷氧基烷氧基烷基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{CHOCH}_2$ -和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2$ -。“烷氧基烷氧基”表示烷氧基上的烷氧基取代。烷氧基烷氧基的实例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}$ 。“烯氧基”包括直链或支链的烯氧基基团。“烯氧基”的实例包括 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 。“炔氧基”包括直链或支链的炔氧基基团。“炔氧基”的实例包括 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 和 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 。“烷硫基”包括支链或直链的烷硫基基团,例如甲硫基、乙硫基以及不同的丙硫基、丁硫基、戊硫基和己硫基异构体。“烷基亚磺酰基”包括烷基亚磺酰基基团的两种对映体。“烷基亚磺酰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ -、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ -以及不同的丁基亚磺酰基、戊基亚磺酰基和己基亚磺酰基异构体。“烷基磺酰基”表示被直链或支链烷基取代的磺酰基基团。“烷基磺酰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ -、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ -以及不同的丁基磺酰基、戊基磺酰基和己基磺酰基异构体。“烷硫基烷基”表示烷基上的烷硫基取代。“烷硫基烷基”的实例包括 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 。“烷基亚磺酰基烷基”表示烷基上的烷基亚磺酰基取代。“烷基亚磺酰基烷

基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ 。“烷基磺酰基烷基”表示烷基上的烷基磺酰基取代。“烷基磺酰基烷基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 。“烷基磺酰氧基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 。“烷基氨基”、“二烷基氨基”、“卤代二烷基氨基”等与上述实例类似地定义。“烷基磺酰氨基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{NH}-$ 和 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{NH}-$ 。“烷基氨基烷基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{NHCH}_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHCH}_2-$ 和 $\text{CH}_3\text{NHCH}(\text{CH}_3)-$ 。“二烷基氨基烷基”的实例包括 $(\text{CH}_3)_2\text{NCH}_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{CH}_3)\text{H}-$ 和 $(\text{CH}_3)(\text{CH}_3)\text{NCH}_2-$ 。“烷基氨基羰基”的实例包括 $(\text{CH}_3)\text{NHC}(\text{O})-$ 和 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{NHC}(\text{O})-$ 。“二烷基氨基羰基”的实例是 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{O})-$ 。“烷基氨基磺酰基”的实例是 $(\text{CH}_3)\text{NHS}(\text{O})_2-$ ，且“二烷基氨基磺酰基”的实例是 $(\text{CH}_3)_2\text{NS}(\text{O})_2-$ 。术语“烷基羰基氨基”表示与羰基氨基基团的 $\text{C}(=\text{O})$ 部分键合的直链或支链烷基部分。“烷基羰基氨基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ 。术语“烷氧基羰基氨基”表示与羰基氨基基团的 $\text{C}(=\text{O})$ 部分键合的直链或支链烷氧基部分。“烷氧基羰基氨基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$ 。

[0061] “环烷基”包括例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。术语“烷基环烷基”表示环烷基部分上的烷基取代，并且包括例如乙基环丙基、异丙基环丁基、3-甲基环戊基和4-甲基环己基。术语“环烷基烷基”表示烷基部分上的环烷基取代。“环烷基烷基”的实例包括环丙基甲基、环戊基乙基，以及与直链或支链烷基键合的其它环烷基部分。术语“烷基环烷基烷基”的实例包括1-甲基环丙基甲基和2-甲基环戊基乙基。术语“环烷基烯基”表示与烯基部分键合的环烷基。术语“环烷基环烷基”表示通过单键连接的环烷基部分上的环烷基取代。术语“环烷基炔基”表示与炔基部分键合的环烷基。术语“环烷基氨基”表示与氨基部分键合的环烷基。术语“环烷基氨基羰基”表示与氨基羰基部分键合的环烷基。术语“环烷基氨基烷基”表示与氨基烷基部分键合的环烷基。术语“环烷基羰基”表示与羰基部分键合的环烷基。术语“环烷基羰基烷基”表示与羰基烷基部分键合的环烷基。术语“环烷基羰氧基”表示与羰氧基部分的碳原子键合的环烷基。术语“环烷氧基”表示通过氧原子连接的环烷基，例如环戊氧基和环己氧基。术语“环烷氧基烷基”表示通过烷基部分连接的环烷氧基。术语“环烷硫基”、“环烷基亚磺酰基”和“环烷基磺酰基”分别表示通过硫、亚磺酰基或磺酰基部分键合的环烷基。

[0062] 术语“环烷氧基羰基”表示通过羰基部分连接的环烷氧基。“环烷基烷氧基”表示通过与烷基链结合的氧原子连接的环烷基烷基。“环烷基烷氧基”的实例包括环丙基甲氧基、环戊基乙氧基，以及与直链或支链烷氧基基团键合的其它环烷基部分。“环烯基”包括诸如环戊烯基和环己烯基的基团，以及具有多于一个双键的基团，例如1,3-环己二烯基和1,4-环己二烯基。术语“卤代环烯基”表示环烯基部分上的卤素取代。

[0063] 单独的或在诸如“卤代烷基”的复合词中的或者当用于诸如“被卤素取代的烷基”的描述时的术语“卤素(卤代)”包括氟、氯、溴或碘。此外，当用于诸如“卤代烷基”的复合词中时，或当用于诸如“被卤素取代的烷基”的描述中时，所述烷基可以是被卤素原子(其可以是相同的或不同的)部分地或完全地取代的。“卤代烷基”或“被卤素取代的烷基”的实例包括 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 和 CF_3CCl_2 。术语“卤代环烷基”、“卤代环烷基烷基”、“卤代环烷氧基”、“卤代烷氧基”、“卤代烷氧基烷氧基”、“卤代烷硫基”、“卤代烷基亚磺酰基”、“卤代烷基磺酰基”、“卤代烯基”、“卤代炔基”、“卤代烯氧基”、“卤代烯基烷基”、“卤代烷基羰基”、“卤代烷

基羰基氨基”、“卤代烷基磺酰氨基”、“卤代烷氧基卤代烷氧基”、“卤代烷基磺酰氧基”、“卤代炔氧基”、“卤代烷氧基烷基”、“卤代烷基羰氧基”、“卤代烷基氨基烷基”等与术语“卤代烷基”类似地定义。“卤代烷氧基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 。“卤代烷硫基”的实例包括 $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ 和 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 。“卤代烷基亚磺酰基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$ 。“卤代烷基磺酰基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 。“卤代烷基磺酰氧基”的实例包括 $\text{CHCl}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 、 $\text{CH}_2\text{ClCH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 和 $\text{CH}_3\text{CHClCH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 。“卤代烯基”的实例包括 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ 。“卤代烯氧基”的实例包括 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}-$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}-$ 。“卤代炔基”的实例包括 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}-$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ 和 $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2-$ 。“卤代炔氧基”的实例包括 $\text{HC}\equiv\text{CCHClO}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ 和 $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}-$ 。“卤代烷氧基烷基”的实例包括 CF_3OCH_2- 、 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2-$ 以及支链烷基衍生物。“卤代烷氧基羰基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{OC}(\text{O})-$ 、 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})-$ 以及支链烷基衍生物。

[0064] “烷基羰基”表示与 $\text{C}(\text{O})$ 部分键合的直链或支链的烷基部分。“烷氧基羰基”表示与 $\text{C}(\text{O})$ 部分键合的直链或支链烷氧基部分。“烷基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{C}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})-$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(\text{O})-$ 。“烷氧基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(\text{O})-$ 和不同的丁氧基羰基或戊氧基羰基异构体。“环烷基烷氧基羰基”表示与烷氧基羰基部分的氧原子键合的环烷基烷基部分。“环烷基烷氧基羰基”的实例包括环丙基- $\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})-$ 、环丙基- $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OC}(\text{O})-$ 和环戊基- $\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})-$ 。“烷基羰基烷基”表示与羰基烷基部分的碳原子键合的直链或支链烷基基团。“烷基羰基烷基”的实例包括 $(\text{CH}_3)\text{C}(\text{O})\text{CH}_2-$ 和 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{C}(\text{O})\text{CH}_2-$ 。“烷基羰氧基”表示与羰氧基部分的碳原子键合的直链或支链烷基基团。“烷基羰氧基”的实例包括 $(\text{CH}_3)\text{C}(\text{O})\text{O}-$ 和 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{C}(\text{O})\text{O}-$ 。

[0065] 术语“二烷基磷酰基”是指氧化膦(phosine oxide)衍生物。“二烷基磷酰基”的实例包括 $-\text{P}(\text{O})(\text{CH}_3)_2$ 和 $-\text{P}(\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$ 。术语“卤代烷基磷酰基”是指卤代氧化膦衍生物。“卤代烷基磷酰基”的实例包括 $\text{P}(\text{O})(\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 和 $-\text{P}(\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br})_2$ 和 $-\text{P}(\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2)_2$ 。术语“环烷基磷酰基”是指环烷基氧化膦衍生物。“环烷基磷酰基”的实例包括 $-\text{P}(\text{O})(\text{c-Pr})_2$ 和 $-\text{P}(\text{O})(\text{c-hex})_2$ 。术语“二烷氧基磷酰基”是指膦酸衍生物。“二烷氧基磷酰基”的实例包括 $-\text{P}(\text{O})(\text{OCH}_3)_2$ 和 $-\text{P}(\text{O})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)_2$ 。术语“二环烷基烷氧基磷酰基”是指膦酸衍生物。二环烷基烷氧基磷酰基的实例包括 $-\text{P}(\text{O})(\text{O-c-Pr})_2$ 和 $-\text{P}(\text{O})(\text{O-c-Bu})_2$ 。双(烷基氨基)磷酰基的实例包括 $-\text{P}(\text{O})(\text{NHCH}_3)_2$ 和 $-\text{P}(\text{O})(\text{NHCH}_2\text{CH}_3)_2$ 。双(二烷基氨基)磷酰基的实例包括 $-\text{P}(\text{O})(\text{N}(\text{CH}_3)_2)_2$ 和 $-\text{P}(\text{O})(\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2)_2$ 。

[0066] 术语“氰基烷基”或“氰基烷氧基”分别表示通过烷基或烷氧基部分键合的氰基基团。氰基基团中的碳不包括在该术语的碳原子总数中。术语“硝基烷基”或“硝基烯基”分别表示通过烷基或烯基部分键合的硝基基团。术语“羟基烷基”表示通过烷基部分键合的羟基基团。术语“三烷基甲硅烷基”表示通过硅键合的三个烷基基团。术语“三烷基甲硅烷基烷基”表示通过甲硅烷基烷基部分键合的三个烷基基团。术语“三烷基甲硅烷基烷氧基”表示通过甲硅烷基烷氧基部分键合的三个烷基基团。

[0067] 取代基基团中的碳原子总数由“ C_i-C_j ”前缀表示,其中 i 和 j 为1至24的数。例如, C_1-C_4 烷基磺酰基表示甲基磺酰基至丁基磺酰基; C_2 烷氧基烷基表示 CH_3OCH_2- ; C_3 烷氧基烷基表

示例如 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 或 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ ；并且 C_4 烷氧基烷基表示包含总共四个碳原子的被烷氧基基团取代的烷基基团的各种异构体，实例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 。

[0068] 当化合物被带有下标的取代基(所述下标表示所述取代基的数目可以大于1)取代时，所述取代基(当它们的数目大于1时)独立地选自所限定的取代基的群组，例如 $(\text{R}^i)_n$ ， n 为1、2、3、4或5。当某基团含有可以为氢的取代基(例如 R^2 或 R^3)时，则当该取代基为氢时，认为其等同于所述基团未取代。当某变量显示任选地与某位置连接(例如 $\text{R}^{(7)}_n$ ，其中 n 可以是0)时，则氢可以在该位置，即使在该变量的定义中并未提及。当某基团的一或多个位置被称为“未被取代”或“未取代”，则连接氢原子占据任意自由价。

[0069] 与原子环相关的表述“完全饱和”表示该环的原子之间的键均为单键。与环相关的表述“完全不饱和”表示根据价键理论，该环中的原子之间的键为单键或双键，并且该环中的原子之间的键包括尽可能多的双键，但不包括累积的双键(即，没有 $\text{C}=\text{C}=\text{C}$ 、 $\text{N}=\text{C}=\text{C}$ 等)。与环相关的术语“部分不饱和”表示这样的环，其包含至少一个通过双键与相邻的环成员键合的环成员，并且概念上可能通过相邻的环成员容纳许多非累积的双键(即，以其完全不饱和对应形式)，所述非累积的双键大于存在的双键数目(即，以其部分不饱和形式)。当完全不饱和环满足休克尔规则时，则其也可被描述为芳族的。

[0070] 除非另外指明，作为式1的组分的“环”或“环系统”(例如，取代基 Q^1)是碳环或杂环。术语“环系统”表示两个或更多个稠环。术语“双环系统”和“稠合双环系统”表示由两个稠环组成的环系统，其中每个环可以是饱和的、部分不饱和的或完全不饱和的，除非另外指明。术语“稠合杂双环系统”表示其中至少一个环原子不是碳的稠合双环系统。术语“环成员”表示形成环或环系统的骨架的原子或其它部分(例如， $\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{C}(=\text{S})$ 、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(=\text{O})_2$)。

[0071] 术语“碳环(carbocyclic ring)”、“碳环(carbocycle)”或“碳环系统”表示其中形成环骨架的原子仅选自碳的环或环系统。除非另外指明，碳环可以是饱和的、部分不饱和的、或完全不饱和的环。当完全不饱和碳环满足休克尔法则时，那么所述环也被称为“芳环”。“饱和碳环”表示这样的环，其具有由通过单键彼此连接的碳原子组成的骨架；除非另外指明，剩余的碳价态被氢原子占据。

[0072] 术语“杂环(heterocyclic ring)”、“杂环(heterocycle)”或“杂环系统”表示其中形成环主链的至少一个原子不是碳(例如为氮、氧或硫)的环或环系统。通常，杂环包含不超过5个氮、不超过2个氧和不超过2个硫。除非另外指明，杂环可以是饱和的、部分不饱和的或完全不饱和的环。当完全不饱和的杂环满足休克尔法则时，则所述环还被称为“杂芳环”或“芳族杂环”。除非另外指明，杂环和杂环系统可通过任意可用的碳或氮连接(通过替代所述碳或氮上的氢实现)。

[0073] “芳族的”是指各环原子基本上在同一平面中，并且具有垂直于所述环平面的p-轨道，并且 $(4n+2)$ 个 π 电子(其中 n 为正整数)与所述环关联，以符合休克尔法则。术语“芳族环或环系统”表示这样的碳环或杂环或环系统，其中该环或该环系统的至少一个环是芳族的。术语“芳族环或环系统”也被称为“芳基”。术语“芳族杂环系统”表示这样的杂环系统，其中该环系统的至少一个环是芳族的。术语“非芳族环系统”表示这样的碳环或杂环系统，其可以是完全饱和的、以及部分或完全不饱和的，条件是该环系统中的环均非芳族的。术语“非

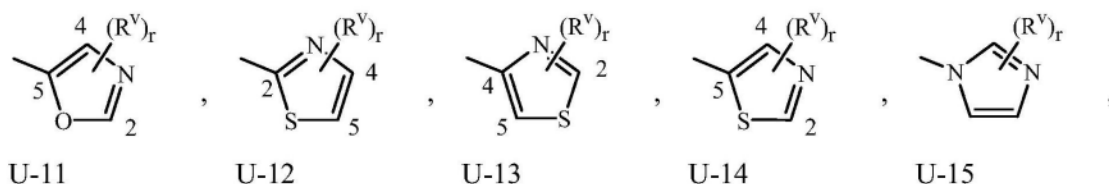
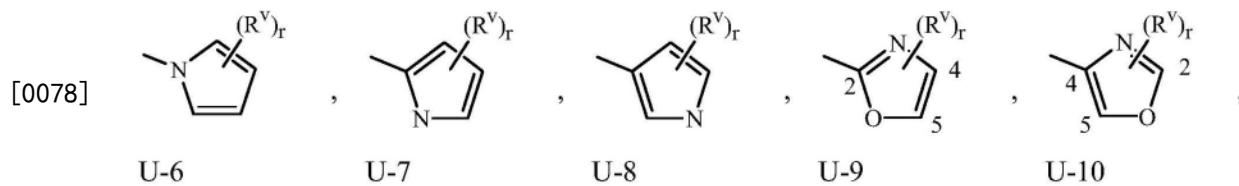
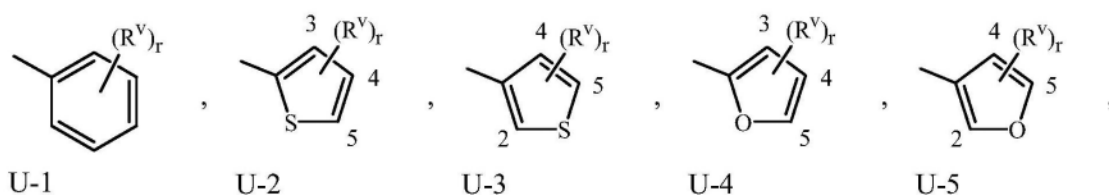
芳族碳环系统”描述这样的碳环系统,其中该环系统中的环均非芳族的。术语“非芳族杂环系统”表示这样的杂环系统,其中该环系统中的环均非芳族的。

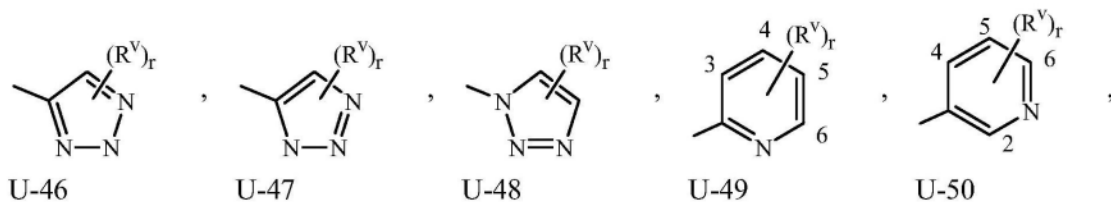
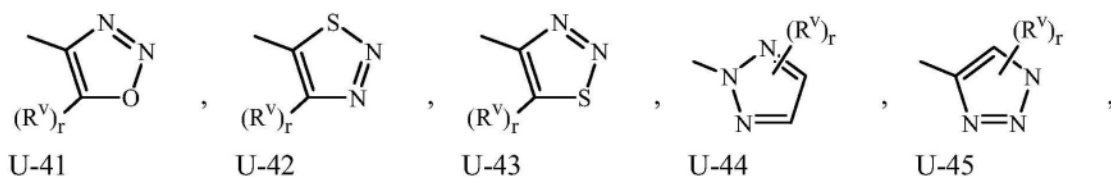
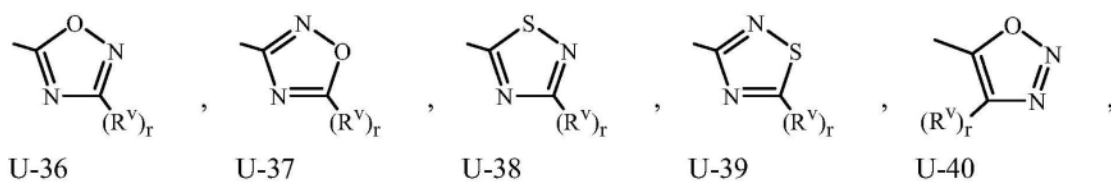
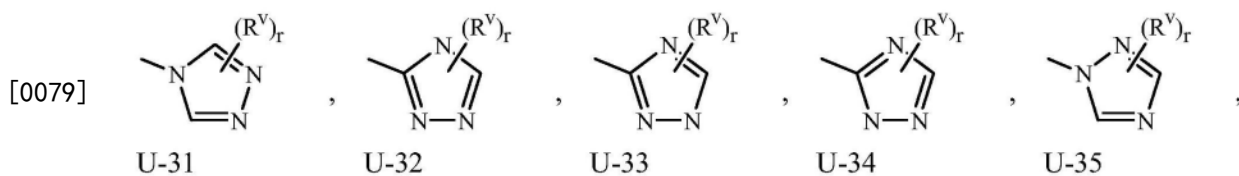
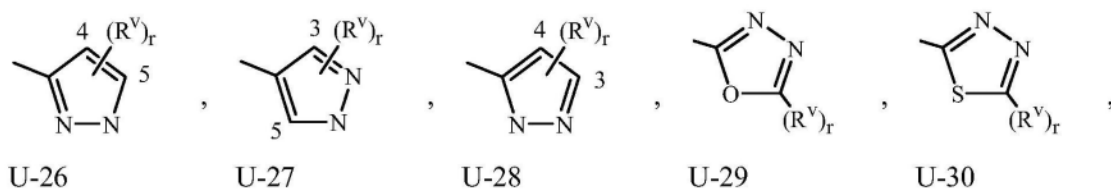
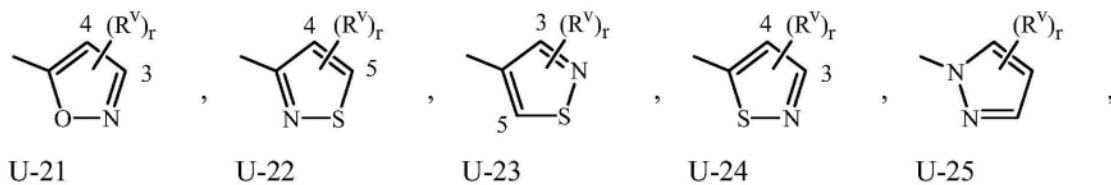
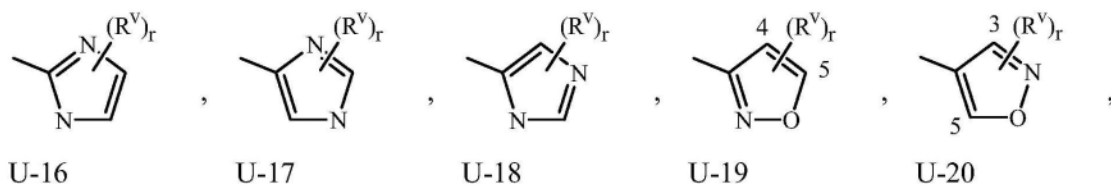
[0074] 与杂环有关的术语“取代的或未被取代的”或“任选地取代的”是指这样的基团,其为未取代的,或具有至少一个不破坏未取代的类似物所拥有的生物活性的非氢取代基。如本文所用,除非另外指明,将应用以下定义。术语“取代的或未被取代的”与短语“任选地取代的”或与术语“(未)取代的”可互换使用。除非另外指明,任选地被取代的基团可在所述基团的每个可取代的位置具有取代基,并且每个取代均彼此独立。

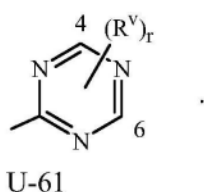
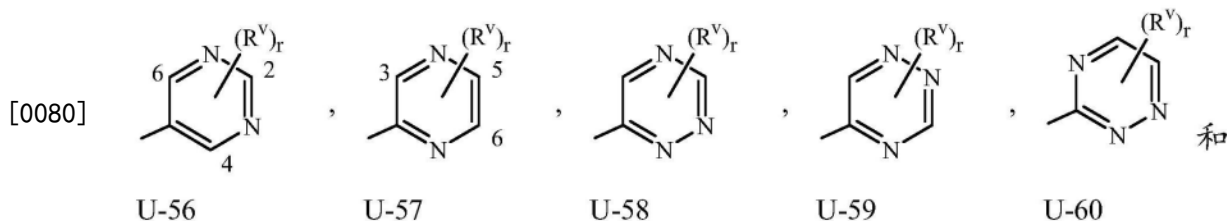
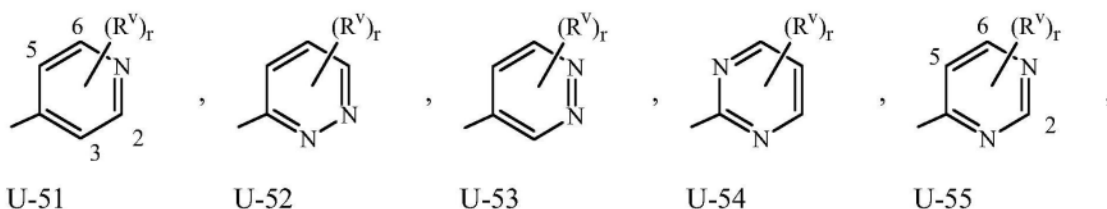
[0075] 当 Q^1 或 Q^2 是4-7元杂环系统时,其可通过任意可用的碳或氮环原子与式1的其余部分连接,除非另有描述。如上所述, Q^1 和 Q^2 可为(特别地)任选地被一个或多个取代基取代的苯基,所述取代基选自如发明概述中定义的取代基群组。任选地被一至五个取代基取代的苯基的实例为示例1中的U-1所示的环,其中,例如, R^v 如发明概述中对 Q^1 所定义的 R^{10} ,或者 R^v 如发明概述中对 Q^2 所定义的 R^{11} ,并且r为整数(0至5)。

[0076] 如上所述, Q^1 和 Q^2 可为(特别地)被一个或多个取代基取代的或未被取代的5元或6元不饱和杂环,所述取代基选自如发明概述中所定义的取代基群组。被一个或多个取代基取代的或未被取代的5元或6元不饱和芳族杂环的实例包括示例1所示的环U-2至U-61,其中 R^v 为如发明概述中对 Q^1 和 Q^2 所定义的任何取代基,并且r为0至4的整数,其受限于每个U基团上的可用位置的数目。由于U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U40、U-41、U-42和U-43仅有一个可用的位置,因此对于这些U基团,r被限定到整数0或1,并且r为0是指U基团是未取代的,并且在由 $(R^v)_r$ 指示的位置处存在氢。

[0077] 示例1





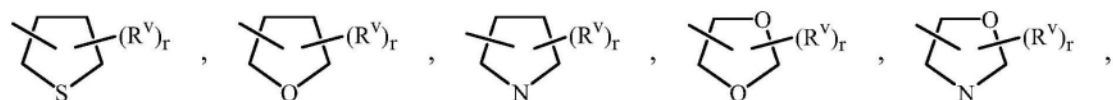


[0081] 请注意,当 Q^1 或 Q^2 是任选地被一或多个取代基(选自如发明概述中对 Q^1 或 Q^2 所定义的取代基群组)取代的5元或6元饱和或不饱和非芳族杂环时,该杂环的一或二个碳环成员可任选地为羰基基团氧化形式。

[0082] 5元或6元饱和或非芳族不饱和杂环的实例包括示例2所示的环G-1至G-35,所述5元或6元饱和或非芳族不饱和杂环包含选自至多二个O原子和至多二个S原子的环成员,并且在碳原子环成员上任选地被至多五个如发明概述中所定义的取代基取代。请注意,当G基团上的连接点显示为浮置时,G基团可通过替代氢原子而经由G基团的任意可用的碳或氮连接到式1的其余部分上。通过替代氢原子,可以将与 R^v 对应的任选的取代基连接到任意可用的碳或氮上。对于这些G环,r通常是0-4的整数,受限于每个G基团上的可用位置的数目。

[0083] 请注意,当 Q^1 或 Q^2 包括选自G-28至G-35的环时, G^2 选自O、S或N。请注意,当 G^2 是N时,该氮原子可通过用H或者与如发明概述中对 Q^1 或 Q^2 所定义的 R^v 对应的取代基(即,碳原子上的 R^{10} 或 R^{11} 以及氮原子上的 R^{12} 或 R^{13})取代来完成其化合价。

[0084] 示例2



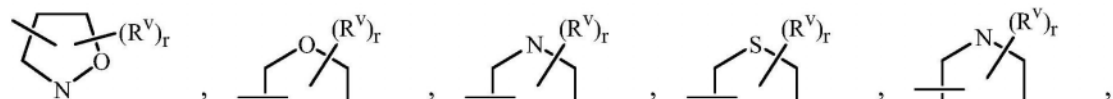
G-1

G-2

G-3

G-4

G-5



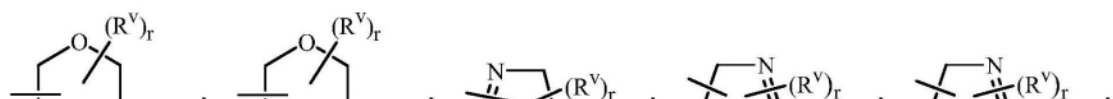
G-6

G-7

G-8

G-9

G-10



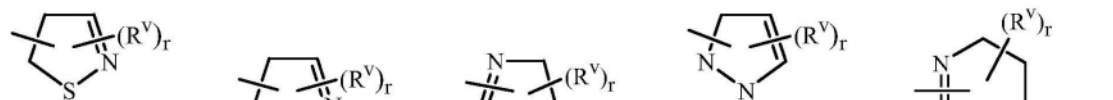
G-11

G-12

G-13

G-14

G-15



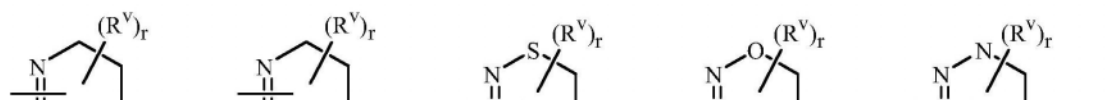
G-16

G-17

G-18

G-19

G-20



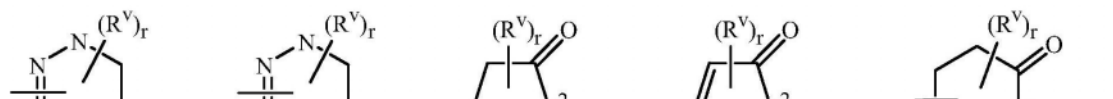
G-21

G-22

G-23

G-24

G-25



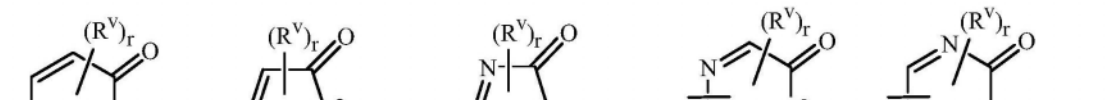
G-26

G-27

G-28

G-29

G-30



G-31

G-32

G-33

G-34

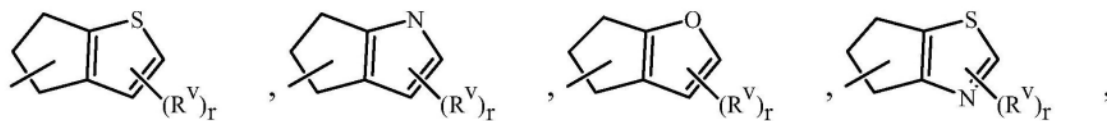
G-35

[0085]

[0086] 如上所述, Q^1 或 Q^2 可以是 (特别地) 8元、9元或10元稠合双环系统, 其任选地被一或多个取代基 (选自如发明概述中所定义的取代基群组) 取代 (即, 碳原子上的 R^{10} 或 R^{11} 以及氮原子上的 R^{12} 或 R^{13})。任选地被一或多个取代基取代的8元、9元或10元稠合双环系统的实例包括示例3所示的环U-81至U-123, 其中 R^v 是如发明概述中对 Q^1 或 Q^2 所定义的任意取代基

(即,碳原子上的 R^{10} 或 R^{11} 以及氮原子上的 R^{12} 或 R^{13}),并且r通常是0-5的整数。

[0087] 示例3

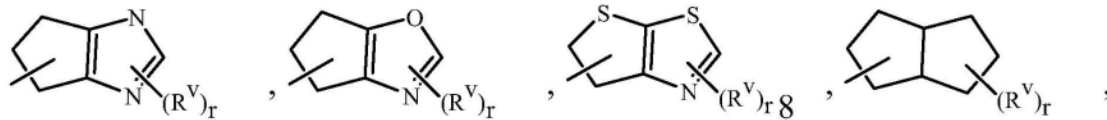


U-81

U-82

U-83

U-84



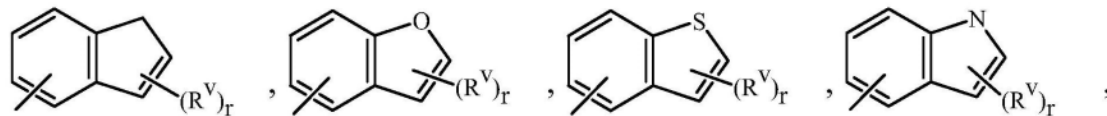
U-85

U-86

U-87

U-88

[0088]

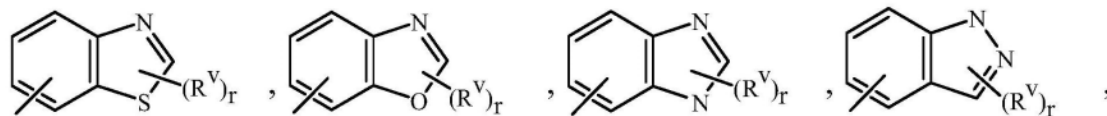


U-89

U-90

U-91

U-92

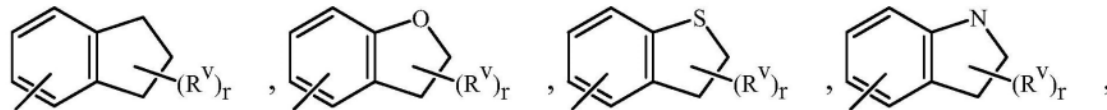


U-93

U-94

U-95

U-96

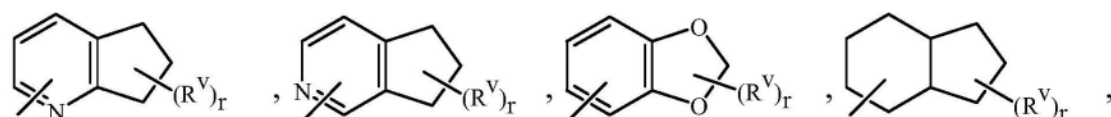


U-97

U-98

U-99

U-100

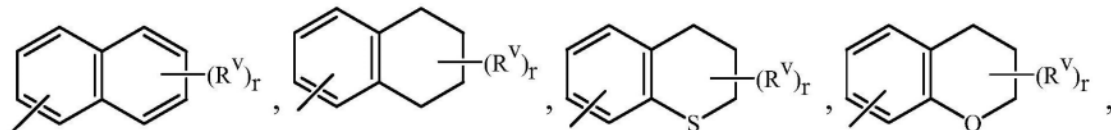


U-101

U-102

U-103

U-104

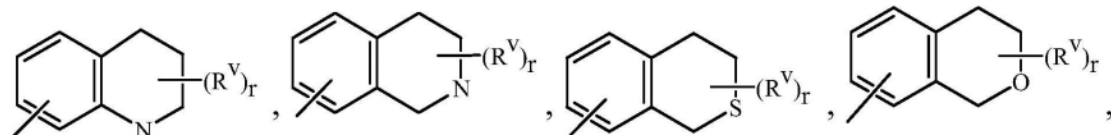


U-105

U-106

U-107

U-108



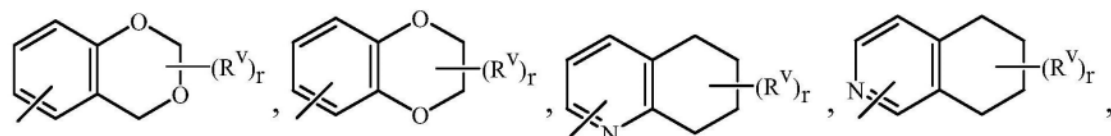
U-109

U-110

U-111

U-112

[0089]

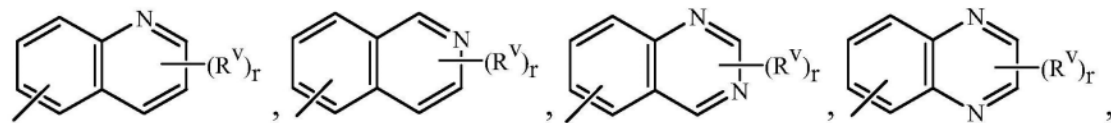


U-113

U-114

U-115

U-116

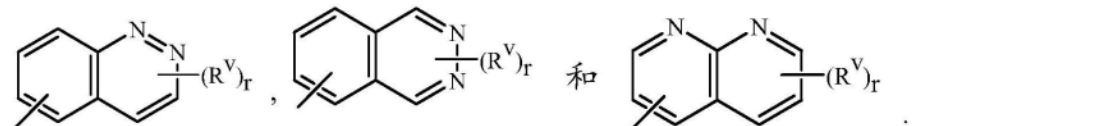


U-117

U-118

U-119

U-120



U-121

U-122

U-123

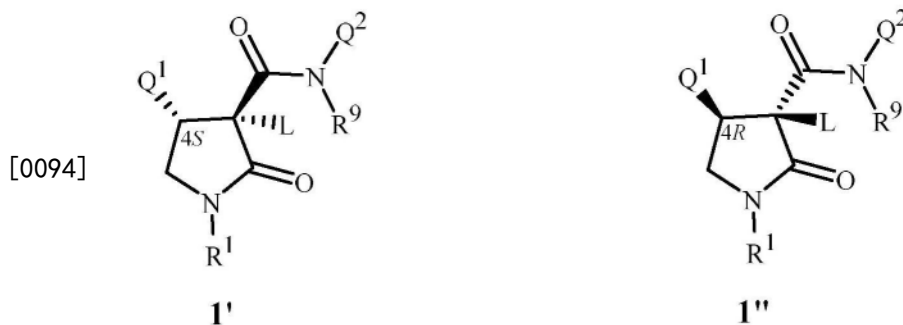
[0090] 虽然在结构U-1至U-123中示出 R^V 基团,但是应注意到,因为它们是任选存在的取代基,因此它们不是必须存在的。需注意,当 R^V 为H时,当连接到原子时,这如同所述原子为未取代的一样。需要取代以填充其化合价的氮原子被H或 R^V 取代。需注意,当 $(R^V)_r$ 与U基团间的连接点显示为浮置时, $(R^V)_r$ 可连接到U基团的任意可用的碳原子或氮原子。需注意,当U基团上的连接点显示为浮置时,所述U基团可通过替代氢原子,经由U基团中的任意可用的碳或氮连接到式1的其余部分。需注意,某些U基团仅能被少于4个 R^V 基团取代(例如U-2至U-5, U-7至U-48,以及U-52至U-61)。

[0091] 本领域中已知有多种合成方法能够制备芳族和非芳族的杂环和环系统;大量的综述参见八卷集的Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R.Katritzky和C.W.Rees主编, Pergamon Press, Oxford, 1984和十二卷集的Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A.R.Katritzky, C.W.Rees和E.F.V.Scriven主编, Pergamon Press, Oxford, 1996。

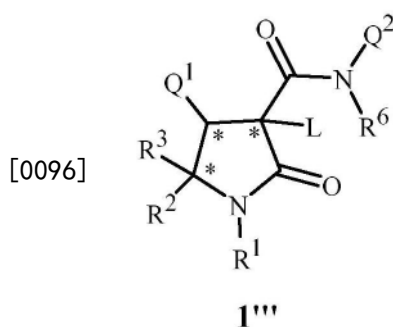
[0092] 本发明的化合物可作为一种或多种立体异构体存在。各种立体异构体包括对映

体、非对映体、阻转异构体和几何异构体。立体异构体为构成相同但它们的原子在空间上排列不同的异构体,并且包括对映体、非对映体、顺-反异构体(还称为几何异构体)和阻转异构体。阻转异构体起因于围绕单键的旋转受限制,其中旋转势垒足够高以允许同分异构物质的分离。本领域技术人员会理解,当一种立体异构体相对于其它立体异构体富集时,或当其与其它立体异构体分离时,其可能更有活性和/或可能表现出有益的效果。另外,本领域技术人员知晓如何分离、富集和/或选择性地制备所述立体异构体。本发明的化合物可作为立体异构体的混合物、单独的立体异构体或作为旋光形式存在。特别是当 R^4 和 R^5 各自为H时, $C(O)N(Q^2)(R^9)$ 和 Q^1 取代基通常主要在吡咯烷酮环上呈热力学上优选的反式构型。

[0093] 例如,如下所示,通常在反式构型中发现与环的3位处的碳键合的 $C(O)N(Q^2)(R^9)$ 部分(即,式1的化合物,其中 Y^1 和 Y^2 均为O; R^1 是H;并且J是 $-CR^2R^3-$,并且 R^2 和 R^3 均为H)以及与环的4位处的碳键合的 Q^1 。这两个碳原子均具有手性中心。最普遍的一对对映异构体如式1'和式1''所示。尽管本发明涉及所有立体异构体,但是对于生物可操作性(biological operability)而言优选的对映异构体被鉴定为式1'。对于立体异构所有方面的综合讨论,参见Ernest L.Eliel和Samuel H.Wilen, Stereochemistry of Organic Compounds, John Wiley&Sons, 1994。



[0095] 本领域技术人员还会认识到,吡咯烷酮环的5位处的碳原子(即,当J是 $-CR^2R^3-$ 时,与 R^2 和 R^3 二者均键合的碳原子)也含有由(*)表示的立体中心,如式1'''所示。本发明涉及所有立体异构体,因此,当 R^2 或 R^3 不是相同的取代基时,则可以是非对映体的混合物。



[0097] 本文绘制的分子式(molecular depiction)遵循描绘立体化学的标准惯例。为了表示立体构型,用实心的楔形表示从图的平面上升并朝向观察者的键,其中楔的宽端连接到从图的平面朝观察者上升的原子。用虚线的楔形表示进入图的平面以下并远离观察者的键,其中楔的窄端连接到更靠近观察者的原子上。等宽线表示相对于用实心或虚线楔形所示的键具有相反或中性方向的键;等宽线还描绘了分子或分子部分中的键,其中未意图指定特定的立体构型。

[0098] 本发明还包括外消旋混合物,例如,等量的式1'和1''(以及任选存在的1''')的对映

体。此外,本发明包括与外消旋混合物相比式1的对映体富集的化合物。还包括式1的化合物的基本上纯的对映体,例如式1'和式1''。

[0099] 当对映体富集时,一种对映体的存在量多于另一种,并且富集程度可以通过对映体过量(“ee”)的表达来定义,ee被定义为 $(2x-1) \cdot 100\%$,其中x是混合物中主要对映体的摩尔分数(例如,20%的ee对应于60:40的对映体比例)。

[0100] 优选地,本发明的组合物具有至少50%的对映体过量;更优选至少75%的对映体过量;还更优选至少90%的对映体过量;最优选至少94%的对映体过量的更具活性的异构体。特别值得注意的是更具活性的异构体的对映体纯的实施方案。

[0101] 式1的化合物可包含另外的手性中心。例如,取代基和其它分子成分如 R^A (即,作为L-1上的取代基)和L-2至L-4本身可能含有手性中心。本发明包括在这些另外的手性中心处的外消旋混合物以及富集的和基本上纯的立体构型。

[0102] 由于绕式1中的酰胺键(例如, $C(O)N(Q^2)(R^9)$)的旋转受限,本发明化合物可以一种或多种构象异构体的形式存在。本发明包括构象异构体的混合物。另外,本发明包括相对于其它构象异构体富含一种构象异构体的化合物。

[0103] 当对映体富集时,一种对映体的存在量多于另一种,并且富集程度可以通过对映体比率(ER)的表达来定义,所述对映体比率表示为通过手性高效液相色谱法测定的两种对映体的相对面积%。

[0104] 优选地,本发明的组合物具有至少50%的ER;更优选至少75%的ER;还更优选至少90%的ER;最优选至少94%的ER的更具活性的异构体。特别值得注意的是更具活性的异构体的对映体纯的实施方案。

[0105] 式1的化合物可包含另外的手性中心。例如,取代基和其它分子成分如 R^2 、 R^3 和 R^6 本身可含有手性中心。本发明包括在这些另外的手性中心处的外消旋混合物以及富集的和基本上纯的立体构型。

[0106] 式1的化合物通常以多于一种的形式存在,因此式1包括它们代表的化合物的所有结晶和非结晶形式。非结晶形式包括为固体的实施方案诸如蜡和树胶,以及为液体的实施方案诸如溶液和熔融物。晶体形式包括代表基本上单一晶型的实施方案,和代表多晶型物(即不同晶型)的混合物的实施方案。术语“多晶型物”是指可以不同晶型结晶的化合物的特定晶型,这些晶型在晶格中具有不同的分子排列和/或分子构象。由于晶格中存在或不存在可微弱或强力结合的共结晶水或其它分子,因此虽然多晶型可具有相同的化学组成,但是它们也可具有不同的组成。多晶型物可具有不同的化学、物理和生物特性,如结晶形状、密度、硬度、颜色、化学稳定性、熔点、吸湿性、可悬浮性、溶解速率和生物利用度。本领域技术人员会知道,相对于同一式1的化合物的另一种多晶型物或多晶型物混合物,式1的化合物的多晶型物可表现出有益效果(例如制备可用制剂的适宜性,改善的生物性能)。式1的化合物的具体多晶型物的制备和分离可通过本领域技术人员已知的方法实现,包括例如采用选定的溶剂和温度进行结晶。关于同质多晶的综述参见R.Hilfiker编辑的Polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006。

[0107] 本领域技术人员会理解,不是所有的含氮杂环都可以形成N-氧化物,因为氮需要有可氧化为氧化物的可用孤对电子;本领域技术人员会识别出那些可形成N-氧化物的含氮杂环。本领域技术人员还会认识到,叔胺可形成N-氧化物。用于制备杂环和叔胺的N-氧化物

的合成方法是本领域技术人员熟知的,包括用过氧酸(如过乙酸和间氯过氧苯甲酸(MCPBA))、过氧化氢、烷基氢过氧化物(烷基hydroperoxide)(如叔丁基氢过氧化物)、过硼酸钠和双环氧乙烷(如二甲基双环氧乙烷)氧化杂环化合物和叔胺。用于制备N-氧化物的这些方法已广泛描述和综述于文献中,参见例如:T.L.Gilchrist于Comprehensive Organic Synthesis,第7卷,第748-750页,S.V.Ley编辑,Pergamon Press;M.Tisler和B.Stanovnik于Comprehensive Heterocyclic Chemistry第3卷,第18-20页,A.J.Boulton和A.McKillop编辑,Pergamon Press;M.R.Grimmett和B.R.T.Keene于Advances in Heterocyclic Chemistry,第43卷,第149-161页,A.R.Katritzky编辑,Academic Press;M.Tisler和B.Stanovnik于Advances in Heterocyclic Chemistry第9卷,第285-291页,A.R.Katritzky和A.J.Boulton编辑,Academic Press;以及G.W.H.Cheeseman和E.S.G.Werstiuk于Advances in Heterocyclic Chemistry,第22卷,第390-392页,A.R.Katritzky和A.J.Boulton编辑,Academic Press。

[0108] 本领域技术人员认识到,由于在环境和生理条件下化合物的盐与它们相应的非盐形式处于平衡,因此盐与非盐形式共享生物用途。因此,可使用多种式1的化合物的盐来控制不期望的植被(即是农业上适合的)。式1的化合物的盐包括与无机酸或有机酸形成的酸加成盐,所述酸诸如氢溴酸、盐酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、富马酸、乳酸、马来酸、丙二酸、草酸、丙酸、水杨酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。当式1的化合物包含酸性部分诸如羧酸或苯酚时,盐还包括那些与有机碱或无机碱(诸如吡啶、三乙胺或氨,或酰胺,或者钠、钾、锂、钙、镁或钡的氢化物、氢氧化物或碳酸盐)形成的盐。因此,本发明包括选自式1、其立体异构体、N-氧化物和其适用于农业的盐的化合物。

[0109] 如发明概述中所述的本发明的实施方案包括(其中如以下实施方案中所用的式1包括其N-氧化物及其盐):

[0110] 实施方案1:式1的化合物(包括所有立体异构体、其N-氧化物及其盐)、包含它们的农业组合物以及它们作为除草剂的用途,如本发明的发明概述中所述。

[0111] 实施方案2.实施方案1的化合物,其中L选自L-1、L-2或L-3。

[0112] 实施方案3.实施方案2的化合物,其中L选自L-1或L-2。

[0113] 实施方案4.实施方案3的化合物,其中L是L-1。

[0114] 实施方案5.实施方案4的化合物,其中L是L-2。

[0115] 实施方案6.实施方案1-5中任一项的化合物,其中R^A是C₁-C₇烷基、C₁-C₇卤代烷基、C₃-C₉环烷基、C₁-C₇烷氧基或C₁-C₇卤代烷氧基、C₃-C₉环烷氧基,其各自被至多2个独立地选自R⁸或G¹的取代基取代或未被取代;或者

[0116] R^A是G¹。

[0117] 实施方案7.实施方案6的化合物,其中R^A是C₁-C₇烷基、C₁-C₇卤代烷基、C₁-C₇烷氧基或C₁-C₇卤代烷氧基,其各自被至多2个独立地选自R⁸的取代基取代或未被取代;或者

[0118] R^A是G¹。

[0119] 实施方案8.实施方案7的化合物,其中R^A是C₁-C₇烷基或C₁-C₇烷氧基,其各自被至多2个独立地选自R⁸的取代基取代或未被取代。

[0120] 实施方案9.实施方案8的化合物,其中R^A是C₁-C₃烷基,其被至多2个独立地选自R⁸的取代基取代或未被取代。

[0121] 实施方案10.实施方案8的化合物,其中 R^A 是 C_1 - C_3 烷氧基,其被至多2个独立地选自 R^8 的取代基取代或未被取代。

[0122] 实施方案11.实施方案1-4中任一项的化合物,其中 R^B 是H、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷基。

[0123] 实施方案12.实施方案11的化合物,其中 R^B 是H、 $-OCH_3$ 、 CF_3 或 CH_3 。

[0124] 实施方案13.实施方案12的化合物,其中 R^B 是H、 $-OCH_3$ 或 CH_3 。

[0125] 实施方案14.实施方案13的化合物,其中 R^B 是H。

[0126] 实施方案15.实施方案1-4或11-15中任一项的化合物,其中 R^C 是H、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷基。

[0127] 实施方案16.实施方案15的化合物,其中 R^C 是H、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 烷基。

[0128] 实施方案17.实施方案16的化合物,其中 R^C 是H或 CH_3 。

[0129] 实施方案18.实施方案17的化合物,其中 R^C 是H。

[0130] 实施方案19.实施方案18的化合物,其中 R^D 是H、 C_1 - C_3 烷基或 C_2 - C_3 烷基羰基。

[0131] 实施方案20.实施方案19的化合物,其中 R^D 是H、 CH_3 、 CH_2CH_3 或 $-C(=O)CH_3$ 。

[0132] 实施方案21.实施方案20的化合物,其中 R^D 是H。

[0133] 实施方案22.实施方案20的化合物,其中 R^D 是 CH_3 或 CH_2CH_3 。

[0134] 实施方案23.实施方案20的化合物,其中 R^D 是 $-C(=O)CH_3$ 。

[0135] 实施方案24.实施方案1-4或11-23中任一项的化合物,其中 R^E 是H、羟基、氨基、氰基、甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 氰基烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烯基、 C_2 - C_8 卤代烯基、 C_2 - C_8 烯基烷基、 C_2 - C_8 卤代烯基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_5 - C_{10} 环烷基羰基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基氨基磺酰基或 C_2 - C_8 二烷基氨基磺酰基。

[0136] 实施方案25.实施方案24的化合物,其中 R^E 是H、羟基、氨基、氰基、甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_5 - C_{10} 环烷基羰基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基。

[0137] 实施方案26.实施方案25的化合物,其中 R^E 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基。

[0138] 实施方案27.实施方案26的化合物,其中 R^E 是H、 C_1 - C_6 烷基或 C_2 - C_8 烷基羰基。

[0139] 实施方案28.实施方案27的化合物,其中 R^E 是H、 C_1 - C_2 烷基或 C_2 - C_4 烷基羰基。

[0140] 实施方案29.实施方案1、2或11-18中任一项的化合物,其中 R^F 是甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基亚磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基氨基磺酰基、 C_2 - C_8 二烷基氨基磺酰基。

基、-P(=O)(OH)₂、C₁-C₆二烷基磷酰基、C₁-C₆卤代烷基磷酰基、C₃-C₈环烷基磷酰基、C₂-C₈二烷基氧基磷酰基、C₆-C₁₄二环烷基氧基磷酰基、C₈-C₁₆二环烷基烷氧基磷酰基、C₂-C₁₂双(烷基氨基)磷酰基、C₄-C₂₄双(二烷基氨基)磷酰基；或者被R¹⁶取代的或未被取代的苯基。

[0141] 实施方案30. 实施方案29的化合物，其中R^F是C₂-C₈烷基羰基、C₄-C₁₀环烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₂-C₈卤代烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₂-C₈烷基氨基羰基、C₃-C₁₀二烷基氨基羰基、C₄-C₁₀环烷基氨基羰基、C₁-C₆烷基磺酰基、C₁-C₆卤代烷基磺酰基、C₃-C₈环烷基磺酰基或C₁-C₆烷基氨基磺酰基；或者被R¹⁶取代的或未被取代的苯基。

[0142] 实施方案31. 实施方案30的化合物，其中R^F是C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₂-C₈卤代烷氧基羰基、C₂-C₈烷基氨基羰基、C₃-C₁₀二烷基氨基羰基或C₁-C₆烷基磺酰基。

[0143] 实施方案32. 实施方案31的化合物，其中R^F是C₂-C₄烷基羰基或C₂-C₄烷氧基羰基。

[0144] 实施方案33. 实施方案1-3或11-18中任一项的化合物，其中R^G是甲酰基、-C(O)NH₂、C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈卤代烷基羰基、C₄-C₁₀环烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₂-C₈卤代烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₂-C₈烷基氨基羰基、C₃-C₁₀二烷基氨基羰基、C₄-C₁₀环烷基氨基羰基、C₁-C₆烷基亚磺酰基、C₁-C₆卤代烷基亚磺酰基、C₃-C₈环烷基亚磺酰基、C₁-C₆烷基磺酰基、C₁-C₆卤代烷基磺酰基、C₃-C₈环烷基磺酰基或C₁-C₆烷基氨基磺酰基。

[0145] 实施方案34. 实施方案33的化合物，其中R^G是甲酰基、C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₂-C₈烷基氨基羰基、C₄-C₁₀环烷基氨基羰基、C₁-C₆烷基磺酰基、C₁-C₆卤代烷基磺酰基、C₃-C₈环烷基磺酰基或C₁-C₆烷基氨基磺酰基。

[0146] 实施方案35. 实施方案34的化合物，其中R^G是甲酰基、C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基或C₄-C₁₀环烷氧基羰基。

[0147] 实施方案36. 实施方案35的化合物，其中R^G是C₂-C₈烷基羰基或C₂-C₈烷氧基羰基。

[0148] 实施方案37. 实施方案36的化合物，其中R^G是C₂-C₄烷基羰基或C₂-C₄烷氧基羰基。

[0149] 实施方案38. 实施方案1-11中任一项的化合物，其中R⁸各自独立地是氰基、硝基、-CHO、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈卤代烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₅-C₁₂环烷基烷氧基羰基、C₂-C₈烷基氨基羰基、C₃-C₁₀二烷基氨基羰基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基或C₂-C₈烷基羰氧基。

[0150] 实施方案39. 实施方案38的化合物，其中R⁸各自独立地是C₂-C₆烯基、C₁-C₆烷氧基或C₁-C₆卤代烷氧基。

[0151] 实施方案40. 实施方案39的化合物，其中R⁸各自独立地是C₁-C₆烷氧基或C₁-C₆卤代烷氧基。

[0152] 实施方案40A. 实施方案40的化合物，其中R⁸各自独立地是C₁-C₆烷氧基。

[0153] 实施方案41. 实施方案1-40A中任一项的化合物，其中J是-CR²R³-、-CR²R³-CR⁴R⁵-或-NR⁶-。

[0154] 实施方案42. 实施方案41的化合物，其中J是-CR²R³-或-CR²R³-CR⁴R⁵-。

[0155] 实施方案43. 实施方案42的化合物，其中J是-CR²R³-CR⁴R⁵-。

[0156] 实施方案44. 实施方案43的化合物，其中J是-CR²R³-。

[0157] 实施方案45. 实施方案1-44中任一项的化合物，其中Y¹和Y²各自独立地是O或S。

[0158] 实施方案46. 实施方案45的化合物，其中Y¹和Y²各自独立地是S。

[0159] 实施方案47. 实施方案46的化合物，其中Y¹和Y²各自独立地是O。

[0160] 实施方案48:实施方案1-47中任一项的化合物,其中 R^1 是H、CHO、 C_3 - C_8 烷基羰基烷基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 氰基烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烷硫基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基或 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基。

[0161] 实施方案49:实施方案48的化合物,其中 R^1 是H、 C_3 - C_8 烷基羰基烷基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 氰基烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基或 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基。

[0162] 实施方案50:实施方案49的化合物,其中 R^1 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 氰基烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基或 C_2 - C_8 烷氧基羰基。

[0163] 实施方案51:实施方案50的化合物,其中 R^1 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基或 C_2 - C_8 烷氧基烷基。

[0164] 实施方案52:实施方案51的化合物,其中 R^1 是H、 CH_3 、 CH_2CH_3 、环丙基、环丙基甲基或 CH_2OCH_3 。

[0165] 实施方案53.实施方案1-52中任一项的化合物,其中 Q^1 是苯环或萘环系统,每个环或环系统被至多5个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代;或者5-6元杂环;或者8-10元双环系统,每个环或环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N原子,其中至多2个碳环成员独立地选自C(=O)和C(=S),并且硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{14})_v$,每个环或环系统被至多4个取代基取代或未被取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{10} 和选自氮原子环成员上的 R^{12} 。

[0166] 实施方案54.实施方案53的化合物,其中 Q^1 是苯环,所述苯环被至多4个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代;或者5-6元杂环,每个环包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N原子,每个环被至多4个取代基取代或未被取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{10} 和选自氮原子环成员上的 R^{12} 。

[0167] 实施方案55.实施方案54的化合物,其中 Q^1 是苯环,所述苯环被至多4个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代。

[0168] 实施方案56.实施方案55的化合物,其中 Q^1 是苯环,所述苯环被至多3个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代。

[0169] 实施方案57.实施方案56的化合物,其中 Q^1 是苯环,所述苯环被至多2个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代。

[0170] 实施方案58.实施方案57的化合物,其中 Q^1 是苯环,所述苯环被至多2个独立地选自 R^{10} 的取代基取代。

[0171] 实施方案59.实施方案58的化合物,其中 Q^1 是苯环,所述苯环被至多2个独立地选自 R^{10} 的取代基取代,其中一个取代基在对位(4-位)。

[0172] 实施方案60.实施方案59的化合物,其中 Q^1 是苯环,所述苯环被至多2个独立地选自 R^{10} 的取代基取代,其中一个取代基在间位(3-位)。

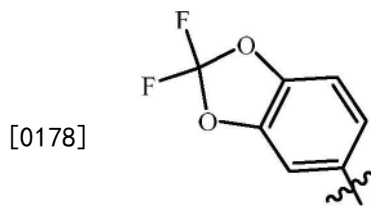
[0173] 实施方案61.实施方案1-60中任一项的化合物,其中 Q^1 不是未取代的苯环。

[0174] 实施方案62.实施方案61的化合物,其中 Q^1 是8-10元双环系统,所述双环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O原子,每个环系统任选地被至多4个取代基取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{10} 。

[0175] 实施方案63.实施方案62的化合物,其中 Q^1 是9元双环系统,所述双环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O原子,每个环系统任选地被至多4个取代基取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{10} 。

[0176] 实施方案64.实施方案63的化合物,其中 Q^1 是9元杂芳族双环系统,所述双环系统包含选自碳原子和2个O原子的环成员,系统任选地被至多3个取代基取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{10} (即,示例3中的U-103)。

[0177] 实施方案65.实施方案64的化合物,其中 Q^1 是U-103A:



U-103A。

[0179] 实施方案66.实施方案1-65中任一项的化合物,其中 Q^2 是苯环,每个环被至多4个独立地选自 R^{11} 的取代基取代或未被取代;或者5-6元杂环;或者8-10元双环系统,每个环或环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N原子,其中至多2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{14})_v$,每个环或环系统被至多4个取代基取代或未被取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{11} 和选自氮原子环成员上的 R^{13} 。

[0180] 实施方案67.实施方案66的化合物,其中 Q^2 是苯环,所述苯环被至多4个独立地选自 R^{11} 的取代基取代或未被取代;或者5-6元杂环;或者8-10元双环系统,每个环或环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N原子,其中至多2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{14})_v$,每个环或环系统被至多4个取代基取代或未被取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{11} 和选自氮原子环成员上的 R^{13} 。

[0181] 实施方案68.实施方案67的化合物,其中 Q^2 是苯环,所述苯环被至多4个独立地选自 R^{11} 的取代基取代或未被取代;或者5-6元杂环,所述杂环包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多4个N原子,其中至多2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,每个环或环系统被至多4个取代基取代或未被取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{11} 和选自氮原子环成员上的 R^{13} 。

[0182] 实施方案69.实施方案68的化合物,其中 Q^2 是苯环,所述苯环被至多4个独立地选自 R^{11} 的取代基取代或未被取代。

[0183] 实施方案70.实施方案69的化合物,其中 Q^2 是苯环,所述苯环被至多3个独立地选自 R^{11} 的取代基取代或未被取代。

[0184] 实施方案71.实施方案70的化合物,其中 Q^2 是苯环,所述苯环被至多2个独立地选

自R¹¹的取代基取代或未被取代。

[0185] 实施方案72. 实施方案71的化合物, 其中Q²是苯环, 所述苯环被至少2个独立地选自R¹¹的取代基取代, 其中一个取代基在邻位(2-位)。

[0186] 实施方案73. 实施方案72的化合物, 其中Q²是苯环, 所述苯环被至少2个独立地选自R¹¹的取代基取代, 其中一个取代基在间位(3-位)。

[0187] 实施方案74. 实施方案1-73中任一项的化合物, 其中Q²不是未取代的苯环。

[0188] 实施方案75. 实施方案1-74中任一项的化合物, 其中R²和R³各自独立地是H或C₁-C₄烷基。

[0189] 实施方案76. 实施方案75的化合物, 其中R²和R³各自独立地是H或CH₃。

[0190] 实施方案77. 实施方案76的化合物, 其中R²和R³各自独立地是H。

[0191] 实施方案78. 实施方案1-77中任一项的化合物, 其中R⁴和R⁵各自独立地是H、卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄烷氧基。

[0192] 实施方案79. 实施方案78的化合物, 其中R⁴和R⁵各自独立地是H、卤素或C₁-C₄烷基。

[0193] 实施方案80. 实施方案79的化合物, 其中R⁴和R⁵各自独立地是H、Cl或CH₃。

[0194] 实施方案81. 实施方案1-80中任一项的化合物, 其中R⁶是H、C₁-C₆烷基或C₁-C₆烷氧基。

[0195] 实施方案82. 实施方案81的化合物, 其中R⁶是H或C₁-C₆烷基。

[0196] 实施方案83. 实施方案82的化合物, 其中R⁶是H或CH₃。

[0197] 实施方案84. 实施方案83的化合物, 其中R⁶是H。

[0198] 实施方案85. 实施方案1-47或53-84中任一项的化合物, 其中R¹和R⁶一起为C₃亚烷基或-CH₂OCH₂-。

[0199] 实施方案86. 实施方案85的化合物, 其中R¹和R⁶一起为C₃亚烷基。

[0200] 实施方案87. 实施方案1-86中任一项的化合物, 其中R⁷是H、卤素、C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄烷基。

[0201] 实施方案88. 实施方案87的化合物, 其中R⁷是H、F、Cl或CH₃。

[0202] 实施方案89. 实施方案1-88中任一项的化合物, 其中R⁷是H或CH₃。

[0203] 实施方案90. 实施方案89的化合物, 其中R⁷是H。

[0204] 实施方案91. 实施方案1-90中任一项的化合物, 其中R⁹是H、C₁-C₆烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₂-C₈烷硫基烷基、C₂-C₈烷基亚磺酰基烷基、C₂-C₈烷基磺酰基烷基、C₂-C₈烷基羰基、C₄-C₁₀环烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基或C₄-C₁₀环烷氧基羰基。

[0205] 实施方案92. 实施方案91的化合物, 其中R⁹是H、C₁-C₆烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₂-C₈烷基羰基或C₂-C₈烷氧基羰基。

[0206] 实施方案93. 实施方案92的化合物, 其中R⁹是H、C₁-C₆烷基或C₂-C₈烷氧基羰基。

[0207] 实施方案94. 实施方案93的化合物, 其中R⁹是H、CH₃或-C(=O)CH₃。

[0208] 实施方案95. 实施方案94的化合物, 其中R⁹是H。

[0209] 实施方案96. 实施方案1-95中任一项的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自是卤素、硝基、C₁-C₈烷基、C₁-C₈氰基烷基、C₁-C₈氰基烷氧基、C₁-C₈卤代烷基、C₁-C₈硝基烷基、C₂-C₈烯基、C₂-C₈卤代烯基、C₂-C₈硝基烯基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₃-C₈烷氧基烷氧基烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₂-C₈卤代烷氧基卤代烷氧基、C₄-C₁₀环烷基烷基、C₄-C₁₀卤代环烷基烷基、C₅-C₁₂烷基环烷

基烷基、C₅-C₁₂环烷基烯基、C₃-C₈环烷基、C₃-C₈卤代环烷基、C₄-C₁₀烷基环烷基、C₆-C₁₂环烷基环烷基、C₃-C₈环烯基、C₃-C₈卤代环烯基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₄-C₁₀环烷氧基烷基、C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈卤代烷基羰基、C₄-C₁₀环烷基羰基、-C(=O)OH、C₂-C₈烷氧基羰基、C₂-C₈卤代烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₅-C₁₂环烷基烷氧基羰基、-C(=O)NH₂、C₁-C₈烷氧基、C₁-C₈卤代烷氧基、C₂-C₈烯氧基、C₂-C₈卤代烯氧基、C₃-C₈环烷氧基、C₃-C₈卤代环烷氧基、C₄-C₁₀环烷基烷氧基、C₃-C₁₀烷基羰基烷氧基、C₂-C₈烷基羰氧基、C₂-C₈卤代烷基羰氧基、C₄-C₁₀环烷基羰氧基、C₁-C₈烷基磺酰氧基、C₁-C₈卤代烷基磺酰氧基、C₁-C₈烷基磺酰基、C₁-C₈卤代烷基磺酰基、C₃-C₈环烷基磺酰基。

[0210] 实施方案97. 实施方案96的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₃-C₈烷氧基烷氧基烷基、C₄-C₁₀环烷基烷基、C₅-C₁₂烷基环烷基烷基、C₃-C₈环烷基、C₃-C₈卤代环烷基、C₆-C₁₂环烷基环烷基、C₃-C₈卤代环烯基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₄-C₁₀环烷氧基烷基、C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈卤代烷基羰基、C₄-C₁₀环烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₅-C₁₂环烷基烷氧基羰基、C₁-C₈烷氧基、C₁-C₈卤代烷氧基、C₂-C₈卤代烯氧基、C₃-C₈环烷氧基、C₃-C₈卤代环烷氧基、C₄-C₁₀环烷基烷氧基、C₃-C₁₀烷基羰基烷氧基或C₂-C₈卤代烷基羰氧基。

[0211] 实施方案98. 实施方案97的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₄-C₁₀环烷基烷基、C₅-C₁₂烷基环烷基烷基、C₃-C₈环烷基、C₃-C₈卤代环烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₁-C₈烷氧基、C₁-C₈卤代烷氧基或C₂-C₈烷氧基烷氧基。

[0212] 实施方案99. 实施方案98的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基、C₃-C₈环烷基、C₁-C₈烷氧基或C₁-C₈卤代烷氧基。

[0213] 实施方案100. 实施方案99的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基、C₁-C₈烷氧基或C₁-C₈卤代烷氧基。

[0214] 实施方案101. 实施方案100的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素或C₁-C₈烷基。

[0215] 实施方案102. 实施方案100的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素或C₁-C₈卤代烷基。

[0216] 实施方案103. 实施方案100的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素或C₁-C₈烷氧基。

[0217] 实施方案104. 实施方案100的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素或C₁-C₈卤代烷氧基。

[0218] 实施方案105. 实施方案100的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是C₁-C₈烷基或C₁-C₈烷氧基。

[0219] 实施方案106. 实施方案100的化合物, 其中R¹⁰和R¹¹各自独立地是C₁-C₈烷基或C₁-C₈卤代烷基。

[0220] 实施方案107. 实施方案1-106中任一项的化合物, 其中R¹²和R¹³各自独立地是C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基、C₃-C₆环烷基、C₂-C₃烷氧基烷基、C₂-C₃烷基羰基或C₂-C₃烷基氨基烷基。

[0221] 实施方案108. 实施方案107的化合物, 其中R¹²和R¹³各自独立地是C₁-C₃烷基、C₃-C₆环烷基或C₂-C₃烷基羰基。

[0222] 实施方案109.实施方案108的化合物,其中 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地是 C_1 - C_3 烷基或 C_2 - C_3 烷基羰基。

[0223] 实施方案110.实施方案109的化合物,其中 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地是 C_1 - C_3 烷基。

[0224] 实施方案111.实施方案110的化合物,其中 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地是 CH_3 。

[0225] 实施方案112.实施方案1-111中任一项的化合物,其中 R^{14} 各自独立地是H或 $-(C=O)CH_3$ 。

[0226] 实施方案113.实施方案112的化合物,其中 R^{14} 各自独立地是H。

[0227] 实施方案114.实施方案1-113中任一项的化合物,其中 R^{15} 是H、CHO、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_6 烷基羰基或 C_2 - C_6 卤代烷基羰基。

[0228] 实施方案115.实施方案114的化合物,其中 R^{15} 是H、 CH_3 、 $-(C=O)CH_3$ 或 $-(C=O)CF_3$ 。

[0229] 实施方案116.实施方案115的化合物,其中 R^{15} 各自独立地是H或 CH_3 。

[0230] 实施方案117.实施方案1-116中任一项的化合物,其中 G^1 各自独立地是苯基;或者6元杂环,其各自在环成员上被至多4个独立地选自 R^{17} 的取代基取代或未被取代。

[0231] 实施方案118.实施方案117的化合物,其中 G^1 各自独立地是苯基,其在环成员上被至多3个独立地选自 R^{17} 的取代基取代或未被取代。

[0232] 实施方案119.实施方案1-118中任一项的化合物,其中 R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自独立地是卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_1 - C_8 羟基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 C_2 - C_6 烷基氨基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_5 - C_{12} 环烷基烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_3 - C_8 二烷基氨基烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_2 - C_8 烷基羰氧基或 C_1 - C_6 烷硫基。

[0233] 实施方案120.实施方案119的化合物,其中 R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自独立地是卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 卤代烷基。

[0234] 实施方案121.实施方案120的化合物,其中 R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自独立地是卤素、硝基、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 卤代烷基。

[0235] 实施方案122.实施方案121的化合物,其中 R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自独立地是卤素、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 卤代烷基。

[0236] 实施方案123.实施方案122的化合物,其中 R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自独立地是卤素或 C_1 - C_6 烷基。

[0237] 实施方案124.实施方案123的化合物,其中 R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自独立地是卤素。

[0238] 实施方案125.实施方案1-124中任一项的化合物,条件是u和v的总和是0。

[0239] 实施方案126.实施方案1-125中任一项的化合物,条件是u和v的总和是2。

[0240] 本发明的实施方案(包括上文实施方案1-126以及本文所述的任何其它实施方案)可以任何方式组合,并且实施方案中的变量描述不仅涉及式1的化合物,而且还涉及用于制备式1的化合物的起始化合物和中间体化合物。此外,本发明的实施方案(包括上文实施方案1-126和本文所述的任何其它实施方案以及它们的任何组合)均适合于本发明的组合物和方法。

[0241] 实施方案A.

[0242] 发明概述1的化合物,其中:

[0243] R^A 是 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 卤代烷基、 C_3 - C_9 环烷基、 C_1 - C_7 烷氧基或 C_1 - C_7 卤代烷氧基、 C_3 - C_9 环烷氧基,其各自被至多2个独立地选自 R^8 或 G^1 的取代基取代或未被取代;或

[0244] R^A 是 G^1 ;

[0245] R^B 是H、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷基;

[0246] R^C 是H、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷基;

[0247] R^D 是H、 C_1 - C_3 烷基或 C_2 - C_3 烷基羰基;

[0248] R^E 是H、羟基、氨基、氰基、甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 氰基烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烯基、 C_2 - C_8 卤代烯基、 C_2 - C_8 烯基烷基、 C_2 - C_8 卤代烯基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_5 - C_{10} 环烷基羰基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基氨基磺酰基或 C_2 - C_8 二烷基氨基磺酰基;

[0249] R^F 是甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基氨基磺酰基、 C_2 - C_8 二烷基氨基磺酰基、 $-P(=O)(OH)_2$ 、 C_1 - C_6 二烷基磷酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磷酰基、 C_3 - C_8 环烷基磷酰基、 C_2 - C_8 二烷氧基磷酰基、 C_6 - C_{14} 二环烷氧基磷酰基、 C_8 - C_{16} 二环烷基烷氧基磷酰基、 C_2 - C_{12} 双(烷基氨基)磷酰基、 C_4 - C_{24} 双(二烷基氨基)磷酰基;或者被 R^{16} 取代的或未被取代的苯基;

[0250] R^G 是甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基磺酰基或 C_1 - C_6 烷基氨基磺酰基;

[0251] Q^1 是苯环或萘环系统,每个环或环系统被至多5个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代;或者5-6元杂环;或者8-10元双环系统,每个环或环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N原子,其中至多2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{14})_v$,每个环或环系统被至多4个取代基取代或未被取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{10} 和选自氮原子环成员上的 R^{12} ;

[0252] Q^2 是苯环,每个环被至多4个独立地选自 R^{11} 的取代基取代或未被取代;或者5-6元杂环;或者8-10元双环系统,每个环或环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员,所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N原子,其中至多2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{14})_v$,每个环或环系统被至多4个取代基取代或未被取代,所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{11} 和选自氮原子环成员上的 R^{13} ;

[0253] J是 $-\text{CR}^2\text{R}^3-$ 、 $-\text{CR}^2\text{R}^3-\text{CR}^4\text{R}^5-$ 或 $-\text{NR}^6-$;

[0254] Y^1 和 Y^2 各自独立地是O或S;

[0255] R^1 是H、CHO、 C_3-C_8 烷基羰基烷基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_2-C_6 氰基烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_2-C_8 烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2-C_8 烷硫基烷基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_2-C_8 卤代烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基或 C_4-C_{10} 环烷基氨基羰基;

[0256] R^2 和 R^3 各自独立地是H或 C_1-C_4 烷基;

[0257] R^4 和 R^5 各自独立地是H、卤素、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 烷氧基;

[0258] R^6 是H、 C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 烷氧基;

[0259] R^7 是H、卤素、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 烷基;

[0260] R^8 各自独立地是氰基、硝基、 $-\text{CHO}$ 、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_5-C_{12} 环烷基烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基或 C_2-C_8 烷基羰氧基;

[0261] R^9 是H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_8 烷氧基烷基、 C_2-C_8 烷硫基烷基、 C_2-C_8 烷基亚磺酰基烷基、 C_2-C_8 烷基磺酰基烷基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基、 C_2-C_8 烷氧基羰基或 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基;

[0262] R^{10} 和 R^{11} 各自是卤素、硝基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_8 氰基烷基、 C_1-C_8 氰基烷氧基、 C_1-C_8 卤代烷基、 C_1-C_8 硝基烷基、 C_2-C_8 烯基、 C_2-C_8 卤代烯基、 C_2-C_8 硝基烯基、 C_2-C_8 烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基卤代烷氧基、 C_4-C_{10} 环烷基烷基、 C_4-C_{10} 卤代环烷基烷基、 C_5-C_{12} 烷基环烷基烷基、 C_5-C_{12} 环烷基烯基、 C_3-C_8 环烷基、 C_3-C_8 卤代环烷基、 C_4-C_{10} 烷基环烷基、 C_6-C_{12} 环烷基环烷基、 C_3-C_8 环烯基、 C_3-C_8 卤代环烯基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷氧基、 C_2-C_8 烷氧基烷氧基、 C_4-C_{10} 环烷氧基烷基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_2-C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_5-C_{12} 环烷基烷氧基羰基、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 C_1-C_8 烷氧基、 C_1-C_8 卤代烷氧基、 C_2-C_8 烯氧基、 C_2-C_8 卤代烯氧基、 C_3-C_8 环烷氧基、 C_3-C_8 卤代环烷氧基、 C_4-C_{10} 环烷基烷氧基、 C_3-C_{10} 烷基羰基烷氧基、 C_2-C_8 烷基羰氧基、 C_2-C_8 卤代烷基羰氧基、 C_4-C_{10} 环烷基羰氧基、 C_1-C_8 烷基磺酰氧基、 C_1-C_8 卤代烷基磺酰氧基、 C_1-C_8 烷基磺酰基、 C_1-C_8 卤代烷基磺酰基、 C_3-C_8 环烷基磺酰基;

[0263] G^1 各自独立地是苯基;或者6元杂环,其各自在环成员上被至多4个独立地选自 R^{17} 的取代基取代或未被取代;

[0264] R^{16} 和 R^{17} 各自独立地是卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_8 烷基羰基、 C_1-C_8 羟基烷基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_2-C_6 烷基氨基烷基、 C_2-C_8 烷氧基羰基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_{10} 环烷氧基羰基、 C_5-C_{12} 环烷基烷氧基羰基、 C_2-C_8 烷基氨基羰基、 C_3-C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 C_2-C_8 烷基羰氧基或 C_1-C_6 烷硫基;并且

[0265] 条件是u和v的总和是2。

[0266] 实施方案B.实施方案A的化合物,其中

[0267] L选自L-1、L-2或L-3;

[0268] R^A 是 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 卤代烷基、 C_1 - C_7 烷氧基或 C_1 - C_7 卤代烷氧基；其各自被至多2个独立地选自 R^8 的取代基取代或未被取代；或者

[0269] R^A 是 G^1 ；

[0270] R^B 是H、 $-OCH_3$ 、 CF_3 或 CH_3 ；

[0271] R^C 是H、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 烷基；

[0272] R^D 是H、 CH_3 、 CH_2CH_3 或 $-C(=O)CH_2CH_2CH_3$ ；

[0273] R^E 是H、羟基、氨基、氰基、甲酰基、 $-C(=O)NH_2$ 、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_5 - C_{10} 环烷基羰基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基；

[0274] R^F 是 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基磺酰基或 C_1 - C_6 烷基氨基磺酰基；或者被 R^{16} 取代的或未被取代的苯基；

[0275] R^G 是甲酰基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基羰基、 C_2 - C_8 烷基氨基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_3 - C_8 环烷基磺酰基或 C_1 - C_6 烷基氨基磺酰基；

[0276] R^8 各自独立地是 C_2 - C_6 烯基、 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 卤代烷氧基；

[0277] J是 $-CR^2R^3-$ 或 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ ；

[0278] Y^1 和 Y^2 各自独立地是O；

[0279] R^1 是H、 C_3 - C_8 烷基羰基烷基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_2 - C_6 氰基烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基、 C_2 - C_8 烷氧基羰基或 C_2 - C_8 卤代烷氧基羰基；

[0280] Q^1 是苯环，所述苯环被至多4个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代；或者5-6元杂环，每个环包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N原子，每个环被至多4个取代基取代或未被取代，所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{10} 和选自氮原子环成员上的 R^{12} ；

[0281] Q^2 是苯环，所述苯环被至多4个独立地选自 R^{11} 的取代基取代或未被取代；或者5-6元杂环；或者8-10元双环系统，每个环或环系统包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多2个O、至多2个S和至多4个N原子，其中至多2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，并且硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ ，每个环或环系统被至多4个取代基取代或未被取代，所述取代基独立地选自碳原子环成员上的 R^{11} 和选自氮原子环成员上的 R^{13} ；

[0282] R^2 和 R^3 各自独立地是H或 CH_3 ；

[0283] R^4 和 R^5 各自独立地是H、卤素或 C_1 - C_4 烷基；

[0284] R^7 是H、F、Cl或 CH_3 ；

[0285] R^9 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_2 - C_8 烷基羰基或 C_2 - C_8 烷氧基羰基；

[0286] R^{10} 和 R^{11} 各自独立地是卤素、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 C_2 - C_8 烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_4 - C_{10} 环烷基烷基、 C_5 - C_{12} 烷基环烷基烷基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_3 - C_8 卤代环烷基、 C_6 - C_{12} 环烷基环烷基、 C_3 - C_8 卤代环烯基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷氧基、 C_2 - C_8 烷氧基烷氧基、

C₄-C₁₀环烷氧基烷基、C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈卤代烷基羰基、C₄-C₁₀环烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₅-C₁₂环烷基烷氧基羰基、C₁-C₈烷氧基、C₁-C₈卤代烷氧基、C₂-C₈卤代烯氧基、C₃-C₈环烷氧基、C₃-C₈卤代环烷氧基、C₄-C₁₀环烷基烷氧基、C₃-C₁₀烷基羰基烷氧基或C₂-C₈卤代烷基羰氧基；

[0287] R¹²和R¹³各自独立地是C₁-C₃烷基、C₃-C₆环烷基或C₂-C₃烷基羰基；

[0288] R¹⁴各自独立地是H；

[0289] R¹⁵是H、CH₃、- (C=O)CH₃或- (C=O)CF₃；

[0290] G¹各自独立地是在环成员上被至多3个独立地选自R¹⁷的取代基取代的或未被取代的苯基；并且

[0291] R¹⁶和R¹⁷各自独立地是卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、-SO₂NH₂、C₁-C₆烷基或C₁-C₆卤代烷基。

[0292] 实施方案C.实施方案B的化合物，其中

[0293] L选自L-1或L-2；

[0294] R^A是C₁-C₇烷基或C₁-C₇烷氧基；其各自被至多2个独立地选自R⁸的取代基取代或未被取代；

[0295] R^B是H、-OCH₃或CH₃；

[0296] R^C是H或CH₃；

[0297] R^D是CH₃或CH₂CH₃；

[0298] R^E是H、C₁-C₆烷基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₂-C₈烷基羰基、C₂-C₈烷氧基羰基、C₄-C₁₀环烷氧基羰基、C₁-C₆烷基磺酰基；

[0299] R⁸各自独立地是C₁-C₆烷氧基或C₁-C₆卤代烷氧基；

[0300] J是-CR²R³-；

[0301] Y¹和Y²各自独立地是O；

[0302] R¹是H、C₁-C₆烷基、C₁-C₆卤代烷基、C₂-C₆氰基烷基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₈环烷基烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基或C₂-C₈烷氧基羰基；

[0303] Q¹是苯环，所述苯环被至多4个独立地选自R¹⁰的取代基取代或未被取代；

[0304] Q²是苯环，所述苯环被至多4个独立地选自R¹¹的取代基取代或未被取代；或者5-6元杂环，所述杂环包含选自碳原子和1-4个杂原子的环成员，所述杂原子独立地选自至多4个N原子，其中至多2个碳环成员独立地选自C(=O)和C(=S)，每个环或环系统被至多4个取代基取代或未被取代，所述取代基独立地选自碳原子环成员上的R¹¹和选自氮原子环成员上的R¹³；

[0305] R²和R³各自独立地是H；

[0306] R⁷是H或CH₃；

[0307] R⁹是H、C₁-C₆烷基或C₂-C₈烷氧基羰基；

[0308] R¹⁰和R¹¹各自独立地是卤素、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基、C₂-C₈烷氧基烷基、C₄-C₁₀环烷基烷基、C₅-C₁₂烷基环烷基烷基、C₃-C₈环烷基、C₃-C₈卤代环烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷氧基、C₁-C₈烷氧基、C₁-C₈卤代烷氧基或C₂-C₈烷氧基烷氧基；并且

[0309] R¹²和R¹³各自独立地是C₁-C₃烷基或C₂-C₃烷基羰基。

[0310] 实施方案D.实施方案C的化合物，其中

- [0311] L选自L-1；
- [0312] R^A 是被至多2个独立地选自 R^8 的取代基取代的或未被取代的 C_1 - C_3 烷基；
- [0313] R^8 各自独立地是 C_1 - C_6 烷氧基；
- [0314] R^1 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_8 环烷基烷基或 C_2 - C_8 烷氧基烷基；
- [0315] Q^1 是苯环，所述苯环被至多3个独立地选自 R^{10} 的取代基取代或未被取代；
- [0316] Q^2 是苯环，所述苯环被至多4个独立地选自 R^{11} 的取代基取代或未被取代；
- [0317] R^7 是H；
- [0318] R^9 是H、 CH_3 或 $-C(=O)CH_3$ ；并且
- [0319] R^{10} 和 R^{11} 各自独立地是卤素、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_1 - C_8 烷氧基或 C_1 - C_8 卤代烷氧基。
- [0320] 实施方案E. 实施方案C的化合物，其中
- [0321] L选自L-1；
- [0322] R^A 是被至多2个独立地选自 R^8 的取代基取代的或未被取代的 C_1 - C_3 烷氧基；
- [0323] R^8 各自独立地是 C_1 - C_6 烷氧基；
- [0324] R^1 是H、 CH_3 、 CH_2CH_3 、环丙基、环丙基甲基或 CH_2OCH_3 ；
- [0325] Q^1 是被至多2个独立地选自 R^{10} 的取代基取代的或未被取代的苯环；
- [0326] Q^2 是被或未被至多3个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环；
- [0327] R^7 是H；
- [0328] R^9 是H；并且
- [0329] R^{10} 和 R^{11} 各自独立地是卤素、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_8 卤代烷基、 C_1 - C_8 烷氧基或 C_1 - C_8 卤代烷氧基。
- [0330] 本发明的具体实施方案包括选自以下的发明概述的化合物：
- [0331] (3S, 4R) -N- (2, 3-二氟苯基) -3- (羟基甲基) -1-甲基-2-氧代-4- [4- (三氟甲基) -3-吡咯烷甲酰胺 (顺式)]；
- [0332] (3R, 4S) -N- (2, 3-二氟苯基) -3- (羟基甲基) -1-甲基-2-氧代-4- [4- (三氟甲基) -3-吡咯烷甲酰胺 (反式)]；
- [0333] (3S, 4R) -3- [(乙酰氧基) 甲基] -N- (2, 3-二氟苯基) -1-甲基-2-氧代-4- [4- (三氟甲基) -3-吡咯烷甲酰胺]；和
- [0334] (3S, 4R) -3-乙酰基-N- (2, 3-二氟苯基) -1-甲基-2-氧代-4- [4- (三氟甲基) -3-吡咯烷甲酰胺]。
- [0335] 本发明还涉及控制不期望的植被的方法，所述方法包括向植被所在地施用除草有效量的本发明化合物 (例如为本文所述的组合物的形式)。值得注意的与使用方法相关的实施方案是那些涉及上述实施方案的化合物的实施方案。本发明的化合物尤其可用于选择性控制作物中的杂草，所述作物诸如小麦、大麦、玉米、大豆、向日葵、棉花、油菜和稻，以及特产作物诸如甘蔗、柑橘、水果和坚果作物。
- [0336] 还值得注意的实施方案是包含上述实施方案的化合物的本发明的除草剂组合物。
- [0337] 本发明还包括除草剂混合物，所述除草剂混合物包含 (a) 选自式1的化合物、其N-氧化物及其盐，和 (b) 至少一种附加活性成分，所述附加活性成分选自：(b1) 光系统II抑制剂，(b2) 乙酰羟酸合酶 (AHAS) 抑制剂，(b3) 乙酰-CoA羧化酶 (ACCase) 抑制剂，(b4) 生长素模

拟物, (b5) 5-烯醇-丙酮酰莽草酸-3-磷酸酯(EPSP)合酶抑制剂, (b6) 光系统I电子转向剂, (b7) 原卟啉原氧化酶(PP0)抑制剂, (b8) 谷氨酰胺合成酶(GS)抑制剂, (b9) 极长链脂肪酸(VLCFA)延伸酶抑制剂, (b10) 生长素运输抑制剂, (b11) 八氢番茄红素去饱和酶(PDS)抑制剂, (b12) 4-羟基苯基-丙酮酸双氧化酶(HPPD)抑制剂, (b13) 尿黑酸茄尼酯转移酶(homogentisate solenesyltransferase, HST)抑制剂, (b14) 纤维素生物合成抑制剂, (b15) 其它除草剂, 包括有丝分裂干扰剂、有机砷化合物、黄草灵、溴丁酰草胺、环庚草醚、苄草隆、棉隆、2-[(2,5-二氯苯基)甲基]-4,4-二甲基-3-异噁唑烷酮、野燕枯、杀草隆、乙氧草胺、抑草丁、杀木磷(fosamine)、调节磷(fosamine-ammonium)、hydantridin、威百亩(metam)、甲基杀草隆、油酸、恶嗪草酮、壬酸和稗草畏, 以及(b16)除草剂安全剂; 以及(b1)至(b16)的化合物的盐。

[0338] “光系统II抑制剂”(b1)为这样的化合物, 其在 Q_b 结合位置处结合到D-1蛋白质上, 从而在叶绿体类囊体膜中阻断电子从 Q_A 传输至 Q_b 。被阻断通过光系统II的电子通过一系列反应转移, 以形成毒性化合物, 所述毒性化合物破坏细胞膜并造成叶绿体溶胀、膜渗漏, 并最终造成细胞破裂。 Q_b 结合位置具有三种不同的结合位点: 结合位点A结合三嗪诸如莠去津、三嗪酮诸如环嗪酮、以及尿嘧啶诸如除草定, 接合位点B结合苯基脲诸如敌草隆, 并且结合位点C结合苯并噻二唑诸如灭草松、腈诸如溴苯腈以及苯基-哒嗪诸如达草特。光系统II抑制剂的实例包括莠灭净、氨唑草酮、莠去津、灭草松、除草定、溴酚肟、溴苯腈、氯溴隆、氯草敏、绿麦隆、枯草隆(chloroxuron)、苄草隆(cumyluron)、氰草津、杀草隆、甜菜安、敌草净、噁唑隆、异戊乙净、敌草隆、磺噻隆、非草隆、伏草隆、环嗪酮、碘苯腈、异丙隆、异噁隆、环草定、利谷隆、苯嗪草酮、甲基苯噻隆、秀谷隆、甲氧隆、嗪草酮、绿谷隆、草不隆、甲氯酰草胺、苯敌草、扑灭通、扑草净、敌稗、扑灭津、pyridafol、哒草特、环草隆、西玛津、西草净、丁噻隆、特草定、特丁通、特丁净、去草净和草达津。

[0339] “AHAS抑制剂”(b2)是这样的化合物, 其抑制乙酰羟酸合酶(AHAS) (还称为乙酰乳酸合酶(ALS)), 从而通过抑制蛋白质合成和细胞生长所需的支链脂族氨基酸诸如缬氨酸、亮氨酸和异亮氨酸的产生来杀死植物。AHAS抑制剂的实例包括酰嘧磺隆、四唑嘧磺隆、苄嘧磺隆(bensulfuron-methyl)、双草醚(bispyribac-sodium)、氯酯磺草胺(cloransulam-methyl)、氯嘧磺隆(chlorimuron-ethyl)、氯磺隆、醚磺隆、环丙嘧磺隆、双氯磺草胺、胺苯磺隆(ethametsulfuron-methyl)、乙氧嘧磺隆、啶嘧磺隆、双氟磺草胺、氟唑磺隆(flucarbazone-sodium)、唑嘧磺草胺、氟啶嘧磺隆(flupyrasulfuron-methyl)、氟嘧磺隆钠(flupyrasulfuron-sodium)、甲酰氨基嘧磺隆、氯吡嘧磺隆(halosulfuron-methyl)、咪草酸(imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟、甲咪唑烟酸、灭草烟、咪唑喹啉酸、咪唑乙烟酸、唑吡嘧磺隆、甲基磺隆(包括钠盐)、iofensulfuron (2-碘代-N-[(4-甲氧基-6-甲基-1,3,5-三嗪-2-基)氨基]羰基)苯磺酰胺)、甲基二磺隆(mesosulfuron-methyl)、嗪吡嘧磺隆(3-氯-4-(5,6-二氢-5-甲基-1,4,2-二噁嗪-3-基)-N-[(4,6-二甲氧基-2-嘧啶基)氨基]羰基)-1-甲基-1H-吡唑-5-磺酰胺)、磺草唑胺、甲磺隆(metsulfuron-methyl)、烟嘧磺隆、环氧嘧磺隆、五氟磺草胺、氟嘧磺隆(primisulfuron-methyl)、丙苯磺隆(propoxycarbazone-sodium)、丙嗪嘧磺隆(2-氯-N-[(4,6-二甲氧基-2-嘧啶基)氨基]羰基)-6-丙基咪唑并[1,2-b]哒嗪-3-磺酰胺)、氟磺隆、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron-ethyl)、嘧啶肟草醚、环酯草醚、嘧草醚(pyriminobac-methyl)、嘧草硫醚(pyrithiobac-sodium)、砒嘧磺隆、甲嘧磺隆

(sulfometuron-methyl)、磺酰磺隆、噻酮磺隆、噻吩磺隆(thifensulfuron-methyl)、氟酮磺草胺(N-[2-[(4,6-二甲氧基-1,3,5-三嗪-2-基)羰基]-6-氟苯基]-1,1-二氟-N-甲基甲烷磺酰胺)、醚苯磺隆、苯磺隆(tribenuron-methyl)、三氟啶磺隆(包括钠盐)、氟胺磺隆(triflusaluron-methyl)和三氟甲磺隆。

[0340] “ACCase抑制剂”(b3)为抑制乙酰-CoA羧化酶的化合物,所述酶负责催化植物中脂质和脂肪酸合成中的早期步骤。脂质是细胞膜的主要组分,没有脂质,则不能制造新细胞。乙酰CoA羧化酶的抑制和后续脂质产生的缺乏导致细胞膜完整性丧失,尤其是在活跃生长区诸如分生组织中。最终苗和根茎生长停止,并且苗分生组织和根茎芽开始枯死。ACCase抑制剂的实例包括禾草灭、丁氧环酮、烯草酮、炔草酯、噻草酮、氰氟草酯、禾草灵、噁唑禾草灵、吡氟禾草灵、氟吡甲禾灵、唑啉草酯、环苯草酮、啶草酯、喹禾灵、稀禾定、得杀草和肟草酮,包括分解形式诸如精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P)、精吡氟禾草灵(fluzifop-P)、精氟吡甲禾灵(haloxyfop-P)和精喹禾灵(quizalofop-P),以及酯形式诸如氟唑·炔草酯(clodinafop-propargyl)、氰氟草酯-丁酯(cyhalofop-butyl)、禾草灵-甲酯(diclofop-methyl)以及精噁唑禾草灵-乙酯(fenoxaprop-P-ethyl)。

[0341] 生长素是植物激素,其调节许多植物组织的生长。“生长素模拟物”(b4)是这样的化合物,其模拟植物生长激素生长素,因此导致不受控制和无序的生长,从而导致易感物种的植物死亡。生长素模拟物的实例包括氯丙啶啶酸(6-氨基-5-氯-2-环丙基-4-啶啶羧酸)及其甲酯和乙酯以及其钠盐和钾盐、氯氨吡啶啶酸、草除灵-乙酯(benazolin-ethyl)、草灭平、氯酰草膦、氯甲酰草胺、二氯吡啶啶酸、麦草畏、2,4-D、2,4-DB、滴丙酸、氯氟吡啶啶酸、氟氯吡啶啶甲酯(haloxifen-methyl)(4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲氧基苯基)-2-吡啶羧酸)、氟氯吡啶啶甲酯(haloxifen-methyl)(4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲氧基苯基)-2-吡啶羧酸甲酯)、MCPA、MCPB、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、毒莠定、二氯喹啉酸、氯甲喹啉酸、2,3,6-TBA、绿草定、和4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲氧基苯基)-5-氟-2-吡啶羧酸甲酯。

[0342] “EPSP合酶抑制剂”(b5)为抑制5-烯醇-丙酮酰莽草酸-3-磷酸酯合酶这种酶的化合物,所述酶涉及芳族氨基酸诸如酪氨酸、色氨酸和苯丙氨酸的合成。EPSP抑制剂除草剂易于通过植物叶吸收并在韧皮部中易位至生长点。草甘膦是属于该组的相对非选择性出苗后除草剂。草甘膦包括酯和盐,诸如铵盐、异丙基铵盐、钾盐、钠盐(包括倍半钠盐)和三甲基铊盐(或者被称为草硫膦)。

[0343] “光系统I电子转向剂”(b6)为接受来自光系统I中的电子,并在数次循环之后产生羟基自由基的化合物。这些自由基极具反应性并易于破坏不饱和脂质,包括膜脂肪酸和叶绿素。这破坏细胞膜完整性,使得细胞和细胞器“渗漏”,从而导致叶片快速萎蔫和干枯,并最终导致植物死亡。该第二类型的光合成抑制剂的实例包括敌草快和百草枯。

[0344] “PPO抑制剂”(b7)为这样的化合物,其抑制原卟啉原氧化酶这种酶,迅速地导致在植物中形成破坏细胞膜的高反应性化合物,从而导致细胞液渗出。PPO抑制剂的实例包括三氟羧草醚(acifluorfen-sodium)、啶啶草酮、双苯啶草酮、甲羧除草醚、氟丙啶草酯、啶草酮、啶草酮乙酯(carfentrazone-ethyl)、甲氧除草醚、吲哚啶草酯(cinidon-ethyl)、cyclopyranil、异丙吡草酯、氟啶啶草酯-乙酯(flufenpyr-ethyl)、氟烯草酸(flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺、乙羧氟草醚(fluoroglyphosate-ethyl)、噻草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、氟磺胺草醚、halosafen、乳氟禾草灵、丙炔噁草酮、噁草酮、乙氧氟

草醚、环戊噁草酮、氟唑草胺、双唑草腈、吡草醚 (pyraflufen-ethyl)、苯嘧磺草胺、甲磺草胺、噻二唑草胺、trifludimoxazin(二氢-1,5-二甲基-6-硫代(thioxo)-3-[2,2,7-三氟-3,4-二氢-3-氧代-4-(2-丙炔-1-基)-2H-1,4-苯并噁嗪-6-基]-1,3,5-三嗪-2,4(1H,3H)-二酮)和tiafenacil(N-[2-[[2-氯-5-[3,6-二氢-3-甲基-2,6-二氧代-4-(三氟甲基)-1(2H)-嘧啶基]-4-氟苯基]硫代]-1-氧代丙基]-β-丙氨酸甲酯)。

[0345] “GS抑制剂”(b8)是抑制谷氨酰胺合酶的活性的化合物,植物使用所述酶以将氨转化为谷氨酰胺。因此,氨累积并且谷氨酰胺含量降低。由于氨毒性和其它代谢过程所需氨基酸的缺乏的联合效应,可能出现植物损害。GS抑制剂包括草胺磷(glufosinate)及其酯和盐,诸如草胺磷(glufosinate-ammonium)和其它草丁膦(phosphinothricin)衍生物、精草胺磷(glufosinate-P)((2S)-2-氨基-4-(羟基甲基氧膦基)丁酸)和毕拉草(bilanaphos)。

[0346] “VLCFA延伸酶抑制剂”(b9)为具有多种化学结构的除草剂,其抑制延伸酶。延伸酶是位于叶绿体中或附近的酶之一,其涉及VLCFA的生物合成。在植物中,极长链脂肪酸为疏水性聚合物的主要成分,其防止叶表面处的干燥并提供花粉粒的稳定性。此类除草剂包括乙草胺、甲草胺、莎稗磷、丁草胺、唑草胺、二甲草胺、二甲酚草胺、草乃敌、fenoxasulfone(3-[[2,5-二氯代-4-乙氧基苯基]甲基]磺酰基)-4,5-二氢-5,5-二甲基异噁唑)、四唑唑草胺、氟噻草胺、茚草酮、苯噻唑草胺、吡草胺、异丙甲草胺、萘丙胺、敌草胺、敌草胺-M((2R)-N,N-二乙基-2-(1-萘氧基)丙酰胺)、烯草胺、哌草磷、丙草胺、毒草胺、异丙草胺、罗克杀草砒、和甲氧噻草胺,包括分解的形式,诸如精异丙甲草胺(S-metolachlor)和氯乙酰胺和氧乙酰胺。

[0347] “生长素传输抑制剂”(b10)是(诸如通过与生长素-载体蛋白质结合)抑制植物中生长素传输的化学物质。生长素传输抑制剂的实例包括氟吡草腈、萘草胺(还称为N-(1-萘基)-邻氨基酰基苯甲酸和2-[(1-萘基氨基)羰基]苯甲酸)。

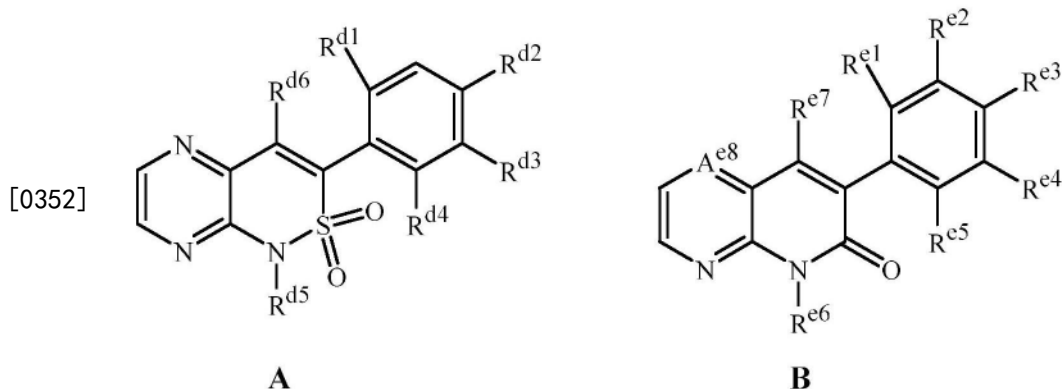
[0348] “PDS抑制剂”(b11)为在八氢番茄红素脱氢酶步骤时抑制类胡萝卜素生物合成途径的化合物。PDS抑制剂的实例包括氟丁酰草胺、S-氟丁酰草胺(S-beflubutamid)、吡氟酰草胺、氟啶草酮、氟咯草酮、呋草酮、氟草敏和氟吡酰草胺。

[0349] “HPPD抑制剂”(b12)是抑制4-羟基苯基-丙酮酸双氧化酶合成的生物合成的化学物质。HPPD抑制剂的实例包括双环磺草酮、吡草酮、氟吡草酮(4-羟基-3-[[2-[(2-甲氧基乙氧基)甲基]-6-(三氟甲基)-3-吡啶基]羰基]二环[3.2.1]辛-3-烯-2-酮)、fenquintrione(2-[[8-氯-3,4-二氢-4-(4-甲氧基苯基)-3-氧代-2-喹啉基]羰基]-1,3-环己二酮)、异噁氯草酮、异噁唑草酮、甲基磺草酮、磺酰草吡唑、吡唑特、苄草唑、磺草酮、特夫三酮、环磺酮、tolpyralate(1-[[1-乙基-4-[3-(2-甲氧基乙氧基)-2-甲基-4-(甲基磺酰基)苯甲酰基]-1H-吡唑-5-基]氧基]乙基甲基碳酸酯)、苯唑草酮、5-氯-3-[(2-羟基-6-氧代-1-环己烯-1-基)羰基]-1-(4-甲氧基苯基)-2(1H)-喹啉酮、4-(2,6-二乙基-4-甲基苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-3(2H)-吡嗪酮、4-(4-氟苯基)-6-[(2-羟基-6-氧代-1-环己烯-1-基)羰基]-2-甲基-1,2,4-三嗪-3,5(2H,4H)-二酮、5-[(2-羟基-6-氧代-1-环己烯-1-基)羰基]-2-(3-甲氧基苯基)-3-(3-甲氧基丙基)-4(3H)-嘧啶酮、2-甲基-N-(4-甲基-1,2,5-噁二唑-3-基)-3-(甲基亚磺酰基)-4-(三氟甲基)苯甲酰胺、和2-甲基-3-(甲基磺酰基)-N-(1-甲基-1H-四唑-5-基)-4-(三氟甲基)苯甲酰胺。

[0350] “HST抑制剂”(b13)破坏植物将尿黑酸(homogentisate)转化成2-甲基-6-茄尼基

(solanyl)-1,4-苯醌的能力,从而破坏类胡萝卜素生物合成。HST抑制剂的实例包括氟啶草、氯草定、3-(2-氯-3,6-二氟苯基)-4-羟基-1-甲基-1,5-萘啶-2(1H)-酮、7-(3,5-二氯-4-吡啶基)-5-(2,2-二氟乙基)-8-羟基吡啶并[2,3-b]吡嗪-6(5H)-酮和4-(2,6-二乙基-4-甲基苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-3(2H)-吡嗪酮。

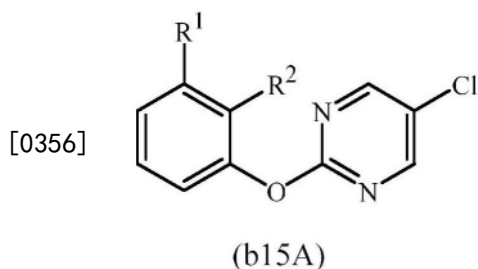
[0351] HST抑制剂还包括式A和B的化合物。



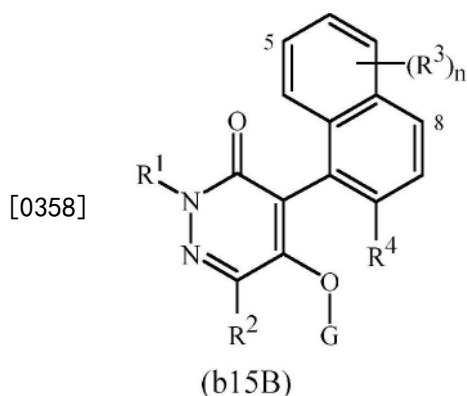
[0353] 其中 R^{d1} 为H、Cl或 CF_3 ; R^{d2} 为H、Cl或Br; R^{d3} 为H或Cl; R^{d4} 为H、Cl或 CF_3 ; R^{d5} 为 CH_3 、 CH_2CH_3 或 CH_2CHF_2 ; 并且 R^{d6} 为OH或 $-OC(=O)-i-Pr$; 并且 R^{e1} 为H、F、Cl、 CH_3 或 CH_2CH_3 ; R^{e2} 为H或 CF_3 ; R^{e3} 为H、 CH_3 或 CH_2CH_3 ; R^{e4} 为H、F或Br; R^{e5} 为Cl、 CH_3 、 CF_3 、 OCF_3 或 CH_2CH_3 ; R^{e6} 为H、 CH_3 、 CH_2CHF_2 或 $C\equiv CH$; R^{e7} 为OH、 $-OC(=O)Et$ 、 $-OC(=O)-i-Pr$ 或 $-OC(=O)-t-Bu$; 并且 A^{e8} 为N或CH。

[0354] 纤维素生物合成抑制剂(b14)抑制某些植物中纤维素的生物合成。它们在对幼嫩或快速生长的植物在预出苗或早期出苗时施用是最有效的。纤维素生物合成抑制剂的实例包括草克乐、敌草腈、氟胺草啞、三嗪莠草胺($N^2-[(1R,2S)-2,3-二氢-2,6-二甲基-1H-茛-1-基]-6-(1-氟乙基)-1,3,5-三嗪-2,4-二胺$)、异噁唑草胺和三嗪氟草胺。

[0355] 其它除草剂(b15)包括通过多种不同作用模式而起作用的除草剂, 诸如有丝分裂干扰剂(例如麦草氟-M-甲酯(flamprop-M-methyl)和麦草氟-M-异丙酯(flamprop-M-isopropyl))、有机砷化合物(例如DSMA和MSMA)、7,8-二氢蝶酸合酶抑制剂、叶绿体类异戊二烯合成抑制剂和细胞壁生物合成抑制剂。其它除草剂包括那些具有未知作用模式的或不属于(b1)至(b14)列出的具体类别中的或通过上文列出的作用模式的组合而起作用的除草剂。其它除草剂的实例包括苯草醚、黄草灵、杀草强、溴丁酰草胺、环庚草醚、异噁草酮、苄草隆、cyclopyrimorate(6-氯-3-(2-环丙基-6-甲基苯氧基)-4-吡嗪基4-吗啉羧酸酯)、杀草隆、2-[(2,5-二氯苯基)甲基]-4,4-二甲基-3-异噁唑烷酮、野燕枯、乙氧苯草胺、伏草隆、抑草丁、杀木膦、调节膦、棉隆、杀草隆、三唑草胺(1-(2,4-二氯苯基)-N-(2,4-二氟苯基)-1,5-二氢-N-(1-甲基乙基)-5-氧代-4H-1,2,4-三唑-4-甲酰胺)、威百亩、甲基杀草隆、油酸、噁唑草酮、壬酸、稗草畏和5-[[(2,6-二氟苯基)甲氧基]甲基]-4,5-二氢-5-甲基-3-(3-甲基-2-噻吩基)异噁唑。“其它除草剂”(b15)还包括式(b15A)的化合物:

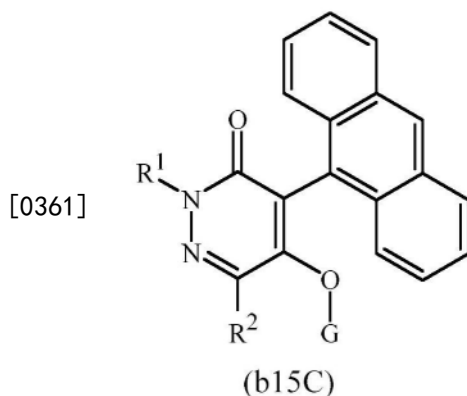


[0357] 其中 R^1 是Cl、Br或CN；并且 R^2 是 $C(=O)CH_2CH_2CF_3$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2CF_3$ 或3- CHF_2 -异噁唑-5-基。“其它除草剂”(b15)还包括式(b15B)的化合物：



[0359] 其中 R^1 是 CH_3 , R^2 是Me, R^4 是 $OCHF_2$, G是H, 并且n是0; R^1 是 CH_3 , R^2 是Me, R^3 是5-F, R^4 是Cl, G是H, 并且n是1; R^1 是 CH_3 , R^2 是Cl, R^4 是Me, G是H, 并且n是0; R^1 是 CH_3 , R^2 是Me, R^4 是Cl, G是H, 并且n是0; R^1 是 CH_3 , R^2 是Me, R^3 是5-Me, R^4 是 $OCHF_2$, G是H, 且n是1; R^1 是 CH_3 , R^2 是Me, R^3 是5-Br, R^4 是 $OCHF_2$, G是H, 并且n是1; R^1 是 CH_3 , R^2 是Me, R^3 是5-Cl, R^4 是Cl, G是H, 并且n是1; 或者 R^1 是 CH_3 , R^2 是 CH_3 , R^4 是 $OCHF_2$, G是 $C(O)Me$, 并且n是0。

[0360] “其它除草剂”(b15)还包括式(b15C)的化合物：



[0362] 其中

[0363] R^1 是 CH_3 , R^2 是Cl, 并且G是H; 或者

[0364] R^1 是 CH_3 , R^2 是Cl, 并且G是 $C(O)Me$ 。

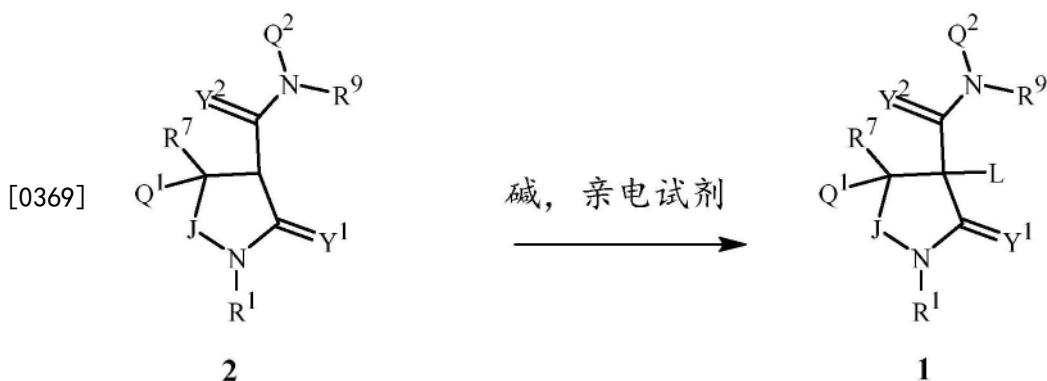
[0365] “除草剂安全剂”(b16)为加入到除草制剂中以消除或减少除草剂对某些作物的植物性毒素效应的物质。这些化合物保护作物免受除草剂的伤害,但通常不阻止除草剂控制不期望的植被。除草剂安全剂的实例包括但不限于解草酮、解毒啉(cloquintocet-mexyl)、苄草隆、解草胺腈、环丙磺酰胺、杀草隆、二氯丙烯胺、dicyclonon、增效磷(dietholate)、哌草丹、解草啉(fenchlorazole-ethyl)、解草啉、解草安、氟草肟、解草噁唑、双苯噁唑酸

(isoxadifen-ethyl)、吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)、4-氯苯基甲基氨基甲酸酯(mephenate)、苯草酮、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈、N-(氨基羰基)-2-甲基苯磺酰胺和N-(氨基羰基)-2-氟苯磺酰胺、1-溴-4-[(氯甲基)磺酰基]苯、2-(二氯甲基)-2-甲基-1,3-二氧戊环(MG 191)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-偶氮螺[4.5]癸烷(MON 4660)、2,2-二氯-1-(2,2,5-三甲基-3-噁唑烷基)-乙酮和2-甲氧基-N-[[4-[(甲基氨基)羰基]氨基]苯基]磺酰基]-苯甲酰胺。

[0366] 式1的化合物可以通过合成有机化学领域中已知的一般方法制备。值得注意的是路线1-5及其变体中所述的以下方法。除非另有说明,下式1至2的化合物中 R^1 、 R^7 、 R^9 、 Q^1 、 Q^2 、 Y^1 、 Y^2 、J和W的定义如上文发明概述中所定义。式1A-1F是式1的化合物的各个子集。除非另有说明,否则每个子集式的取代基的定义均与其母体式相同。

[0367] 如路线1所示,可以通过使式2的化合物与亲电试剂反应来制备式1的化合物。在化学计量量、超化学计量量或催化量的碱的存在下并通常在助溶剂的存在下进行加成反应和取代反应。适用于该反应的碱包括但不限于氢化钠、甲醇钠、乙醇钠、碳酸铯、碳酸钾、叔丁醇钾、二异丙基氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基钠、双(三甲基甲硅烷基)氨基钾、吡啶、三乙胺和N,N-二异丙基乙胺。适用于该反应的亲电试剂包括但不限于酰氯、酸酐(acyl anhydrides)、氯甲酸酯、氰基甲酸酯、异氰酸酯、醛、酮、亚胺、亚胺卤化物(iminium halides)、缺电子烯烃(例如丙烯酸酯、丙烯酰胺类、丙烯腈类、乙烯基酮类和乙烯基砜类)、烷基卤化物和烷基磺酸酯(alkylsulfonates)。通常,反应是在-78℃至溶剂回流温度的温度下,在溶剂中进行的,所述溶剂例如水、甲醇、乙醇、四氢呋喃、二甲基亚砜、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基吡咯烷酮和乙腈或它们的混合物。合成例3的步骤A说明了使用双(三甲基甲硅烷基)氨基锂和乙酰氯制备式1的化合物(其中L为L-1)的路线1的方法。合成例1的步骤A说明了利用催化量的氢氧化钾和多聚甲醛制备式1的化合物(其中L为L-3)的路线1的方法。

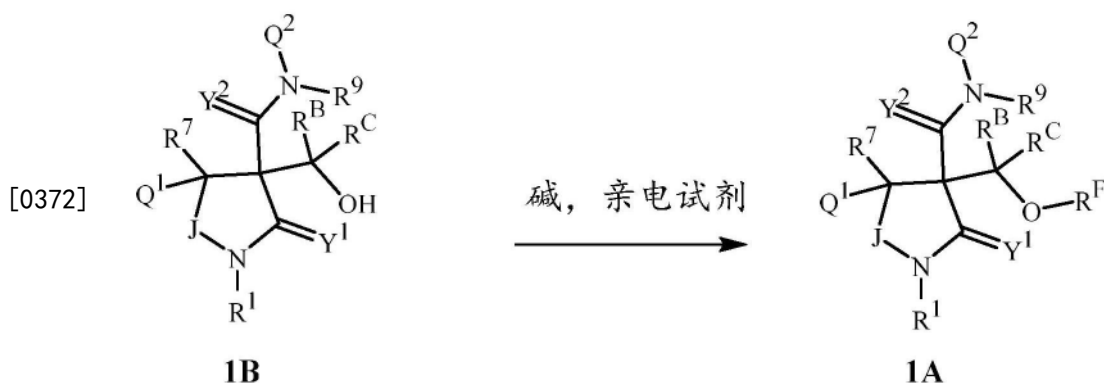
[0368] 路线1



[0370] 如路线2所示,可以通过使式1A的醇(即,式1的化合物,其中L为L-3,且R^F是H)与亲电试剂反应来制备式1B的化合物(即,式1的化合物,其中L为L-3,且R^F不是H)。反应在合适的碱的存在下并且通常在助溶剂的存在下进行。适用于该反应的碱包括但不限于氢化钠、甲醇钠、乙醇钠、碳酸铯、碳酸钾、叔丁醇钾、二异丙基氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基钠、双(三甲基甲硅烷基)氨基钾、吡啶、三乙胺和N,N-二异丙基乙胺。适用于该反应的亲电试剂包括但不限于酰氯、酸酐、氯甲酸酯、氰基甲酸酯、异氰酸酯、磺酰氯、亚磺酰氯和磷酰氯。通常,反应是在-78℃至溶剂回流温度的温度下,在溶剂中进行。

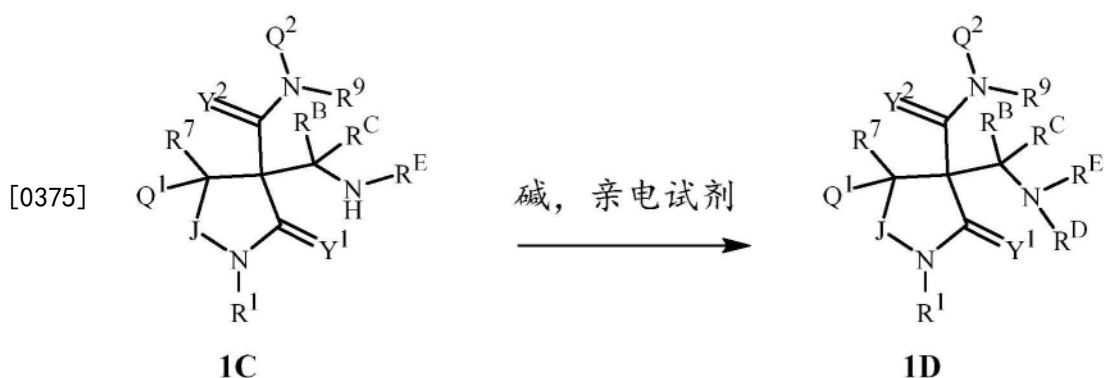
的,所述溶剂例如水、甲醇、乙醇、四氢呋喃、二甲基亚砷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基吡咯烷酮和乙腈或它们的混合物。合成例2的步骤A说明了利用吡啶和乙酰氯制备式1A的化合物(其中L为L-3)的路线2的方法。

[0371] 路线2



[0373] 如路线3所示,可以通过使式1C的化合物(即,式1的化合物,其中L为L-2,且R^D是H)与亲电试剂反应来制备式1D的化合物(即,式1的化合物,其中L为L-2,且R^D不是H)。反应在合适的碱的存在下并且通常在助溶剂的存在下进行。适用于该反应的碱包括但不限于氢化钠、甲醇钠、乙醇钠、碳酸铯、碳酸钾、叔丁醇钾、二异丙基氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基钠、双(三甲基甲硅烷基)氨基钾、吡啶、三乙胺和N,N-二异丙基乙胺。适用于该反应的亲电试剂包括但不限于酰氯、酸酐、氯甲酸酯、氰基甲酸酯、异氰酸酯、缺电子烯烃(例如丙烯酸酯、丙烯酰胺类、丙烯腈类、乙烯基酮类和乙烯基砜类)、烷基卤化物、烷基磺酸酯、磺酰氯、亚磺酰氯和磷酰氯。通常,反应是在-78℃至溶剂回流温度的温度下,在溶剂中进行的,所述溶剂例如水、甲醇、乙醇、四氢呋喃、二甲基亚砷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基吡咯烷酮和乙腈或它们的混合物。

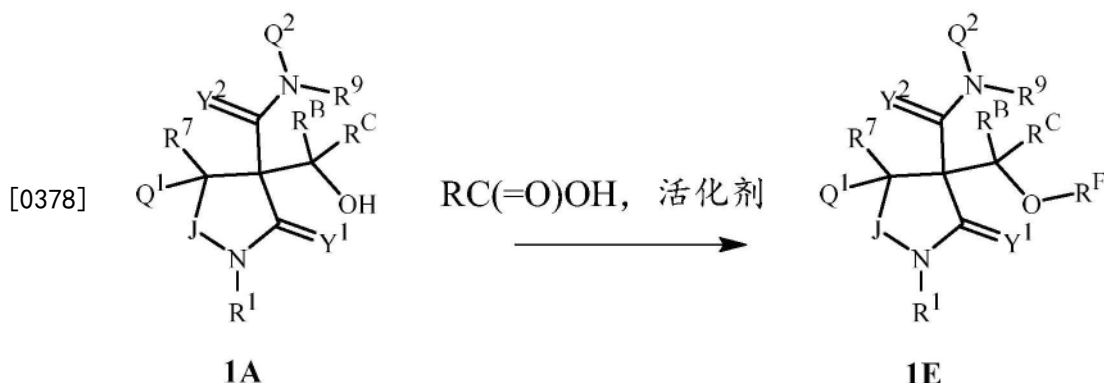
[0374] 路线3



[0376] 也可以如路线4所示,通过在脱水偶联剂(dehydrative coupling reagent)(如丙基膦酸酐、二环己基碳二亚胺、N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺、N,N'-羰基二咪唑、2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯化物或2-氯-1-甲基吡啶鎓碘化物)的存在下,任选地在诸如N,N-二甲基-4-氨基吡啶的催化剂的存在下,使羧酸与式1A的醇(即,式1的化合物,其中L为L-3,且R^F是H)反应来制备式1E的化合物(即,式1的化合物,其中L为L-3,且R^F是C(=O)R,其中与羰基键合的原子为碳)。聚合物负载的试剂(例如聚合物负载的环己基碳二亚胺)也是合适的。这些反应通常在碱(例如三乙胺、N,N-二异丙胺或1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一-7-

烯)的存在下,于0℃至溶剂沸点的温度下,在溶剂(例如二氯甲烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或乙酸乙酯)中进行。

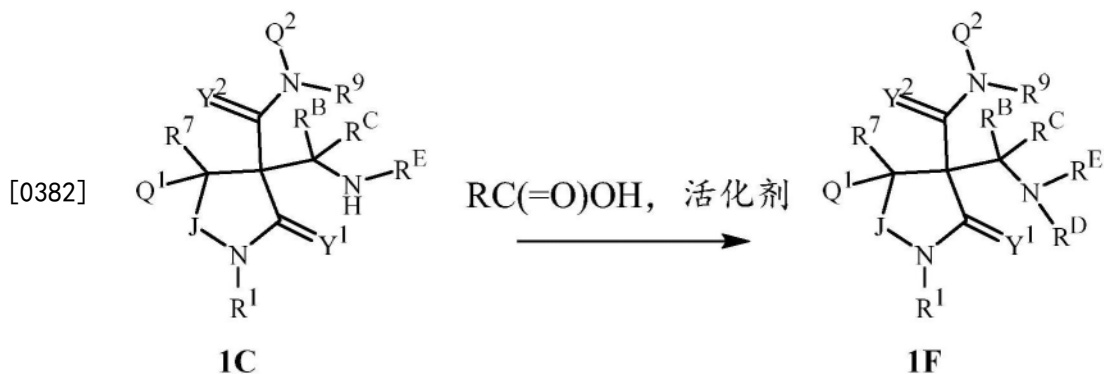
[0377] 路线4



[0379] R^F 是 $-C(=O)R$

[0380] 也可以如路线5所示,通过在脱水偶联剂(如丙基膦酸酐、二环己基碳二亚胺、N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺、N,N'-羰基二咪唑、2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯化物或2-氯-1-甲基吡啶鎓碘化物)的存在下,使羧酸与式1C的化合物(即,式1的化合物,其中L为L-2,且 R^D 是H)反应来制备式1F的化合物(即,式1的化合物,其中L为L-2,且 R^D 是 $C(=O)R$,其中与羰基键合的原子为碳)。聚合物负载的试剂(例如聚合物负载的环己基碳二亚胺)也是合适的。这些反应通常在碱(例如三乙胺、N,N-二异丙胺或1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一-7-烯)的存在下,于0-60℃的温度下,在溶剂(例如二氯甲烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或乙酸乙酯)中进行。关于使用丙基膦酸酐的偶联条件,请参见Organic Process Research&Development 2009,13,900-906。

[0381] 路线5



[0383] R^D 是 $C(=O)R$

[0384] 本领域技术人员认识到,多种官能团可被转变成其它官能团以提供不同的式1的化合物。对于以简单并且直观的方式示出官能团互变的可贵资源,参见Larock,R.C., Comprehensive Organic Transformations:A Guide to Functional Group Preparations,第2版,Wiley-VCH,New York,1999。例如,用于制备式1的化合物的中间体可包含芳族硝基,其可被还原成氨基,然后经由本领域熟知的反应(诸如Sandmeyer反应)被转换成各种卤化物,从而提供式1的化合物。在许多情况下,上述反应还可以另选的顺序来进行。

[0385] 已经认识到,上述用于制备式1的化合物的某些试剂和反应条件可能与中间体中存在的某些官能团不相容。在这些情况下,将保护/脱保护序列或官能团互变体掺入合成中会有助于获得所期望的产物。保护基的使用和选择对于化学合成领域的技术人员会是显而易见的(参见例如Greene,T.W.;Wuts,P.G.M.Protective Groups in Organic Synthesis,第2版;Wiley:New York,1991)。本领域技术人员会认识到,在一些情况下,在按照任何单独路线中所示引入指定试剂后,可能需要进行未详细描述的增加常规合成步骤以完成式1的化合物的合成。本领域技术人员还会认识到,可能需要以与制备式1的化合物时呈现的具体次序不相同的次序来进行上文路线中示出的步骤的组合。

[0386] 本领域技术人员还会认识到,本文所述的式1的化合物和中间体可经历各种亲电反应、亲核反应、自由基反应、有机金属反应、氧化反应和还原反应,以添加取代基或修饰现有的取代基。

[0387] 无需进一步详尽说明,相信本领域技术人员使用前述描述可最大限度地利用本发明。以下非限制性实施例是对本发明的说明。以下实施例中的步骤示出了整个合成转化中各步骤的操作,并且用于各步骤的原料可无需通过其操作描述于其它实施例或步骤中的具体制备过程来制备。百分比均按重量计,除了色谱溶剂混合物或除非另外指明之外。除非另外指明,色谱溶剂混合物的份数和百分比均按体积计。除非另外指明,在500MHz下,在CDCl₃中,以距四甲基硅烷的低场ppm数为单位记录¹H NMR波谱;“s”表示单峰,“d”表示双重峰,“t”表示三重峰,“q”表示四重峰,“m”表示多重峰,“dd”表示重双峰,“dt”表示双重三峰,并且“br s”表示宽单峰。

[0388] 合成例1

[0389] (3S,4R)-N-(2,3-二氟苯基)-3-(羟基甲基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺(化合物4和5)的制备

[0390] 步骤A:(3S,4R)-N-(2,3-二氟苯基)-3-(羟基甲基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺的制备

[0391] 将(3S,4S)-N-(2,3-二氟苯基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺(0.80g,2.0mmol)、多聚甲醛(0.072g,2.4mmol)和氢氧化钾(0.002g,0.04mmol)的溶液添加到四氢呋喃(16mL)中,并加热至溶剂的回流温度,持续30分钟。将反应混合物浓缩,得到粗产物。将粗产物通过柱色谱法(用0%至100%乙酸乙酯的己烷溶液洗脱)纯化,得到作为无色油状物(0.20g)的标题化合物(其为本发明的化合物)及其非对映体(作为无色固体(0.60g)的(3R,4R)-N-(2,3-二氟苯基)-3-(羟基甲基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺,其为本发明的化合物)。

[0392] ¹H NMRδ10.22(br s,1H),7.52(d,J=8.2Hz,2H),7.50-7.45(m,1H),7.33(d,J=8.2Hz,2H),6.99-6.82(m,2H),4.18-4.08(m,1H),4.07-4.00(m,1H),3.98-3.83(m,2H),3.56-3.48(m,1H),3.15-3.11(m,1H),3.07(s,3H)。

[0393] 非对映体:¹H NMRδ10.27(br s,1H),8.03-7.97(m,1H),7.72(d,J=8.4Hz,2H),7.64(d,J=8.4Hz,2H),7.08-6.99(m,1H),6.95-6.86(m,1H),4.40-4.33(m,1H),3.91-3.64(m,4H),3.08(s,3H),2.24-2.20(m,1H)。

[0394] 合成例2

[0395] (3S,4R)-3-[(乙酰氧基)甲基]-N-(2,3-二氟苯基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟

甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺(化合物2)的制备

[0396] 步骤A: (3S,4R)-3-[(乙酰氧基)甲基]-N-(2,3-二氟苯基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺的制备

[0397] 将(3S,4R)-N-(2,3-二氟苯基)-3-(羟基甲基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺和(3R,4R)-N-(2,3-二氟苯基)-3-(羟基甲基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺(即合成例1的产物)(0.080g,0.19mmol)和吡啶(0.020mL,0.22mmol)溶解于二氯甲烷(1.0mL)。加入乙酰氯(0.015mL,0.22mmol),并将溶液在23℃下搅拌20分钟。将反应混合物浓缩到硅胶上,并通过柱色谱法(用0%至50%乙酸乙酯的己烷溶液洗脱)纯化,得到作为浅黄色油状物(0.045g)的标题化合物,其为本发明的化合物。

[0398] ^1H NMR δ 10.51 (br s, 1H), 7.55-7.44 (m, 3H), 7.31-7.26 (m, 2H), 6.94-6.81 (m, 2H), 4.81 (d, J=10.9Hz, 1H), 4.47 (d, J=10.9Hz, 1H), 4.06-3.98 (m, 1H), 3.65-3.59 (m, 1H), 3.35-3.29 (m, 1H), 3.05 (s, 3H), 2.10 (s, 3H)。

[0399] 合成例3

[0400] (3S,4R)-3-乙酰基-N-(2,3-二氟苯基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺(化合物3)的制备

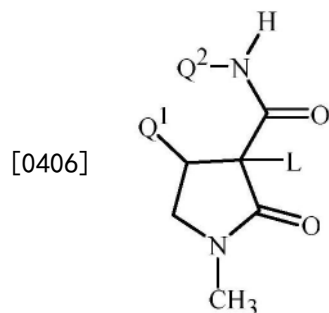
[0401] 步骤A: (3S,4R)-3-乙酰基-N-(2,3-二氟苯基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺的制备

[0402] 将(3S,4S)-N-(2,3-二氟苯基)-1-甲基-2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺(0.10g,0.25mmol)溶解于四氢呋喃(10mL)中并冷却至0℃。加入双(三甲基甲硅烷基)氨基锂的四氢呋喃溶液(1.0M,0.50mL,0.50mmol),并在0℃下搅拌10分钟。加入乙酰氯(0.020mL,0.28mmol)。将反应温热至23℃并搅拌20分钟。将反应混合物浓缩至硅胶上,并通过柱色谱法(用0%至50%乙酸乙酯的己烷溶液洗脱)纯化,得到作为无色固体(0.021g)的标题化合物,其为本发明的化合物。

[0403] ^1H NMR δ 10.62 (br s, 1H), 7.51 (d, J=8.0Hz, 2H), 7.40-7.33 (m, 1H), 7.28 (d, J=8.2Hz, 2H), 6.95-6.84 (m, 2H), 4.38-4.34 (m, 1H), 4.04-3.98 (m, 1H), 3.06 (s, 3H), 2.42 (s, 3H)。

[0404] 通过本文所述的操作以及本领域已知的方法,可以制备表1至1008的以下化合物。在下表中使用以下缩写:i表示异,c表示环,Me表示甲基,Et表示乙基,Pr表示丙基,Bu表示丁基,c-Pr表示环丙基,c-Bu表示环丁基,Ph表示苯基,OMe表示甲氧基,OEt表示乙氧基,Py表示吡啶基, $-\text{NO}_2$ 表示硝基。

[0405] 表1



[0407] L是L-1;R^A是Me;Q²是Ph(2-F);并且Q1是:

Q ¹	Q ¹	Q ¹
Ph(3-Cl)	Ph(3-CF ₃ ,4-F)	3-Py(5-F)
Ph(3-F)	Ph(3-F,4-CF ₃)	3-Py(5-CF ₃)
Ph(3-Br)	Ph(3-CHF ₂ ,4-F)	3-Py(5-Me)
Ph(3-Me)	Ph(3-CH ₂ F,4-F)	3-Py(4-F)
Ph(3-CF ₃)	Ph(3,5-二-Et)	3-Py(4-CF ₃)
Ph(3-CHF ₂)	Ph(3-Me,5-OMe)	3-Py(4-Me)
Ph(3-CH ₂ F)	Ph(3,5-二-OMe)	3-Py(2-F)
Ph(3-OCF ₃)	Ph(3-OMe,5-OEt)	3-Py(2-CF ₃)
Ph(3-OCF ₂ H)	Ph(3-Me,5-CH ₂ F)	3-Py(2-Me)
Ph(3-OMe)	Ph(3-OMe,5-CH ₂ F)	4-Py
Ph(3-OCF ₂ CF ₂ H)	Ph(3-OEt,5-CH ₂ F)	4-Py(3-F)
Ph(4-Cl)	Ph(2,3,4-三-F)	4-Py(3-CF ₃)
Ph(4-F)	Ph(3,4,5-三-F)	4-Py(3-Me)
Ph(4-Br)	2-Py	4-Py(2-F)
Ph(4-Me)	2-Py(6-F)	4-Py(2-CF ₃)
Ph(4-CF ₃)	2-Py(6-CF ₃)	4-Py(2-OMe,6-OEt)
Ph(4-CHF ₂)	2-Py(6-Me)	4-Py(2-Me,6-F)
Ph(4-CH ₂ F)	2-Py(5-F)	4-Py(2-OMe,6-F)
Ph(4-OCF ₃)	2-Py(5-CF ₃)	4-Py(2-OEt,6-F)
Ph(4-OCF ₂ H)	2-Py(5-Me)	4-Py(2,6-二-F)
Ph(4-OMe)	2-Py(4-F)	4-Py(2-Me,6-CH ₂ F)
Ph(4-OCF ₂ CF ₂ H)	2-Py(4-CF ₃)	4-Py(2-OMe,6-CH ₂ F)
Ph(2,3-二-F)	2-Py(4-Me)	4-Py(2-OEt,6-CH ₂ F)
Ph(2,4-二-F)	2-Py(3-F)	4-Py(2-F,6-CH ₂ F)
Ph(2,5-二-F)	2-Py(3-CF ₃)	4-Py(2-Me,6-OCHF ₂)
Ph(2,6-二-F)	2-Py(3-Me)	4-Py(2-OMe,6-OCHF ₂)
Ph(3,4-二-F)	3-Py	4-Py(2-OEt,6-OCHF ₂)
Ph(3,5-二-F)	3-Py(6-F)	4-Py(2-F,6-OCHF ₂)
Ph(3-Me,4-F)	3-Py(6-CF ₃)	2-噻吩基
Ph(3-F,4-Me)	3-Py(6-Me)	2-噻吩基(4-CF ₃)

	Q ¹
	2-噻吩基(5-CF ₃)
	3-噻吩基
	3-噻吩基(4-CF ₃)
	3-噻吩基(5-CF ₃)
	2-呋喃基
	2-呋喃基(4-CF ₃)
	2-呋喃基(5-CF ₃)
	3-呋喃基
[0409]	3-呋喃基(4-CF ₃)
	3-呋喃基(5-CF ₃)
	吡嗪-2-基
	吡嗪-2-基(5-CF ₃)
	嘧啶-2-基
	嘧啶-2-基(5-CF ₃)
	嘧啶-5-基
	嘧啶-5-基(2-CF ₃)
	1,3-二氧戊环-4-基
	2,2-二-F-1,3-二氧戊环-4-基

[0410] 表2以与表1相同的方式构造,不同之处在于用下表2列出的行标题(即“L是L-1;R^A是Me;Q²是Ph(2,3-二-F);并且Q¹是”)代替“L是L-1;R^A是Me;Q²是Ph(2-F);并且Q¹是”的行标题。因此表2的第一条是式1的化合物,其中J是-CH₂-;Q²是Ph(2,3-二-F);Q¹是Ph(3-Cl)(即3-氯苯基);Y¹是O;Y²是O;R⁷是H;R⁹是H;L是L-1;并且R^A是Me。表3至16的构造类似。

表	行标题
2	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2,3-二-F);并且Q ¹ 是
3	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2,4-二-F);并且Q ¹ 是
4	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2,3,4-三-F);并且Q ¹ 是
5	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-CF ₃);并且Q ¹ 是
6	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-Me);并且Q ¹ 是
7	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-NO ₂);并且Q ¹ 是
8	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-Cl);并且Q ¹ 是
9	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-SO ₂ Me);并且Q ¹ 是
10	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-F,3-Cl);并且Q ¹ 是
11	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-SOMe);并且Q ¹ 是
12	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-SMe);并且Q ¹ 是
13	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是Ph(2-Me,3-F);并且Q ¹ 是
14	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是3-吡啶基(2,6-二-F);并且Q ¹ 是
15	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是3-吡啶基(2-F);并且Q ¹ 是

16	L是L-1;R ^A 是Me;Q ² 是2-吡啶基(6-F);并且Q ¹ 是
----	--

[0412] 表17-1008

[0413] 表17-1008以与表1-16相同的方式构造,不同之处在于行标题中提及L定义的部分“L是L-1;R^A是Me”被下表17-32列出的行标题中提及L定义的部分(即“L是L-1;R^A是Et”)所代替。因此表17的第一条是式1的化合物,其中J是-CH₂-;Q²是Ph(2,3-二-F);Q¹是Ph(3-Cl)(即3-氯苯基);Y¹是O;Y²是O;R⁷是H;R⁹是H;L是L-1;并且R^A是Et。

[0414]

表	行标题
17-32	L 是 L-1; R ^A 是 Me
33-48	L 是 L-1; R ^A 是 Et
49-64	L 是 L-1; R ^A 是 <i>n</i> -Pr
65-80	L 是 L-1; R ^A 是 <i>i</i> -Pr
81-96	L 是 L-1; R ^A 是 <i>c</i> -Pr
97-112	L 是 L-1; R ^A 是 <i>n</i> -Bu

[0415]

113-128	L 是 L-1; R ^A 是 CF ₃
129-144	L 是 L-1; R ^A 是 CCl ₃
145-160	L 是 L-1; R ^A 是 Ph
161-176	L 是 L-1; R ^A 是 Ph(2-Me)
177-192	L 是 L-1; R ^A 是 Ph(3-Me)
193-208	L 是 L-1; R ^A 是 Ph(4-Me)
209-224	L 是 L-1; R ^A 是 OMe
225-240	L 是 L-1; R ^A 是 OEt
241-256	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 Me
257-272	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 Et
273-288	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 <i>n</i> -Pr
289-304	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 <i>c</i> -Pr
305-320	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 COMe
321-336	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 COPh
337-352	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 COOMe
353-368	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 COOEt
369-384	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 SO ₂ Me
385-400	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 H; R ^E 是 SO ₂ Ph
401-416	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 Me
417-432	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 Et
433-448	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 <i>n</i> -Pr
449-464	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 <i>c</i> -Pr
465-480	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 COMe
481-496	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 COPh
497-512	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 COOMe
513-528	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 COOEt
529-544	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 SO ₂ Me
545-560	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Me; R ^E 是 SO ₂ Ph
561-576	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 Me
577-592	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 Et
593-608	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 <i>n</i> -Pr
609-624	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 <i>c</i> -Pr
625-640	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 COMe
641-656	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 COPh
657-672	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 COOMe
673-688	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 COOEt
689-704	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 SO ₂ Me
705-720	L 是 L-2; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^D 是 Et; R ^E 是 SO ₂ Ph

[0416]

721-736	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 COMe
737-752	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 COCF ₃
753-768	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 CPh
769-784	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 COOMe
785-800	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 COOEt
801-816	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 SO ₂ Me
817-832	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 SO ₂ Ph
833-848	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 PO(OH) ₂
849-864	L 是 L-3; R ^B 是 H; R ^C 是 H; R ^F 是 PO(OMe) ₂
865-880	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 COMe
881-896	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 COCF ₃
897-912	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 CPh
913-928	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 COOMe
929-944	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 COOEt
945-960	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 SO ₂ Me
961-976	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 SO ₂ Ph
977-992	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 PO(OH) ₂
993-1008	L 是 L-4; R ^B 均各自为 H; R ^C 均各自为 H; R ^G 是 PO(OMe) ₂

[0417] 本发明的化合物一般可用作组合物(即制剂)中的除草活性成分,所述组合物具有至少一种用作载体的附加组分,所述附加组分选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。选择制剂或组合物成分,以符合活性成分的物理性质、施用方式和环境因素诸如土壤类型、水分和温度。

[0418] 可用的制剂包括液体组合物和固体组合物。液体组合物包括溶液剂(包括可乳化浓缩物)、混悬剂、乳剂(包括微乳剂、水包油乳剂、可流动浓缩物和/或悬乳剂(suspoemulsion))等,它们可以任选地被增稠为凝胶。水性液体组合物的一般类型为可溶性浓缩物、混悬剂浓缩物、胶囊混悬剂、浓缩乳剂、微乳剂、水包油乳剂、可流动浓缩物和悬乳剂。非水性液体组合物的一般类型为可乳化浓缩物、可微乳化浓缩物、可分散浓缩物和油分散体。

[0419] 固体组合物的一般类型为粉尘剂、粉末、颗粒剂、丸剂、粒料(剂)、锭剂、片剂、填充膜剂(包括种子包衣)等,它们可以是水分散性的(“可润湿的”)或水溶性的。由成膜溶液剂或可流动混悬剂形成的膜和包衣特别可用于种子处理。活性成分可被(微)胶囊包封,并且进一步形成混悬剂或固体制剂;或者,可将整个活性成分制剂进行胶囊包封(或“包覆”)。包封可以控制或延迟活性成分的释放。可乳化颗粒剂结合了可乳化浓缩物制剂和干颗粒制剂这两者的优点。高浓度组合物主要用作进一步制剂的中间体。

[0420] 可喷雾制剂通常在喷雾之前分散在适宜的介质中。此类液体和固体制剂被配制在喷雾介质(通常是水),但偶尔另一种适宜的介质(如芳族烃或石蜡烃或植物油)中是易于稀释的。喷雾体积可以在每公顷约一升至几千升的范围内,但更典型地在每公顷约十升至几百升的范围内。可喷雾制剂可在罐中与水或另一种适宜的介质混合,用于通过空气或地面施用进行叶处理,或者施用到植物的生长介质。液体和干燥制剂可以直接定量加入滴灌系统中,或在种植期间定量加入垄沟中。

[0421] 所述制剂通常会包含有效量的活性成分、稀释剂和表面活性剂,其在以下大致范围内,总计为按重量计达100%。

	重量%		
	活性成分	稀释剂	表面活性剂
水分散性和水溶性颗粒剂、片剂和粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
[0422] 油分散体、混悬剂、乳剂、溶液剂(包括可乳化浓缩物)	1-50	40-99	0-50
粉尘剂	1-25	70-99	0-5
颗粒和丸剂	0.001-99	5-99.999	0-15
高浓度组合物	90-99	0-10	0-2

[0423] 固体稀释剂包括例如粘土(诸如膨润土、蒙脱土、绿坡缕石和高岭土)、石膏、纤维素、二氧化钛、氧化锌、淀粉、糊精、糖(例如乳糖、蔗糖)、二氧化硅、滑石、云母、硅藻土、脲、碳酸钙、碳酸钠和碳酸氢钠、以及硫酸钠。典型的固体稀释剂在Watkins等人,Handbook of Insecticide Dust Diluent and Carriers,第2版,Dorland Books,Caldwell,New Jersey中有所描述。

[0424] 液体稀释剂包括例如水、N,N-二甲基烷酰胺(例如,N,N-二甲基甲酰胺)、柠檬烯、二甲基亚砷、N-烷基吡咯烷酮(例如,N-甲基吡咯烷酮)、磷酸烷基酯(例如磷酸三乙酯)、乙二醇、三甘醇、丙二醇、双丙二醇、聚丙二醇、碳酸丙烯酯、碳酸丁烯酯、石蜡(例如白矿物油、正链烷烃、异链烷烃)、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯、山梨醇、芳烃、脱芳构化脂族化合物(dearomatized aliphatics)、烷基苯、烷基萘、酮(诸如环己酮、2-庚酮、异佛尔酮和4-羟基-4-甲基-2-戊酮)、乙酸酯(诸如乙酸异戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三烷基酯和乙酸异冰片酯)、其它酯(诸如烷基化乳酸酯、二元酯、苯甲酸烷基酯和苯甲酸芳基酯和 γ -丁内酯),以及可以是直链、支链、饱和或不饱和的醇(诸如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇、异丁醇、正己醇、2-乙基己醇、正辛醇、癸醇、异癸醇、异十八烷醇、鲸蜡醇、月桂醇、十三烷醇、油醇、环己醇、四氢糠醇、双丙酮醇、甲酚和苄醇)。液体稀释剂还包括饱和的和饱和的脂肪酸(通常为 C_6 - C_{22})的甘油酯,如植物种子和果实的油(例如橄榄油、蓖麻油、亚麻籽油、芝麻油、谷物(玉米)油、花生油、葵花籽油、葡萄籽油、红花油、棉籽油、大豆油、油菜籽油、椰子油和棕榈仁油)、动物源脂肪(例如牛脂、猪脂、猪油、鳕鱼肝油、鱼油)、以及它们的混合物。液体稀释剂还包括烷基化(例如甲基化、乙基化、丁基化)脂肪酸,其中脂肪酸可以通过水解来自植物和动物来源的甘油酯获得,并且可通过蒸馏进行纯化。典型的液体稀释剂在Marsden,Solvents Guide,第2版,Interscience,New York,1950中有所描述。

[0425] 本发明的固体组合物和液体组合物通常包含一种或多种表面活性剂。当添加到液体中时,表面活性剂(还被称为“表面活性物质”)通常改变,最通常降低液体的表面张力。根据表面活性剂分子中的亲水基团和亲脂基团的性质,表面活性剂可用作润湿剂、分散剂、乳化剂或消泡剂。

[0426] 表面活性剂可被归类为非离子表面活性剂、阴离子表面活性剂或阳离子表面活性剂。可用于本发明组合物的非离子表面活性剂包括但不限于:醇烷氧基化物,如基于天然醇和合成醇(其可以是支链或直链的)并且由该醇和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的

混合物制备而成的醇烷氧基化物;胺乙氧基化物、链烷醇酰胺和乙氧基化链烷醇酰胺;烷氧基化甘油三酯,如乙氧基化的大豆油、蓖麻油和油菜籽油;烷基苯酚烷氧基化物,如辛基苯酚乙氧基化物、壬基苯酚乙氧基化物、二壬基苯酚乙氧基化物和十二烷基苯酚乙氧基化物(由苯酚和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制得);由环氧乙烷或环氧丙烷制得的嵌段聚合物和其中末端嵌段由环氧丙烷制得的反式嵌段聚合物;乙氧基化脂肪酸;乙氧基化脂肪酯和油;乙氧基化甲酯;乙氧基化三苯乙烯基苯酚(包括由环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制得的那些);脂肪酸酯、甘油酯、羊毛脂系衍生物、多乙氧基化酯(如多乙氧基化脱水山梨糖醇脂肪酸酯、多乙氧基化山梨醇脂肪酸酯和多乙氧基化甘油脂肪酸酯);其它脱水山梨糖醇衍生物,如脱水山梨糖醇酯;聚合物表面活性剂,如无规共聚物、嵌段共聚物、醇酸(聚乙二醇)树脂、接枝或梳型聚合物以及星型聚合物;聚乙二醇(peg);聚乙二醇脂肪酸酯;硅酮系表面活性剂;和糖衍生物,如蔗糖酯、烷基多苷和烷基多糖。

[0427] 可用的阴离子表面活性剂包括但不限于:烷基芳基磺酸和它们的盐;羧化的醇或烷基苯酚乙氧基化物;二苯基磺酸酯衍生物;木质素和木质素衍生物,如木质素磺酸盐;马来酸或琥珀酸或它们的酸酐;烯烴磺酸酯;磷酸酯,诸如醇烷氧基化物的磷酸酯、烷基酚烷氧基化物的磷酸酯和苯乙烯基苯酚乙氧基化物的磷酸酯;蛋白质系表面活性剂;肌氨酸衍生物;苯乙烯基苯酚醚硫酸盐;油和脂肪酸的硫酸盐和磺酸盐;乙氧基化烷基酚的硫酸盐和磺酸盐;醇的硫酸盐;乙氧基化醇的硫酸盐;胺和酰胺的磺酸盐,如N,N-烷基牛磺酸盐;苯、枯烯、甲苯、二甲苯以及十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸盐;缩聚萘的磺酸盐;萘和烷基萘的磺酸盐;石油馏分的磺酸盐;磺基琥珀酰胺酸盐(sulfosuccinamates);以及磺基琥珀酸盐和它们的衍生物,如二烷基磺基琥珀酸盐。

[0428] 可用的阳离子表面活性剂包括但不限于:酰胺和乙氧基化酰胺;胺,如N-烷基丙二胺、三亚丙基三胺和二亚丙基四胺,以及乙氧基化胺、乙氧基化二胺和丙氧基化胺(由胺和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备);胺盐(如胺乙酸盐)和二胺盐;季铵盐(quaternary ammonium salts),如季铵盐(quaternary salts)、乙氧基化季铵盐和二季铵盐(diquaternary salt);以及胺氧化物,如烷基二甲基胺氧化物和双-(2-羟基乙基)-烷基胺氧化物。

[0429] 还可用于本发明组合物的是非离子表面活性剂和阴离子表面活性剂的混合物、或非离子表面活性剂和阳离子表面活性剂的混合物。非离子表面活性剂、阴离子表面活性剂和阳离子表面活性剂及其推荐应用在多个已公布的参考文献中有所公开,包括McCutcheon分部,The Manufacturer Confectioner Publishing Co.出版的McCutcheon's Emulsifiers and Detergents,北美和国际年鉴版;Sisely和Wood,Encyclopedia of Surface Active Agents,Chemical Publ.Co.,Inc.,New York,1964;以及A.S.Davidson和B.Milwidsky,Synthetic Detergents,第七版,John Wiley和Sons,New York,1987。

[0430] 本发明的组合物还可包含本领域技术人员已知为制剂辅助的制剂助剂和添加剂(其中一些也可被认为是起到固体稀释剂、液体稀释剂或表面活性剂作用的)。此类制剂助剂和添加剂可控制:pH(缓冲剂)、加工过程中的起泡(消泡剂,诸如聚有机硅氧烷)、活性成分的沉降(悬浮剂)、粘度(触变增稠剂)、容器内的微生物生长(抗微生物剂)、产品冷冻(防冻剂)、颜色(染料/颜料分散体)、洗脱(成膜剂或粘着剂)、蒸发(防蒸发剂)、以及其它制剂

属性。成膜剂包括例如聚乙酸乙烯酯、聚乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物和蜡。制剂助剂和添加剂的实例包括McCutcheon分部, The Manufacture of Confectioner Publishing Co.出版的McCutcheon的第2卷:Functional Materials,北美和国际年鉴版;以及PCT公布WO 03/024222中列出的那些。

[0431] 通常通过将活性成分溶于溶剂中或者通过在液体或干燥稀释剂中研磨活性成分将式1的化合物和任何其它活性成分掺入本发明组合物中。可通过简单地混合所述成分来制备溶液剂(包括可乳化浓缩物)。如果旨在用作可乳化浓缩物的液体组合物的溶剂是与水不混溶的,通常加入乳化剂使含有活性成分的溶剂在用水稀释时发生乳化。可使用介质研磨机来研磨粒径为至多2,000 μm 的活性成分浆液,以获得具有低于3 μm 的平均直径的颗粒。水性浆液可以制备为成品混悬剂浓缩物(参见例如U.S.3,060,084)或通过喷雾干燥而进一步加工形成水分散性的颗粒剂。干燥制剂通常需要干燥研磨工艺,其产生在2 μm 至10 μm 范围内的平均粒径。粉尘剂和粉末可以通过共混,并且通常通过研磨(如用锤磨机或流能磨)来制备。可通过将活性物质喷雾在预成形颗粒载体上或者通过附聚技术来制备颗粒剂和球剂。参见Browning的“Agglomeration”(Chemical Engineering,1967年12月4日,第147-48页)、Perry的Chemical Engineer's Handbook,第4版(McGraw-Hill,New York,1963,第8-57页及其后页)和WO 91/13546。丸剂可根据U.S.4,172,714中所述进行制备。水分散性和水溶性颗粒剂可根据U.S.4,144,050、U.S.3,920,442和DE 3,246,493中的教导来制备。片剂可根据U.S.5,180,587、U.S.5,232,701和U.S.5,208,030中的教导来制备。膜可根据GB 2,095,558和U.S.3,299,566中的教导来制备。

[0432] 关于制剂领域的进一步信息,参见T.S.Woods的Pesticide Chemistry and Bioscience,The Food-Environment Challenge中的“The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture”,T.Brooks和T.R.Roberts编辑,Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry,The Royal Society of Chemistry,Cambridge,1999,第120-133页。还参见U.S.3,235,361,第6栏,第16行至第7栏,第19行和实施例10-41;U.S.3,309,192,第5栏,第43行至第7栏,第62行和实施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167和169-182;U.S.2,891,855,第3栏,第66行至第5栏,第17行和实施例1-4;Klingman的Weed Control as a Science,John Wiley and Sons,Inc.,New York,1961,第81-96页;Hance等人的Weed Control Handbook,第8版,Blackwell Scientific Publications,Oxford,1989;以及Developments in formulation technology,PJB出版物,Richmond,UK,2000。

[0433] 在下列实施例中,所有的百分比都是按重量计的,并且所有的制剂以常规的方式制备。化合物编号参照索引表A中的化合物。无需进一步详述,相信使用上文描述的本领域技术人员可最大限度地利用本发明。因此,以下实施例应被解释为仅仅是说明性的,而不以任何方式限制本公开。除非另外说明,否则百分比按重量计。

[0434] 实施例A

[0435] 高浓度浓缩物

[0436]	化合物1	98.5%
[0437]	二氧化硅气凝胶	0.5%
[0438]	合成无定形精细二氧化硅	1.0%

[0439]	<u>实施例B</u>	
[0440]	<u>可润湿性粉末</u>	
	化合物 1	65.0%
	十二烷基苯酚聚乙二醇醚	2.0%
[0441]	木质素磺酸钠	4.0%
	硅酸铝钠	6.0%
	蒙脱土(煅烧)	23.0%
[0442]	<u>实施例C</u>	
[0443]	<u>颗粒剂</u>	
[0444]	化合物1	10.0%
[0445]	绿坡缕石颗粒剂(低挥发性物质,0.71/0.30mm;	90.0%
[0446]	U.S.S.No.25-50筛目)	
[0447]	<u>实施例D</u>	
[0448]	<u>挤出丸剂</u>	
	化合物 1	25.0%
	无水硫酸钠	10.0%
[0449]	粗制木质素磺酸钙	5.0%
	烷基萘磺酸钠	1.0%
	钙/镁膨润土	59.0%
[0450]	<u>实施例E</u>	
[0451]	<u>可乳化浓缩物</u>	
[0452]	化合物1	10.0%
	聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	20.0%
[0453]	C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%
	<u>实施例F</u>	
[0454]	<u>微乳剂</u>	
	化合物 1	5.0%
	聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
[0455]	烷基多苷	30.0%
	单油酸甘油酯	15.0%
	水	20.0%
[0456]	<u>实施例G</u>	
[0457]	<u>混悬剂浓缩物</u>	

	化合物 1	35%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸类聚合物	1.0%
[0458]	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
	硅酮系消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	水	53.7%
[0459]	<u>实施例H</u>	
[0460]	<u>水乳剂(emulsion in water)</u>	
	化合物 1	10.0%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸类聚合物	1.0%
	黄原胶	0.1%
[0461]	丙二醇	5.0%
	硅酮系消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	芳族石油系烃(aromatic petroleum based hydrocarbon)	20.0%
	水	58.7%
[0462]	<u>实施例I</u>	
[0463]	<u>油分散体</u>	
	化合物 1	25%
	聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	15%
[0464]	有机改性的膨润土粘土	2.5%
	脂肪酸甲酯	57.5%

[0465] 本公开还包括上文的实施例A至I,不同的是“化合物1”被上述“化合物2”和“化合物3”、“化合物4”、“化合物5”、“化合物6”、“化合物7”、“化合物8”或“化合物9”替换。测试结果显示,本发明的化合物是高活性出苗前和/或出苗后除草剂和/或植物生长调节剂。本发明的化合物通常对于出苗后杂草控制(即在杂草幼苗从土壤萌发后施用)与出苗前杂草控制(即在杂草幼苗从土壤萌发前施用)显示出最高活性。在期望完全控制所有植被的区域,诸如在燃料储槽、工业仓储区域、停车场、露天汽车电影院、机场、河岸、灌溉水道及其它水道、看板与高速公路及铁路结构体周围,它们中的许多对于广谱出苗前和/或出苗后杂草控制具有效用。许多本发明化合物经由下列方式而可用于选择性控制作物/杂草混生中的禾草(grass)与阔叶杂草:在作物与杂草中进行选择性代谢、或对于作物与杂草中的生理抑制位点具有选择性活性、或在作物与杂草混生的环境之上或之中进行选择性的施放。本领域技术人员会认识到,在化合物或化合物组中,这些选择性因子的优选组合可容易地通过进行常规生物和/或生化测定而确定。本发明的化合物可对重要的农业作物显示耐受性,所述农业作物包括但不限于苜蓿,大麦,棉花,小麦,油菜,糖用甜菜,玉蜀黍(玉米),高粱,大豆,稻,燕麦,花生,蔬菜,番茄,马铃薯,多年生种植作物包括咖啡豆、可可豆、油棕榈、橡胶、甘

蔗、柑橘、葡萄、果树、坚果树、香蕉、车前草、凤梨、啤酒花、茶和森林诸如桉树和针叶树(例如,火炬松)、和草皮物种(例如,肯塔基蓝草、圣奥古斯汀草、肯塔基羊茅和百慕大草)。本发明化合物可用于经基因转化或选殖的作物,以掺入除草剂抗性,表达对无脊椎动物害虫具有毒性的蛋白质(诸如苏云金芽孢杆菌毒素)和/或表达其它可用性状。本领域技术人员会知道,不是所有化合物对所有杂草均具有相同的效果。或者,本发明化合物可用于改变植物生长。

[0466] 由于本发明的化合物具有出苗前和出苗后除草活性,因此为了通过杀灭或伤害不期望的植被或减缓其生长来控制所述植被,通常通过多种方法来施用所述化合物,所述方法包括使除草有效量的本发明化合物或包含所述化合物以及表面活性剂、固体稀释剂或液体稀释剂中的至少一种的组合物接触所述不期望的植被的叶子或其它部位,或接触所述不期望的植被的环境(如所述非期望植物生长于其中的土壤或水),或所述不期望的植被的种子或其它繁殖体周围的土壤或水。不期望的植被包括选自禾本科杂草(grass weeds)和阔叶杂草中的至少一种。不期望的植被选自一年生蓝草、鸭跖草、大穗看麦娘、龙葵、阔叶信号草、加拿大蓟、早雀麦、苍耳(*Xanthium pensylvanicum*)、豚草、虞美人、田野紫罗兰(field violet)、巨型狗尾草、牛筋草、绿色狗尾草、大黍(guinea grass)、毛鬼针草、抗除草剂的大穗看麦娘、加拿大蓬、多花黑麦草、曼陀罗、假高粱(*Sorghum halepense*)、大马唐草、小子蔊草、叶牵牛(morning glory)、宾夕法尼亚苎麻、瘤梗番薯、刺黄花稔(prickly sida)、偃麦草、反枝苋、双色高粱、荠菜、silky windgrass、向日葵(如马铃薯中的杂草)、野生荞麦(*Polygonum convolvulus*)、野生芥菜(*Brassica kaber*)、野生燕麦(*Avena fatua*)、野生山毛榉(wild pointsettia)、黄色狗尾草和油莎草(*Cyperus esculentus*)。

[0467] 本发明化合物的除草有效量由多种因素决定。这些因素包括:所选择的制剂、施用方法、所存在植被的数量和种类、生长条件等。一般来讲,本发明化合物的除草有效量为约0.001kg/ha至20kg/ha,其中优选约0.004kg/ha至1kg/ha的范围。本领域技术人员可容易确定杂草控制的期望程度所需的除草有效量。

[0468] 在一个常见的实施方案中,通常以配制的组合物形式将本发明的化合物施用到包括期望植被(例如,作物)和非期望植被(即杂草)的位点,期望植被和非期望植被两者均可与生长介质(例如,土壤)接触的种子、幼苗和/或更大植物。在该位点中,包含本发明的化合物的组合物可被直接施用到植物或其部分(尤其是对于非期望的植被来说)和/或施用到与植物接触的生长介质。

[0469] 用本发明的化合物处理的位点中的期望植被的植物种类和品种可通过常规的增殖和繁殖方法或通过基因工程方法获得。经基因修饰的植物(转基因植物)为其中异源性基因(转基因)已被稳定整合进植物的基因组的那些。由其在植物基因组中的特定位置所限定的转基因被称为转化事件或转基因事件。

[0470] 位点中经基因修饰的可根据本发明处理的植株栽培品系包括抵抗一种或多种生物胁迫(害虫诸如线虫动物、昆虫、螨虫、真菌等)或非生物胁迫(干旱、低温、土壤盐化等)的那些,或含其它期望特性的那些。植物可经基因修饰以表现出性状,例如除草剂耐受性、昆虫耐受性、修饰的油特征或耐旱性。

[0471] 尽管最通常地,本发明的化合物用于控制非期望的植被,但在经处理位点中期望的植被与本发明化合物的接触可在该期望的植被中导致超加和性或基因特质的协同(增

强)效应,包括通过基因修饰导入的特质。例如,对植食性害虫或植物病害的抗性、对生物胁迫/非生物胁迫的耐受性或贮存稳定性可大于对期望植被中的基因特质所预期的。

[0472] 本发明的化合物可与一种或多种其它生物学活性化合物或药剂混合形成多组分杀虫剂,赋予甚至更广谱的农业保护作用,所述生物学活性化合物或药剂包括除草剂、除草剂安全剂、杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀菌剂、杀螨剂、生长调节剂如昆虫蜕皮抑制剂和生根刺激剂、化学不育剂、化学信息素、拒斥剂、诱虫剂、信息素、取食刺激剂、植物营养素、其它生物学活性化合物或昆虫致病细菌、病毒或真菌。本发明化合物与其它除草剂的混合物可扩大抵抗其它杂草物种的活性谱范围,并且抑制任何抗性生物类型的繁殖。因此本发明还涉及包含式1的化合物(除草有效量)和至少一种附加生物学活性化合物或药剂(生物学有效量)的组合物,并且所述组合物还可包含表面活性剂、固体稀释剂或液体稀释剂中的至少一种。所述其它生物学活性化合物或药剂可配制到包含表面活性剂、固体稀释剂或液体稀释剂中的至少一种的组合物中。对于本发明的混合物,可将一种或多种其它生物学活性化合物或药剂与式1的化合物配制在一起以形成预混物,或者可将一种或多种其它生物学活性化合物或药剂与式1的化合物分开配制,并且在施用前将制剂合并在一起(例如在喷雾罐中),或者进行依次施用。

[0473] 本发明化合物与以下除草剂中的一种或多种的混合物尤其可用于杂草控制:乙草胺、氟锁草醚及其钠盐、苯草醚、丙烯醛(2-丙烯醛)、甲草胺、禾草灭、莠灭净、氨唑草酮、啶嘧磺隆、氯丙嘧啶酸及其酯(例如,甲酯、乙酯)和盐(例如,钠盐、钾盐)、氯氨吡啶酸、杀草强、氨基磺酸铵、莎稗磷、黄草灵、莠去津、四唑嘧磺隆、氟丁酰草胺、S-氟丁酰草胺、草除灵、草除灵-乙酯、bencarbazone、氟草胺、呋草黄、苄嘧磺隆、地散磷、灭草松、双环磺草酮、吡草酮、氟吡草酮、甲羧除草醚、双丙氨膦、双草醚及其钠盐、除草定、溴丁酰草胺、溴酚肟、溴苯腈、溴苯腈辛酸酯、丁草胺、氟丙嘧草酯、抑草磷、地乐胺、丁氧环酮、丁草特(butylate)、唑草胺、长杀草、唑草酮乙酯、儿茶酸、甲氧除草醚、草灭平、氯溴隆、整形素(chlorflurenol-methyl)、氯草敏、氯嘧磺隆、绿麦隆、氯苯胺灵、氯磺隆、敌草索(chlorthal-dimethyl)、草克乐、吲哚酮草酯、环庚草醚、醚磺隆、氯酰草膦、环苯草酮、烯草酮、炔草酯、广灭灵、氯甲酰草胺、二氯吡啶酸、二氯吡啶酸-乙醇胺(clopyralid-olamine)、氯酯磺草胺、苄草隆、氰草津、环草敌、cyclopyranil、cyclopyrimorate、环丙嘧磺隆、噻草酮、氰氟草酯、2,4-D(及其丁氧基乙酯(butotyl)、丁酯、异辛酯(isooctyl)和异丙酯及其二甲基铵盐、二乙醇胺盐和三乙醇胺盐)、杀草隆、茅草枯(dalapon)、茅草枯-钠(dalapon-sodium)、棉隆、2,4-DB(及其二甲基铵盐、钾盐和钠盐)、甜菜安、敌草净、麦草畏(及其二甘醇铵盐、二甲基铵盐、钾盐和钠盐)、敌草腈、2,4-滴丙酸、禾草灵-甲酯、双氯磺草胺、野燕枯甲硫酸盐(difenzoquat metilsulfate)、吡氟酰草胺、氟吡草胺、噁唑隆、哌草丹、二甲草胺、异戊乙净、二甲酚草胺、精二甲酚草胺(dimethenamid-P)、噁节因、二甲基次膦酸及其钠盐、敌乐胺、特乐酚、草乃敌、二溴敌草快、氟硫草定、敌草隆、DNOC、茵多酸、EPTC、戊草丹、乙丁烯氟灵、胺苯磺隆、乙噻草酮、甜菜呋、氯氟草醚、乙氧嘧磺隆、乙氧苯草胺、噁唑禾草灵-乙酯、精噁唑禾草灵-乙酯、fenoxasulfone、fenquinotrione、四唑酰草胺、非草隆、非草隆-TCA、麦草氟-甲酯(flamprop-methyl)、麦草氟-M-异丙酯(flamprop-M-isopropyl)、麦草氟-M-甲酯(flamprop-M-methyl)、啶嘧磺隆、双氟磺草胺、吡氟禾草灵-丁酯(flauzifop-butyl)、精吡氟禾草灵-丁酯(flauzifop-P-butyl)、异丙吡草酯、氟酮磺隆、氟吡磺隆、氟消草、氟噻草

胺、氟吡啶草酯、氟吡啶草酯-乙酯、唑嘧磺草胺、氟烯草酸、丙炔氟草胺、伏草隆、乙羧氟草醚、氟胺草唑、氟啶嘧磺隆及其钠盐、抑草丁、抑草丁-丁酯(flurenol-butyl)、氟啶草酮、氟咯草酮、氯氟吡氧乙酸、呋草酮、噻草酸甲酯、氟磺胺草醚、甲酰氨基嘧磺隆、调节膦、草胺膦、草铵膦、精草胺膦、草甘膦及其盐(诸如铵盐、异丙基铵盐、钾盐、钠盐(包括倍半钠盐)和三甲基铈盐(或者命名为草硫膦))、氟氯吡啶酯、氟氯吡啶甲酯、氯吡嘧磺隆、氟吡乙禾灵(haloxypop-etotyl)、氟吡甲禾灵(haloxypop-methyl)、环嗪酮、hydantocidin、咪草酸、甲氧咪草烟、甲咪唑烟酸、灭草烟、咪唑喹啉酸、咪唑喹啉酸-铵(imazaquin-ammonium)、咪唑乙烟酸、咪唑乙烟酸-铵(imazethapyr-ammonium)、唑嘧磺隆、茚草酮、三嗪茚草胺、iofensulfuron、甲基碘磺隆、碘苯腈、碘苯腈辛酸酯、碘苯腈-钠(ioxynil-sodium)、三唑啉草胺、异丙隆、异噁隆、异噁啉草胺、异噁啉草酮、异噁氯草酮、乳氟禾草灵、环草定、利谷隆、马来酰肼、MCPA(及其盐(例如,MCPA-二甲基铵、MCPA-钾和MCPA-钠)、酯(例如,MCPA-2-乙基己酯、MCPA-2-甲-4-氯丁氧基乙酯(MCPA-butotyl))和硫酯(例如,MCPA-硫代乙酯))、MCPB及其盐(例如,MCPB-钠)和酯(例如,MCPB-乙酯)、2-甲-4-氯丙酸、精2-甲-4-氯丙酸(mecoprop-P)、苯噻草胺、氟磺草胺、甲基二磺隆、硝磺草酮、威百亩-钠(metamsodium)、噁唑草胺、苯噻草酮、吡草胺、噻嘧磺隆、甲基苯噻隆、甲基肿酸(及其钙盐、单铵盐、单钠盐和二钠盐)、甲基杀草隆、吡喃隆、秀谷隆、异丙甲草胺、精异丙甲草胺、磺草唑胺、甲氧隆、噻草酮、甲磺隆、禾草特、绿谷隆、萘丙胺、敌草胺、敌草胺-M、抑草生、草不隆、烟嘧磺隆、达草灭、坪草丹、噻苯胺磺隆、氨磺乐灵、丙炔噁草酮、噁草酮、环氧嘧磺隆、恶噻草酮、乙氧氟草醚、百草枯二氯化物、克草猛、壬酸、二甲戊乐灵、五氟磺草胺、甲氯酰草胺、环戊噁草酮、黄草伏、烯草胺、烯草胺、苯敌草、毒莠定、毒莠定-钾(picloram-potassium)、氟吡啶草胺、唑啉草酯、哌草磷、丙草胺、氟嘧磺隆、氨氟乐灵、氯苯噻草酮、扑灭通、扑草净、毒草胺、敌稗、啶草酯、扑灭津、苯胺灵、异丙草胺、丙苯磺隆、丙噻嘧磺隆、戊炔草胺、苄草丹、氟磺隆、双唑草腈、吡草醚、磺酰草吡啶、双唑草腈、吡啶特、苄草唑、吡嘧磺隆、嘧啶肟草醚、稗草畏、吡草特、环酯草醚、嘧草醚、吡丙醚、嘧硫草醚、嘧草硫醚、罗克杀草砒、甲氧磺草胺、快杀稗、氯甲喹啉酸、灭藻醌、喹禾灵-乙酯(quizalofop-ethyl)、精喹禾灵-乙酯(quizalofop-P-ethyl)、糖草酯(quizalofop-P-tefuryl)、砒嘧磺隆、苯嘧磺草胺、稀禾定、环草隆、西玛津、西草净、磺草酮、甲磺草胺、甲嘧磺隆、磺酰磺隆、2,3,6-TBA、TCA、TCA-钠、牧草胺、丁噻隆、特呋三酮、环磺酮、吡喃草酮、特草定、特丁通、特丁净、去草净、甲氧噻草胺、噻唑烟酸、噻酮磺隆、噻吩磺隆、禾草丹、tiafenacil、仲草丹、tolpyralate、苯吡啶草酮、肟草酮、野麦畏、氟酮磺草胺、醚苯磺隆、三嗪氟草胺、苯磺隆、绿草定、三氯吡氧乙酸丁氧基乙酯(triclopyr-butotyl)、绿草定-三乙铵(triclopyr-triethylammonium)、灭草环、草达津、三氟啶磺隆、trifludimoxazin、氟乐灵、氟胺磺隆、三氟甲磺隆、灭草猛、3-(2-氯-3,6-二氟苯基)-4-羟基-1-甲基-1,5-萘啶-2(1H)-酮、5-氯-3-[(2-羟基-6-氧代-1-环己烯-1-基)羰基]-1-(4-甲氧基苯基)-2(1H)-喹啉酮、2-氯-N-(1-甲基-1H-四唑-5-基)-6-(三氟甲基)-3-吡啶甲酰胺、7-(3,5-二氯代-4-吡啶基)-5-(2,2-二氟乙基)-8-羟基吡啶并[2,3-b]吡嗪-6(5H)-酮、4-(2,6-二乙基-4-甲基苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-3(2H)-噻嗪酮、5-[[[(2,6-二氟苯基)甲氧基]甲基]-4,5-二氢-5-甲基-3-(3-甲基-2-噻吩基)异噁唑(先前为methioxolin)、4-(4-氟苯基)-6-[(2-羟基-6-氧代-1-环己烯-1-基)羰基]-2-甲基-1,2,4-三嗪-3,5(2H,4H)-二酮、4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲氧基苯基)-5-氟代-

2-吡啶羧酸甲酯、2-甲基-3-(甲基磺酰基)-N-(1-甲基-1H-四唑-5-基)-4-(三氟甲基)苯甲酰胺和2-甲基-N-(4-甲基-1,2,5-噁二唑-3-基)-3-(甲基亚磺酰基)-4-(三氟甲基)苯甲酰胺。其它除草剂还包括生物除草剂,诸如损毁链格孢(*Alternaria destruens* Simmons)、刺盘孢炭疽菌(*Colletotrichum gloeosporioides* (Penz.) Penz.&Sacc.)、稗内脐蠕孢菌(*Drechslera monoceras*) (MTB-951)、疣孢漆斑菌(*Myrothecium verrucaria* (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries)、棕榈疫霉(*Phytophthora palmivora* (Butl.) Butl.)和*Puccinia thlaspeos* Schub.

[0474] 优选用于更好地控制不期望的植被(例如,较低的使用率(例如是由于大于加和效应(greater-than-additive effects)而导致的)、较宽的杂草控制范围或增强的作物安全性)或用于防止产生抗性杂草的是本发明化合物与选自以下的除草剂的混合物:莠去津、四唑嘧磺隆、氟丁酰草胺、S-氟丁酰草胺F4050、苯并异噁唑啉酮、唑草酮乙酯、氯嘧磺隆、氯磺隆-甲酯(chlorsulfuron-methyl)、异噁草酮、二氯吡啶酸-钾(clopyralid potassium)、氯酯磺草胺、2-[(2,5-(二氯苯基)甲基]-4,4-二甲基-3-异噁唑烷酮F9600、胺苯磺隆、唑嘧磺草胺、4-(4-氟苯基)-6-[(2-羟基-6-氧代-1-环己烯-1-基)羰基]-2-甲基-1,2,4-三嗪-3,5-(2H,4H)-二酮F9960、氟啶嘧磺隆、噻草酸甲酯、氟磺胺草醚、咪草烟、环草定、硝磺草酮、噻草酮、胺苯磺隆、烯草胺、毒莠定、罗克杀草砒、二氯喹啉酸、砒嘧磺隆、精异丙甲草胺、甲磺草胺、噻吩磺隆、氟胺磺隆和苯磺隆。

[0475] 本发明的化合物还可与植物生长调节剂以及植物生长调节生物体结合使用,所述植物生长调节剂诸如艾维激素(aviglycine)、N-(苯基甲基)-1H-嘌呤-6-胺、丙酰芸苔素内酯(epocholeone)、赤霉素、赤霉素A₄和A₇、超敏蛋白(harpin protein)、甲哌鎗(mepiquat chloride)、调环酸钙、茉莉酮(prohydrojasmon)、硝酚钠(sodium硝基phenolate)和甲基抗倒酯(trinexapac-methyl),所述植物生长调节生物体诸如蜡状芽孢杆菌(*Bacillus cereus*)菌株BP01。

[0476] 农用保护剂(即除草剂、除草剂安全剂、杀昆虫剂、杀真菌剂、杀线虫剂、杀螨剂和生物药剂)的一般参考文献包括The Pesticide Manual,第13版,C.D.S.Tomlin编辑,British Crop Protection Council,Farnham,Surrey,U.K.,2003和The BioPesticide Manual,第2版,L.G.Copping编辑,British Crop Protection Council,Farnham,Surrey,U.K.,2001。

[0477] 对于使用这些各种混合组分(mixing partner)中的一种或多种的实施方案,通常以类似于当单独使用混合组分时的惯用量的量使用该混合组分。更特别地,在混合物中,通常以在单独使用活性成分的产品标签上指定的一半至全量施用率之间的施用率施用活性成分。这些量在参考文献中列出,例如The Pesticide Manual和The BioPesticide Manual。这些不同混合组分(总量)与式1的化合物的重量比通常为约1:3000至约3000:1。值得注意的是约1:300至约300:1的重量比(例如约1:30至约30:1的比率)。本领域技术人员可容易地通过简单的实验来确定获得所期望的生物活性谱所需要的活性成分的生物学有效量。显然,包含这些附加组分可使杂草控制谱超越式1的化合物本身所控制的范围。

[0478] 在某些情况下,本发明化合物与其它生物活性(尤其是除草)化合物或药剂(即活性成分)的组合对于杂草可获得大于加和(即协同(增强))的效应,和/或对于作物或其它期望植物可获得小于加和(即安全化)的效应。降低活性成分在环境中的释放量同时确保有效

的害虫控制一直是人们所期望的。使用较大量活性成分以提供更有效的杂草控制而不会造成过度作物伤害的能力也是令人期望的。当除草活性成分以获得农艺上令人满意的杂草控制程度的施用率对杂草产生协同作用(增强效应)时,此类组合可有利地用于降低农作物生产成本并且减少环境负荷。当除草活性成分的安全化发生于作物上时,此类组合可有利地用于通过减少杂草竞争而提高作物保护。

[0479] 值得注意的是本发明的化合物与至少一种其它除草活性成分的组合。特别值得注意的是其中其它除草活性成分具有与本发明化合物不同的作用位点的此类组合。在某些情况下,与至少一种具有类似控制范围但是不同作用位点的其它除草活性成分的组合会尤其有利于抗性管理。因此,本发明的组合物还可包含具有类似控制范围但不同作用位点的(除草有效量的)至少一种附加的除草活性成分。

[0480] 本发明的化合物还可与除草剂安全剂组合使用以增加对某些作物的安全性,所述除草剂安全剂诸如二丙烯草胺、解草酮、解草酯(cloquintocet-mexyl)、苄草隆、解草胺腈、啶酰菌胺、杀草隆、二氯丙烯胺、dicyclonon、增效磷、哌草丹、解草唑、解草啉、解草安、氟草肟、解草噁唑、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、4-氯苯基甲基氨基甲酸酯、苯草酮、萘二甲酸酐(1,8-萘二甲酸酐)、解草腈、N-(氨基羰基)-2-甲基苯磺酰胺、N-(氨基羰基)-2-氟苯磺酰胺、1-溴-4-[(氯甲基)磺酰基]苯(BCS)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-偶氮螺[4.5]癸烷(MON 4660)、2-(二氯甲基)-2-甲基-1,3-二氧戊环(MG 191)、1,6-二氢-1-(2-甲氧基苯基)-6-氧代-2-苯基-5-噻啉羧酸乙酯、2-羟基-N,N-二甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3-甲酰胺、3-氧代-1-环己烯-1-基1-(3,4-二甲基苯基)-1,6-二氢-6-氧代-2-苯基-5-噻啉羧酸酯、2,2-二氯-1-(2,2,5-三甲基-3-噁唑烷基)-乙酮和2-甲氧基-N-[[4-[[[(甲基氨基)羰基]氨基]苯基]磺酰基]-苯甲酰胺。解毒有效量的除草剂安全剂可与本发明的化合物同时施用,或作为种子处理物施用。因此,本发明的一个方面涉及除草剂混合物,所述混合物包含本发明化合物和解毒有效量的除草剂安全剂。种子处理物对于选择性杂草控制尤为有用,因为它将解毒作用物理地限制在作物植物上。因此,尤其有用的本发明的实施方案为选择性控制作物中不期望的植被生长的方法,所述方法包括使所述作物的所在地与除草有效量的本发明化合物接触,其中所述作物自其长成的种子用解毒有效量的安全剂处理。安全剂的解毒有效量可容易地由本领域技术人员通过简单的实验确定。

[0481] 本发明的化合物还可以与以下物质混合:(1)多核苷酸,包括但不限于通过下调、干扰、抑制或沉默产生除草效应的遗传衍生的转录本来影响特定靶标的量的DNA、RNA和/或化学修饰的核苷酸;(2)多核苷酸,包括但不限于通过下调、干扰、抑制或沉默产生安全效应的遗传衍生转录本来影响特定靶标的量的DNA、RNA和/或化学修饰的核苷酸。

[0482] 值得注意的是包含以下物质的组合物:(除草有效量的)本发明化合物、(有效量的)至少一种选自其它除草剂和除草剂安全剂的附加活性成分、以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的组分。

[0483] 表A1列出了组分(a)与组分(b)的具体组合,例证了本发明的混合物、组合物和方法。组分(a)栏中的化合物1(即,“Cmpd.No.”表示“化合物号”)标示于索引表A中。表A1的第二栏列出具体的组分(b)化合物(例如第一行中的“2,4-D”)。表A1的第三栏、第四栏和第五栏列出了通常在将组分(a)化合物施用于田间生长作物时,相对于组分(b)的重量比范围(即(a):(b))。因此,例如,表A1第一行具体公开了组分(a)(即索引表A中的化合物1)与2,4-D的

组合通常以1:192-6:1的重量比施用。表A1的其余行以类似方式解释。

[0484] 表A1

组分(a) (Cmpd. No.)	组分(b)	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
1	2,4-D	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	乙草胺	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	三氟羧草醚	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	苯草醚	1:857 – 2:1	1:285 – 1:3	1:107 – 1:12
1	甲草胺	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	莠灭净	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6

[0486]

组分(a) (Cmpd. No.)	组分(b)	典型的重量比	更典型的 重量比	最典型的重 量比
1	氨唑草酮	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	酰嘧磺隆	1:6 – 168:1	1:2 – 56:1	1:1 – 11:1
1	氯丙嘧啶酸	1:48 – 24:1	1:16 – 8:1	1:6 – 2:1
1	氯氮吡啶酸	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	杀草强	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	莎稗磷	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	黄草灵	1:960 – 2:1	1:320 – 1:3	1:120 – 1:14
1	莠去津	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	四唑嘧磺隆	1:6 – 168:1	1:2 – 56:1	1:1 – 11:1
1	氟丁酰草胺	1:342 – 4:1	1:114 – 2:1	1:42 – 1:5
1	S-氟丁酰草胺	1:171 – 4:0.5	1:57 – 2:0.5	1:21 – 1:2.5
1	吡草黄	1:617 – 2:1	1:205 – 1:2	1:77 – 1:9
1	苄嘧磺隆	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	灭草松	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	双环磺草酮	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	吡草酮	1:257 – 5:1	1:85 – 2:1	1:32 – 1:4
1	氟吡草酮	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	甲羧除草醚	1:257 – 5:1	1:85 – 2:1	1:32 – 1:4
1	双草醚	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	除草定	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	溴丁酰草胺	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	溴苯腈	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	丁草胺	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	氟丙嘧草酯	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	丁草特	1:1542 – 1:2	1:514 – 1:5	1:192 – 1:22
1	苯酮唑(Carfenstrole)	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	唑草酮乙酯	1:128 – 9:1	1:42 – 3:1	1:16 – 1:2
1	氯嘧磺隆	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	绿麦隆	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	氯磺隆	1:6 – 168:1	1:2 – 56:1	1:1 – 11:1
1	醚磺隆	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	吡啶酮草酯	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	环庚草醚	1:34 – 34:1	1:11 – 12:1	1:4 – 3:1
1	氯酰草腈	1:34 – 34:1	1:11 – 12:1	1:4 – 3:1
1	烯草酮	1:48 – 24:1	1:16 – 8:1	1:6 – 2:1
1	炔草酯	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	异噁草酮	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	氯甲酰草胺	1:171 – 7:1	1:57 – 3:1	1:21 – 1:3
1	二氯吡啶酸	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	氯酯磺草胺	1:12 – 96:1	1:4 – 32:1	1:1 – 6:1
1	苄草隆	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	氟草津	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6

[0487]

组分(a) (Cmpd. No.)	组分(b)	典型的重量比	更典型的 重量比	最典型的重 量比
1	Cyclopyrimorate	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	环丙嘧磺隆	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	噻草酮	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	氟氟草酯	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	杀草隆	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	甜菜安	1:322 – 4:1	1:107 – 2:1	1:40 – 1:5
1	麦草畏	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	敌草腈	1:1371 – 1:2	1:457 – 1:4	1:171 – 1:20
1	滴丙酸	1:925 – 2:1	1:308 – 1:3	1:115 – 1:13
1	禾草灵-甲酯	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	双氟磺草胺	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	野燕枯	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	吡氟酰草胺	1:857 – 2:1	1:285 – 1:3	1:107 – 1:12
1	氟吡草胺	1:12 – 96:1	1:4 – 32:1	1:1 – 6:1
1	二甲草胺	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	异戊乙净	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	精二甲酚草胺	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	氟硫草定	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	敌草隆	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	EPTC	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	戊草丹	1:1371 – 1:2	1:457 – 1:4	1:171 – 1:20
1	乙丁烯氟灵	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	胺苯磺隆	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	氟氟草醚	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	乙氧嘧磺隆	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	乙氧苯草胺	1:257 – 5:1	1:85 – 2:1	1:32 – 1:4
1	噁唑禾草灵	1:120 – 10:1	1:40 – 4:1	1:15 – 1:2
1	Fenoxasulfone	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	Fenquinotrione	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	四唑酰草胺	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	啶嘧磺隆	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	双氟磺草胺	1:2 – 420:1	1:1 – 140:1	2:1 – 27:1
1	吡氟禾草灵	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	氟酮磺隆	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	氟吡磺隆	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	氟噻草胺	1:257 – 5:1	1:85 – 2:1	1:32 – 1:4
1	唑嘧磺草胺	1:24 – 48:1	1:8 – 16:1	1:3 – 3:1
1	氟烯草酸	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	丙炔氟草胺	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	伏草隆	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	氟啶嘧磺隆	1:3 – 336:1	1:1 – 112:1	2:1 – 21:1
1	氟啶草酮	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6

[0488]

组分(a) (Cmpd. No.)	组分(b)	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
1	氯氟吡氧乙酸	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	唑草酮	1:857 – 2:1	1:285 – 1:3	1:107 – 1:12
1	噻草酸甲酯	1:48 – 42:1	1:16 – 14:1	1:3 – 3:1
1	氟磺胺草醚	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	甲酰氨基密磺隆	1:13 – 84:1	1:4 – 28:1	1:1 – 6:1
1	草胺磷	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	草甘膦	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	氯吡嘧磺隆	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	氟氯吡啶酯	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	氟氯吡啶甲酯	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	氟吡甲禾灵	1:34 – 34:1	1:11 – 12:1	1:4 – 3:1
1	环噻酮	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	Hydantocidin	1:1100 – 16:1	1:385 – 8:1	1:144 – 4:1
1	甲氧咪草烟	1:13 – 84:1	1:4 – 28:1	1:1 – 6:1
1	甲咪唑烟酸	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	灭草烟	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	咪唑喹啉酸	1:34 – 34:1	1:11 – 12:1	1:4 – 3:1
1	咪草酸	1:171 – 7:1	1:57 – 3:1	1:21 – 1:3
1	咪草烟	1:24 – 48:1	1:8 – 16:1	1:3 – 3:1
1	唑吡嘧磺隆	1:27 – 42:1	1:9 – 14:1	1:3 – 3:1
1	茚草酮	1:342 – 4:1	1:114 – 2:1	1:42 – 1:5
1	三嗪茚草胺	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	甲基碘磺隆	1:3 – 336:1	1:1 – 112:1	2:1 – 21:1
1	碘苯腈	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	三唑酰草胺	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	异丙隆	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	异噁酰草胺	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	异噁唑草酮	1:60 – 20:1	1:20 – 7:1	1:7 – 2:1
1	乳氟禾草灵	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	环草定	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	利谷隆	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	MCPA	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	MCPB	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	2-甲-4-氯丙酸	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	苯噻酰草胺	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	氟磺酰草胺	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	甲基二磺隆	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1
1	甲基磺草酮	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	噁唑酰草胺	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	吡草胺	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	噻吡嘧磺隆	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	甲基苯噻隆	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11

[0489]

组分(a) (Cmpd. No.)	组分(b)	典型的重量比	更典型的 重量比	最典型的重 量比
1	异丙甲草胺	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	磺草唑胺	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	噻草酮	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	甲磺隆	1:2 – 560:1	1:1 – 187:1	3:1 – 35:1
1	禾草特	1:1028 – 2:1	1:342 – 1:3	1:128 – 1:15
1	敌草胺	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	敌草胺-M	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	荼草胺	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	烟嘧磺隆	1:12 – 96:1	1:4 – 32:1	1:1 – 6:1
1	达草灭	1:1152 – 1:1	1:384 – 1:3	1:144 – 1:16
1	坪草丹	1:1371 – 1:2	1:457 – 1:4	1:171 – 1:20
1	噻苯胺磺隆	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	氟磺乐灵	1:514 – 3:1	1:171 – 1:2	1:64 – 1:8
1	炔噁草酮	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	噁草酮	1:548 – 3:1	1:182 – 1:2	1:68 – 1:8
1	环氧噻磺隆	1:27 – 42:1	1:9 – 14:1	1:3 – 3:1
1	噁嗪草酮	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	乙氧氟草醚	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	百草枯	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	二甲戊乐灵	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	五氟磺草胺	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	烯草胺	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	环戊噁草酮	1:102 – 12:1	1:34 – 4:1	1:12 – 1:2
1	苯敌草	1:102 – 12:1	1:34 – 4:1	1:12 – 1:2
1	毒莠定	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	氟吡啶草胺	1:34 – 34:1	1:11 – 12:1	1:4 – 3:1
1	唑啉草酯	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	丙草胺	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	氟噻磺隆	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	氟氟乐灵	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	环苯草酮	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	扑草净	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	毒草胺	1:1152 – 1:1	1:384 – 1:3	1:144 – 1:16
1	敌稗	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	噁草酯	1:48 – 24:1	1:16 – 8:1	1:6 – 2:1
1	丙苯磺隆	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	丙噻噻磺隆	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	戊炔草胺	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	苄草丹	1:1200 – 1:2	1:400 – 1:4	1:150 – 1:17
1	氟磺隆	1:6 – 168:1	1:2 – 56:1	1:1 – 11:1
1	双唑草腈	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	吡草醚	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1

[0490]

组分(a) (Cmpd. No.)	组分(b)	典型的重量比	更典型的重量比	最典型的重量比
1	磺酰草吡唑	1:13 – 84:1	1:4 – 28:1	1:1 – 6:1
1	吡唑特	1:857 – 2:1	1:285 – 1:3	1:107 – 1:12
1	吡啶磺隆	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	苄草唑	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1
1	嘧啶脲草醚	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	稗草畏	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	达草特	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	环酯草醚	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	嘧草醚	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	吡丙醚	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	嘧草硫醚	1:24 – 48:1	1:8 – 16:1	1:3 – 3:1
1	罗克杀草砒	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	甲氧磺草胺	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1
1	二氯喹啉酸	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	喹禾灵	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	砒嘧磺隆	1:13 – 84:1	1:4 – 28:1	1:1 – 6:1
1	嘧啶脲草醚	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	稀禾定	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	西玛津	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	磺草酮	1:120 – 10:1	1:40 – 4:1	1:15 – 1:2
1	甲磺草胺	1:147 – 8:1	1:49 – 3:1	1:18 – 1:3
1	甲嘧磺隆	1:34 – 34:1	1:11 – 12:1	1:4 – 3:1
1	磺酰磺隆	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	丁噻隆	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	特啖三酮	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	环磺酮	1:31 – 37:1	1:10 – 13:1	1:3 – 3:1
1	得杀草	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	特草定	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	特丁净	1:857 – 2:1	1:285 – 1:3	1:107 – 1:12
1	去草净	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	甲氧噻草胺	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	噻唑烟酸	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	噻酮磺隆	1:3 – 336:1	1:1 – 112:1	2:1 – 21:1
1	噻吩磺隆	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1
1	Tiafenacil	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	禾草丹	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	Tolpyralate	1:31 – 37:1	1:10 – 13:1	1:3 – 3:1
1	苯吡唑草酮	1:6 – 168:1	1:2 – 56:1	1:1 – 11:1
1	脲草酮	1:68 – 17:1	1:22 – 6:1	1:8 – 2:1
1	氟酮磺草胺	1:2 – 420:1	1:1 – 140:1	2:1 – 27:1
1	野麦畏	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	醚苯磺隆	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1

[0491]	<u>组分(a)</u> (Cmpd. No.)	<u>组分(b)</u>	<u>典型的重量比</u>	<u>更典型的重量比</u>	<u>最典型的重量比</u>
	1	三嗪氟草胺	1:171 – 7:1	1:57 – 3:1	1:21 – 1:3
	1	苯磺隆	1:3 – 336:1	1:1 – 112:1	2:1 – 21:1
	1	绿草定	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
	1	三氟啶磺隆	1:2 – 420:1	1:1 – 140:1	2:1 – 27:1
	1	Trifludimoxazin	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
	1	氟乐灵	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
	1	氟胺磺隆	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
	1	三氟甲磺隆	1:13 – 84:1	1:4 – 28:1	1:1 – 6:1

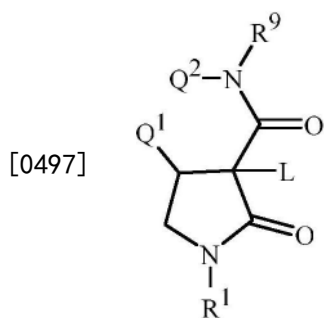
[0492] 表A2的构造如同上表A1,不同的是“组分(a)”栏标题下面的条目被下文所示的相应组分(a)的栏条目替代。组分(a)栏中的化合物2标示于索引表A中。因此,例如,表A2中“组分(a)”栏标题下面的条目全部涉及“化合物2”(即索引表A中所标示的化合物2),并且表A2中栏标题下方的第一行具体公开了化合物2与2,4-D的混合物。表A3-A11具有类似的构造。

<u>表序号</u>	<u>组分(a)栏条目</u>
A2	化合物 2
A3	化合物 3
A4	化合物 4
[0493] A5	化合物 5
A6	化合物 6
A7	化合物 7
A8	化合物 8
A9	化合物 9

[0494] 优选用于更好地控制不期望的植被(例如,较低的使用率(例如是由于协同作用(增强效应)而导致的)、较宽的杂草控制范围或增强的作物安全性)或用于防止产生抗性杂草的是本发明的式1化合物与选自以下的除草剂的混合物:氯嘧磺隆、烟嘧磺隆、甲基磺草酮、噻吩磺隆、氟啶嘧磺隆、苯磺隆、罗克杀草砒、唑啉草酯、环磺酮、甲氧磺草胺、异丙甲草胺和精异丙甲草胺。

[0495] 以下测试表明本发明的化合物对于特定杂草的控制功效。然而,由所述化合物提供的杂草控制作用不限于这些物种。化合物的描述参见索引表A。以下缩写用于以下索引表中。缩写“Cmpd.No.”表示“化合物号”。缩写“Ex.”表示“实施例”,并且跟随有数字,表示其中制备所述化合物的实施例。质谱数据记录为通过使用大气压化学电离法(AP+)观察到的通过向分子中添加H⁺(分子量为1)而形成的最高同位素丰度母离子(M+1)的分子量,估计精度在±0.5Da之内(AP+)。

[0496] 索引表A



Cmpd. No.	Q ¹	Q ²	L	R ⁹	L
1 (Ex. 3)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-1	H	R ^A = CH ₃
2 (Ex. 2)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-3	H	R ^B , R ^C = H; R ^F = C(=O)CH ₃
3	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-1		-C(=O)C(CH ₃) ₂ C(=O)-
4 (Ex. 1) (顺式)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-3	H	R ^B , R ^C = H; R ^F = H
5 (Ex. 1) (反式)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-3	H	R ^B , R ^C = H; R ^F = H
6 (反式)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-3	H	R ^B , R ^C = H; R ^F = C(=O)(CH ₂) ₃ C(=O)OH
7	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-1	H	R ^A = N(H)CH ₂ CH ₃
8	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-1	H	R ^A = N(H)CH(CH ₃) ₂
9	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	L-2	H	R ^B , R ^C = H; R ^D = CH ₃ ; R ^E is CH ₃

[0499] 索引表B

Cmpd. No.	Mass (M+)
1	*
2	*
3	495 (M+1)
4	429 (M+1)
5	429 (M+1)
6	529 (M+1)
7	470 (M+1)
8	484 (M+1)
9	454 (M-1)

[0501] *¹H NMR数据参见合成例

[0502] 本发明的生物学实施例

[0503] 测试A

[0504] 将选自稗草 (*Echinochloa crus-galli*)、地肤 (*Kochia scoparia*)、豚草 (猪草, *Ambrosia elatior*)、黑麦草、多花黑麦草 (意大利黑麦草, *Lolium multiflorum*)、狐尾草、狗尾草 (绿狐尾, *Setaria viridis*) 和反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) 的植物物种的种子种植到壤土和沙的共混物中, 并在出苗前用定向土壤喷雾处理, 所述定向土壤喷雾使用在包含表面活性剂的无植物毒性的溶剂混合物中配制的测试化学品。

[0505] 同时, 将选自这些杂草物种以及小麦 (*Triticum aestivum*)、玉米 (*Zea mays*)、大穗看麦娘 (*Alopecurus myosuroides*) 和猪殃殃 (catchweed bedstraw, *Galium aparine*) 的植物种植于包含相同的壤土和砂的共混物的盆中, 并且用以相同方式配制的测试化学品来进行出苗后施用处理。使用高度范围在2cm至10cm并且在一叶至二叶阶段的植物来进行出

苗后处理。使经处理的植物与未经处理的对照物在温室中保持约10天,之后将所有经处理的植物与未经处理的对照物比较,并且目视评估损伤。总结于表A中的植株响应评分基于0至100标度,其中0为无效果,而100为完全控制。破折号(-)响应表示无测试结果。

表 A		化合物								
125 g ai/ha		1	2	3	4	5	6	7	8	9
出苗后										
[0506]	稗草	90	50	70	60	80	50	10	0	90
	大穗看麦娘	50	10	30	40	30	0	0	0	60
	玉米	80	40	80	50	60	0	0	0	50
	绿狐尾	90	70	60	60	80	20	20	0	90
	猪殃殃	60	40	50	40	40	0	30	0	60
	地肤	70	40	60	60	70	0	0	0	70
	反枝苋	80	40	60	70	50	0	30	0	80
	豚草	40	40	40	0	40	0	0	0	30
	意大利黑麦草	80	50	50	50	50	40	10	0	60
	小麦	50	20	40	20	30	10	0	0	60
表 A		化合物								
31 g ai/ha		1	2	3	4	5	6	7	8	9
出苗后										
[0507]	稗草	70	0	40	0	30	0	0	0	70
	大穗看麦娘	0	0	20	0	0	0	0	0	50
	玉米	20	0	10	0	0	0	0	0	40
	绿狐尾	50	20	0	10	30	0	0	0	50
	猪殃殃	50	0	40	20	40	0	0	0	60
[0508]	地肤	20	0	0	0	30	0	0	0	50
	反枝苋	30	20	40	30	30	0	10	0	30
	豚草	0	0	0	0	0	0	0	0	30
	意大利黑麦草	60	20	40	0	20	0	0	0	50
	小麦	20	0	0	0	0	0	0	0	30
表 A		化合物								
125 g ai/ha		1	2	3	4	5	6	7	8	9
出苗前										
[0509]	稗草	90	80	90	90	90	50	70	0	90
	绿狐尾	90	90	90	90	90	80	80	0	90
	地肤	80	50	50	40	60	0	0	0	70
	反枝苋	90	80	100	90	60	0	10	0	80
	豚草	70	30	20	0	60	0	0	0	60
	意大利黑麦草	60	10	40	50	80	30	0	0	80

表 A		化合物								
31 g ai/ha		1	2	3	4	5	6	7	8	9
出苗前										
[0510]	稗草	80	50	80	30	80	10	0	0	90
	绿狐尾	90	60	90	50	70	30	0	0	90
	地肤	40	20	0	0	0	0	0	0	30
	反枝苋	50	20	20	0	0	0	0	0	70
	豚草	20	0	0	0	0	0	0	0	0
	意大利黑麦草	30	0	20	0	10	0	0	0	60

[0511] 测试B

[0512] 在淹水稻田测试中使选自稻 (*Oryza sativa*)、异型莎草 (*small-flower umbrella sedge*, *Cyperus difformis*)、沼生异蕊花 (*Heteranthera limosa*) 和稗草 (*Echinochloa crus-galli*) 的植物物种生长至2叶阶段以供测试。在处理时,将测试盆注水至距土壤表面上方3cm,通过向田水直接施用测试化合物来处理,然后在测试期间保持该水深。将经处理的植株和对照物在温室中保持13天至15天,之后将所有物种与对照物进行比较,并且视觉评估。总结于表B中的植株响应评分基于0至100标度,其中0为无效果,而100为完全控制。破折号(-)响应表示无测试结果。

表 B		化合物								
250 g ai/ha		1	2	3	4	5	6	7	8	9
注水										
[0513]	稗草	70	65	45	50	65	60	0	0	65
	沼生异蕊花	90	95	80	95	90	85	75	0	95
	稻	0	30	10	0	25	20	30	0	0
	异型莎草	0	0	0	0	0	0	0	0	0