



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 107592862 B

(45) 授权公告日 2021.06.15

(21) 申请号 201680026577.7

(22) 申请日 2016.05.02

(65) 同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 107592862 A

(43) 申请公布日 2018.01.16

(30) 优先权数据
62/160,592 2015.05.12 US

(85) PCT国际申请进入国家阶段日
2017.11.07

(86) PCT国际申请的申请数据
PCT/US2016/030450 2016.05.02

(87) PCT国际申请的公布数据
W02016/182780 EN 2016.11.17

(73) 专利权人 FMC公司
地址 美国宾夕法尼亚州

(72) 发明人 M·J·坎贝尔 T·M·史蒂文森
A·D·萨特菲尔德

(74) 专利代理机构 永新专利商标代理有限公司
72002
代理人 安琪 张晓威

(51) Int.Cl.
C07D 487/04 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)

(56) 对比文件
WO 2004037787 A1, 2004.05.06
CN 102971302 A, 2013.03.13
WO 2015/084796 A1, 2015.06.11
审查员 马冲

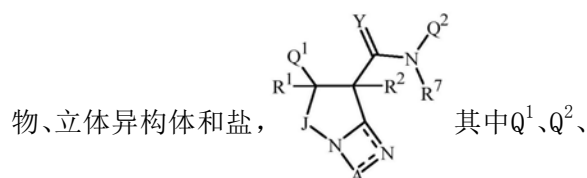
权利要求书3页 说明书81页

(54) 发明名称

作为除草剂的芳基取代的双环化合物

(57) 摘要

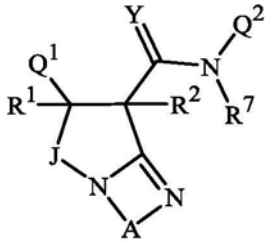
披露了式1的化合物,包括其所有的N-氧化



1

R¹、R²、Y、J和R⁷是如本披露所定义的。还披露了包含这些式1的化合物的组合物,以及用于控制不希望植被的方法,这些方法包括使该不希望植被或其环境与有效量的本发明的化合物或组合物接触。

1. 一种化合物, 该化合物选自式1和其盐,



1

其中

Q¹是苯环, 其任选地被1至4个独立地选自R⁹的取代基取代;

Q²是苯环, 其任选地被最高达5个独立地选自R¹¹的取代基取代;

R¹和R²各自是H;

Y是O;

A是-CH₂CH₂CH₂-、-CH=N-、-C(R³)=N-、-C(=O)CH₂-或-CH=CH-, 其中向左边伸出的键连接到-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的-N=C-部分的氮;

每个R³独立地是C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基;

每个R⁴独立地是C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基或C₃-C₆环烷基;

J是-CH₂-;

R⁷是H或C₁-C₆烷基;

每个R⁹独立地是卤素、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基或C₁-C₈卤代烷硫基;

每个R¹¹独立地是卤素、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基或C₁-C₈烷硫基; 并且

前提是该化合物不同于以下式1的化合物, 在该式1中Q¹是3-三氟甲基苯基; Q²是2-氟苯基; A是-CH₂CH₂-; 并且R⁷是H。

2. 如权利要求1所述的化合物, 其中

每个R³独立地是C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基;

每个R⁴独立地是C₁-C₄烷基; 并且

R⁷是H。

3. 如权利要求2所述的化合物, 其中

Q¹是被1至3个独立地选自R⁹的取代基取代的苯环;

Q²是任选地被最高达3个独立地选自R¹¹的取代基取代的苯环;

每个R⁴独立地是C₁-C₄烷基;

每个R⁹独立地是卤素或C₁-C₈卤代烷基; 并且

每个R¹¹独立地是F、Cl、CH₃或CF₃。

4. 如权利要求3所述的化合物, 其中

Q¹是被1至3个独立地选自R⁹的取代基取代的苯环;

Q²是在3-位处被1个独立地选自R¹¹的取代基取代的苯环; 并且

R³是C₁-C₄烷基。

5. 如权利要求4所述的化合物, 其中

Q¹是被1至2个独立地选自R⁹的取代基取代的苯环;

A是 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$;

每个 R^9 独立地是卤素或 C_1-C_8 卤代烷基;并且

每个 R^{11} 独立地是F、Cl、 CH_3 或 CF_3 。

6. 如权利要求4所述的化合物,其中

Q^1 是被1至2个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环;

A是 $-\text{CH}=\text{N}-$ 或 $-\text{C}(\text{R}^3)=\text{N}-$,其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮,并且向右边伸出的键连接到式1的该 $-\text{N}=\text{C}-$ 部分的氮;

R^3 是 C_1-C_4 烷基;

每个 R^9 独立地是F、Cl、 CF_3 ;并且

每个 R^{11} 独立地是F、Cl、 CH_3 或 CF_3 。

7. 如权利要求1所述的化合物,该化合物选自下组,该组由以下各项组成:

N-(2-氟苯基)-6,7-二氢-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺;以及

N-(2-氟苯基)-2,3,6,7-四氢-3-氧代-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[1,2-a]咪唑-7-甲酰胺。

8. 如权利要求3所述的化合物,其中

A是 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CF}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ 或 $-\text{CH}=\text{CH}-$,其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮,并且向右边伸出的键连接到式1的该 $-\text{N}=\text{C}-$ 部分的氮。

9. 如权利要求8所述的化合物,其中

A是 $-\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{N}-$ 或 $-\text{C}(\text{CF}_3)=\text{N}-$,其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮,并且向右边伸出的键连接到式1的该 $-\text{N}=\text{C}-$ 部分的氮。

10. 一种除草组合物,包含如权利要求1至9中任一项所述的化合物和至少一种选自下组的组分,该组由以下各项组成:表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。

11. 一种除草组合物,包含如权利要求1至9中任一项所述的化合物、至少一种选自自由其他除草剂和除草剂安全剂组成的组的附加活性成分、以及至少一种选自自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的组分。

12. 一种除草混合物,包含(a)如权利要求1至9中任一项所述的化合物、以及(b)至少一种选自以下项的附加活性成分:(b1)光系统II抑制剂,(b2)乙酰羟酸合酶(AHAS)抑制剂,(b3)乙酰辅酶A羧化酶(ACCase)抑制剂,(b4)生长素模拟物,(b5)5-烯醇-丙酮酸莽草酸-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(PPO)抑制剂,(b8)谷氨酰胺合成酶(GS)抑制剂,(b9)极长链脂肪酸(VLCFA)延长酶抑制剂,(b10)生长素转运抑制剂,(b11)八氢番茄红素脱氢酶(PDS)抑制剂,(b12)4-羟基苯基-丙酮酸双加氧酶(HPPD)抑制剂,(b13)尿黑酸茄尼转移酶(HST)抑制剂,(b14)纤维素生物合成抑制剂,(b15)其他除草剂,包括有丝分裂干扰剂、有机含砷化合物、磺草灵、溴丁酰草胺、环庚草醚、苜草隆、棉隆、野燕枯、杀草隆、乙氧苯草胺、抑草丁、调节膦、调节膦-铵、海丹托西丁(hydantocidin)、威百亩、甲基杀草隆、油酸、噁嗪草酮、壬酸和稗草畏,(b16)除草剂安全剂,以及(b1)至(b16)的化合物的盐。

13. 一种用于控制不希望植被的生长的方法,该方法包括使该植被或其环境与除草有效量的如权利要求1至9中任一项所述的化合物接触。

作为除草剂的芳基取代的双环化合物

技术领域

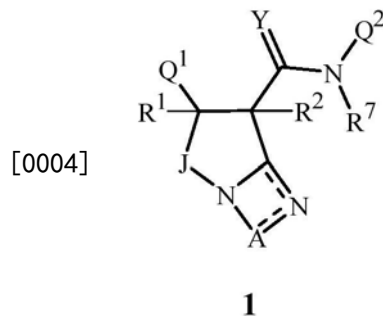
[0001] 本发明涉及某些双环甲酰胺,其N-氧化物、盐和组合物,以及其用于控制不希望植被的方法。

背景技术

[0002] 控制不希望植被在实现高作物效率中是极其重要的。实现对杂草生长的选择性控制,尤其是在此类有用的作物尤其如稻、大豆、甜菜、玉蜀黍、马铃薯、小麦、大麦、番茄和种植园作物中,是非常希望的。在此类有用的作物中的未加抑制的杂草生长可造成产量的显著下降,并且从而导致消费者成本增加。在非作物区域中对不希望植被的控制也是重要的。为了这些目的,许多产品是可商购的,但持续需要更有效、较低成本、较低毒性、对环境更安全或具有不同的作用位点的新型化合物。

发明内容

[0003] 本发明针对式1的化合物(包括所有立体异构体),包括其N-氧化物和盐,包含它们的农业组合物,以及它们作为除草剂的用途:



[0005] 其中

[0006] Q^1 是苯基或苄基环或萘环体系,每个环或环体系任选地被最高达5个独立地选自 R^9 的取代基取代;或是5-至6-元完全不饱和的杂环或是8-至10-元杂芳族双环体系,每个环或环体系含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员,这些杂原子独立地选自最高达2个O、最高达2个S和最高达4个N原子,其中最高达3个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且这些硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^8)_v$,每个环或环体系任选被最高达5个取代基取代,在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^9 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{10} ;

[0007] Q^2 是苯环或萘环体系,每个环或环体系任选地被最高达5个独立地选自 R^{11} 的取代基取代;或是5-至6-元完全不饱和的杂环或是8-至10-元杂芳族双环体系,每个环或环体系含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员,这些杂原子独立地选自最高达2个O、最高达2个S和最高达4个N原子,其中最高达3个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且这些硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^8)_v$,每个环或环体系任选被最高达5个取代基取代,在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{11} 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自

R¹²;

[0008] R¹和R²各自独立地是H、卤素、羟基或C₁-C₄烷基;

[0009] Y是O、S或NR¹⁵;

[0010] A是含有2至4个原子的饱和的、部分不饱和的或完全不饱和的链,这些原子选自最高达4个碳、最高达1个O、最高达1个S和最高达2个N原子,其中最高达2个碳成员独立地选自C(=O)和C(=S)并且该硫原子成员选自S(=O)_u(=NR⁸)_v;所述链任选地被最高达5个取代基取代,在碳原子上所述取代基独立地选自R³并且在氮原子上所述取代基独立地选自R⁴;

[0011] 每个R³独立地是卤素、氰基、羟基、-CO₂H、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₂-C₄烷氧基烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₃-C₆环烷基或C₄-C₆环烷基烷基;或

[0012] 两个R³与它们所结合的一个或多个碳原子一起形成C₃-C₇环烷基环;

[0013] 每个R⁴独立地是氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基或C₃-C₆环烷基;

[0014] J是-CR⁵R⁶-或-CR⁵R⁶-CR^{5a}R^{6a}-其中该-CR⁵R⁶-部分直接连接到N;

[0015] R⁵和R⁶各自独立地是H、卤素、羟基、C₁-C₄烷基或C₁-C₄烷氧基;或

[0016] R⁵和R⁶与它们所结合的碳原子一起形成C₃-C₇环烷基环;

[0017] R^{5a}和R^{6a}各自独立地是H、卤素或C₁-C₄烷基;或

[0018] R^{5a}和R^{6a}与它们所结合的碳原子一起形成C₃-C₇环烷基环;

[0019] R⁷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、C₃-C₁₀三烷基甲硅烷基或G¹;

[0020] 每个R⁸独立地是H、氰基、C₂-C₃烷基羰基或C₂-C₃卤代烷基羰基;

[0021] 每个R⁹独立地是卤素、氰基、硝基、C₁-C₈烷基、C₁-C₄氰基烷基、C₁-C₄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炔基、C₂-C₈卤代炔基、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烷氧基烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₃-C₈卤代烷氧基烷基、C₁-C₄羟烷基、C₄-C₁₀环烷氧基烷基、C₃-C₁₀烷氧基烷基烷基、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、-CHO、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烷氧基烷氧基、C₂-C₈烯氧基、C₂-C₈卤代烯氧基、C₂-C₈卤代烷氧基卤代烷氧基、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烷基羰基氧

基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基氧基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基氧基、 C_1 - C_8 烷基磺酰基氧基、 C_1 - C_8 卤代烷基磺酰基氧基、 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_2 - C_8 烷氧基羰基氨基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基氨基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基氨基、 $-SF_5$ 、 $-SCN$ 、 SO_2NH_2 、 C_3 - C_{12} 三烷基甲硅烷基、 C_4 - C_{12} 三烷基甲硅烷基、 C_4 - C_{12} 三烷基甲硅烷基烷氧基或 G^2 ；

[0022] 每个 R^{11} 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_4 氰基烷基、 C_1 - C_4 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 炔基、 C_2 - C_8 卤代炔基、 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 烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_3 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_1 - C_4 羟烷基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烷氧基烷氧基烷基、 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、 $-C(=O)NH_2$ 、 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 烷氧基烷氧基、 C_2 - C_8 烯氧基、 C_2 - C_8 卤代烯氧基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基卤代烷氧基、 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 烷基羰基氧基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基氧基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基氧基、 C_1 - C_8 烷基磺酰基氧基、 C_1 - C_8 卤代烷基磺酰基氧基、 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_2 - C_8 烷氧基羰基氨基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基氨基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基氨基、 $-SF_5$ 、 $-SCN$ 、 SO_2NH_2 、 C_3 - C_{12} 三烷基甲硅烷基、 C_4 - C_{12} 三烷基甲硅烷基、 C_4 - C_{12} 三烷基甲硅烷基烷氧基或 G^3 ；

[0023] 每个 R^{10} 和 R^{12} 独立地是氰基、 C_1 - C_3 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；

[0024] R^{15} 是H、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 $-C(=O)CH_3$ 或 $-C(=O)CF_3$ ；

[0025] 每个 G^1 独立地是苯基、苯基甲基(即苄基)、吡啶基甲基、吡啶氧基、苯基羰基(即苯甲酰基)、苯氧基、苯基乙炔基、苯基磺酰基、苯基羰基(C_1 - C_4 烷基)；或是5-或6-元杂芳环，各自任选地在环成员上被最高达5个独立地选自 R^{13} 的取代基取代；

[0026] 每个 G^2 独立地是苯基、苯基甲基(即苄基)、吡啶基甲基、苯基羰基(即苯甲酰基)、苯基羰基烷基、苯氧基、苯基乙炔基、苯基磺酰基或吡啶氧基；或是5-或6-元杂芳环，各自任选地在环成员上被最高达5个独立地选自 R^{14} 的取代基取代；或是 $R^{16}ON=CR^{17}$ -、 $(R^{18})_2C=NO$ -、 $(R^{19})_2NN=CR^{17}$ -、 $(R^{18})_2C=NNR^{20}$ -、 $R^{21}N=CR^{17}$ -、 $(R^{18})_2C=N$ -、 $R^{22}ON=CR^{17}C(R^{23})_2$ -或 $(R^{18})_2C=NOC(R^{23})_2$ -，其中向右边伸出的自由键指示与 Q^1 的连接点；

[0027] 每个 G^3 独立地是苯基、苯基甲基(即苄基)、吡啶基甲基、苯基羰基(即苯甲酰基)、苯基羰基烷基、苯氧基、苯基乙炔基、苯基磺酰基或吡啶氧基；或是5-或6-元杂芳环，各自

任选地在环成员上被最高达5个独立地选自R¹⁵的取代基取代；

[0028] 每个R¹³、R¹⁴和R¹⁵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、C₁-C₆卤代烷基、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、C₂-C₈烷基羰基氧基、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烷基羰基氨基或C₁-C₆烷基磺酰基氨基；

[0029] 每个R¹⁶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、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、C₁-C₆烷基氨基磺酰基、C₂-C₈二烷基氨基磺酰基、C₃-C₁₀三烷基甲硅烷基或G¹；

[0030] 每个R¹⁷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、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆卤代烷硫基、C₃-C₈环烷硫基、C₃-C₁₀三烷基甲硅烷基或G¹；

[0031] 每个R¹⁸独立地是H、羟基、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、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、C₃-C₁₀三烷基甲硅烷基或G¹；

[0032] 每个R¹⁹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、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、C₃-C₁₀三烷基甲硅烷基或G¹；

[0033] 每个R²⁰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；

[0034] 每个R²¹独立地是H、羟基、氨基、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、

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 G^1 ;

[0035] 每个 R^{22} 独立地是H、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基或 C_3-C_6 环烷基;

[0036] 每个 R^{23} 独立地是H、卤素、氰基、羟基、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_8 环烷基、 C_4-C_8 环烷基烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基或 C_3-C_6 环烷基;并且

[0037] 在 $S(=O)_u(=NR^8)_v$ 的每个例子中,每个u和v独立地是0、1或2,前提是u和v之和是0、1或2;并且前提是该化合物不同于以下式1的化合物,在该式1中 Q^1 是 $Ph(3-CF_3)$; Q^2 是 $Ph(2-F)$; R^1 是H; R^2 是H; Y是O; A是 $-CH_2CH_2-$; J是 $-CR^5R^6-$; R^5 是H; R^6 是H; 并且 R^7 是H。

[0038] 更具体地,本发明涉及一种式1的化合物(包括所有立体异构体)、其N-氧化物或盐。本发明还涉及一种除草组合物,该除草组合物包含本发明的化合物(即以除草有效量)和至少一种选自下组的组分,该组由以下各项组成:表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂。本发明还涉及一种用于控制不希望植被的生长方法,该方法包括使该植被或其环境与除草有效量的本发明的化合物(例如,作为本文所述的组合物)接触。

[0039] 本发明还包括一种除草混合物,该除草混合物包含(a)选自式1、其N-氧化物和盐的化合物,以及(b)至少一种选自如下所述的(b1)至(b16)、以及(b1)至(b16)的化合物的盐的附加活性成分。

具体实施方式

[0040] 如本文所用,术语“包含(comprise)”、“包含着(comprising)”、“包括(include)”、“包括着(including)”、“具有(has)”、“具有着(having)”、“含有(contains)”、“含有着(containing)”、“特征在于”或其任何其他变型旨在覆盖非排他性的包括,以任何明确指明的限定为条件。例如,包含一系列元素的组合物、混合物、工艺或方法不必仅限于那些元素,而是可以包括其他未明确列出的元素,或此类组合物、混合物、工艺或方法固有的元素。

[0041] 连接短语“由...组成”排除任何未指出的元素、步骤或成分。如果在权利要求中,则此类短语将使权利要求为封闭式,使其不包含除那些叙述的材料以外的材料,但通常与其相关的杂质除外。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元素;其他元素不作为整体从该权利要求中被排除。

[0042] 连接短语“基本上由...组成”用于限定除了字面披露的那些以外还包括材料、步骤、特征、组分、或元素的组合物或方法,前提是这些附加的材料、步骤、特征、组分、或元素不会实质影响请求保护的发明的基本和新颖特征。术语“基本上由...组成”居于“包含”和“由...组成”中间。

[0043] 当申请人已经用开放式术语如“包含着”定义了本发明或其一部分时,则应易于理

解(除非另外指明),说明书应被解释为还使用术语“基本上由...组成”或“由...组成”描述本发明。

[0044] 此外,除非有相反的确切说明,否则“或”是指包含性的“或”,而不是指排他性的“或”。例如,条件A或B由下列任一项满足:A是真(或存在)和B是假(或不存在),A是假(或不存在)和B是真(或存在),和A和B二者都是真(或存在)。

[0045] 同样,在本发明的元素或组分前的不定冠词“一个/一种(a/an)”关于元素或组分的例子(即,出现)的数目旨在是非限制性的。因此,“一个/一种”应理解为包括一个/一种或至少一个/一种,并且元素或组分的单数词语形式还包括复数,除非该数字明显意指单数。

[0046] 如本文所提及的,单独或以词语的组合使用的术语“幼苗”是指由种子的胚芽发育的植物幼苗。

[0047] 如本文所提及的,单独使用或以诸如“阔叶杂草”的词语使用的术语“阔叶”是指双子叶或双子叶植物,用于描述以具有两个子叶的胚芽为特征的一类被子植物的术语。

[0048] 如本文所用,术语“烷基化剂”是指其中含碳基团通过碳原子键合到离去基团如卤化物或磺酸酯的化合物,该离去基团可通过亲核体与所述碳原子的键合而被置换。除非另外指明,否则术语“烷基化”不将含碳基团限制为烷基;烷基化剂中的含碳基团包括对于(R^9 和 R^{11})指定的各种碳键合的取代基基团。术语“直接连接的”是指“连接的”或“键合的”。

[0049] 在以上叙述中,术语“烷基”,单独使用或以复合词如“烷硫基”或“卤代烷基”使用,包括直链或支链烷基,诸如甲基、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,诸如乙烯基、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”还包括聚烯,诸如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,诸如乙炔基、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”还可包括由多个三键构成的部分,诸如2,5-己二炔基。

[0050] “烷氧基”包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基和不同的丁氧基、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 、 $CH_3OCH_2CH_2$ 、 $CH_3CH_2OCH_2$ 、 $CH_3CH_2CH_2CH_2OCH_2$ 和 $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ 。“烷氧基烷氧基”表示烷氧基上的烷氧基取代。“烷氧基烷氧基烷基”表示在烷氧基烷基部分上的烷氧基取代。“烯氧基”包括直链或支链的烯氧基部分。“烯氧基”的实例包括 $H_2C=CHCH_2O$ 、 $(CH_3)_2C=CHCH_2O$ 、 $(CH_3)CH=CHCH_2O$ 、 $(CH_3)CH=C(CH_3)CH_2O$ 和 $CH_2=CHCH_2CH_2O$ 。“炔氧基”包括直链或支链的炔氧基部分。“炔氧基”的实例包括 $HC\equiv CCH_2O$ 、 $CH_3C\equiv CCH_2O$ 和 $CH_3C\equiv CCH_2CH_2O$ 。“烷硫基”包括支链或直链的烷硫基部分,诸如甲硫基、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”包括烷基亚磺酰基的两种对映异构体。“烷基亚磺酰基”的实例包括 $CH_3S(O)-$ 、 $CH_3CH_2S(O)-$ 、 $CH_3CH_2CH_2S(O)-$ 、 $(CH_3)_2CHS(O)-$ 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”的实例包括 $CH_3S(O)_2-$ 、 $CH_3CH_2S(O)_2-$ 、 $CH_3CH_2CH_2S(O)_2-$ 、 $(CH_3)_2CHS(O)_2-$ 、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 、 $CH_3SCH_2CH_2$ 、 $CH_3CH_2SCH_2$ 、 $CH_3CH_2CH_2CH_2SCH_2$ 和 $CH_3CH_2SCH_2CH_2$ 。“氰基烷基”表示被一个氰基取代的烷基。“氰基烷基”的实例包括 $NCCH_2$ 、 $NCCH_2CH_2$ 和 $CH_3CH(CN)CH_2$ 。“烷基氨基”、“二烷基氨基”等类似于上述实例进行定义。术语“烷硫基烷基”、“烷基磺酰基氨基”、“烷基磺酰基氧基”、“烷基氨基磺酰基”、“烷基磺酰基氨基”、“烷基氨基烷基”、“烷基亚磺酰基烷基”、“烷基磺酰基烷基”、“二

烷基氨基烷基”同样地进行定义。

[0051] “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。术语“环烷基烯基”表示烯基部分上的环烷基取代。术语“环烷基炔基”表示炔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、以及其他键合到直链或支链烷基上的环烷基部分。术语“环烷氧基”表示通过氧原子连接的环境基,诸如环戊氧基和环己氧基。“环烷基烷氧基”表示通过附接至烷基链的氧原子连接的环境基烷基。“环烷基烷氧基”的实例包括环丙基甲氧基、环戊基乙氧基、以及其他键合到直链或支链烷氧基的环境基部分。“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-和1,4-环己二烯基。术语“环烷基环烷基”是指环烷基部分上的环境基取代。术语“环烷氧基烷基”、“烷基环烷基烷基”、“环烷基氨基烷基”、“环烷硫基”、“环烷基亚磺酰基”、“环烷基磺酰基”等同样地进行定义。

[0052] 术语“卤素”,单独地或在复合词如“卤代烷基”中,或者当在描述如“被卤素取代的烷基”中使用,包括氟、氯、溴或碘。此外,当在复合词如“卤代烷基”中使用,或者当在描述如“被卤素取代的烷基”中使用,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”、“卤代环烷氧基”、“卤代环烯基”、“卤代环烷基烷基”、“卤代烷氧基”、“卤代烷氧基卤代烷氧基”、“卤代烷基氨基烷基”、“卤代烷基羰基氨基”、“卤代烷硫基”、“卤代烷基磺酰基氨基”、“卤代烯基”、“卤代炔基”、“卤代烷基羰基氧基”、“卤代烷基磺酰基氧基”、“卤代炔氧基”等类似于术语“卤代烷基”进行定义。“卤代烷氧基”的实例包括 CF_3O -、 CCl_3CH_2O -、 $HCF_2CH_2CH_2O$ -和 CF_3CH_2O -。“卤代烷硫基”的实例包括 CCl_3S -、 CF_3S -、 CCl_3CH_2S -和 $ClCH_2CH_2CH_2S$ -。“卤代烷基亚磺酰基”的实例包括 $CF_3S(O)$ -、 $CCl_3S(O)$ -、 $CF_3CH_2S(O)$ -和 $CF_3CF_2S(O)$ -。“卤代烷基磺酰基”的实例包括 $CF_3S(O)_2$ -、 $CCl_3S(O)_2$ -、 $CF_3CH_2S(O)_2$ -和 $CF_3CF_2S(O)_2$ -。“卤代烯基”的实例包括 $(Cl)_2C=CHCH_2$ -和 $CF_3CH_2CH=CHCH_2$ -。“卤代炔基”的实例包括 $HC\equiv CCHCl$ -、 $CF_3C\equiv C$ -、 $CCl_3C\equiv C$ -和 $FCH_2C\equiv CCH_2$ -。“卤代烷氧基烷氧基”的实例包括 CF_3OCH_2O -、 $ClCH_2CH_2OCH_2CH_2O$ -、 $Cl_3CCH_2OCH_2O$ -以及支链烷基衍生物。“卤代烯氧基”的实例包括 $(Cl)_2C=CHCH_2O$ -和 $CF_3CH_2CH=CHCH_2O$ -。“卤代烷氧基烷基”的实例包括 CF_3OCH_2 -、 $CCl_3CH_2OCH_2$ -、 $HCF_2CH_2CH_2OCH_2$ -和 $CF_3CH_2OCH_2$ -。

[0053] “烷基羰基”表示键合到 $C(=O)$ 部分上的直链或支链的烷基部分。“烷基羰基”的实例包括 $CH_3C(=O)$ -、 $CH_3CH_2CH_2C(=O)$ -和 $(CH_3)_2CHC(=O)$ -。“烷氧基羰基”的实例包括 $CH_3OC(=O)$ -、 $CH_3CH_2OC(=O)$ -、 $CH_3CH_2CH_2OC(=O)$ -、 $(CH_3)_2CHOC(=O)$ -和不同的丁氧基-或戊氧基羰基异构体。术语“烷基羰基烷基”、“烷基羰基氧基”、“烷基羰基烷氧基”、“烷基羰基氨基”、“烷氧基羰基氨基”、“烷基氨基羰基”、“二烷基氨基磺酰基”、“环烷基羰基”、“环烷基烷氧基羰基”、“环烷氧基羰基”、“环烷基羰基氧基”、“二烷基氨基羰基”、“环烷基氨基羰基”、“卤代烷基羰基”和“卤代烷氧基羰基”同样地进行定义。术语“羟烷基”是指与烷基附接的羟基。术语“氰基烷基”是指与烷基附接的氰基。术语“氰基烷氧基”是指与烷氧基附接的氰基。术语“硝基烷基”是指与烷基附接的硝基。术语“硝基烯基”是指与烯基附接的硝基。

[0054] 术语“三烷基甲硅烷基”是指被三个烷基取代的甲硅烷基。术语“三烷基甲硅烷基

烷基”意思是指通过烷基键合的三烷基甲硅烷基(例如-CH₂TMS)。术语“三烷基甲硅烷基氧基”意思是指通过氧键合的三烷基甲硅烷基(例如-OTMS)。

[0055] 在取代基中的碳原子的总数用“C_i-C_j”前缀表示,其中i和j是从1至12的数。例如,C₁-C₄烷基磺酰基表示甲基磺酰基至丁基磺酰基;C₂烷氧基烷基表示 CH₃OCH₂-;C₃烷氧基烷基表示例如CH₃CH(OCH₃)-、CH₃OCH₂CH₂-或 CH₃CH₂OCH₂-;并且C₄烷氧基烷基表示包含总共四个碳原子的被烷氧基取代的烷基的各种异构体,实例包括CH₃CH₂CH₂OCH₂-和CH₃CH₂OCH₂CH₂-。

[0056] 当化合物被带有下标(其表示所述取代基的数目可超过1)的取代基取代时,所述取代基(当它们超过1时)独立地选自所定义的取代基的组,例如, S(=O)_u(=NR⁸)_v,u和v独立地是0、1或2)。当基团含有可为氢的取代基,例如(R⁵或R⁶)时,则当该取代基为氢时,公认这等同于所述基团是未取代的。当可变基团表明任选地附接到一个位置上时,例如R⁹和R¹¹,其中n可以是0,则即使可变基团定义中没有进行叙述,氢也可以在所述位置上。当基团上的一个或多个位置据说是“没有取代的”或“未取代的”时,则附接氢原子以占据任何自由价。

[0057] 除非另外指明,否则作为式1的组分的“环”或“环体系”(例如,取代基Q¹和Q²是杂环的)。术语“环体系”表示两个或更多个稠合的环。术语“双环体系”和“稠合的双环体系”表示由两个稠合的环组成的环体系,其中除非另外指明,否则这两个环中的任一个可以是饱和的、部分不饱和的或完全不饱和的。术语“稠合的杂双环体系”表示其中至少一个环原子不是碳的稠合的双环体系。术语“环成员”是指形成环或环体系的骨架的原子或其他部分(例如,C(=O)、C(=S)、S(O)或 S(O)₂)。

[0058] 术语“杂环(heterocyclic ring)”、“杂环(heterocycle)”或“杂环体系”表示其中至少一个形成环骨架的原子不是碳(例如,氮、氧或硫)的环或环体系。典型地,杂环含有不超过4个氮、不超过2个氧和不超过2个硫。除非另外指明,否则杂环可以是饱和的、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规则时,则所述环还被称为“杂芳族环”或“芳族杂环”。除非另外指明,否则杂环和环体系可通过任何可用的碳或氮经由替换在所述碳或氮上的氢来附接。

[0059] “芳族的”表示每个环原子基本上在相同的平面上且具有垂直于该环平面的p-轨道,且(4n+2)个π电子(其中n是正整数)与该环相关联以符合休克尔规则。术语“芳族环体系”表示碳环或杂环体系,其中该环体系的至少一个环是芳族的。术语“芳族杂环体系”表示其中该环体系的至少一个环是芳族的杂环体系。术语“非芳族环体系”表示可以是完全饱和的、以及部分或完全不饱和的碳环或杂环体系,前提是环体系中的环都不是芳族的。

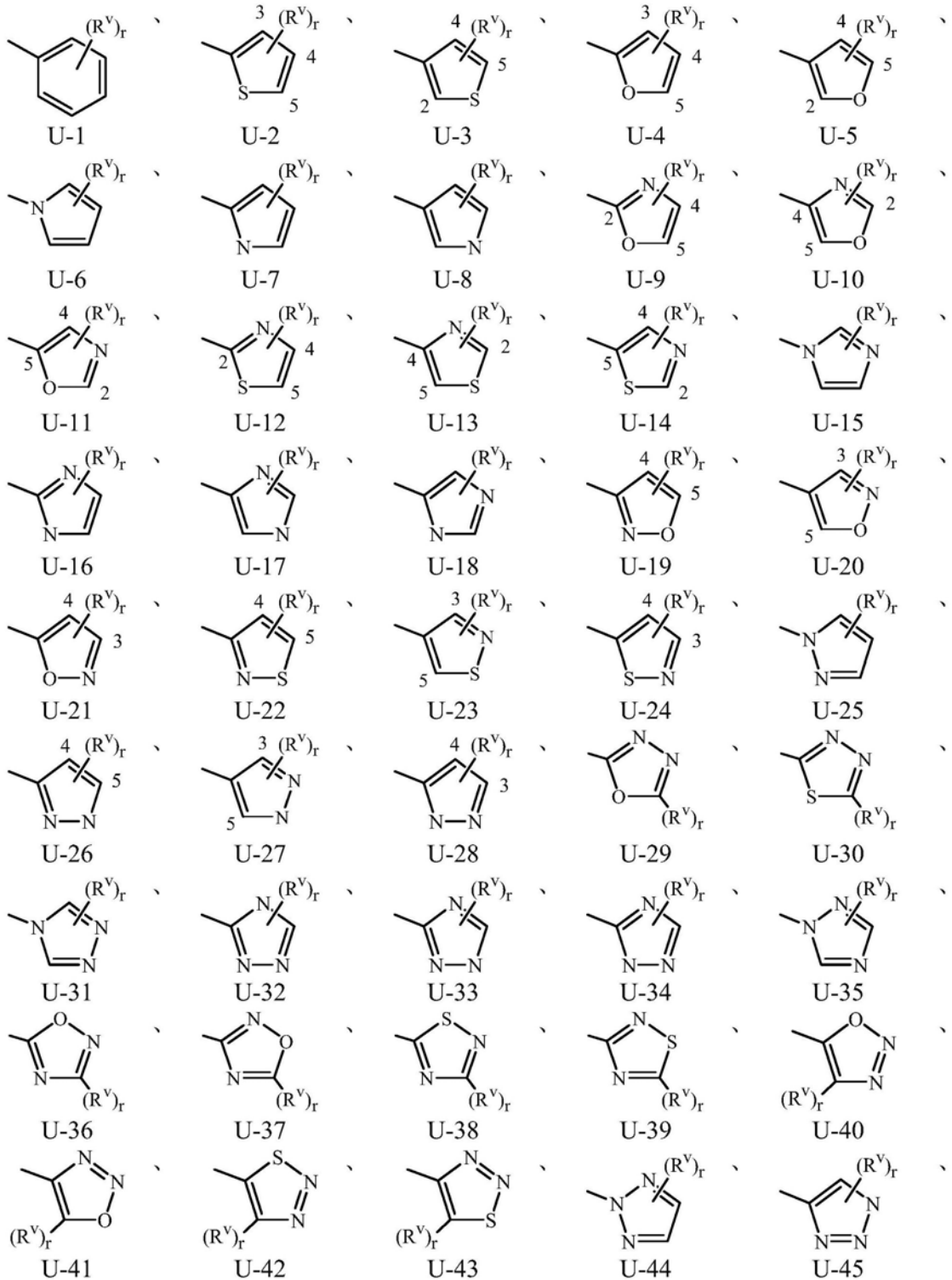
[0060] 与杂环有关的术语“任选地取代的”是指这样的基团,其为未取代的或具有至少一个不消除由未取代的类似物所拥有的生物活性的非氢取代基。如本文所用,除非另外指明,否则将应用下列定义。术语“任选地取代的”与短语“取代或未取代的”或与术语“(未)取代的”可互换使用。除非另外指明,否则任选地取代的基团可在基团的每个可取代的位置处具有取代基,并且每个取代彼此独立。

[0061] 如上所指出,Q¹可以是(尤其)任选地被一个或多个取代基取代的苯基,该一个或多个取代基选自如在发明内容中所定义的取代基的组中。任选地被一至五个取代基取代的苯基的实例是如在示例1中的U-1所示的环,其中R^v是如在发明内容中对于Q¹所定义的R⁹,并且R^v是如在发明内容中对于Q²所定义的R¹¹,且r是从0到5的整数。

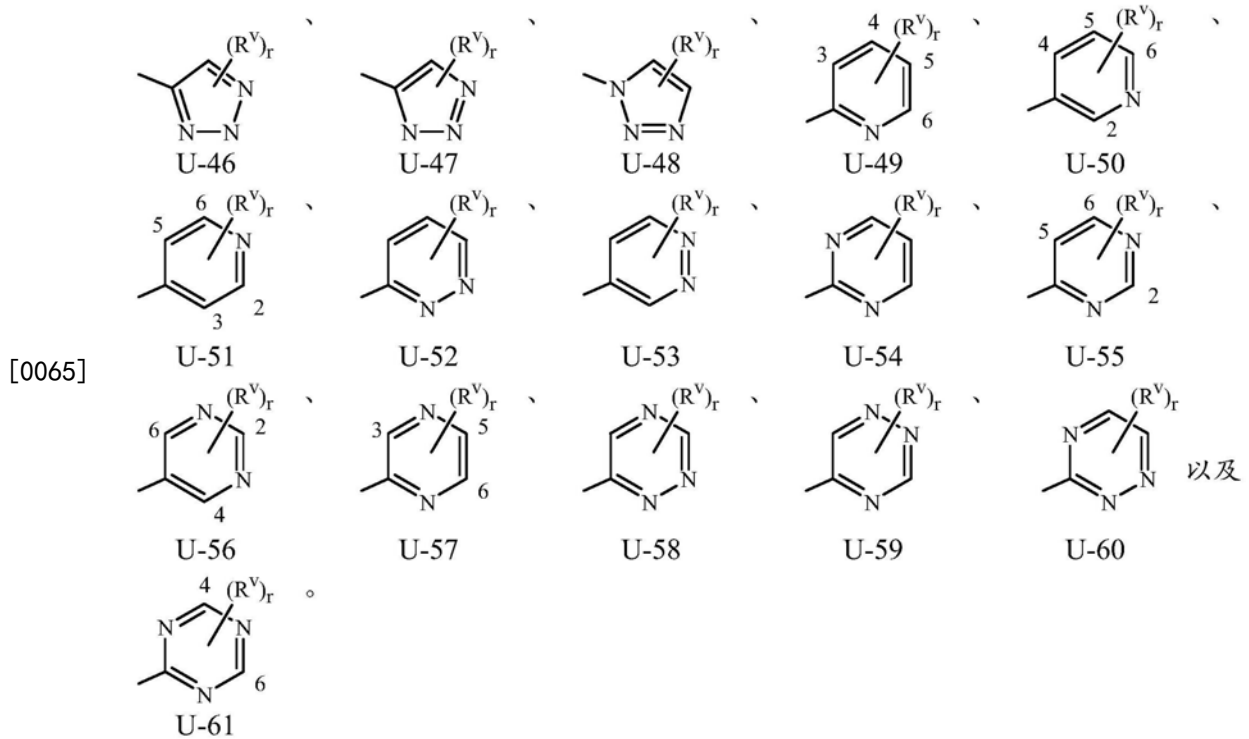
[0062] 如上所指出,Q¹可以是(尤其)5-或6-元完全不饱和的杂环(其可以是饱和的或不

饱和的), 任选地被一个或多个选自如在发明内容中所定义的取代基的组中的取代基取代。任选地被一个或多个取代基取代的5-或6-元不饱和的芳族杂环的实例包括示例1中所示的环U-2至U-61, 其中 R^v 是如在发明内容中对于 Q^1 所定义的任何取代基(即 R^9), 并且 r 为从0至5的整数、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、U-40、U-41、U-42和U-43仅有一个可用位置, 所以对于这些U基团, r 限于整数0或1, 并且 r 是0意指该U基团是未取代的, 并且氢存在于由 $(R^v)_r$ 所指示的位置处。

[0063] 示例1



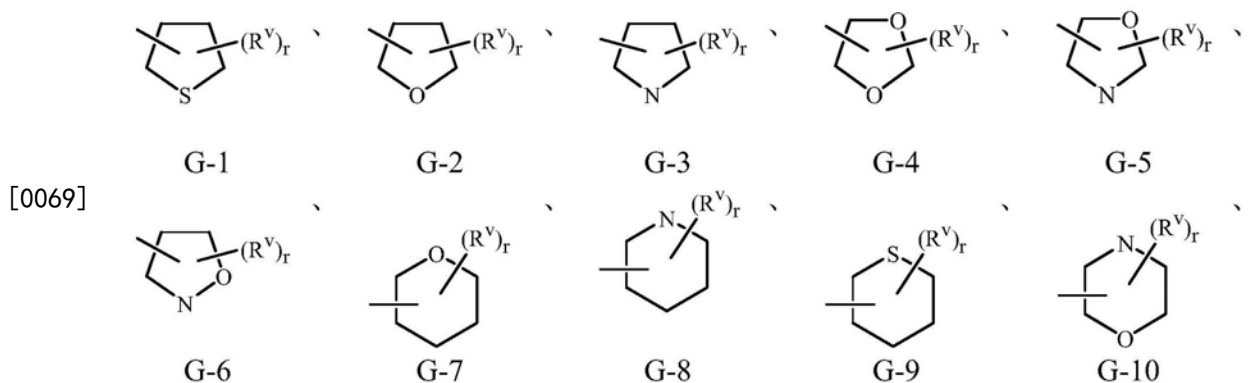
[0064]

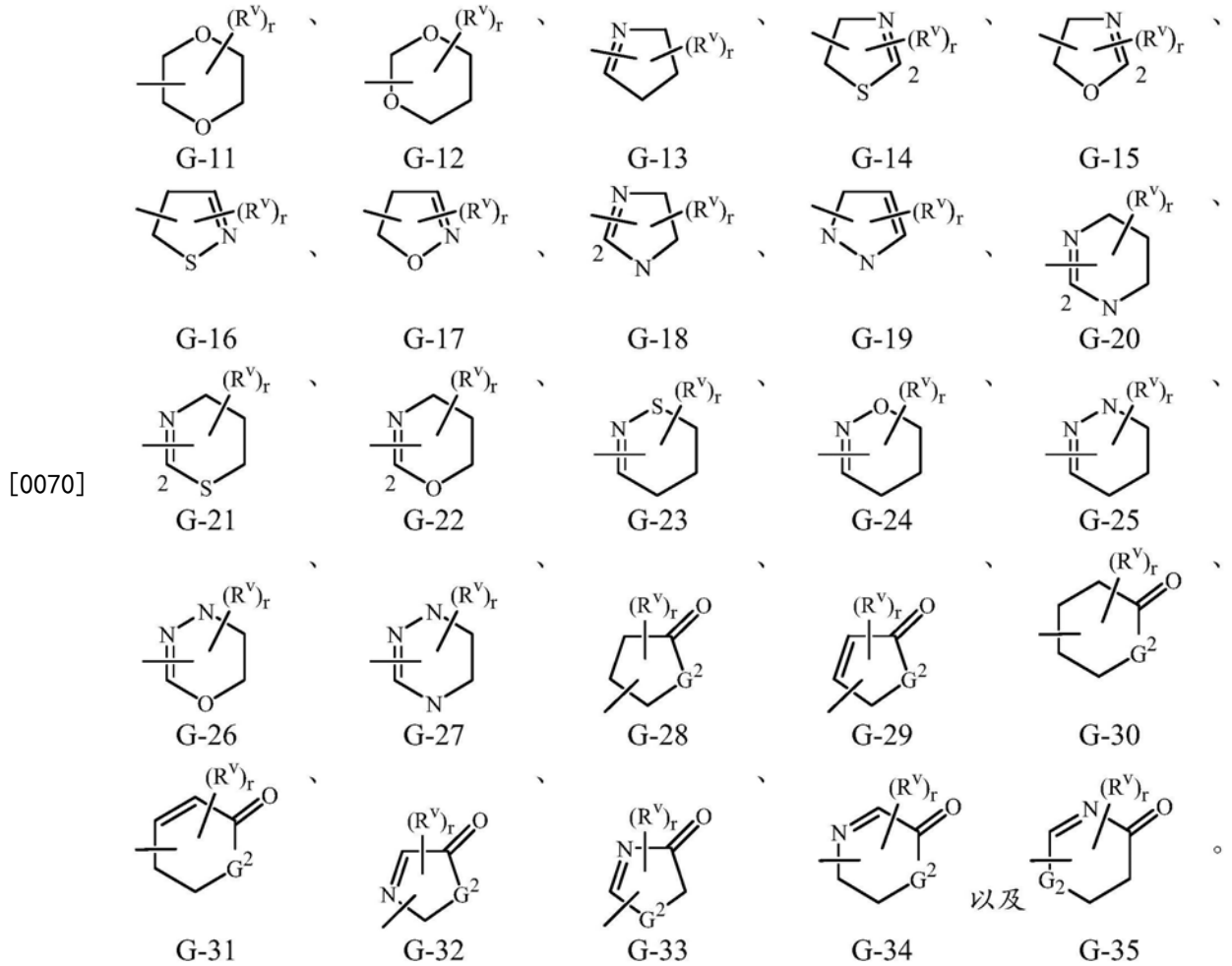


[0066] 含有选自最高达两个O原子和最高达两个S原子和最高达4个N原子的环成员、并且任选地在碳原子环成员上被最高达5个卤素原子取代的5-或6-元饱和或非芳族不饱和杂环的实例包括如示例2中所示的环G-1至G-35。应注意到,当G基团上的附接点示出为浮动时,G基团可通过G基团的任何可用的碳或氮经由替换氢原子而附接到式1的其余部分。对应于 R^v 的任选取代基可以通过替换氢原子附接到任何可用的碳或氮上。对于这些G环,r典型地为从0至5的整数,受每个G基团上可用位置的数目限制。

[0067] 应注意,当 Q^1 或 Q^2 包含选自G-28至G-35的环时, G^2 选自O、S或N。应注意,当 G^2 是N时,氮原子可以通过用H或对应于如在发明内容中对于 Q^1 或 Q^2 所定义的 R^v 的取代基取代而使其化合价完整。

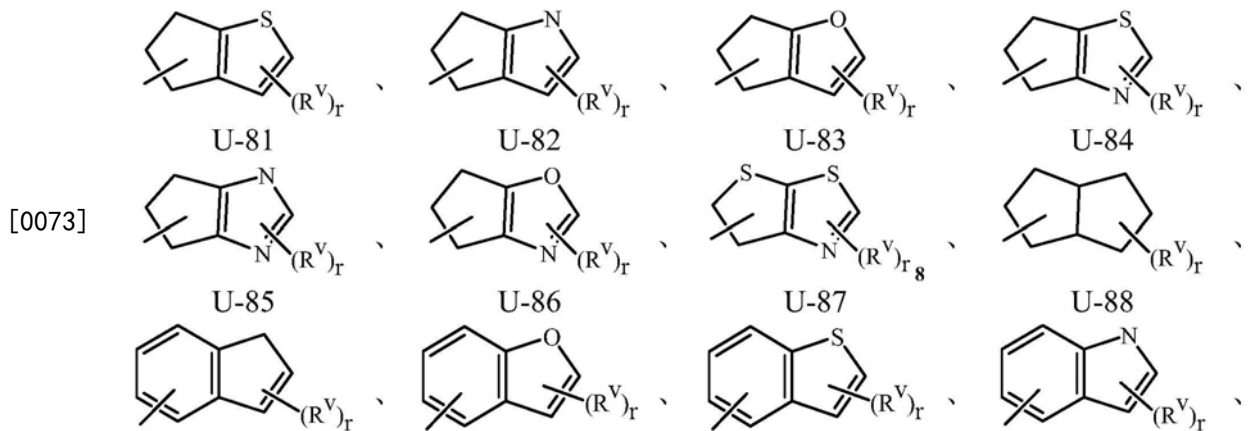
[0068] 示例2

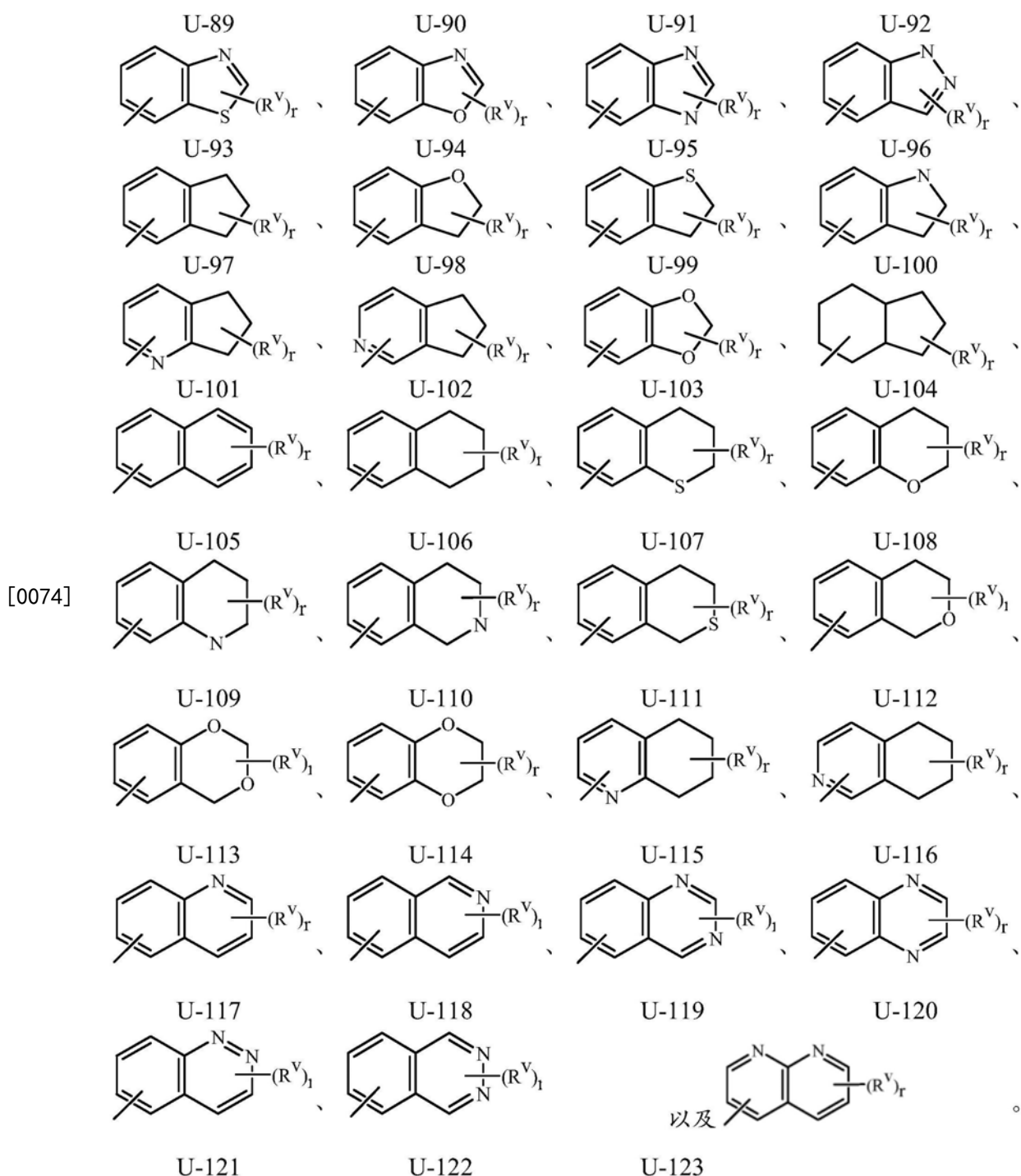




[0071] 如上所指出, Q^1 可以是 (尤其) 8-、9- 或 10- 元杂芳香族双环体系, 任选地被一或多个选自如在发明内容中所定义的取代基的组中的取代基 (即 R^9 和 R^{11}) 取代。任选地被一个或多个取代基取代的 8-、9- 或 10- 元杂芳香族双环体系的实例包括示例 3 中所示的环 U-81 至 U-123, 其中 R^v 是如在发明内容中对于 Q^1 所定义的任何取代基 (即 R^8), 并且 r 典型地是从 0 至 5 的整数。

[0072] 示例 3





[0075] 虽然在结构U-1至U-123中示出 R^V 基团,但是应注意到,因为它们是任选的取代基,所以它们不必存在。应注意到,当 R^V 为H时,当附接到原子上时,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。应注意到,当 $(R^V)_r$ 与U基团之间的附接点示出为浮动时, $(R^V)_r$ 可附接到U基团的任何可用的碳原子或氮原子。应注意到,当U基团上的附接点示出为浮动时,U基团可通过U基团的任何可用的碳或氮经由替换氢原子而附接到式1的其余部分。应注意到,一些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)。

[0076] 本领域中已知多种合成方法能够制备芳族和非芳族的杂环和环体系;对于广泛的评论,参见八卷集的Comprehensive Heterocyclic Chemistry[综合杂环化学],A.R.

Katritzky和C.W.Rees主编,Pergamon Press,Oxford[培格曼出版社,牛津],1984和十二卷集的Comprehensive Heterocyclic Chemistry II[综合杂环化学II],A.R. Katritzky,C.W.Rees和E.F.V.Scriven主编,培格曼出版社,牛津,1996。

[0077] 本发明的化合物可作为一种或多种立体异构体存在。多种立体异构体包括对映异构体、非对映异构体、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中的排列不同的异构体,并且包括对映异构体、非对映异构体、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种的分离。本领域的技术人员将理解,一种立体异构体当相对于一种或多种其他立体异构体富集时,或当与一种或多种其他立体异构体分离时,可能更有活性和/或可能表现出有益的效果。另外,熟练的技术人员知道如何分离、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、或作为光学活性形式存在。

[0078] 当对映异构体富集时,一种对映体以比另一种更大的量存在,并且富集程度可以通过定义为 $(2x-1) \cdot 100\%$ 的对映异构体过量("ee")的表达来定义,其中x是混合物中占优势的对映异构体的摩尔分数(例如,20%的ee对应于对映异构体的60:40比率)。

[0079] 优选地,本发明的组合物具有更具活性异构体的至少50%的对映异构体过量;更优选至少75%的对映异构体过量;还更优选至少90%的对映异构体过量;并且最优选至少94%的对映异构体过量。特别值得注意的是更具活性的异构体的对映纯实施例。

[0080] 式1的化合物可包含附加的手性中心。例如,取代基和其他分子成分如 R^2 和 R^3 本身可以含有手性中心。本发明包括外消旋混合物以及在这些附加的手性中心处富集的和基本上纯的立体构型。

[0081] 由于围绕式1中的酰胺键(例如, $C(Y)N(Q^2)(R^7)$)的旋转受限,本发明的化合物因此可作为一种或多种构象异构体存在。本发明包括构象异构体的混合物。此外,本发明包括相对于其他构象异构体富集在一种构象异构体中的化合物。

[0082] 式1的化合物典型地以多于一种形式存在,并且因此式1包括它们所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例诸如蜡和树胶,以及为液体的实施例诸如溶液和熔融物。结晶形式包括代表基本上单晶类型的实施例和代表多晶型物(即不同结晶类型)的混合物的实施例。术语“多晶型物”是指可以以不同晶型结晶的化合物的具体晶型,这些晶型在晶格中具有不同的分子排列和/或构象。虽然多晶型物可具有相同的化学组成,但是它们也可以在组成上由于共结晶水或其他分子的存在或不存在而不同,该共结晶水或其他分子可弱结合或强结合在晶格内。多晶型物可以在此类化学、物理、和生物特性方面不同,诸如晶体形状、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。本领域的技术人员将理解,相对于式1的相同化合物的另一种多晶型物或多晶型物的混合物,式1的化合物的多晶型物可展现出有益效果(例如适合制备有用制剂,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,包括例如采用所选溶剂和温度的结晶。对于多晶型现象的综合讨论,参见R.Hilfiker编辑的Polymorphism in the Pharmaceutical Industry[制药工业的多晶型现象],Wiley-VCH,魏因海姆(Weinheim),2006。

[0083] 本领域的技术人员将理解,不是所有的含氮杂环都可以形成N-氧化物,因为氮需

要可用的孤电子对以氧化成氧化物;本领域的技术人员将认出可形成N-氧化物的那些含氮杂环。本领域技术人员还将认识到叔胺能够形成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的技术人员非常熟知的,包括使用过氧酸诸如过氧乙酸和间-氯过氧苯甲酸(MCPBA)、过氧化氢、烷基氢过氧化物诸如叔丁基氢过氧化物、过硼酸钠和二环氧乙烷诸如二甲基二环氧乙烷来氧化杂环和叔胺。用于制备N-氧化物的这些方法已被广泛描述和综述于文献中,参见例如:T.L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis* [综合有机合成], 第7卷, 第748-750页, S.V. Ley编辑, 培格曼出版社; M. Tisler和B. Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry* [综合杂环化学], 第3卷, 第18-20页, A. J. Boulton和A. McKillop编辑, 培格曼出版社; M. R. Grimmett和B. R. T. Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry* [杂环化学进展], 第43卷, 第149-161页, A. R. Katritzky编辑, Academic Press [学术出版社]; M. Tisler和B. Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry* [杂环化学进展], 第9卷, 第285-291页, A. R. Katritzky和A. J. Boulton编辑, 学术出版社; 以及G. W. H. Cheeseman和E. S. G. Werstiuk, *杂环化学进展*, 第22卷, 第390-392页, A. R. Katritzky和A. J. Boulton编辑, 学术出版社。

[0084] 本领域的技术人员认识到, 由于在环境中和在生理条件下化合物的盐与它们相应的非盐形式处于平衡, 因此盐共享非盐形式的生物效用。因此, 多种式1的化合物的盐可用于控制不希望的植被(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酚时, 盐还包括与有机碱或无机碱形成的那些, 所述碱诸如吡啶, 三乙基胺或氨, 或钠、钾、锂、钙、镁或钡的酰胺、氢化物、氢氧化物或碳酸盐。因此, 本发明包括选自式1、其N-氧化物和农业上合适的盐的化合物。

[0085] 如在发明内容中所述的本发明的实施例包括(其中如以下实施例中所用的式1 包括其N-氧化物和盐)以下项:

[0086] 实施例1. 如式1所述的化合物(包括所有立体异构体)、其N-氧化物和盐, 包含它们的农业组合物, 以及它们作为除草剂的用途, 如发明内容中所述。

[0087] 实施例2. 如实施例1所述的化合物, 其中 Q^1 是苯基或苄基环或萘环体系, 每个环或环体系任选地被最高达5个独立地选自 R^9 的取代基取代; 或是5-至6-元完全不饱和的杂环, 每个环或环体系含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达2个O、最高达2个S和最高达4个N原子, 其中最高达3个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$, 并且这些硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_v(=NR^8)_v$, 每个环或环体系任选地被最高达5个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^9 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{10} 。

[0088] 实施例3. 如实施例2所述的化合物, 其中 Q^1 是任选地被最高达5个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环; 或是5-至6-元完全不饱和的杂环, 每个环含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达2个O、最高达2个S和最高达4个N原子, 其中最高达3个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$, 并且这些硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_v(=NR^8)_v$, 每个环或环体系任选地被最高达5个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^9 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{10} 。

[0089] 实施例4.如实施例3所述的化合物,其中 Q^1 是任选地被最高达5个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环。

[0090] 实施例5.如实施例4所述的化合物,其中 Q^1 是被1至3个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环。

[0091] 实施例6.如实施例5所述的化合物,其中 Q^1 是被1至2个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环。

[0092] 实施例7.如实施例6所述的化合物,其中 Q^1 是具有在对(4-)位处选自 R^9 的取代基(和任选地其他取代基)的苯环。

[0093] 实施例8.如实施例7所述的化合物,其中当 Q^1 是被至少两个选自 R^9 的取代基取代的苯环时,则一个取代基在(苯环的)对(4-)位处,并且至少一个其他取代基在间位处。

[0094] 实施例9.如实施例1至3中任一项所述的化合物,其中 Q^1 是5-至6-元完全不饱和的杂环,每个环含有选自碳原子和1至3个杂原子的环成员,这些杂原子独立地选自最高达1个O、最高达1个S和最高达2个N原子,其中最高达2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且这些硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^8)_v$,每个环任选地被最高达5个取代基取代,在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^9 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{10} 。

[0095] 实施例10.如实施例9所述的化合物,其中 Q^2 是苯环或萘环体系,每个环或环体系任选地被最高达5个独立地选自 R^{11} 的取代基取代;或是5-至6-元完全不饱和的杂环,每个环含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员,这些杂原子独立地选自最高达1个O、最高达1个S和最高达2个N原子,其中最高达2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且这些硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^8)_v$,每个环或环体系任选地被最高达5个取代基取代,在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{11} 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{12} 。

[0096] 实施例11.如实施例10所述的化合物,其中 Q^2 是任选地被最高达5个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环。

[0097] 实施例12.如实施例11所述的化合物,其中 Q^2 是任选地被最高达3个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环。

[0098] 实施例13.如实施例12所述的化合物,其中 Q^2 是在3-位处被1个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环。

[0099] 实施例14.如实施例10所述的化合物,其中 Q^2 是5-至6-元完全不饱和的杂环,每个环含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员,这些杂原子独立地选自最高达1个O、最高达1个S和最高达2个N原子,其中最高达2个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$,并且这些硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^8)_v$,每个环或环体系任选地被最高达5个取代基取代,在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{11} 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{12} 。

[0100] 实施例15.如实施例1至14中任一项所述的化合物,其中 R^1 和 R^2 各自独立地是H、卤素或 C_1 - C_4 烷基。

[0101] 实施例16.如实施例15所述的化合物,其中 R^1 和 R^2 各自独立地是H、Cl、或 CH_3 。

[0102] 实施例17.如实施例16所述的化合物,其中 R^1 和 R^2 各自独立地是H或Cl。

- [0103] 实施例18.如实施例17所述的化合物,其中R¹和R²各自是H。
- [0104] 实施例19.如实施例1至16中任一项所述的化合物,其中Y是O或S。
- [0105] 实施例20.如实施例19所述的化合物,其中Y是O。
- [0106] 实施例21.如实施例19所述的化合物,其中Y是S。
- [0107] 实施例22.如实施例1至21中任一项所述的化合物,其中A是含有2至4个原子的饱和的、部分不饱和的或完全不饱和的链,这些原子选自最高达3个碳、最高达1个O、最高达1个S和最高达1个N原子,其中最高达2个碳成员独立地选自 C(=O) 和C(=S) 并且该硫原子成员选自S(=O)_u(=NR⁸)_v;所述链任选地被最高达3个取代基取代,在碳原子上所述取代基独立地选自R³并且在氮原子上所述取代基独立地选自R⁴。
- [0108] 实施例23.如实施例22所述的化合物,其中A是含有2至4个原子的饱和的或部分不饱和的链,这些原子选自最高达2个碳和最高达1个N原子,其中最高达1个碳成员独立地选自C(=O) 和C(=S);所述链任选地被最高达2个取代基取代,在碳原子上所述取代基独立地选自R³并且在氮原子上所述取代基独立地选自R⁴。
- [0109] 实施例24.如实施例23所述的化合物,其中A是含有2至3个原子的饱和的或部分不饱和的链,这些原子选自最高达2个碳和最高达1个N原子,其中最高达1个碳成员独立地选自C(=O);所述链任选地被最高达1个取代基取代,在碳原子上所述取代基独立地选自R³并且在氮原子上所述取代基独立地选自R⁴。
- [0110] 实施例25.如实施例24所述的化合物,其中A是-CH₂CH₂CH₂-、-NCH₂-、-C(=O)CH₂-或-CH=CH-,其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮,并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C-(或-N-CH-)部分的氮。
- [0111] 实施例26.如实施例25所述的化合物,其中A是-CH₂CH₂CH₂-。
- [0112] 实施例27.如实施例25所述的化合物,其中A是-NCH₂-,其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮,并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C-部分的氮。
- [0113] 实施例28.如实施例25所述的化合物,其中A是-C(=O)CH₂-,其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮,并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C-部分的氮。
- [0114] 实施例29.如实施例25所述的化合物,其中A是-CH=CH-。
- [0115] 实施例30.如实施例1至29中任一项所述的化合物,其中每个R³独立地是卤素、氰基、羟基、-CO₂H、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₃-C₆环烷基或C₄-C₆环烷基烷基。
- [0116] 实施例31.如实施例30所述的化合物,其中每个R³独立地是氰基、-CO₂H、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷硫基或C₄-C₆环烷基烷基。
- [0117] 实施例32.如实施例31所述的化合物,其中每个R³独立地是氰基、-CO₂H、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。
- [0118] 实施例33.如实施例32所述的化合物,其中每个R³独立地是氰基、-CO₂H或C₁-C₄烷基。
- [0119] 实施例34.如实施例1所述的化合物,其中两个R³与它们所结合的一个或多个碳原子一起形成C₄环烷基环。
- [0120] 实施例35.如实施例1至34中任一项所述的化合物,其中每个R⁴独立地是C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基或C₃-C₆环烷基。

- [0121] 实施例36.如实施例35所述的化合物,其中每个 R^4 独立地是 C_1-C_4 烷基。
- [0122] 实施例37.如实施例36所述的化合物,其中每个 R^4 是 CH_3 。
- [0123] 实施例38.如实施例1至37中任一项所述的化合物,其中J是 $-CR^5R^6-$ 。
- [0124] 实施例39.如实施例1至37中任一项所述的化合物,其中J是 $-CR^5R^6-CR^{5a}R^{6a}-$ 其中该 $-CR^5R^6-$ 部分直接连接到N。
- [0125] 实施例40.如实施例38所述的化合物,其中J是 $-CH_2-$ 。
- [0126] 实施例41.如实施例39所述的化合物,其中J是 $-CH_2CH_2-$ 。
- [0127] 实施例42.如实施例1至39中任一项所述的化合物,其中 R^5 和 R^6 各自独立地是H、卤素、羟基或 CH_3 。
- [0128] 实施例43.如实施例42所述的化合物,其中 R^5 和 R^6 各自独立地是H或卤素。
- [0129] 实施例44.如实施例43所述的化合物,其中 R^5 和 R^6 各自是H。
- [0130] 实施例45.如实施例1至39中任一项所述的化合物,其中 R^5 和 R^6 与它们所结合的碳原子一起形成 C_4 环烷基环。
- [0131] 实施例46.如实施例1至39中任一项所述的化合物,其中 R^{5a} 和 R^{6a} 各自独立地是H或 C_1-C_4 烷基。
- [0132] 实施例47.如实施例1至46中任一项所述的化合物,其中 R^7 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} 二烷基氨基羰基或 C_4-C_{10} 环烷基氨基羰基。
- [0133] 实施例48.如实施例47所述的化合物,其中 R^7 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 卤代烷氧基烷基或 C_2-C_8 烷硫基烷基。
- [0134] 实施例49.如实施例48所述的化合物,其中 R^7 是H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基或 C_2-C_8 烷氧基烷基。
- [0135] 实施例50.如实施例49所述的化合物,其中 R^7 是H或 C_1-C_6 烷基。
- [0136] 实施例51.如实施例1至50中任一项所述的化合物,其中每个 R^8 独立地是H、氰基或 C_2-C_3 烷基羰基。
- [0137] 实施例52.如实施例51所述的化合物,其中每个 R^8 独立地是H。
- [0138] 实施例53.如实施例1至52中任一项所述的化合物,其中每个 R^9 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_4 氰基烷基、 C_1-C_4 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 炔基、 C_2-C_8 卤代炔基、 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 烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷基、 C_3-C_8 卤代烷氧基烷氧基、 C_1-C_4 羟烷基、 C_4-C_{10} 环烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烷氧基烷氧基烷基、 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、 $-C(=O)NH_2$ 、 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 烷氧基烷氧基、 C_2 - C_8 烯氧基、 C_2 - C_8 卤代烯氧基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基卤代烷氧基、 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 烷基羰基氧基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基氧基或 C_4 - C_{10} 环烷基羰基氧基。

[0139] 实施例54. 如实施例53所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_4 氰基烷基、 C_1 - C_4 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 炔基、 C_2 - C_8 卤代炔基、 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 烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_3 - C_8 卤代烷氧基烷氧基、 C_1 - C_4 羟烷基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烷氧基烷氧基烷基、 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} 环烷基氨基烷基或 C_3 - C_{10} 二烷基氨基烷基。

[0140] 实施例55. 如实施例54所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_4 氰基烷基、 C_1 - C_4 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 炔基、 C_2 - C_8 卤代炔基、 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} 烷基环烷基或 C_6 - C_{12} 环烷基环烷基。

[0141] 实施例56. 如实施例55所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_4 氰基烷基、 C_1 - C_4 氰基烷氧基或 C_1 - C_8 卤代烷基。

[0142] 实施例57. 如实施例56所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是卤素或 C_1 - C_8 卤代烷基。

[0143] 实施例58. 如实施例57所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是F、Cl或 CF_3 。

[0144] 实施例59. 如实施例58所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是F或 CF_3 。

[0145] 实施例60. 如实施例1至59中任一项所述的化合物, 其中每个 R^{11} 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_4 氰基烷基、 C_1 - C_4 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 炔基、 C_2 - C_8 卤代炔基、 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 烷氧基烷基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基烷基、 C_3 - C_8 卤代烷氧基烷氧基、 C_1 - C_4 羟烷基、 C_4 - C_{10} 环烷氧基烷基、 C_3 - C_{10} 烷氧基烷氧基烷基、 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 烷基、 C_1 - C_8 卤代烷氧基、 C_2 - C_8 烷氧基烷氧基、 C_2 - C_8 烯氧基、 C_2 - C_8 卤代烯氧基、 C_2 - C_8 卤代烷氧基卤代烷氧基、 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 烷基羰基氧基、 C_2 - C_8 卤代烷基羰基氧基、 C_4 - C_{10} 环烷基羰基氧基、 C_1 - C_8 烷基磺酰基氧基、 C_1 - C_8 卤代烷基磺酰基氧基、 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 -

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卤代烷基羰基氨基或C₂-C₈烷氧基羰基氨基。

[0146] 实施例61. 如实施例60所述的化合物, 其中每个R¹¹独立地是卤素、氰基、硝基、C₁-C₈烷基、C₁-C₄氰基烷基、C₁-C₄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炔基、C₂-C₈卤代炔基、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烷氧基烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₃-C₈卤代烷氧基烷氧基、C₁-C₄羟烷基、C₄-C₁₀环烷氧基烷基、C₃-C₁₀烷氧基烷氧基烷基、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-C₈烷基磺酰基氧基、C₁-C₈卤代烷基磺酰基氧基、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卤代烷基磺酰基或C₃-C₈环烷基磺酰基。

[0147] 实施例62. 如实施例61所述的化合物, 其中每个R¹¹独立地是卤素、氰基、硝基、C₁-C₈烷基、C₁-C₄氰基烷基、C₁-C₄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炔基、C₂-C₈卤代炔基、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、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。

[0148] 实施例63. 如实施例62所述的化合物, 其中每个R¹¹独立地是卤素、C₁-C₈烷基、C₁-C₈卤代烷基或C₁-C₈烷基磺酰基。

[0149] 实施例64. 如实施例63所述的化合物, 其中每个R¹¹独立地是F、Cl、CH₃、CF₃或-SO₂CF₃。

[0150] 实施例65. 如实施例64所述的化合物, 其中每个R¹¹独立地是F、Cl、CH₃、CF₃或-SO₂CF₃。

[0151] 实施例66. 如实施例1至65中任一项所述的化合物, 其中每个R¹⁰和R¹²独立地是C₁-C₃烷基、C₃-C₆环烷基、C₂-C₃烷氧基烷基、C₂-C₃烷基羰基、C₂-C₃烷氧基羰基或C₂-C₃烷基氨基烷基。

[0152] 实施例67. 如实施例66所述的化合物, 其中每个R¹⁰和R¹²独立地是C₁-C₃烷基、C₃-C₆环烷基或C₂-C₃烷氧基烷基。

[0153] 实施例68. 如实施例67所述的化合物, 其中每个R¹⁰和R¹²独立地是C₁-C₃烷基。

[0154] 实施例69. 如实施例68所述的化合物, 其中每个R¹⁰和R¹²独立地是CH₃。

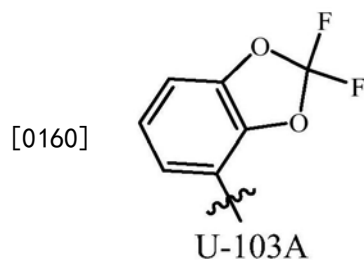
[0155] 实施例70. 如实施例1所述的化合物, 其中Q¹是8-至10元杂芳香族双环体系, 每个环体系含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达2个O和最高达2个N原子, 其中最高达3个碳环成员独立地选自C(=O)和C(=S), 每个环体系任选地被最高达4个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自R⁹并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自R¹⁰。

[0156] 实施例71. 如实施例70所述的化合物, 其中Q¹是8-至9元杂芳香族双环体系, 每个环体系含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达2个O原子, 每个环体系任选地被最高达4个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自R⁹。

[0157] 实施例72. 如实施例71所述的化合物, 其中 Q^1 是9元杂芳香族双环体系, 该体系含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达2个O原子, 每个环体系任选地被最高达4个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^9 。

[0158] 实施例73. 如实施例72所述的化合物, 其中 Q^1 是9元杂芳香族双环体系, 该体系含有选自碳原子和2个O原子的环成员, 体系任选地被最高达3个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^9 (即示例3中的U-103)。

[0159] 实施例74. 如实施例73所述的化合物, 其中 Q^1 是U-103A。



[0161] 实施例75. 如实施例1、2和10至69中任一项所述的化合物, 其中 Q^1 是任选地被1至4个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环; 或是包含选自碳原子和1至4个杂原子的环成员的5-至6-元杂芳香族环, 这些杂原子独立地选自最高达2个O、最高达2个S和最高达4个N原子, 任选地被最高达4个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^9 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{10} 。

[0162] 实施例76. 如实施例1所述的化合物, 其中 Q^2 是任选地被最高达5个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环; 或是5-至6-元完全不饱和的杂环, 每个环含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达2个O、最高达2个S和最高达4个N原子, 每个环或环体系任选地被最高达5个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{11} 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{12} 。

[0163] 实施例77. 如实施例1或76所述的化合物, 其中 Q^2 是任选地被最高达5个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环; 或是6-元完全不饱和的杂环, 每个环含有选自碳原子和1至4个独立地选自最高达4个N原子的杂原子的环成员, 每个环或环体系任选地被最高达5个独立地选自 R^{11} 的取代基在碳原子环成员上取代。

[0164] 实施例78. 如实施例77所述的化合物, 其中 Q^2 是任选地被最高达4个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环; 或是吡啶环, 任选地被最高达4个独立地选自 R^{11} 的取代基在碳原子环成员上取代。

[0165] 实施例79. 如实施例78所述的化合物, 其中 Q^2 是任选地被最高达3个独立地选自 R^{11} 的取代基在碳原子环成员上取代的3-吡啶环。

[0166] 实施例80. 如实施例79所述的化合物, 其中 Q^2 是任选地被最高达3个独立地选自 C_1 - C_8 烷基或 C_1 - C_8 卤代烷基的取代基取代的3-吡啶环。

[0167] 实施例81. 如实施例1至56或60至80中任一项所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是卤素、 C_1 - C_8 烷基或 C_1 - C_8 卤代烷基。

[0168] 实施例82. 如实施例81所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是Cl、F、 CH_3 或 CF_3 。

[0169] 实施例83. 如实施例82所述的化合物, 其中每个 R^9 独立地是 CH_3 。

[0170] 实施例84. 如实施例1至64或66至83中任一项所述的化合物, 其中每个 R^{11} 独立地是

F、Cl、CH₃或CF₃。

[0171] 实施例85. 如实施例24所述的化合物, 其中A是 -CH₂CH₂CH₂-、-CH=N-、-C(=O)CH₂-或-CH=CH-, 其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C- (或-N-CH-) 部分的氮。

[0172] 实施例86. 如实施例1至24或30至84中任一项所述的化合物, 其中A是 -CH₂CH₂CH₂-、-CH=N-、-C(CH₃)=N-、-C(CH₂CH₃)=N-、-C(CH₂CH₂CH₃)=N-、-C(CF₃)=N-、-C(=O)CH₂-或-CH=CH-, 其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C- (或-N-CH-) 部分的氮。

[0173] 实施例87. 如实施例86所述的化合物, 其中A是 -CH=N-、-C(CH₃)=N-、-C(CH₂CH₃)=N-、-C(CH₂CH₂CH₃)=N-或-C(CF₃)=N-, 其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C- (或-N-CH-) 部分的氮。

[0174] 实施例88. 如实施例1至24或30至84中任一项所述的化合物, 其中A是 -C(R³)=N-, 其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C- (或-N-CH-) 部分的氮。

[0175] 实施例89. 如实施例88所述的化合物, 其中A是 -CH=N-。

[0176] 实施例90. 如实施例88所述的化合物, 其中A是 -C(CH₃)=N-。

[0177] 实施例91. 如实施例88所述的化合物, 其中A是 -C(CH₂CH₃)=N-。

[0178] 本发明的实施例, 包括以上的实施例1-91以及任何本文所述的其他实施例, 可以以任何方式组合, 并且实施例中的变量的描述不仅涉及式1的化合物, 而且还涉及对于制备式1的化合物有用的起始化合物和中间体化合物。此外, 本发明的实施例, 包括以上的实施例1-91以及任何本文所述的其他实施例及其任何组合, 涉及本发明的组合物和方法。

[0179] 实施例A. 一种式1的化合物, 其中:

[0180] Q¹是苯基或苜基环或萘环体系, 每个环或环体系任选地被最高达5个独立地选自R⁹的取代基取代; 或是5-至6-元完全不饱和的杂环, 每个环或环体系含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达2个O、最高达2个S和最高达4个N原子, 其中最高达3个碳环成员独立地选自C(=O)和C(=S), 并且这些硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR⁸)_v, 每个环或环体系任选地被最高达5个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自R⁹并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自R¹⁰;

[0181] Q²是苯环或萘环体系, 每个环或环体系任选地被最高达5个独立地选自R¹¹的取代基取代; 或是5-至6-元完全不饱和的杂环, 每个环含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达1个O、最高达1个S和最高达2个N原子, 其中最高达2个碳环成员独立地选自C(=O)和C(=S), 并且这些硫原子环成员独立地选自S(=O)_u(=NR⁸)_v, 每个环或环体系任选地被最高达5个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自R¹¹并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自R¹²;

[0182] R¹和R²各自独立地是H、卤素或C₁-C₄烷基;

[0183] Y是O或S;

[0184] A是含有2至4个原子的饱和的、部分不饱和的或完全不饱和的链, 这些原子选自最高达3个碳、最高达1个O、最高达1个S和最高达1个N原子, 其中最高达2个碳成员独立地选自C(=O)和C(=S)并且该硫原子成员选自S(=O)_u(=NR⁸)_v; 所述链任选地被最高达3个取代

基取代,在碳原子上所述取代基独立地选自R³并且在氮原子上所述取代基独立地选自R⁴;

[0185] 每个R³独立地是卤素、氰基、羟基、-CO₂H、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₃-C₆环烷基或C₄-C₆环烷基烷基;

[0186] 每个R⁴独立地是C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基或C₃-C₆环烷基;

[0187] R⁵和R⁶各自独立地是H、卤素、羟基或CH₃;

[0188] R^{5a}和R^{6a}各自独立地是H或C₁-C₄烷基;

[0189] R⁷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-C₁₀二烷基氨基羰基或C₄-C₁₀环烷基氨基羰基;

[0190] 每个R⁸独立地是H、氰基或C₂-C₃烷基羰基;

[0191] 每个R⁹独立地是卤素、氰基、硝基、C₁-C₈烷基、C₁-C₄氰基烷基、C₁-C₄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炔基、C₂-C₈卤代炔基、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烷氧基烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₃-C₈卤代烷氧基烷氧基、C₁-C₄羟烷基、C₄-C₁₀环烷氧基烷基、C₃-C₁₀烷氧基烷氧基烷基、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、-CHO、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烷氧基烷氧基、C₂-C₈烯氧基、C₂-C₈卤代烯氧基、C₂-C₈卤代烷氧基卤代烷氧基、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烷基羰基氧基、C₂-C₈卤代烷基羰基氧基或C₄-C₁₀环烷基羰基氧基;

[0192] 每个R¹¹独立地是卤素、氰基、硝基、C₁-C₈烷基、C₁-C₄氰基烷基、C₁-C₄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炔基、C₂-C₈卤代炔基、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烷氧基烷基、C₂-C₈卤代烷氧基烷基、C₃-C₈卤代烷氧基烷氧基、C₁-C₄羟烷基、C₄-C₁₀环烷氧基烷基、C₃-C₁₀烷氧基烷氧基烷基、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、-CHO、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烷氧基烷氧基、C₂-C₈烯氧基、C₂-C₈卤代烯氧基、C₂-C₈卤代烷氧基卤代烷氧基、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烷基羰基氧

基、 C_2-C_8 卤代烷基羰基氧基、 C_4-C_{10} 环烷基羰基氧基、 C_1-C_8 烷基磺酰基氧基、 C_1-C_8 卤代烷基磺酰基氧基、 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 卤代烷基羰基氨基或 C_2-C_8 烷氧基羰基氨基；并且

[0193] 每个 R^{10} 和 R^{12} 独立地是 C_1-C_3 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_2-C_3 烷氧基烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基或 C_2-C_3 烷基氨基烷基。

[0194] 实施例B. 如实施例A所述的化合物, 其中

[0195] Q^1 是任选地被最高达5个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环; 或是5-至6-元完全不饱和的杂环, 每个环含有选自碳原子和1至4个杂原子的环成员, 这些杂原子独立地选自最高达2个O、最高达2个S和最高达4个N原子, 其中最高达3个碳环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$, 并且这些硫原子环成员独立地选自 $S(=O)_u(=NR^8)_v$, 每个环或环体系任选地被最高达5个取代基取代, 在碳原子环成员上所述取代基独立地选自 R^9 并且在氮原子环成员上所述取代基独立地选自 R^{10} ;

[0196] Q^2 是任选地被最高达5个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环;

[0197] R^1 和 R^2 各自独立地是H、Cl、或 CH_3 ;

[0198] Y是O;

[0199] A是含有2至4个原子的饱和的或部分不饱和的链, 这些原子选自最高达2个碳和最高达1个N原子, 其中最高达1个碳成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$; 所述链任选地被最高达2个取代基取代, 在碳原子上所述取代基独立地选自 R^3 并且在氮原子上所述取代基独立地选自 R^4 ;

[0200] 每个 R^3 独立地是氰基、 $-CO_2H$ 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷硫基或 C_4-C_6 环烷基烷基;

[0201] 每个 R^4 独立地是 C_1-C_4 烷基;

[0202] J是 $-CR^5R^6-$;

[0203] R^5 和 R^6 各自独立地是H或卤素;

[0204] R^7 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 卤代烷氧基烷基或 C_2-C_8 烷硫基烷基;

[0205] 每个 R^8 独立地是H;

[0206] 每个 R^9 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_4 氰基烷基、 C_1-C_4 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 炔基、 C_2-C_8 卤代炔基、 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 烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷基、 C_3-C_8 卤代烷氧基烷氧基、 C_1-C_4 羟烷基、 C_4-C_{10} 环烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烷氧基烷氧基烷基、 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} 环烷基氨基烷基或 C_3-C_{10} 二烷基氨基烷基;

[0207] 每个 R^{11} 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_4 氰基烷基、 C_1-C_4 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 炔基、 C_2-C_8 卤代炔基、 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 烷氧基烷基、 C_2-C_8 卤代烷氧基烷基、 C_3-C_8 卤代烷氧基烷氧基、 C_1-C_4 羟烷基、 C_4-C_{10} 环烷氧基烷基、 C_3-C_{10} 烷氧基烷氧基烷基、 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_1-C_8 烷基磺酰基氧基、 C_1-C_8 卤代烷基磺酰基氧基、 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 卤代烷基磺酰基或 C_3-C_8 环烷基磺酰基；并且

[0208] 每个 R^{10} 和 R^{12} 独立地是 C_1-C_3 烷基、 C_3-C_6 环烷基或 C_2-C_3 烷氧基烷基。

[0209] 实施例C. 如实施例B所述的化合物, 其中

[0210] Q^1 是任选地被最高达5个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环；

[0211] Q^2 是任选地被最高达3个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环；

[0212] R^1 和 R^2 各自独立地是H或Cl；

[0213] A是含有2至3个原子的饱和的或部分不饱和的链, 这些原子选自最高达2个碳和最高达1个N原子, 其中最高达1个碳成员独立地选自 $C(=O)$; 所述链任选地被最高达1个取代基取代, 在碳原子上所述取代基独立地选自 R^3 并且在氮原子上所述取代基独立地选自 R^4 ;

[0214] 每个 R^3 独立地是氰基、 $-CO_2H$ 或 C_1-C_4 烷基；

[0215] 每个 R^4 是 CH_3 ；

[0216] R^5 和 R^6 各自独立地是H或卤素；

[0217] R^7 是H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基或 C_2-C_8 烷氧基烷基；

[0218] 每个 R^9 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_4 氰基烷基、 C_1-C_4 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 炔基、 C_2-C_8 卤代炔基、 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} 烷基环烷基或 C_6-C_{12} 环烷基环烷基；并且

[0219] 每个 R^{11} 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_4 氰基烷基、 C_1-C_4 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 炔基、 C_2-C_8 卤代炔基、 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_1-C_8 烷基磺酰基、 C_1-C_8 卤代烷基磺酰基或 C_3-C_8 环烷基磺酰基。

[0220] 实施例D. 如实施例C所述的化合物, 其中

[0221] Q^1 是被1至3个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环；

[0222] Q^2 是在3-位处被1个独立地选自 R^{11} 的取代基取代的苯环；

[0223] R^1 和 R^2 各自是H；

[0224] A是 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-NCH_2-$ 、 $-C(=O)CH_2-$ 或 $-CH=CH-$, 其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C-部分的氮；

[0225] 每个 R^9 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_4 氰基烷基、 C_1-C_4 氰基烷氧基或 C_1-C_8 卤代烷基；并且

[0226] 每个 R^{11} 独立地是卤素、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_8 卤代烷基或 C_1-C_8 烷基磺酰基。

[0227] 实施例E. 如实施例D所述的化合物, 其中

[0228] Q^1 是被1至2个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环；

- [0229] A是 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$;
- [0230] 每个 R^9 独立地是卤素或 C_1-C_8 卤代烷基;并且
- [0231] 每个 R^{11} 独立地是F、Cl、 CH_3 、 CF_3 或 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 。
- [0232] 实施例F. 如实施例D所述的化合物, 其中
- [0233] Q^1 是被1至2个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环;
- [0234] A是 $-\text{NCH}_2-$, 其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C-部分的氮;
- [0235] 每个 R^9 独立地是F、Cl、 CF_3 ; 并且
- [0236] 每个 R^{11} 独立地是F、Cl、 CH_3 、 CF_3 或 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 。
- [0237] 实施例G. 如实施例C所述的化合物, 其中
- [0238] A是 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-(\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CF}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ 或 $-\text{CH}=\text{CH}-$, 其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C- (或-N-CH-) 部分的氮;
- [0239] 每个 R^9 独立地是卤素、氰基、硝基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_4 氰基烷基、 C_1-C_4 氰基烷氧基或 C_1-C_8 卤代烷基; 并且
- [0240] 每个 R^{11} 独立地是卤素、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_8 卤代烷基或 C_1-C_8 烷基磺酰基。
- [0241] 实施例H. 如实施例G所述的化合物, 其中
- [0242] A是 $-\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{N}-$ 或 $-\text{C}(\text{CF}_3)=\text{N}-$, 其中向左边伸出的键连接到该-N-J-部分的氮, 并且向右边伸出的键连接到式1的该-N=C- (或-N-CH-) 部分的氮;
- [0243] 每个 R^9 独立地是卤素、 C_1-C_8 烷基或 C_1-C_8 卤代烷基; 并且
- [0244] 每个 R^{11} 独立地是F、Cl、 CH_3 或 CF_3 。
- [0245] 本发明的具体实施例包括选自以下项的发明内容的化合物:
- [0246] N-(2-氟苯基)-6,7-二氢-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺; 以及
- [0247] N-(2-氟苯基)-2,3,6,7-四氢-3-氧代-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[1,2-a]咪唑-7-甲酰胺。
- [0248] 本发明还涉及一种用于控制不希望植被的方法, 该方法包括向该植被所在地施用除草有效量的本发明的化合物(例如, 作为本文所述的组合物)。应注意作为与使用方法有关的实施例是涉及上述实施例的化合物的那些。本发明的化合物特别可用于选择性地控制作物如小麦、大麦、玉蜀黍、大豆、向日葵、棉、油菜和稻以及特种作物如甘蔗、柑橘、水果和坚果作物中的阔叶杂草。
- [0249] 另外值得注意作为实施例是包含上述实施例的化合物的本发明的除草组合物。
- [0250] 本发明还包括一种除草混合物, 该除草混合物包含(a)选自式1、其N-氧化物和盐的化合物和(b)至少一种选自以下项的附加活性成分: (b1)光系统II抑制剂, (b2)乙酰羟酸合酶(AHAS)抑制剂, (b3)乙酰辅酶A羧化酶(ACCase)抑制剂, (b4)生长素模拟物, (b5)5-烯醇-丙酮酸莽草酸-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(PPO)抑制剂, (b8)谷氨酰胺合成酶(GS)抑制剂, (b9)极长链脂肪酸(VLCFA)延长酶抑制剂, (b10)生长素转运抑制剂, (b11)八氢番茄红素脱氢酶(PDS)抑制剂, (b12)4-羟基苯

基-丙酮酸双加氧酶 (HPPD) 抑制剂, (b13) 尿黑酸茄尼转移酶 (HST) 抑制剂, (b14) 纤维素生物合成抑制剂, (b15) 其他除草剂, 包括有丝分裂干扰剂、有机含砷化合物、磺草灵、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、调节膦、调节膦-铵、海丹托西丁 (hydantocidin)、威百亩、甲基杀草隆、油酸、噁嗪草酮、壬酸和稗草畏, 和 (b16) 除草剂安全剂; 以及 (b1) 到 (b16) 的化合物的盐。

[0251] “光系统II抑制剂” (b1) 是在 Q_B -结合位置处结合到D-1蛋白质上并因此在叶绿体类囊体膜中阻断电子从 Q_A 传输至 Q_B 的化合物。由穿过光系统II被阻断的电子通过一系列反应转移以形成毒性化合物, 这些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 -结合位置具有三个不同的结合位点: 结合位点A结合三嗪如莠去津、三嗪酮如环嗪酮、以及尿嘧啶如除草定, 结合位点B 结合苯基脲如敌草隆, 并且结合位点C结合苯并噻二唑如灭草松、腈如溴苯腈以及苯基-哒嗪如哒草特。光系统II抑制剂的实例包括莠去津、氨唑草酮、莠去津、灭草松、除草定、杀草全、溴苯腈、氯溴隆、杀草敏、绿麦隆、枯草隆、苄草隆、草净津、杀草隆、甜菜安、敌草净、噁唑隆、异戊净、敌草隆、磺隆、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、溴谷隆、甲氧隆、赛克津、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、氯苯吡啶 (pyridafol)、哒草特、环草隆、西玛津、西草净、特丁噻草隆、特草定、特丁通、特丁津、去草净和草达津。值得注意的是与莠去津、溴草腈或赛克津混合的本发明的化合物。

[0252] “AHAS抑制剂” (b2) 是抑制乙酰羟酸合酶 (AHAS) (也称为乙酰乳酸合酶 (ALS)) 的化合物, 并因此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生产来杀死植物。AHAS抑制剂的实例包括酰嘧磺隆、四唑嘧磺隆、苄嘧磺隆、双草醚钠、氯酯磺草胺、氯嘧磺隆、氯磺隆、醚磺隆、环丙嘧磺隆、双氯磺草胺、胺苯磺隆、乙氧嘧磺隆、啶嘧磺隆、双氟磺草胺、氟酮磺隆-钠、唑嘧磺草胺、氟啶嘧磺隆、氟啶嘧磺隆钠、甲酰胺磺隆、氯吡嘧磺隆、咪草酸、甲氧咪草烟、甲咪唑烟酸、灭草烟、灭草嗪、咪草烟、唑吡嘧磺隆、甲基磺隆 (包括钠盐)、碘嗪磺隆 (iofensulfuron) (2-碘-N-[[(4-甲氧基-6-甲基-1,3,5-三嗪-2-基) 氨基] 羰基] 苯磺酰胺)、甲磺胺磺隆、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、烟嘧磺隆、环氧嘧磺隆、五氟磺草胺、氟氯磺隆、丙苯磺隆-钠、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、嘧啶脒草醚、环酯草醚、嘧草醚、嘧硫草醚-钠、砒嘧磺隆、甲嘧磺隆、磺酰磺隆、噁酮磺隆、噁吩磺隆、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-甲基甲磺酰胺)、醚苯磺隆、苯磺隆、三氟啶磺隆 (包括钠盐)、氟胺磺隆和三氟甲磺隆。值得注意的是与烟嘧磺隆、氟嘧啶磺隆或氯嘧磺隆混合的本发明的化合物。

[0253] “ACCase抑制剂” (b3) 是抑制乙酰辅酶A羧化酶的化合物, 该酶负责催化植物中脂质和脂肪酸合成的早期步骤。脂质是细胞膜的主要组分, 并且没有脂质, 则不能产生新细胞。乙酰辅酶A羧化酶的抑制和后续脂质生产的缺乏导致细胞膜完整性丧失, 尤其是在活跃生长区域如分生组织中。最终幼苗和根茎生长停止, 并且幼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、丁苯草酮、烯草酮、炔草酯、噁草酮、氰氟草酯、禾草灵、噁唑禾草灵、吡氟禾草灵、吡氟氯禾灵、唑啉草酯、环苯草酮、噁草酯、喹禾灵、稀禾定、得杀草

和脲草酮,包括经解析形式,诸如精噁唑禾草灵、精吡氟禾草灵、精吡氟氯禾灵和精喹禾灵以及酯形式如炔草酯、氰氟草酯、禾草灵和精噁唑禾草灵。值得注意的是与唑啉草酯或喹禾灵混合的本发明的化合物。

[0254] 生长素是调节许多植物组织的生长的植物激素。“生长素模拟物”(b4)是模拟植物生长激素生长素的化合物,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环丙嘧啶酸(6-氨基-5-氯-2-环丙基-4-嘧啶羧酸)及其甲基和乙基酯及其钠盐和钾盐、氯氨吡啶酸、草除灵-乙酯、草灭平、氯酰草膦、稗草胺、二氯吡啶酸、麦草畏、2,4-D、2,4-DB、滴丙酸、氯氟吡氧乙酸、氟氯吡啶酯(haloxifen)(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、毒莠定、二氯喹啉酸、氯甲喹啉酸、2,3,6-TBA、绿草定、以及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。值得注意的是与麦草畏混合的本发明的化合物。

[0255] “EPSP合酶抑制剂”(b5)是抑制酶,5-烯醇-丙酮酰莽草酸-3-磷酸酯合酶的化合物,该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)。

[0256] “光系统I电子转向剂”(b6)是从光系统I中接收电子,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”,从而导致快速叶片萎蔫和干枯,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。

[0257] “PPO抑制剂”(b7)是抑制酶原卟啉原氧化酶的化合物,其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-钠、唑啉草酮、双苯嘧草酮、甲羧除草醚、氟丙嘧草酯、唑啉草酯、三唑啉草酯、甲氧除草醚、吲哚啉草酯、异丙吡草酯、氟吡啶草酯、氟胺草酯、丙炔氟草胺、乙羧氟草醚、氟噻甲草酯、氟磺胺草醚、氟硝磺酰胺(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、苯嘧磺草胺、甲磺草胺、噻二唑草胺、trifludimoxazin(二氢-1,5-二甲基-6-巯基-3-[2,2,7-三氟-3,4-二氢-3-氧基-4-(2-丙-1-基)-2H-1,4-苯并噁嗪-6-基]-1,3,5-三嗪-2,4(1H,3H)-二酮)和氟丙嘧草酯(tiafenacil)(N-[2-[[2-氯-5-[3,6-二氢-3-甲基-2,6-二氧基-4-(三氟甲基)-1(2H)-嘧啶基]-4-氟苯基]巯基]-1-氧代丙基]-β-丙氨酸甲酯)。

[0258] “GS抑制剂”(b8)是抑制谷氨酰胺合成酶的活性的化合物,植物使用该酶以将氨转化为谷氨酰胺。因此,氨累积并且谷氨酰胺水平降低。由于氨毒性和其他代谢过程所需的氨基酸的缺乏的联合效应,植物损害可能出现。GS抑制剂包括草胺磷及其酯和盐,诸如草胺磷和其他草胺磷衍生物、草胺磷-P((2S)-2-氨基-4-(羟基甲基氧膦基)丁酸)和双丙氨膦(bilanaphos)。

[0259] “VLCFA延长酶抑制剂”(b9)是具有各种化学结构的除草剂,其抑制延长酶。延长酶是位于叶绿体中或附近的酶之一,其在VLCFA的生物合成中被涉及。在植物中,极长链脂肪酸是疏水聚合物的主要成分,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、苯酮唑、二甲草胺、噻吩草胺、双苯酰草胺、异噁苯砜 (fenoxasulfone) (3-[[(2,5-二氯-4-乙氧基苯基) 甲基] 磺酰基]-4,5-二氢-5,5-二甲基异噁唑)、四唑酰草胺、氟噻草胺、茚草酮、苯噻草胺、吡唑草胺、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、罗克杀草砜 (pyroxasulfone) 和甲氧噻草胺, 包括经解析形式诸如精异丙甲草胺和氯乙酰胺和氧乙酰胺。值得注意的是与氟噻草胺混合的本发明的化合物。

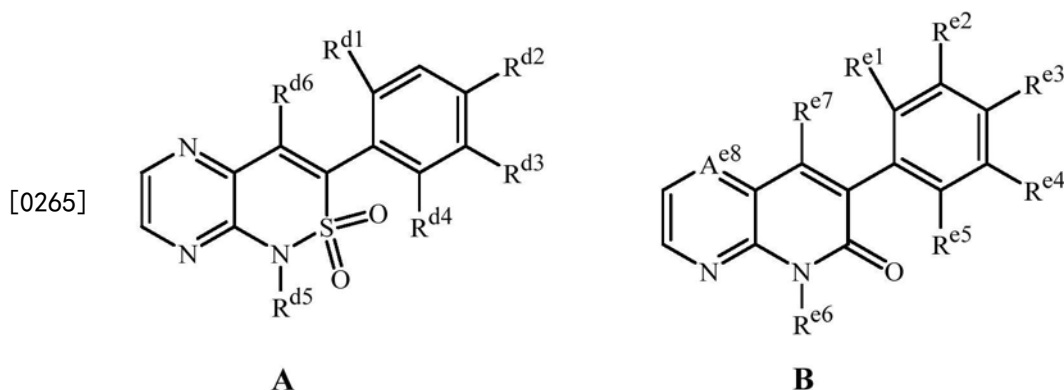
[0260] “生长素传输抑制剂” (b10) 是抑制植物中生长素传输的化学物质, 诸如通过与生长素-载体蛋白质结合。生长素传输抑制剂的实例包括氟吡草腓、萘草胺 (也称为N-(1-萘基)-邻氨甲酰基苯甲酸和2-[(1-萘基氨基) 羰基] 苯甲酸)。

[0261] “PDS抑制剂 (b11)” 是在八氢番茄红素去饱和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、吡氟草胺、氟啶草酮、氟咯草酮、呋草酮、氟草敏 (norflurzon) 和氟吡酰草胺。

[0262] “HPPD抑制剂” (b12) 是抑制4-羟基-苯基-丙酮酸酯双加氧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] 双环[3.2.1] 辛-3-烯-2-酮)、芬昆诺三酮 (fenquinotrione) (2-[[8-氯-3,4-二氢-4-(4-甲氧基苯基)-3-氧基-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、磺酰草吡啶、吡唑特、苜草唑、磺草酮、特呋三酮、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)、苯吡唑草酮、5-氯-3-[(2-羟基-6-氧基-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-氧基-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-氧基-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。值得注意的是与硝磺草酮或pyrasulfatole混合的本发明的化合物。

[0263] “HST抑制剂” (b13) 破坏植物将尿黑酸转化成2-甲基-6-茄尼基-1,4-苯并醌的能力, 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、环比瑞摩 (cyclopyrimorate) (6-氯-3-(2-环丙基-6-甲基苯氧基)-4-吡嗪基-4-吗啉羧酸酯)、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-羟基吡咯并[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。

[0264] HST抑制剂还包括式A和B的化合物。



[0266] 其中 R^{d1} 是H、Cl或 CF_3 ； R^{d2} 是H、Cl或Br； R^{d3} 是H或Cl； R^{d4} 是H、Cl或 CF_3 ； R^{d5} 是 CH_3 、 CH_2CH_3 或 CH_2CHF_2 ；并且 R^{d6} 是OH、或 $-OC(=O)-i-Pr$ ；并且 R^{e1} 是H、F、Cl、 CH_3 或 CH_2CH_3 ； R^{e2} 是H或 CF_3 ； R^{e3} 是H、 CH_3 或 CH_2CH_3 ； R^{e4} 是H、F或Br； R^{e5} 是Cl、 CH_3 、 CF_3 、 OCF_3 或 CH_2CH_3 ； R^{e6} 是H、 CH_3 、 CH_2CHF_2 或 $C\equiv CH$ ； R^{e7} 是OH、 $-OC(=O)Et$ 、 $-OC(=O)-i-Pr$ 或 $-OC(=O)-t-Bu$ ；并且 A^{e8} 是N或CH。

[0267] “纤维素生物合成抑制剂” (b14) 抑制某些植物中的纤维素的生物合成。当对幼嫩或快速生长的植物出苗前施用或出苗后早期施用时，它们是最有效的。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、三嗪茛草胺 (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)、异噁酰草胺和三嗪氟草胺。

[0268] “其他除草剂” (b15) 包括通过多种不同作用模式起作用的除草剂，诸如有丝分裂干扰剂 (例如，麦草氟甲酯和麦草氟异丙酯)、有机含砷化合物 (例如，DSMA和MSMA)、7,8-二氢叶酸合成抑制剂、叶绿体类异戊二烯合成抑制剂和细胞壁生物合成抑制剂。其他除草剂包括具有未知作用模式或不落入 (b1) 至 (b14) 列出的具体类别中或通过以上列出的作用模式的组合起作用的那些除草剂。其他除草剂的实例包括苯草醚、磺草灵、杀草强、溴丁酰草胺、环庚草醚、异噁草酮、苄草隆、杀草隆、野燕枯、乙氧苯草胺、伏草隆、抑草丁、调节膦、调节膦-铵、棉隆、杀草隆、三唑酰草胺 (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、噁嗪草酮、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。

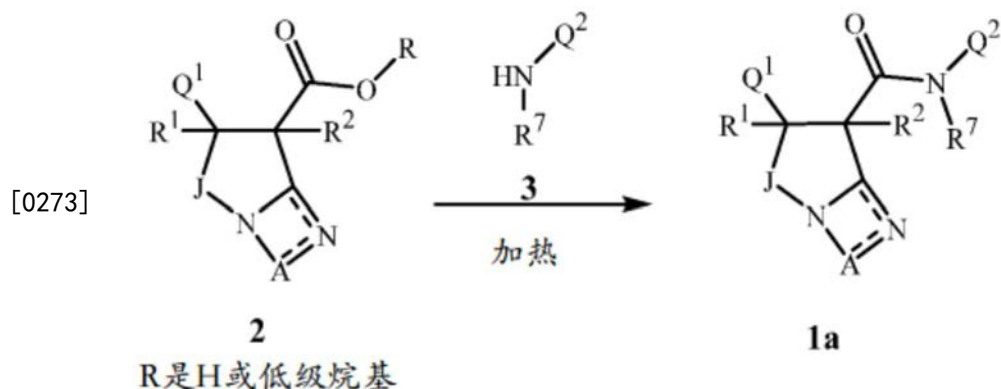
[0269] “除草剂安全剂” (b16) 是加入除草剂制剂中以消除或减少除草剂对某些作物的植物性毒素效应的物质。这些化合物保护作物免受除草剂伤害，但通常不能防止除草剂控制不期望的植被。除草剂安全剂的实例包括但不限于解草酮、解草酯、苄草隆、解草胺腈、环丙磺酰胺、杀草隆、二氯丙烯胺、大赛克农 (dicyclonon)、增效磷 (dietholate)、哌草丹、解草啞、解草啞、解草安、氟草肟、解草噁啞、双苯噁啞酸、吡啶解草酯、梅芬内 (mephenate)、去草酮、萘二甲酸酐、解草腈、N-(氨基羰基)-2-甲基苯磺酰胺和N-(氨基羰基)-2-氟苯磺酰胺、1-溴-4-[(氯甲基) 磺酰基] 苯、2-(二氯甲基)-2-甲基-1,3-二氧戊环 (MG191)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺 [4.5] 癸烷 (MON 4660)、2,2-二氯-1-(2,2,5-三甲基-3-噁啞烷基)-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。

[0270] 式1的化合物可以通过合成有机化学领域中已知的通用方法与以下在方案1至21中所示的方法及其变体组合来制备。以下式1至17的化合物中的 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{5a} 、 R^{6a} 、 Q^1 、 Q^2 和Y的定义如以上发明内容中所定义，除非另外指出。式1a、2a、4a、6a、8a、10a和

13a的化合物分别是式1、2、4、8、10和13 的化合物的不同子集。式1b、2b、8b、10b和13b的化合物分别是式1、2、8、10 和13的化合物的不同子集。式1c、8c、10c、和13c的化合物分别是式1、8、10和 13的化合物的不同子集。式10d和10e的化合物是式10的化合物的不同子集。除非另外指出,否则对于每个子集式的取代基如对于其母本式所定义的。主要发现分别由 Q^1 和 $(Y)N(Q^2)(R^7)$ 表示的式1的化合物的取代基是呈反式构型。在一些情况下,可以通过NMR检测到少量的顺式异构体的存在。

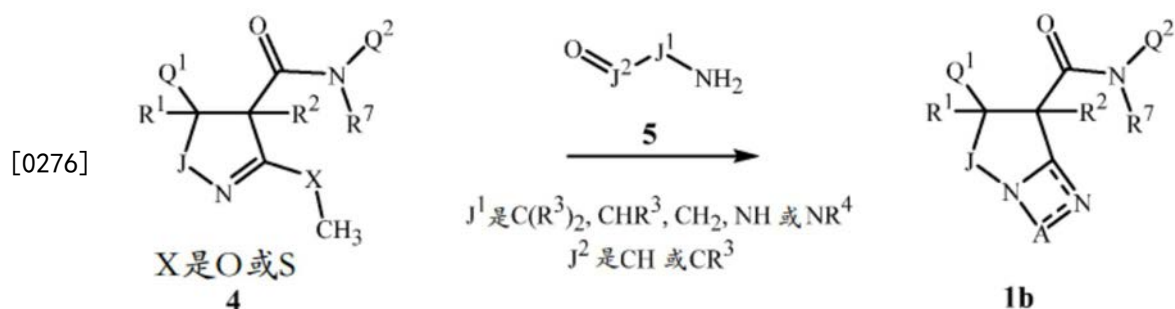
[0271] 如方案1中所示,式1a的化合物(即其中 R^1 是H; R^2 是H;并且Y是O的式 1的化合物)可以通过经由在高于 100°C 的温度下加热,任选地在溶剂的存在下的式 2的酯与过量的式3的胺的反应来制备。方案1的方法通过合成实例1中的步骤E、合成实例2和3中的步骤D和合成实例4中的步骤A来说明。

[0272] 方案1



[0274] 如方案2中所示,式1b的化合物(即其中A是含有碳或氧原子的链; R^7 是 H;并且Y是O的式1的化合物)可以通过式4的化合物的环化来制备。环化在中性条件或酸性条件下,使用合适的式5的含氮化合物,例如但不限于氨基缩醛、氨基醛、氨基酮和酰肼,进行。用于反应的合适的酸包括无机酸如盐酸、氢溴酸和硫酸,以及有机酸如乙酸和三氟乙酸。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于水、甲醇、乙醇和四氢呋喃。该反应在从 -20°C 至溶剂的沸点、并且典型地从 0°C 至 10°C 的范围内的温度下进行。方案2的方法通过合成实例1的步骤D、合成实例3 的步骤F、合成实例4的步骤C、和合成实例5的步骤A来说明。

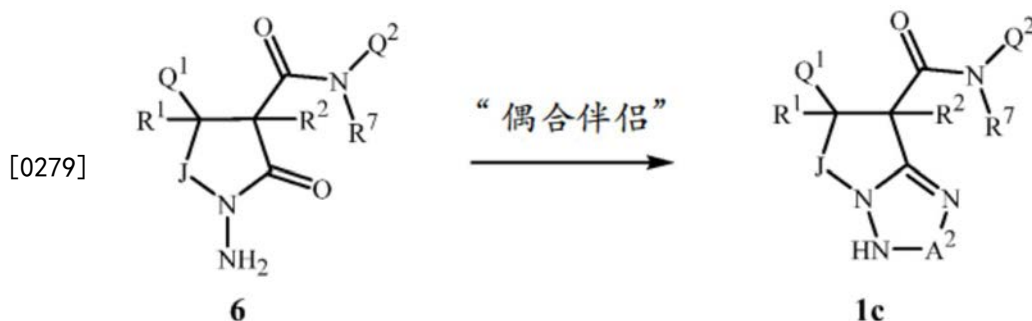
[0275] 方案2



[0277] 如方案3中所示,式1c的化合物(即其中 R^1 是H; R^2 是H;Y是O;并且A 是 $-NHA^2-$ 的式1的化合物)可以通过在“偶合伴侣(coupling partner)”的存在下式 6的N-氨基内酰胺的环化来制备。用于反应的“偶合伴侣”可以单独地或组合地选自伯酰胺、酰氯、二硫化碳、氰化物如氰化钠或氰化钾或氨。环化可任选地在活化剂的存在下并且典型地在共溶剂的存在下进行。用于反应的合适的活化剂包括但不限于金属氯化物如氯化锌和羧酸如乙酸和丙酸。

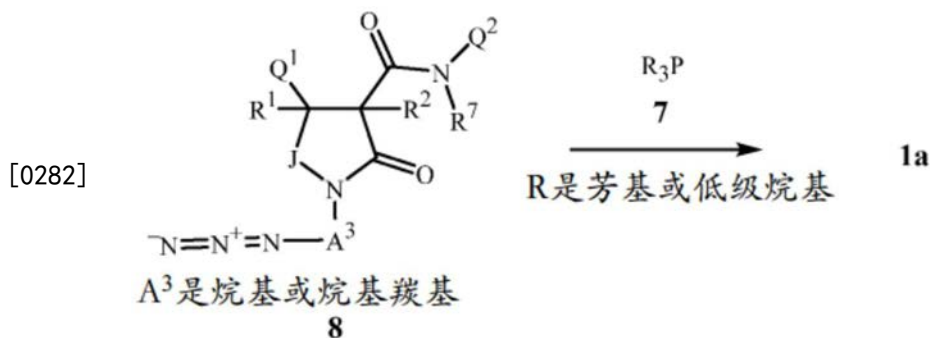
多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于乙酸、甲苯、苯、二甲苯、二硫化碳、N,N-二甲基甲酰胺和四氢呋喃。该反应在从-20℃至溶剂的沸点、并且典型地从0℃至150℃的范围内的温度下进行。方案3的方法由合成实例1的步骤G说明。

[0278] 方案3



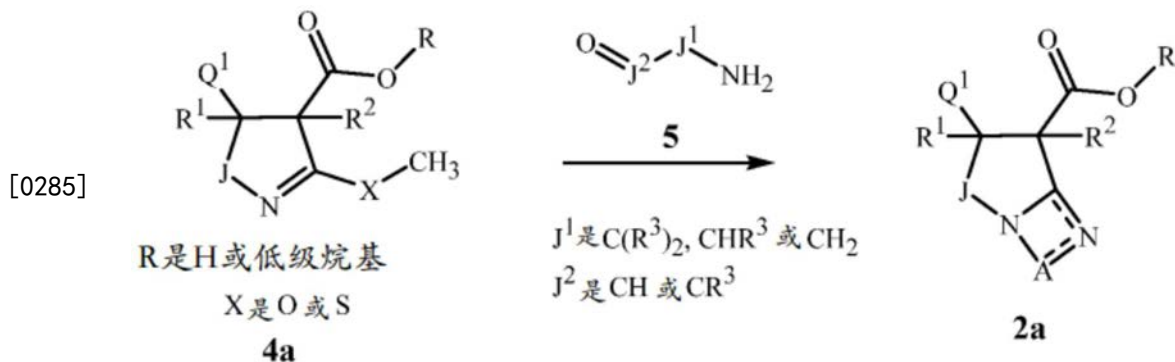
[0280] 如方案4中所示,式1a的化合物也可以通过式8的叠氮内酰胺的环化来制备。环化可通过式7的有机膦、典型地在共溶剂的存在下进行。用于反应的合适的有机膦包括但不限于三苯基膦或三正丁基膦。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于苯、氯苯、四氯化碳和四氢呋喃。该反应在从-20℃至溶剂的沸点、并且典型地从0℃至100℃的范围内的温度下进行。方案4的方法由合成实例2的步骤C说明。

[0281] 方案4



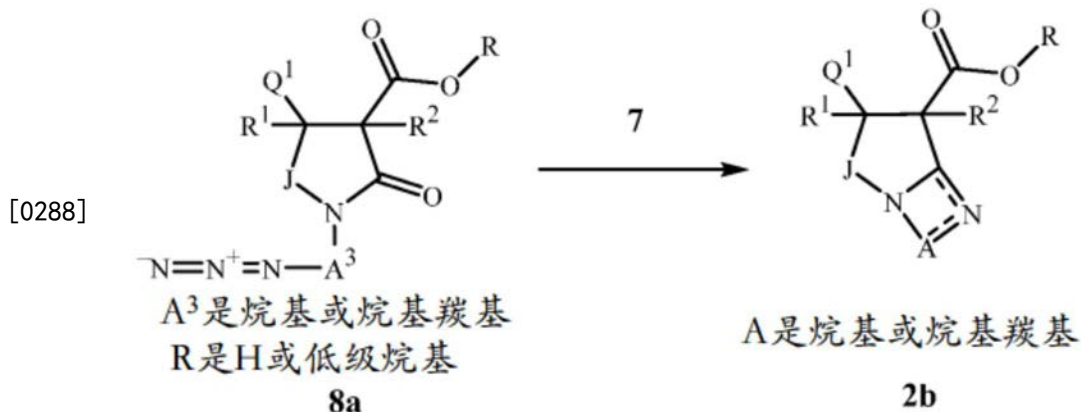
[0283] 如方案5中所示,式2a的化合物可以通过式4a的化合物的环化来制备。环化可以在中性条件或酸性条件下,使用合适的含氮化合物,例如但不限于氨基缩醛、氨基醛、氨基酮和酰肼,进行。用于反应的合适的酸包括但不限于无机酸如盐酸、氢溴酸和硫酸,以及有机酸如乙酸和三氟乙酸。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于水、甲醇、乙醇和四氢呋喃。该反应在从-20℃至溶剂的沸点、并且典型地从0℃至100℃的范围内的温度下进行。

[0284] 方案5



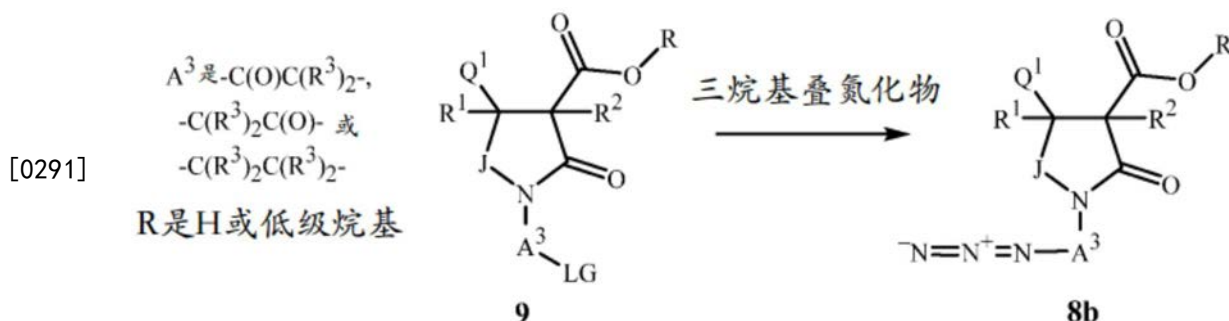
[0286] 如方案6中所示,式2b的化合物可以通过式8a的叠氮内酰胺的环化来制备。环化可通过有机膦、典型地在共溶剂的存在下进行。用于反应的示例性有机膦包括三苯基膦或三正丁基膦。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于苯、氯苯、四氯化碳和四氢呋喃。该反应在从-20℃至溶剂的沸点、并且典型地从0℃至100℃的范围内的温度下进行。

[0287] 方案6



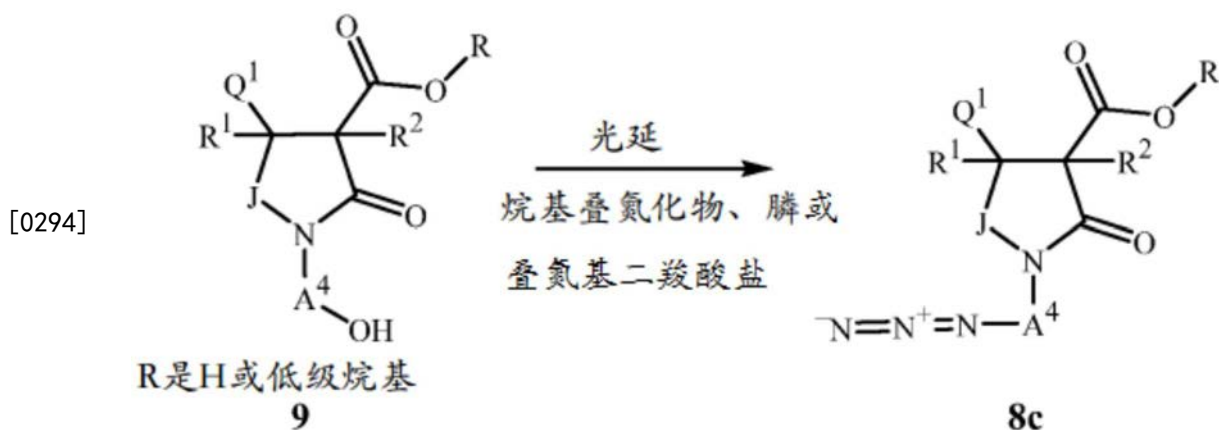
[0289] 如方案7中所示,式8b的化合物可以通过式9的内酰胺的取代来制备。取代用无机叠氮化物或三烷基甲硅烷基叠氮化物、典型地在共溶剂的存在下进行。用于反应的合适的叠氮化物包括但不限于无机叠氮化物如叠氮化钠和三烷基甲硅烷基叠氮化物如叠氮基三甲基硅烷。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砜和乙醇。该反应在从-20℃至溶剂的沸点、并且典型地从0℃至100℃的范围内的温度下进行。方案7的方法由合成实例2 的步骤B说明。

[0290] 方案7



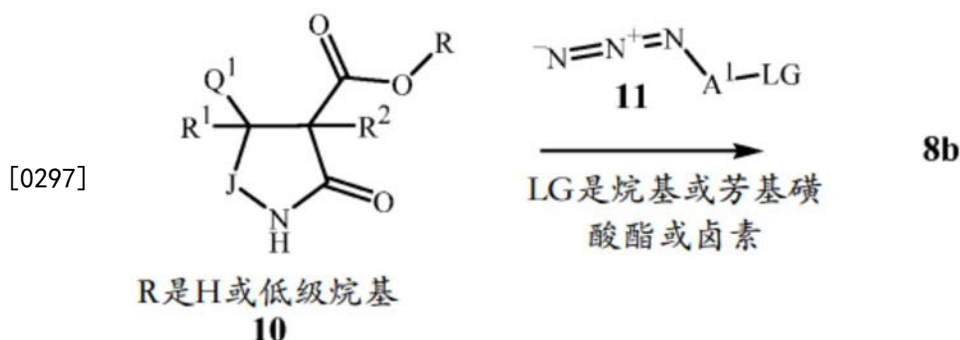
[0292] 如方案8中所示,式8c的化合物可以通过式9的醇的取代通过光延 (Mitsunobu) 取代法来制备。其典型地用叠氮化物、膦和偶氮二羧酸盐,在共溶剂的存在下进行。用于反应的合适的叠氮化物包括但不限于二苯基磷酰基叠氮化物和叠氮基三甲基硅烷。用于反应的合适的膦包括但不限于三苯基膦或三正丁基膦。用于反应的合适的膦包括但不限于偶氮二羧酸二乙酯和偶氮二羧酸二叔-丁酯。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于N,N-二甲基甲酰胺和四氢呋喃。该反应在从-20℃至溶剂的沸点、并且典型地从0℃至100℃的范围内的温度下进行。例如这种类型的转化参见Org.Lett.[有机化学通讯]2008,10(14),2997-3000和J.O.C.[有机化学期刊]1999,64(16),6049-6055。

[0293] 方案8



[0295] 如方案9中所示,式8b的化合物可以通过使式10的化合物与式11的化合物反应来制备。取代任选地在碱的存在下、典型地在共溶剂的存在下进行。用于反应的合适的碱包括但不限于氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾,碳酸盐如碳酸钠和碳酸钾,以及含氮碱如三乙胺、N,N-二异丙胺和1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砜、乙醇、甲醇、乙腈和四氢呋喃。该反应在从-20℃至溶剂的沸点、并且典型地从0℃至100℃的范围内的温度下进行。式10的化合物(其中J是-CR⁵R⁶-)可以以多种方式制备,如PCT/US2014/068073(WO 2015/084796)中所述。式10的化合物(其中J是-CR⁵R⁶-CR^{5a}R^{6a}-)可以以多种方式制备,如PCT/US2014/38473(WO 2016/003997)中所述。

[0296] 方案9

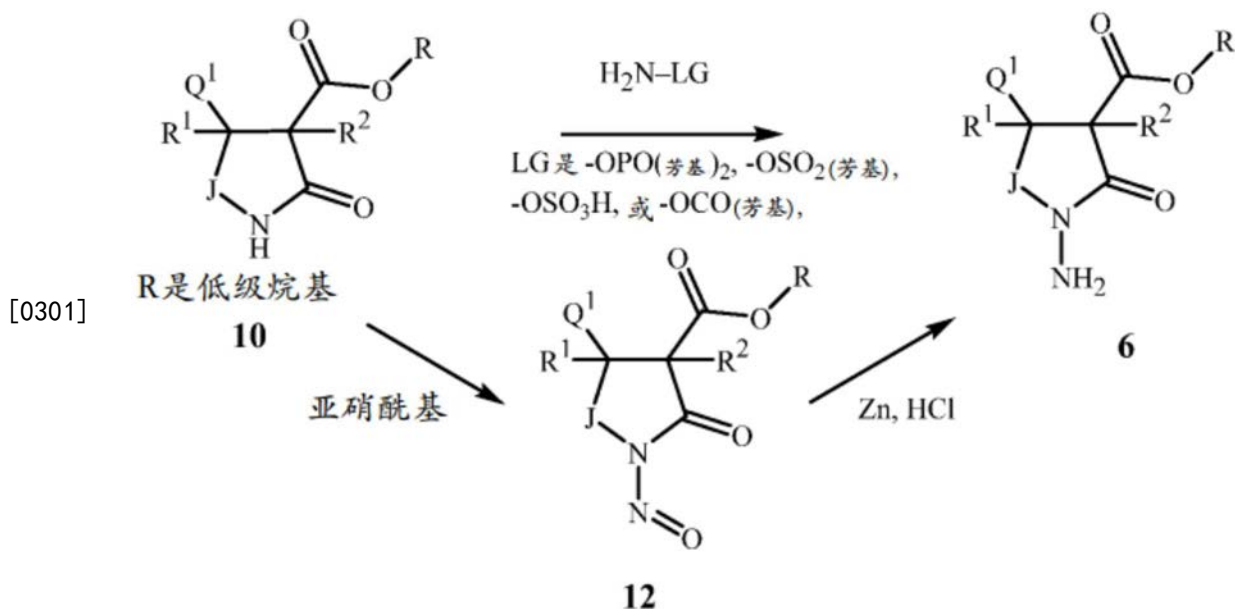


[0298] 如方案10中所示,式6的化合物可以通过式10的内酰胺的N-氨基化来制备。氨基化使用亲电氨基化试剂、任选地在碱的存在下并且典型地在共溶剂的存在下进行。合适的亲电氨基化试剂包括但不限于N-氯胺、0-二苯基磷酰基羟胺、0-莱基(mesityl)磺酰基羟胺、0-磺酸羟胺、0-莱酰基羟胺和0-2,4-二硝基苯基羟胺。用于反应的合适的碱包括但不限于氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾,醇盐如乙醇钠和乙醇钾,碳酸盐如碳酸钠和碳酸钾,氢化钠,金属酰胺如二异丙基氨基锂和六甲基二硅氮烷钠,以及中性含氮碱如三乙胺、N,N-二异丙胺和1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于二甲苯、甲苯、苯、二乙醚、N,N-二甲基甲酰胺和四氢呋喃。该反应在从-20℃至溶剂的沸点、并且典型地从0℃至150℃的范围内的温度下进行。

[0299] 可替代地,N-氨基化可以通过两步程序来实现,该两步程序通过式12的中间体N-亚硝基内酰胺的形成和随后还原进行。式12的N-亚硝基内酰胺化合物可以通过在活化剂的存在下并且典型地在共溶剂的存在下进行式10的内酰胺与适当的亚硝基化剂的反应来获

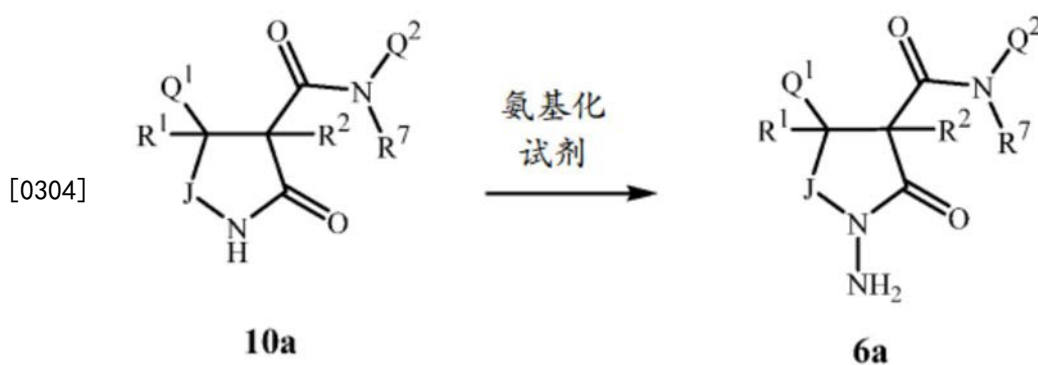
得。合适的亚硝化基剂包括但不限于亚硝酸盐如亚硝酸钠和亚硝酸钾以及氮氧化物。用于反应的合适的活化剂包括但不限于乙酸盐如乙酸钠和乙酸钾,羧酸如乙酸和丙酸,以及路易斯酸如三氯化铋(III)和四氯化锡(IV)。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于乙酸酐、四氯化碳和二氯甲烷。该反应在从-20°C至溶剂的沸点、并且典型地从0°C至100°C的范围内的温度下进行。式6的N-氨基化合物可以通过进行式12的N-亚硝基内酰胺与适当的还原剂的反应、典型地在共溶剂的存在下来获得。合适的还原剂包括但不限于锌金属。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于乙酸和水性盐酸。该反应在从-20°C至溶剂的沸点、并且典型地从-20°C至100°C的范围内的温度下进行。代表性程序参见Synthesis[合成]2006,14,2371-2375和Synthetic Communications[合成通讯]2009,39,604-612。式10的化合物(即其中J是 $-CR^5R^6-$)可以以多种方式制备,如PCT/US2014/068073(WO 2015/084796)中所传授。式10的化合物(其中J是 $-CR^5R^6-CR^{5a}R^{6a}-$)可以以多种方式制备,如PCT/US2014/38473(WO 2016/003997)中所述。

[0300] 方案10



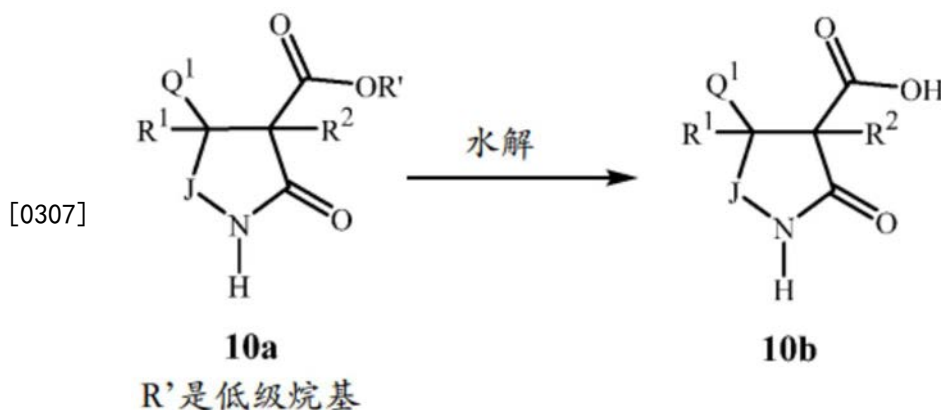
[0302] 可替代地,如方案11中所示,式6a的化合物可以通过使式10a的化合物与氨基化试剂如O-(二苯基氧磷基)羟胺和羟基氨基-O-磺酸反应来制备。对于程序、条件和试剂,参见Bioorg.&Med.Chem.Lett.[生物有机化学与医药化学通讯]2009,19, 5924-5926和J.O.C.[有机化学期刊]2002,67,6236-6239。

[0303] 方案11



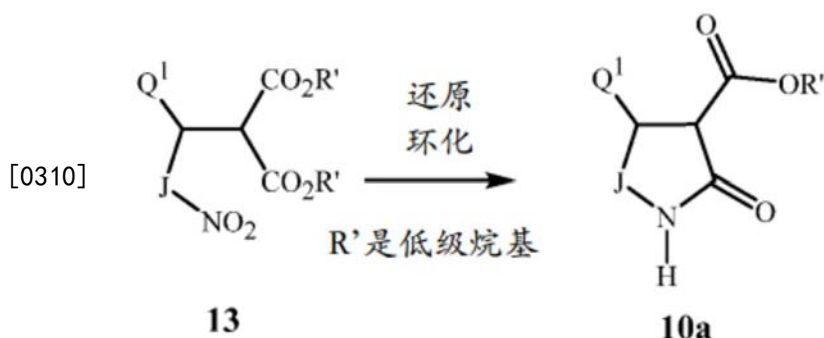
[0305] 如方案12中所示,式10b的化合物可以通过式10a的酯的水解来制备。水解用碱水溶液或酸水溶液典型地在共溶剂的存在下进行。用于反应的合适的碱包括但不限于氢氧化钠和氢氧化钾,以及碳酸盐如碳酸钠和碳酸钾。用于反应的合适的酸包括但不限于无机酸如盐酸、氢溴酸和硫酸,以及有机酸如乙酸和三氟乙酸。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于甲醇、乙醇和四氢呋喃。该反应在从-20°C至溶剂的沸点、并且典型地从0°C至100°C的范围内的温度下进行。

[0306] 方案12



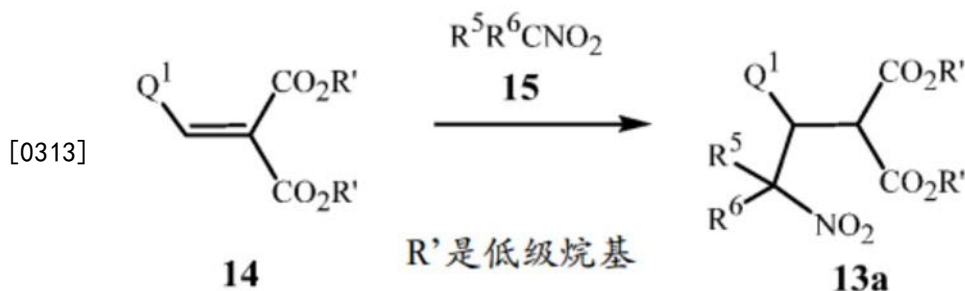
[0308] 如方案13中所示,式4的化合物可以通过还原式13的化合物并且随后原位环化所得中间体胺来获得。用于还原式13的化合物中的脂肪族硝基的各种方法在文献中是已知的。典型的还原方法包括在碳载钯或酸性介质中的雷尼镍、铁或锌金属 (参见,例如, *Berichte der Deutschen Chemischen Gesellschaft* 1904,37,3520- 3525) 和氢化铝锂的存在下的催化氢化。还原还可以在诸如甲醇的质子源的存在下,用碘化钆(II)来实现(参见例如, *Tet.Lett.* [四面体通讯] 1991,32(14), 1699-1702)。可替代地,可以使用在镍催化剂如乙酸镍(II)或氯化镍(II)存在下的硼氢化钠(参见例如, *Tet.Lett.* [四面体通讯] 1985,26(52), 6413-6416)。在氯化镍(II)六水合物的存在下使用硼氢化钠的方案12的方法由合成实例1的步骤C说明。

[0309] 方案13



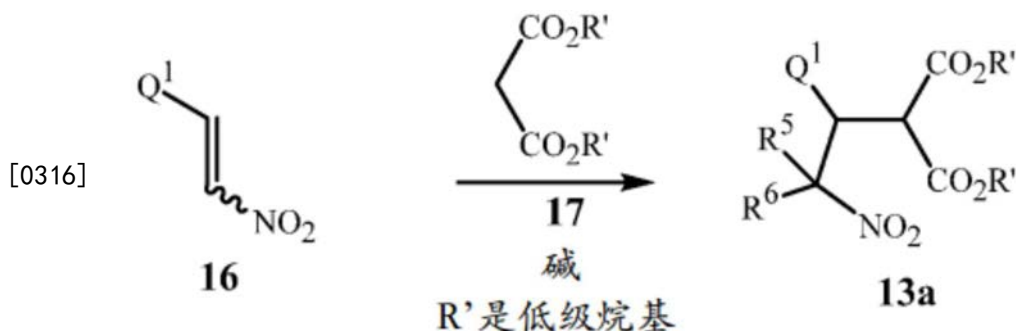
[0311] 如方案14中所示,式13a的化合物(其中J是- CR^5R^6 -的式13的化合物)可以通过使式14的二酯与式15的硝基烷烃反应、典型地在碱的存在下来制备。用于反应的合适的碱包括碱金属低级醇盐如甲醇中的甲醇钠或乙醇中的乙醇钠。方案14的方法由合成实例1的步骤B说明。式14的化合物可以容易地通过本领域技术人员已知的方法制备,例如通过醛和丙二酸酯的克脑文纳格尔缩合反应(参见例如G. Jones, *Organic Reactions* [有机反应] 第15卷, 约翰威利父子出版社, 1967)。

[0312] 方案14



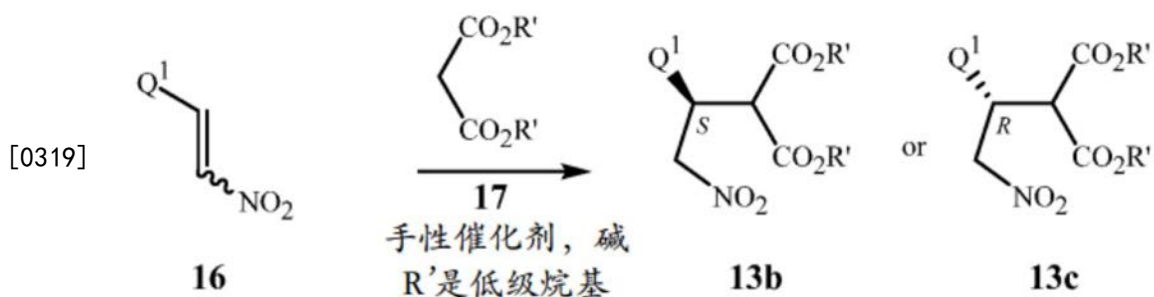
[0314] 式13a(即其中J是 $-CR^5R^6-$ 的式13)的化合物可以通过使式16的硝基烯烃与式17的丙二酸酯在碱的存在下反应来制备,如方案15中所示。用于该反应的合适的碱包括但不限于碱金属低级醇盐如甲醇中的甲醇钠或乙醇中的乙醇钠,或碱如在溶剂如四氢呋喃中的二(三甲基硅基)氨基锂、二(三甲基硅基)氨基钠和二异丙基氨基锂。典型地,该反应在从 -78°C 至 23°C 的范围内进行。用于进行该转化的条件参见 Synthesis[合成]2005,2239-2245。在不存在催化剂下在回流水中进行这种转化的条件已经在合成通讯(Synthetic Communications)2013,43,744-748中报道。式16的硝基烯烃可以容易地通过已知的方法由醛和硝基甲烷制备。

[0315] 方案15



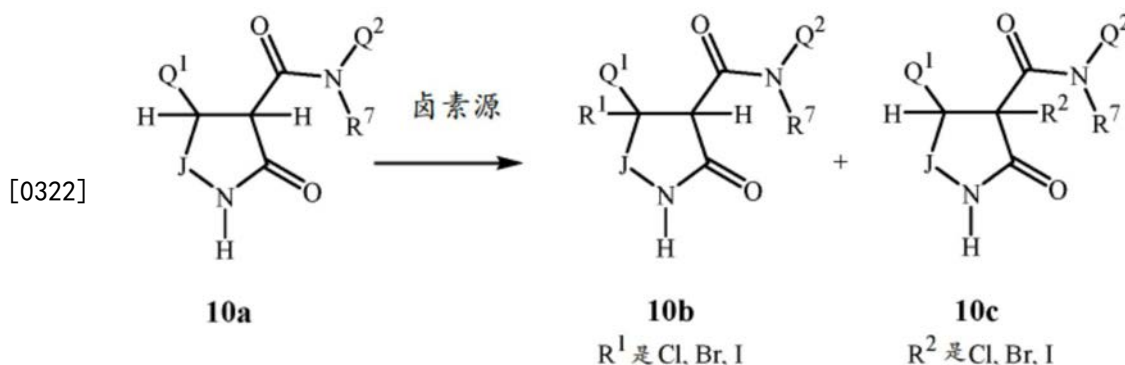
[0317] 式13b和13c的化合物可以通过在手性催化剂的存在下和任选地在合适的碱的存在下使式16的硝基烯烃与式17的丙二酸酯反应来立体选择性地制备,如方案16中所示。合适的催化剂包括但不限于具有邻位二胺配体的Ni(II)如双[(R,R)-N,N'-二苄基环己烷-1,2-二胺]二溴化镍(II)、双[(S,S)-N,N'-二苄基环己烷-1,2-二胺]二溴化镍(II)或具有手性1,1'-二(四氢异喹啉)型二胺的溴化镍(II)。用于该反应的合适的有机碱包括但不限于哌啶、吗啉、三乙胺、4-甲基吗啉或N,N-二异丙基乙胺。这种转化可以纯地或在溶剂如四氢呋喃、甲苯或二氯甲烷中完成。典型地,该反应在从 -78°C 至 80°C 的范围内使用0至1当量的催化剂和0至1当量的碱进行。进行这种转化的条件已经在J. Am. Chem. Soc. [美国化学会志]2005,9958-9959或Eur. J. Org. Chem. [欧洲有机化学杂志]2011,5441-5446中对于条件进行报告。式16的硝基烯烃可以容易地通过本领域技术人员已知的方法由醛和硝基甲烷制备。

[0318] 方案16



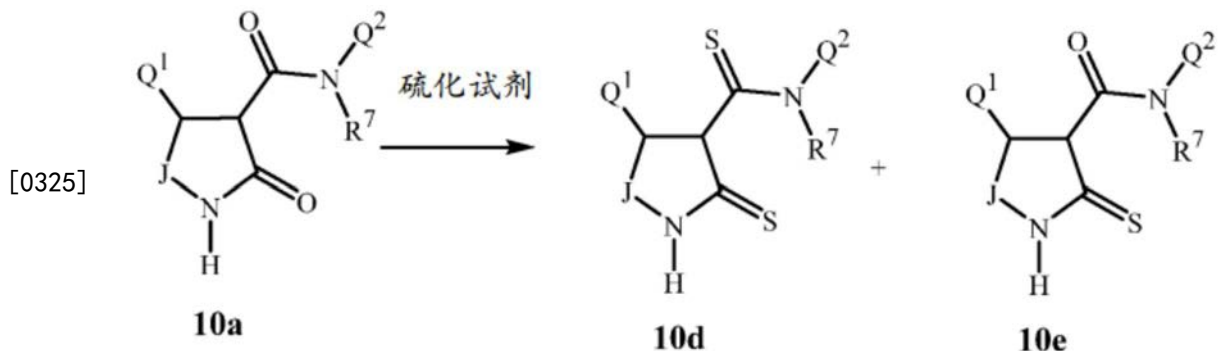
[0320] 如方案17中所示,式10b(即其中Y是O;R¹是卤素;并且R²是H的式10)和10c(即其中Y是O;R¹是H;并且R²是卤素的式10)的化合物的混合物可以通过使式10a的化合物与卤素源在溶剂中、在引发剂的存在或不存在下进行反应来制备。在该反应中产生的区域异构体的分离可以通过标准方法如色谱法或分级结晶来实现。用于反应的合适的卤素源包括溴、氯、N-氯代琥珀酰亚胺、N-溴代琥珀酰亚胺和N-碘代琥珀酰亚胺。用于该反应的合适的引发剂包括2,2'-偶氮二异丁腈(AIBN)和过氧化苯甲酰。典型地,该反应在溶剂如二氯甲烷中在从0°C至溶剂沸点的范围内进行。

[0321] 方案17



[0323] 如方案18中所示,式10d和10e的化合物(即其中R¹和R²是H,并且Y分别是O(10d)或S(10e)的式10的化合物)可以通过使式10a的化合物与至少两当量的硫化试剂例如劳氏试剂(Lawesson's reagent)、十硫化四磷或五硫化二磷在溶剂如四氢呋喃或甲苯中进行反应来制备。典型地,该反应在范围从0°C至115°C的温度下进行。本领域技术人员认识到,使用少于2当量的硫化试剂可以提供包含式10d和10e(即其中Y分别是S或O)的化合物的产物的混合物,其可以通过常规方法如色谱法和结晶来分离。方案18的方法由合成实例1的步骤D说明。

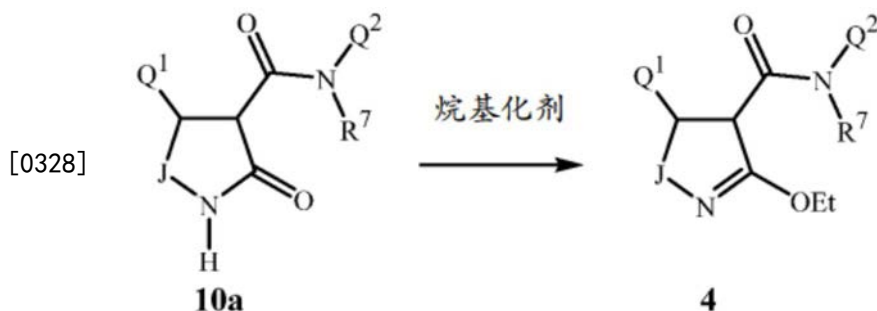
[0324] 方案18



[0326] 如方案19中所示,式4(即其中R¹和R²是H;并且Y是O的式1)的化合物可以通过任选

地在碱的存在下用合适的烷基化剂烷基化式10a的化合物来制备。合适的烷基化剂包括但不限于三甲基氧鎓四氟硼酸盐、三乙基氧鎓四氟硼酸盐、碘甲烷、碘乙烷、溴甲烷和对甲苯磺酸甲酯。用于反应的合适的碱包括但不限于碳酸盐如碳酸钠和碳酸钾以及中性含氮碱如三乙胺和1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯。多种多样的共溶剂适用于反应,包括但不限于乙腈、N,N-二甲基甲酰胺和四氢呋喃。该反应在从-20°C至溶剂的沸点、并且典型地从0°C至150°C的范围内的温度下进行。方案19的方法由合成实例1的步骤F说明。

[0327] 方案19



[0329] 本领域的技术人员认识到,各种官能团可被转变成其他以提供不同的式1的化合物。对于以简单且直接的方式说明官能团的相互转换的有价值的资源,参见 Larock, R.C., 综合有机转化:官能团制备的指引 (Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations), 第2版, Wiley-VCH, 纽约, 1999。例如,用于制备式1的化合物的中间体可包含芳族硝基,这些芳族硝基可被还原成氨基,并且然后经由本领域熟知的反应(诸如桑德迈尔反应)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,上述反应还可以以交替的顺序进行。

[0330] 应认识到,上述对于制备式1的化合物所描述的某些试剂和反应条件可能不与中间体中存在的某些官能团相容。在这些情况下,将保护/去保护序列或官能团相互转换结合到合成中将有助于获得所期望的产物。保护基团的使用和选择对于化学合成领域的技术人员将是显而易见的(参见,例如, Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis [有机合成中的保护基团], 第2版; Wiley: 纽约, 1991)。本领域的技术人员将认识到,在一些情况下,在按照任何单独方案中描绘的引入给定试剂后,可能需要进行没有详细描述额外常规合成步骤以完成式1的化合物的合成。本领域的技术人员还将认识到,可能需要以与制备式1的化合物所具体呈现的顺序不同的顺序来进行以上方案中示出的步骤的组合。

[0331] 本领域的技术人员还将认识到,本文所述的式1的化合物和中间体可经受各种亲电反应、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改性现有的取代基。

[0332] 无需进一步详尽说明,据信本领域技术人员使用前述说明可将本发明利用至其最大程度。以下非限制性实例是本发明的例示。以下实例中的步骤示出了在整体合成转化中每个步骤的程序,并且用于每个步骤的起始物质并不必须由其程序描述于其他实例或步骤中的具体制备试验来制备。百分比是按重量计,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是按体积计。¹H NMR谱以距四甲基硅烷的低场的ppm来报告。“s”意指单峰、“d”意指双峰、“m”意指多重峰并且“br s”意指宽单峰。

[0333] 合成实例1

[0334] N-(2-氟苯基)-6,7-二氢-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺(化合物2)的制备

[0335] 步骤A:2-[[3-(三氟甲基)苯基]亚甲基]丙二酸1,3-二乙酯的制备

[0336] 将3-(三氟甲基)苯甲醛(7.55g,43.3mmol)、丙二酸二乙酯(6.6g,41.3 mmol)、哌啶(0.91g,10.7mmol)和苯(50mL)的混合物回流17小时,其中使用迪安-斯达克分水器连续除去水。将冷却的反应混合物在减压下浓缩,并将残余物在硅胶上色谱分离(用己烷中的0%至30%乙酸乙酯洗脱),以提供作为澄清无色油状物的标题化合物(10.9g)。

[0337] $^1\text{H NMR}$ δ 7.74 (m, 1H), 7.71 (m, 1H), 7.64 (m, 2H), 7.52 (m, 1H), 4.33 (m, 4H), 1.35 (m, 3H), 1.29 (m, 3H)。

[0338] 步骤B:2-[2-硝基-1-[3-(三氟甲基)苯基]乙基]丙二酸1,3-二乙酯的制备

[0339] 将2-[[3-(三氟甲基)苯基]亚甲基]丙二酸1,3-二乙酯(即步骤A的产物,10.9 g, 34.5mmol)、硝基甲烷(18.5mL,345mmol)和甲醇钠的甲醇溶液(25wt%, 0.76g,3.45mmol)在乙醇(150mL)中的混合物在23°C下搅拌21小时。然后将反应混合物在减压下浓缩以提供稠油状物,将其用己烷中的25%乙酸乙酯稀释并通过 Celite® 硅藻土助滤剂垫过滤以除去不溶性微粒。将滤液在减压下浓缩以提供呈黄色油状物的标题化合物(11.0g)。

[0340] $^1\text{H NMR}$ δ 7.57 (m, 1H), 7.51 (m, 1H), 7.47 (m, 2H), 4.97 (m, 1H), 4.89 (m, 1H), 4.32 (m, 1H), 4.23 (m, 4H), 3.82 (d, J=9.0Hz, 1H), 1.27 (m, 3H), 1.07 (m, 3H)。

[0341] 步骤C:2-氧代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯的制备

[0342] 将2-[2-硝基-1-[3-(三氟甲基)苯基]乙基]丙二酸1,3-二乙酯(即步骤B的产物, 11.0g,29.0mmol)、氯化镍(II)六水合物(13.8g,58.0mmol)和乙醇(250mL)的搅拌混合物在冰浴中冷却并用在45分钟内以0.5g份加入的硼氢化钠(6.6g,174 mmol)处理。将所得混合物在23°C下搅拌4小时。然后加入饱和氯化铵溶液(500 mL),将混合物搅拌2小时。用乙酸乙酯(3×200mL)萃取该水层。将合并的有机萃取物用盐水洗涤,干燥(MgSO_4)并在减压下浓缩。将残余物溶于乙酸乙酯(100 mL)中,并当所有黑色颗粒消失时用饱和氯化铵溶液(100mL)剧烈搅拌1小时。分离这些层,并将有机层用水洗涤,干燥(MgSO_4)并在减压下浓缩。将残余物在硅胶上色谱分离(用己烷中的0%至100%乙酸乙酯洗脱),以提供作为澄清无色油状物的标题化合物。

[0343] $^1\text{H NMR}$ δ 7.57 (m, 1H), 7.51 (m, 1H), 7.48 (m, 2H), 6.47 (br s, 1H), 4.26 (m, 2H), 4.19 (m, 1H), 3.86 (m, 1H), 3.54 (d, J=9.5Hz, 1H), 3.46 (m, 1H), 1.29 (m, 3H)。

[0344] 步骤D:2-硫代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯的制备

[0345] 将2-氧代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯(即步骤C的产物,1.0g, 3.3mmol)和劳氏试剂(0.67g,1.7mmol)在甲苯(15mL)中的混合物在回流下搅拌4小时。将冷却的反应混合物在减压下浓缩,并将残余物在硅胶上色谱分离(用己烷中的0%至100%乙酸乙酯洗脱),以提供作为黄色油状物的标题化合物(0.60g)。

[0346] $^1\text{H NMR}$ δ 8.07 (br s, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.49 (m, 2H), 7.44 (m, 1H), 4.28 (m, 3H), 4.16 (m, 1H), 3.90 (m, 1H), 3.72 (m, 1H), 1.31 (m, 3H)。

[0347] 步骤E:N-(2-氟苯基)-2-硫代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺的制备

[0348] 将2-硫代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯(即步骤D的产物,0.55g,

1.7mmol) 和 2-氟苯胺 (2.0mL, 20.7mmol) 的混合物在氮气氛下加热至 120℃ 持续 71 小时。将混合物在硅胶上色谱分离 (用己烷中的 0% - 40% 乙酸乙酯洗脱), 以提供作为灰白色固体的标题产物 (0.49g)。

[0349] $^1\text{H NMR}$ δ 9.68 (br s, 1H), 8.21 (m, 1H), 7.75 (br s, 1H), 7.57 (m, 2H), 7.52 (m, 2H), 7.10 (m, 3H), 4.62 (m, 1H), 4.16 (m, 1H), 3.94 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 1H), 3.72 (m, 1H)。

[0350] 步骤 F: N-(2-氟苯基)-3,4-二氢-5-甲硫基-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡咯-4-甲酰胺的制备

[0351] 将 N-(2-氟苯基)-2-硫代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺 (即步骤 E 的产物, 0.49g, 1.3mmol)、碘甲烷 (0.090mL, 1.4mmol) 和碳酸钾 (0.36g, 2.6 mmol) 在乙腈 (10mL) 中的混合物在 23℃ 下搅拌 4 小时。将混合物在减压下浓缩。将残余物吸收在乙酸乙酯 (20mL) 中并用水 (2×10mL) 洗涤。将有机萃取物干燥 (MgSO_4) 并在减压下浓缩以提供作为棕色油状物的标题产物 (0.39g)。

[0352] $^1\text{H NMR}$ δ 8.29 (m, 1H), 7.60 (br s, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.44 (m, 3H), 7.11 (m, 3H), 4.52 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.77 (s, 1H), 2.57 (m, 3H)。

[0353] 步骤 G: N-(2-氟苯基)-6,7-二氢-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺的制备

[0354] 将 N-(2-氟苯基)-3,4-二氢-5-甲硫基-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡咯-4-甲酰胺 (即步骤 F 的产物, 0.13g, 0.33mmol) 和甲酰肼 (0.030g, 0.50mmol) 在 N,N-二甲基乙酰胺 (0.4mL) 中的混合物在 120℃ 下搅拌 15 小时。将混合物在减压下浓缩。将残余物在硅胶上色谱分离 (用己烷中的 0% 至 100% 乙酸乙酯、然后乙酸乙酯中的 0% 至 5% 甲醇洗脱), 以提供作为棕色油状物的标题化合物, 本发明的化合物 (0.065g)。

[0355] $^1\text{H NMR}$ δ 9.17 (br s, 1H), 8.26 (s, 1H), 8.15 (m, 1H), 7.62 (m, 2H), 7.56 (m, 3H), 7.09 (m, 3H), 4.93 (m, 1H), 4.61 (m, 1H), 4.36 (d, $J=7.4\text{Hz}$, 1H), 4.14 (m, 1H)。

[0356] 合成实例 2

[0357] N-(2-氟苯基)-2,3,6,7-四氢-3-氧代-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[1,2-a]咪唑-7-甲酰胺 (化合物 3) 的制备

[0358] 步骤 A: 1-(2-氯乙酰基)-2-氧代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯的制备

[0359] 将 2-氧代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯 (即实例 1 步骤 C 的产物, 0.30g, 1.0mmol) 和氯乙酰氯 (0.16mL, 2.0mmol) 在苯 (3mL) 中的混合物在 75℃ 下搅拌 16 小时。将冷却的反应混合物在减压下浓缩以提供作为深棕色油状物的标题化合物 (0.37g)。

[0360] $^1\text{H NMR}$ δ 7.61 (m, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.46 (m, 1H), 4.73 (m, 2H), 4.42 (m, 1H), 4.27 (m, 2H), 4.10 (m, 1H), 3.82 (d, $J=10.7\text{Hz}$, 1H), 3.78 (m, 1H), 1.30 (m, 3H)。

[0361] 步骤 B: 1-(2-叠氮乙酰基)-2-氧代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯的制备

[0362] 将 1-(2-氯乙酰基)-2-氧代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯 (即步骤 A 的产物, 0.37g, 1.0mmol) 和叠氮化钠 (0.20g, 3.0mmol) 在 N,N-二甲基甲酰胺 (3mL) 中的混合物在 23℃ 下搅拌 6 小时。将反应混合物用乙酸乙酯 (40mL) 稀释。将混合物依次用水 (2×15mL) 和饱和氯化钠 (15mL) 洗涤。将有机层干燥 (MgSO_4) 并在减压下浓缩以提供作为红色

油状物的标题化合物 (0.37g)。

[0363] $^1\text{H NMR}$ δ 7.61 (m, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.45 (m, 1H), 4.51 (s, 2H), 4.42 (m, 1H), 4.27 (m, 2H), 4.10 (m, 1H), 3.80 (d, $J=10.9\text{Hz}$, 1H), 3.77 (m, 1H), 1.29 (m, 3H)。

[0364] 步骤C: 2,3,6,7-四氢-3-氧代-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[1,2-a]咪唑-7-甲酸乙酯的制备

[0365] 将1-(2-叠氮乙酰基)-2-氧代-4-[3-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸乙酯(即步骤B的产物, 0.37g, 1.0mmol)和三苯基膦(0.29g, 1.1mmol)在苯(10mL)中的混合物在回流下搅拌1小时。将溶液在23°C下静置20小时,在此时间期间形成固体。将混合物过滤并用甲苯洗涤以提供作为无色固体的标题化合物(0.20g)。将滤液浓缩。将残余物溶于甲苯(4mL)中。加入氯化镁(0.30g),并将混合物在65°C下搅拌1小时。将冷却的反应混合物过滤。将滤液在减压下浓缩以提供附加量的作为无色固体的标题化合物(0.12g)。

[0366] $^1\text{H NMR}$ δ 7.49 (m, 2H), 7.43 (m, 2H), 5.72 (br s, 1H), 4.67 (m, 1H), 4.38 (m, 2H), 4.15 (m, 1H), 4.02 (m, 2H), 3.59 (m, 1H), 1.08 (br s, 3H)。

[0367] 步骤D: N-(2-氟苯基)-2,3,6,7-四氢-3-氧代-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[1,2-a]咪唑-7-甲酰胺的制备

[0368] 将2,3,6,7-四氢-3-氧代-6-[3-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[1,2-a]咪唑-7-甲酸乙酯(即步骤C的产物, 0.10g, 0.29mmol)和2-氟苯胺(0.50mL, 5.2mmol)在甲苯(3mL)中的混合物在微波反应器中加热至200°C持续2小时。将冷却的反应混合物在硅胶上色谱分离(用己烷中的0%-100%乙酸乙酯洗脱),以提供作为黄色油状物的标题产物,本发明的化合物(0.027g)。 $^1\text{H NMR}$ 示出大约2:1的烯胺:脒互变异构体的混合物。

[0369] $^1\text{H NMR}$ δ 烯胺互变异构体 8.20 (m, 1H), 7.58 (m, 4H), 7.07 (m, 3H), 6.37 (br s, 1H), 6.27 (br s, 1H), 4.56 (m, 2H), 4.51 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 3.59 (m, 1H); 脒互变异构体 9.49 (br s, 1H), 8.20 (m, 1H), 7.58 (m, 4H), 7.07 (m, 3H), 4.77 (m, 1H), 4.41 (s, 2H), 4.28 (m, 1H), 4.14 (m, 1H), 3.59 (m, 1H)。

[0370] 合成实例3

[0371] N-(2-氟苯基)-6,7-二氢-甲基-6-[4-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺(化合物24)的制备

[0372] 步骤A: 2-[2-硝基-1-[4-(三氟甲基)苯基]乙基]丙二酸1,3-二甲酯的制备

[0373] 将4-(三氟甲基)苯甲醛(25.0g, 112mmol)、丙二酸二甲酯(15.6g, 118mmol)、哌啶(2.39g, 28.0mmol)和苯(75mL)的混合物回流2小时,其中连续除去水(迪安-斯塔克分水器)。加入乙酸(3.47g, 57.7mmol),并将反应加热另外1.5小时。将冷却的反应混合物依次用盐酸水溶液(1M, 2×40mL)和饱和碳酸氢钠(2×40mL)洗涤。将有机层干燥(Na_2SO_4)并在减压下浓缩以提供黄色油状物(0.37g)。将该黄色油状物、硝基甲烷(60.0mL, 1.12mol)和甲醇钠的甲醇溶液(25wt%, 2.42g, 11.2mmol)在甲醇(110mL)中的混合物在23°C下搅拌17小时。然后将反应混合物在减压下浓缩以提供稠油状物。通过二氧化硅垫(用己烷中的50%乙酸乙酯洗脱)过滤该粗材料以提供作为橙色油状物的标题化合物(29.0g)。

[0374] $^1\text{H NMR}$ δ 7.60 (m, 2H), 7.38 (m, 2H), 4.93 (m, 2H), 4.32 (m, 1H), 3.87 (d, $J=8.8\text{Hz}$, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.60 (s, 3H)。

[0375] 步骤B: 2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷-羧酸甲酯的制备

[0376] 将2-[2-硝基-1-[4-(三氟甲基)苯基]乙基]-丙二酸1,3-二甲酯(即步骤A的产物, 29.0g, 83.0mmol)、氯化镍(II)六水合物(19.8g, 83.0mmol)和甲醇(275mL)的搅拌混合物在冰浴中冷却并用在1小时内以0.5g份加入的硼氢化钠(9.5g, 250 mmol)处理。将所得混合物在0℃下搅拌1.5小时并且然后在23℃下搅拌17小时。然后加入饱和氯化铵溶液(300mL)和乙酸乙酯(300mL), 将混合物剧烈搅拌2小时。分离淡蓝色混合物。用乙酸乙酯(2×100mL)萃取该水层。将合并的有机萃取物用饱和氯化铵溶液(100mL)洗涤, 干燥(MgSO₄)并在减压下浓缩。将粗混合物用1-氯丁烷(100mL)研磨以提供作为无色固体的标题化合物(12.3g)。

[0377] ¹H NMRδ7.63 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 6.23 (br s, 1H), 4.21 (m, 1H), 3.86 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.57 (d, J=9.6Hz, 1H), 3.45 (m, 1H)。

[0378] 步骤C: 2-硫代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸甲酯的制备

[0379] 将2-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸甲酯(即步骤B的产物, 8.0g, 27.9mmol)和劳氏试剂(5.63g, 13.9mmol)在甲苯(70mL)中的混合物在回流下搅拌4.5小时。将冷却的反应混合物在减压下浓缩, 并将残余物在硅胶上色谱分离(用己烷中的0%至100%乙酸乙酯洗脱), 以提供由标题化合物和20%的未知杂质组成的黄色固体。将混合物从乙酸乙酯(100mL, 热)和己烷(200mL, 冷)中重结晶以提供作为浅黄色固体的标题化合物(5.0g)。

[0380] ¹H NMRδ8.20 (br s, 1H), 7.62 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 4.24 (m, 1H), 4.15 (m, 1H), 3.94 (d, J=8.2Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.71 (m, 1H)。

[0381] 步骤D: N-(2-氟苯基)-2-硫代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺的制备

[0382] 将2-硫代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸甲酯(即步骤C的产物, 1.00g, 3.3mmol)和2-氟苯胺(2.55mL, 26mmol)的混合物在氮气氛下加热至130℃持续22小时。将反应在减压下浓缩以除去大部分过量的苯胺。将剩余的残余物用1-氯丁烷研磨以提供作为无色固体的标题化合物(1.18g)。

[0383] ¹H NMRδ9.67 (br s, 1H), 8.21 (m, 1H), 7.73 (br s, 1H), 7.64 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.10 (m, 3H), 4.62 (m, 1H), 4.16 (m, 1H), 3.93 (d, J=5.8Hz, 1H), 3.71 (m, 1H)。

[0384] 步骤E: N-(2-氟苯基)-3,4-二氢-5-(甲硫基)-3-[4-(三氟甲基)苯基]-2H-吡咯-4-甲酰胺的制备

[0385] 将N-(2-氟苯基)-2-硫代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺(即步骤D的产物, 1.11g, 2.9mmol)、碘甲烷(0.22mL, 3.5mmol)和碳酸钾(0.81g, 5.8 mmol)在乙腈(15mL)中的混合物在23℃下搅拌18小时。将混合物用水(100 mL)稀释并用乙酸乙酯(2×100mL)萃取。将有机萃取物干燥(MgSO₄)并在减压下浓缩以提供作为棕色固体的标题产物(0.97g)。

[0386] ¹H NMRδ8.29 (m, 1H), 7.60 (br s, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.44 (m, 3H), 7.11 (m, 3H), 4.52 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.77 (s, 1H), 2.57 (s, 3H)。

[0387] 步骤F: N-(2-氟苯基)-6,7-二氢-3-甲基-6-[4-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺的制备

[0388] 将N-(2-氟苯基)-3,4-二氢-5-(甲硫基)-3-[4-(三氟甲基)苯基]-2H-吡咯-4-甲酰胺(即步骤E的产物, 0.100g, 0.25mmol)和乙酰肼(0.028g, 0.38mmol)在乙酸(1.2mL)中的混合物在110℃下搅拌75分钟。将混合物浓缩到硅胶上并在硅胶上色谱分离(用己烷中的10%至100%乙酸乙酯、然后乙酸乙酯中的0%至5%甲醇洗脱), 以提供被几种其他杂质污

染的标题化合物。将混合物在C18-硅胶上色谱分离（用水中的10%至100%1:1乙腈/甲醇洗脱），以提供作为黄色油状物的标题化合物，本发明的化合物（0.021g）。

[0389] ^1H NMR (d_6 -丙酮) δ 9.65 (br s, 1H), 8.25 (m, 1H), 7.76 (m, 4H), 7.15 (m, 3H), 7.09 (m, 3H), 4.92 (m, 1H), 4.63 (m, 2H), 4.17 (m, 1H), 2.39 (s, 3H)。

[0390] 合成实例4

[0391] N-(2,3-二氟苯基)-3-乙基-6,7-二氢-6-[4-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺(化合物8)的制备

[0392] 步骤A:N-(2,3-二氟苯基)-2-硫代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺的制备

[0393] 将2-硫代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷羧酸甲酯(即实例3步骤C的产物, 1.00g, 3.3mmol)和2,3-二氟苯胺(3.4g, 26mmol)的混合物在氮气氛围下加热至130°C持续22小时。将反应在减压下浓缩以除去大部分过量的苯胺。将剩余的残余物用1-氯丁烷研磨以提供作为无色固体的标题化合物(1.13g)。

[0394] ^1H NMR δ 9.84 (br s, 1H), 7.97 (m, 1H), 7.75 (br s, 1H), 7.64 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.04 (m, 1H), 6.92 (m, 1H), 4.60 (m, 1H), 4.15 (m, 1H), 3.94 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 1H), 3.72 (m, 1H)。

[0395] 步骤B:N-(2,3-二氟苯基)-3,4-二氢-5-(甲硫基)-3-[4-(三氟甲基)苯基]-2H-吡咯-4-甲酰胺的制备

[0396] 将N-(2,3-二氟苯基)-2-硫代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-3-吡咯烷甲酰胺(即步骤A的产物, 1.16g, 2.9mmol)、碘甲烷(0.22mL, 3.5mmol)和碳酸钾(0.81g, 5.8 mmol)在乙腈(15mL)中的混合物在23°C下搅拌18小时。将混合物用水(100 mL)稀释并用乙酸乙酯(2×100mL)萃取。将有机萃取物干燥(MgSO_4)并在减压下浓缩以提供作为棕色固体的标题产物(1.10g)。

[0397] ^1H NMR δ 8.06 (m, 1H), 7.60 (m, 3H), 7.33 (m, 2H), 7.07 (m, 1H), 6.94 (m, 1H), 4.51 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 4.01 (m, 1H), 3.77 (s, 1H), 2.58 (s, 3H)。

[0398] 步骤C:N-(2,3-二氟苯基)-3-乙基-6,7-二氢-6-[4-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺的制备

[0399] 将N-(2,3-二氟苯基)-3,4-二氢-5-(甲硫基)-3-[4-(三氟甲基)苯基]-2H-吡咯-4-甲酰胺(即步骤B的产物, 0.200g, 0.48mmol)和水合肼(0.036mL, 0.72mmol)在丙酸(2.4mL)中的混合物在110°C下搅拌16.5小时。将混合物浓缩到Celite®硅藻土助滤剂上并在C18-硅胶上色谱分离(用水中的10%至100%1:1乙腈/甲醇洗脱),以提供作为棕色固体的标题化合物,本发明的化合物(0.037g)。

[0400] ^1H NMR δ 10.19 (br s, 1H), 7.82 (m, 1H), 7.64 (m, 2H), 7.47 (m, 2H), 6.92 (m, 1H), 6.83 (m, 1H), 4.99 (m, 1H), 4.50 (m, 2H), 3.98 (m, 1H), 2.81 (m, 2H), 1.37 (m, 3H)。

[0401] 合成实例5

[0402] N-(2,3-二氟苯基)-6,7-二氢-3-(三氟甲基)-6-[4-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺(化合物22)的制备

[0403] 步骤A:N-(2,3-二氟苯基)-6,7-二氢-3-(三氟甲基)-6-[4-(三氟甲基)苯基]-5H-吡咯并[2,1-c]-1,2,4-三唑-7-甲酰胺的制备

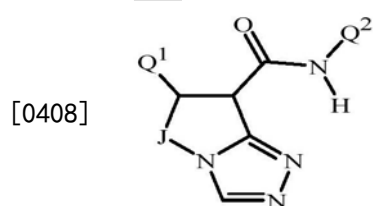
[0404] 将N-(2,3-二氟苯基)-3,4-二氢-5-(甲硫基)-3-[4-(三氟甲基)苯基]-2H-吡咯-

4-甲酰胺(即实例4步骤B的产物,0.220g,0.53mmol)、三氟乙酰肼(0.076g,0.58 mmol)和新戊酸(2.7g)的混合物在130℃下搅拌90分钟。将冷却的混合物用乙酸乙酯(100mL)稀释并依次用饱和碳酸氢钠(50mL)、水(50mL)和饱和氯化钠(50mL)洗涤。将有机层干燥(MgSO₄)、浓缩到 Celite® 硅藻土助滤剂上并在 C18-硅胶上色谱分离(用水中的10%至100%1:1乙腈/甲醇洗脱),以提供被一些杂质污染的标题化合物。将混合物用1-氯丁烷研磨以提供作为无色固体的标题化合物,本发明的化合物(0.029g)。

[0405] ¹H NMRδ9.25 (br s, 1H), 7.89 (m, 1H), 7.70 (m, 2H), 7.51 (m, 2H), 7.03 (m, 1H), 6.92 (m, 1H), 5.04 (m, 1H), 4.71 (m, 1H), 4.46 (d, J=7.6Hz, 1H), 4.24 (m, 1H)。

[0406] 通过本文所述的程序与本领域已知的方法一起,可以制备表1至140中的下列化合物。以下缩写用于下表中:i-Pr意指异丙基,Bu意指丁基,Ph意指苯基,OMe 意指甲氧基,OEt意指乙氧基,SMe意指甲硫基,\S(O)Me意指甲基亚磺酰基,以及 S(O)₂Me意指甲基磺酰基。

[0407] 表1



[0409] J是-CH₂-;Q²是Ph(2-F);并且Q¹是

[0410]

Q	Q	Q
Ph(3-Cl)	Ph(4-CF ₃)	2-吡啶基(5-Me)
Ph(3-F)	Ph(4-OCF ₃)	2-吡啶基(4-F)
Ph(3-Br)	Ph(4-OCF ₂ H)	2-吡啶基(4-CF ₃)
Ph(3-Me)	Ph(4-OMe)	2-吡啶基(4-Me)
Ph(3-Et)	Ph(4-CH ₂ CF ₃)	2-吡啶基(3-F)
Ph(3-CF ₃)	Ph(4-O- <i>i</i> -Pr)	2-吡啶基(3-CF ₃)
Ph(3-CH ₂ CF ₃)	Ph(4-OCF ₂ CF ₂ H)	2-吡啶基(3-Me)
Ph(3-OCF ₃)	Ph(2,3-二-F)	3-吡啶基
Ph(3-OCF ₂ H)	Ph(2,4-二-F)	3-吡啶基(6-F)
Ph(3-O- <i>i</i> -Pr)	Ph(2,5-二-F)	3-吡啶基(6-CF ₃)
Ph(3-OMe)	Ph(2,6-二-F)	3-吡啶基(6-Me)
Ph(3-OCF ₂ CF ₂ H)	Ph(3,4-二-F)	3-吡啶基(5-F)
Ph(2-Cl)	Ph(3,5-二-F)	3-吡啶基(5-CF ₃)
Ph(2-F)	Ph(3-Me,4-F)	3-吡啶基(5-Me)
Ph(2-Br)	Ph(3-F,4-Me)	3-吡啶基(4-F)
Ph(2-Me)	Ph(3-CF ₃ ,4-F)	3-吡啶基(4-CF ₃)
Ph(2-CF ₃)	Ph(3-F,4-CF ₃)	3-吡啶基(4-Me)
Ph(2-OCF ₃)	Ph(2,3,4-三-F)	3-吡啶基(2-F)
Ph(2-OCF ₂ H)	Ph(3,4,5-三-F)	3-吡啶基(2-CF ₃)
Ph(2-OMe)	2-吡啶基	3-吡啶基(2-Me)
Ph(2-OCF ₂ CF ₂ H)	2-吡啶基(6-F)	4-吡啶基
Ph(2-CH ₂ CF ₃)	2-吡啶基(6-CF ₃)	4-吡啶基(6-F)
Ph(2-O- <i>i</i> -Pr)	2-吡啶基(6-Me)	4-吡啶基(6-CF ₃)
Ph(4-Cl)	2-吡啶基(5-F)	
Ph(4-F)	2-吡啶基(5-CF ₃)	
Ph(4-Br)		
Ph(4-Me)		
Ph(4-Et)		

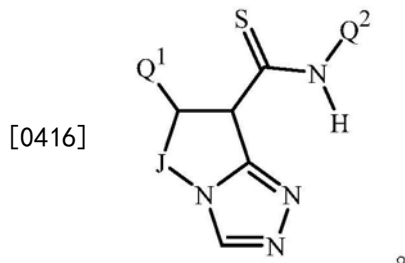
	Q ¹	Q ¹	Q ¹
	4-吡啶基(6-Me)	嘧啶-5-基	苯并咪喃-2-基
	4-吡啶基(5-F)	嘧啶-5-基(2-CF ₃)	苯并噻吩-2-基
	4-吡啶基(5-CF ₃)	1,3,5-三嗪-2-基	1,3-苯并噁唑-2-基
	4-吡啶基(5-Me)	噻唑-2-基	1,3-苯并噻唑-2-基
	4-吡啶基(3-F)	噻唑-2-基(5-CF ₃)	7-喹啉基
	4-吡啶基(3-CF ₃)	噻唑-5-基	吲唑-1-基
	4-吡啶基(3-Me)	噻唑-5-基(2-CF ₃)	苯并咪唑-1-基
	4-吡啶基(2-F)	噁唑-2-基	吲哚-1-基
	4-吡啶基(2-CF ₃)	噁唑-2-基(5-CF ₃)	吡咯并[2,3-c]吡啶-1-基
	4-吡啶基(2-Me)	噁唑-5-基	Ph(3-OCH ₂ - <i>c</i> -Pr)
	2-噻吩基	噁唑-5-基(2-CF ₃)	Ph(2-OCH ₂ - <i>c</i> -Pr)
	2-噻吩基(4-CF ₃)	异噻唑-5-基	Ph(4-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ - <i>c</i> -hex)
	2-噻吩基(5-CF ₃)	异噻唑-5-基(3-CF ₃)	Ph(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
	3-噻吩基	异噻唑-3-基	Ph(4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ - <i>c</i> -hex)
	3-噻吩基(4-CF ₃)	异噻唑-3-基(5-CF ₃)	Ph(3-OCH ₂ CF ₂)
	3-噻吩基(5-CF ₃)	异噻唑-5-基	Ph(2-(3,3-二氯烯丙基氧基))
	2-咪喃基	异噻唑-5-基(3-CF ₃)	Ph(2-甲氧基乙氧基)
	2-咪喃基(4-CF ₃)	异噻唑-3-基	Ph(3-丙氧基丙氧基)
	2-咪喃基(5-CF ₃)	异噻唑-3-基(5-CF ₃)	Ph(2-CH ₂ CH ₂ SCH ₃)
[0411]	3-咪喃基	1 <i>H</i> -1,2,3,4-四唑-1-基	Ph(2-CH ₂ CH ₂ SOCH ₃)
	3-咪喃基(4-CF ₃)	5-Me-1 <i>H</i> -1,2,3,4-四唑-1-基	Ph(2-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃)
	3-咪喃基(5-CF ₃)	1-Me-1 <i>H</i> -1,2,3,4-四唑-5-基	Ph(3-SMe)
	1 <i>H</i> -吡唑-1-基	1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基	Ph(3-SCF ₃)
	4-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基	1,3,4-噁二唑-2-基	Ph(3-S- <i>c</i> -Pr)
	1 <i>H</i> -咪唑-1-基	1,3,4-噻二唑-2-基	Ph(3-SOMe)
	4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-1-基	1,2,4-噁二唑-3-基	Ph(3-SOCF ₃)
	2-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-1-基	1,2,4-噻二唑-3-基	Ph(3-SO- <i>c</i> -Pr)
	1-Me-1 <i>H</i> -咪唑-2-基	四氢吡喃-2-基	Ph(3-SO ₂ Me)
	1-Me-1 <i>H</i> -咪唑-4-基	四氢吡喃-3-基	Ph(3-SO ₂ CF ₃)
	3-Me-1 <i>H</i> -咪唑-4-基	四氢咪喃-2-基	Ph(3-SO ₂ - <i>c</i> -Pr)
	1-Me-1 <i>H</i> -吡唑-4-基	四氢咪喃-3-基	Ph(3-炔丙基)
	1-Me-1 <i>H</i> -1,2,3-三唑-4-基	1,3-二氧戊环-4-基	Ph(3-(2-丁炔基))
	2-Me-1 <i>H</i> -1,2,3-三唑-4-基	2,2-二-氟-1,3-二氧戊环-4-基	Ph(2-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃)
	4-Me-1 <i>H</i> -1,2,3-三唑-2-基	1,3-二硫戊环 (Dithiolan) -	Ph(2-C(=O)CH ₃)
	4-Me-1 <i>H</i> -1,2,3-三唑-1-基	4-基	Ph(2-OC(=O)CH ₃)
	吡嗪-2-基	1,4-二氧戊环-2-基	Ph(3-OC(=O)CH ₃)
	吡嗪-2-基(5-CF ₃)	1,4-二硫戊环-2-基	Ph(2-OC(=O)CF ₃)
	嘧啶-2-基	1-萘基	Ph(3-OC(=O)CF ₃)
	嘧啶-2-基(5-CF ₃)	2-萘基	

[0412] 表2以相同的方式构造,除了行标题“J是-CH₂-;Q²是Ph(2-F);并且Q¹是”被替换为对于下表2列出的行标题(即“J是-CH₂-;Q²是Ph(2,3-二-F);并且Q¹是”)。因此,表2中的第一条目是式I的化合物,其中J是-CH₂-;Q²是Ph(2,3-二-F);并且Q¹是Ph(3-Cl)(即3-氯苯基)。表3至20类似地构造。

[0413]	表	行标题
	2	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2,3-二-F); 并且Q ¹ 是
	3	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2,4-二-F); 并且Q ¹ 是
	4	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2,3,4-三-F); 并且Q ¹ 是
	5	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-CF ₃); 并且Q ¹ 是
	6	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-Me); 并且Q ¹ 是
	7	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-NO ₂); 并且Q ¹ 是
	8	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-Cl); 并且Q ¹ 是
	9	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-SO ₂ Me); 并且Q ¹ 是
	10	J是-CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-F,3-Cl); 并且Q ¹ 是
	11	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-F); 并且Q ¹ 是
	12	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2,3-二-F); 并且Q ¹ 是
	13	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2,4-二-F); 并且Q ¹ 是
	14	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2,3,4-三-F); 并且Q ¹ 是
	15	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-CF ₃); 并且Q ¹ 是
	16	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-Me); 并且Q ¹ 是
	17	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-NO ₂); 并且Q ¹ 是
	18	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-Cl); 并且Q ¹ 是
	19	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-SO ₂ Me); 并且Q ¹ 是
	20	J是-CH ₂ CH ₂ -; Q ² 是Ph(2-F,3-Cl); 并且Q ¹ 是

[0414] 表21

[0415] 表21以与上表1相同的方式构造,除了结构被替换为以下结构:

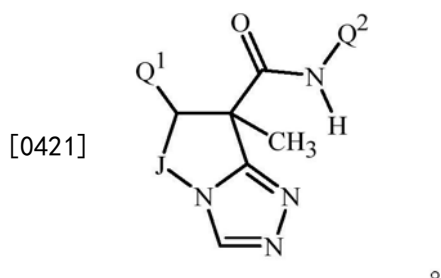


[0417] 表22至40

[0418] 本披露还包括表22至40,每个表以与上表2至20相同的方式构造,除了结构被替换为上表21中的结构。

[0419] 表41

[0420] 表41以与上表1相同的方式构造,除了结构被替换为以下结构:

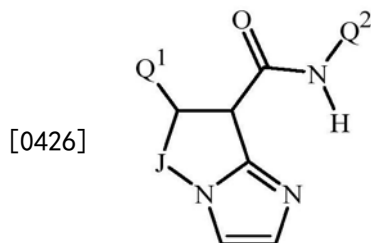


[0422] 表42至60

[0423] 本披露还包括表42至60,每个表以与上表2至20相同的方式构造,除了结构被替换为上表41中的结构。

[0424] 表61

[0425] 表61以与上表1相同的方式构造,除了结构被替换为以下结构:

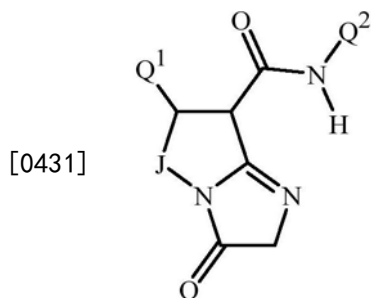


[0427] 表62至80

[0428] 本披露还包括表62至80,每个表以与上表2至20相同的方式构造,除了结构被替换为上表61中的结构。

[0429] 表81

[0430] 表81以与上表1相同的方式构造,除了结构被替换为以下结构:

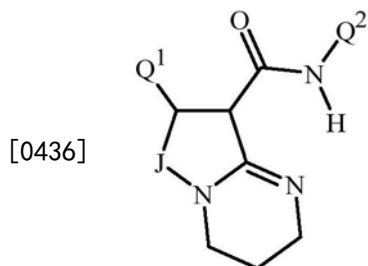


[0432] 表82至100

[0433] 本披露还包括表82至100,每个表以与上表2至20相同的方式构造,除了结构被替换为上表81中的结构。

[0434] 表101

[0435] 表101以与上表1相同的方式构造,除了结构被替换为以下结构:



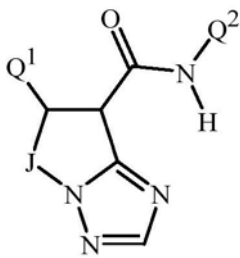
[0437] 表102至120

[0438] 本披露还包括表102至120,每个表以与上表2至20相同的方式构造,除了结构被替换为上表101中的结构。

[0439] 表121

[0440] 表121以与上表1相同的方式构造,除了结构被替换为以下结构:

[0441]



[0442] 表122至140

[0443] 本披露还包括表122至140,每个表以与上表2至20相同的方式构造,除了结构被替换为上表121中的结构。

[0444] 本发明的化合物一般将用作组合物(即制剂)中的除草剂活性成分,其中至少一种附加组分选自下组,该组由以下各项组成:表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂,其用作载体。选择该制剂或组合物成分,以与活性成分的物理特性、施用模式和环境因素诸如土壤类型、水分和温度一致。

[0445] 有用的制剂包括液体和固体组合物二者。液体组合物包括任选地可以被稠化成凝胶的溶液(包括可乳化的浓缩物)、悬浮液、乳液(包括微乳液、水包油乳液、可流动的浓缩物和/或悬浮乳液)等。水性液体组合物的一般类型为可溶性浓缩物、悬浮液浓缩物、胶囊悬浮液、浓缩乳液、微乳液、水包油乳液、可流动的浓缩物和悬浮乳液。非水性液体组合物的一般类型为可乳化的浓缩物、可微乳化的浓缩物、可分散的浓缩物和油分散体。

[0446] 固体组合物的一般类型为粉剂、粉末、颗粒剂、球剂、粒料、锭剂、片剂、填充膜(包括种子包衣)等,它们可以是水-可分散的(“可润湿的”)或水-溶性的。由成膜溶液或可流动的悬浮液形成的膜和包衣特别可用于种子处理。活性成分可以被(微)包封并进一步形成悬浮液或固体制剂;可替代地,活性成分的整个制剂可以被包封(或“包覆”)。包封可以控制或延缓活性成分的释放。可乳化的颗粒剂结合了可乳化的浓缩物制剂和干颗粒制剂两者的优点。高强度组合物主要用作进一步制剂的中间体。

[0447] 可喷雾的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成在喷雾介质,通常为水,但偶尔另一种合适介质像芳族烃或石蜡烃或植物油中易于稀释的。喷雾体积的范围可以为每公顷从约一升至几千升,但更典型为在每公顷从约十至几百升的范围内。可喷雾的制剂可在槽中与水或另一种合适的介质混合,用于通过空气或地面施用来进行叶处理,或用于施用到植物的生长介质中。液体和干制剂可以直接计量加入滴灌系统中,或在种植期间计量加入垄沟中。

[0448] 制剂典型地将含有在以下近似范围(总计达100重量百分比)内的有效量的活性成分、稀释剂和表面活性剂。

		重量百分比		
		活性成分	稀释剂	表面活性剂
[0449]	水可分散的和可溶性的颗粒剂、片剂和粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
	油分散体、悬浮液、乳液、溶液(包括可乳化的浓缩物)	1-50	40-99	0-50
	粉剂	1-25	70-99	0-5
	颗粒剂和球剂	0.001-99	5-99.999	0-15
	高强度组合物	90-99	0-10	0-2

[0450] 固体稀释剂包括,例如,粘土诸如膨润土、蒙脱土、凹凸棒石和高岭土、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等人的Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers[杀昆虫剂粉剂稀释剂和载体手册],第2版,Dorland Books,考德威尔,新泽西州中进行描述。

[0451] 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、二丙二醇、聚丙二醇、碳酸亚丙酯、碳酸亚丁酯、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、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,其他酯,诸如诸如烷基化乳酸酯、二元酯、苯甲酸烷基和芳基酯和 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、甲酚和苜醇。液体稀释剂还包括饱和的和饱和的脂肪酸(典型地为 C_6 - C_{22})的甘油酯,诸如植物种子和果实油(例如,橄榄油、蓖麻油、亚麻籽油、芝麻油、玉米油(玉蜀黍油)、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、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来自植物和动物来源的甘油酯的水解获得,并且可通过蒸馏纯化。典型的液体稀释剂在Marsden, Solvents Guide[溶剂指南],第2版,Interscience,纽约,1950中进行描述。

[0452] 本发明的固体和液体组合物经常包括一种或多种表面活性剂。当添加到液体中时,表面活性剂(也称为“表面活性试剂”)通常改变、最经常地降低液体的表面张力。根据表面活性剂分子中的亲水和亲脂基团的性质,表面活性剂可用作润湿剂、分散剂、乳化剂或消泡剂。

[0453] 表面活性剂可以分为非离子的、阴离子的或阳离子的。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,诸如基于天然醇和合成醇(其可以是支链或直链的)并且由醇和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备的醇烷氧基化物;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,诸如乙氧基化的大豆油、蓖麻油和油菜籽油;烷基酚烷氧基化物,诸如辛基酚乙氧基化物、壬基酚乙氧基

化物、二壬基酚乙氧基化物和十二烷基酚乙氧基化物(由酚和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或其混合物制备);由环氧乙烷或环氧丙烷制备的嵌段聚合物和其中末端嵌段由环氧丙烷制备的反式嵌段聚合物;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酚(包括由环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或其混合物制备的那些);脂肪酸酯、甘油酯、基于羊毛脂的衍生物、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);其他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,诸如无规共聚物、嵌段共聚物、醇酸peg(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(pegs);聚乙二醇脂肪酸酯;硅酮基表面活性剂;和糖衍生物,诸如蔗糖酯、烷基多糖苷和烷基多糖。

[0454] 有用的阴离子表面活性剂包括但不限于:烷基芳基磺酸及其盐;羧化的醇或烷基酚乙氧基化物;二苯基磺酸酯衍生物;木质素和木质素衍生物,诸如木质素磺酸盐;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酚乙氧基化物的磷酸酯;基于蛋白质的表面活性剂;肌氨酸衍生物;苯乙烯基酚醚硫酸盐;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,诸如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;馏石油的磺酸盐;磺基琥珀酰胺酸盐;以及磺基琥珀酸盐和它们的衍生物,诸如二烷基磺基琥珀酸盐。

[0455] 有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;胺诸如N-烷基丙二胺、三亚丙基三胺和二亚丙基四胺,和乙氧基化胺、乙氧基化二胺以及丙氧基化胺(由胺和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备);胺盐如乙酸铵和二胺盐;季铵盐如季盐、乙氧基化季盐和二季盐;以及胺氧化物,诸如烷基二甲基胺氧化物和双-(2-羟乙基)-烷基胺氧化物。

[0456] 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用途在多个已公布的参考文献中披露,这些参考文献包括McCutcheon分部,The Manufacturing Confectioner Publishing Co.[糖果制造商出版公司]出版的McCutcheon's Emulsifiers and Detergents[McCutcheon的乳化剂和洗涤剂],annual American and International Editions[美国和国际年度版];Sisely 和Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents[表面活性剂百科全书],Chemical Publ.Co., Inc.[化工出版社有限公司],纽约,1964;以及A.S.Davidson和B. Milwidsky, Synthetic Detergents[合成洗涤剂],第七版,约翰威利父子出版社,纽约,1987。

[0457] 本发明的组合物还可包含本领域技术人员已知为辅助制剂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)。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(蒸发阻滞剂)、以及其他制剂属性。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由McCutcheon的分

部, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出版的 McCutcheon 的第二卷: Functional Materials [功能材料], 国际和北美年度版; 以及 PCT 公布 WO 03/024222 中列出的那些。

[0458] 通常通过将活性成分溶于溶剂中或者通过在液体或干稀释剂中研磨将式1的化合物和任何其他活性成分结合到本发明组合中。可通过简单地混合这些成分来制备包括可乳化的浓缩物的溶液。如果旨在用作可乳化的浓缩物的液体组合物的溶剂是与水不混溶的, 通常加入乳化剂以使含有活性成分的溶剂在用水稀释时乳化。粒径最高达2,000 μm 的活性成分浆料可以使用介质研磨机进行湿法研磨, 以得到平均粒径低于3 μm 的颗粒。水性浆液可以制成成品悬浮液浓缩物(参见, 例如, U.S. 3,060,084) 或通过喷雾干燥进一步加工以形成水可分散性颗粒剂。干制剂通常需要干研磨过程, 其产生在2至10 μm 范围内的平均粒径。粉剂和粉末可以通过共混并且通常通过研磨(例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的颗粒剂载体上或者通过附聚技术来制备颗粒剂和球剂。参见, Browning, "Agglomeration [附聚]", Chemical Engineering [化学工程], 1967年12月4日, 第147-48页; Perry's Chemical Engineer's Handbook [佩里化学工程师手册], 第4版, McGraw-Hill [麦格劳希尔集团], 纽约, 1963, 第8-57页及其后页, 以及 WO 91/13546。球剂可以如 U.S. 4,172,714 中所述制备。水-可分散的和水-溶性颗粒剂可如在 U.S. 4,144,050、U.S. 3,920,442 和 DE 3,246,493 中传授的来制备。片剂可以如在 U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 和 U.S. 5,208,030 中所传授的来制备。膜可以如在 GB 2,095,558 和 U.S. 3,299,566 中所传授的来制备。

[0459] 关于制剂领域的进一步信息, 参见 T.S. Woods, Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge [农药化学与生物科学, 食品与环境挑战] 中的 "The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture [制剂工具箱- 现代农业产品形式]", T. Brooks 和 T.R. Roberts 编辑, Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry [第九届农药化学国际会议论文集], The Royal Society of Chemistry [皇家化学学会], 剑桥, 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行和实例10-41; U.S. 3,309,192, 第5栏, 第43行至第7栏, 第62行和实例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行和实例1-4; Klingman, Weed Control as a Science [杂草控制科学], 约翰威利父子公司, 纽约, 1961, 第81-96页; Hance 等人, Weed Control Handbook [杂草控制手册], 第8版, Blackwell Scientific Publications [布莱克威尔科学出版社], 牛津, 1989; 和 Developments in formulation technology [配方技术的发展], PJB 出版公司 (PJB Publications), 里士满, UK, 2000。

[0460] 在下列实例中, 全部百分比都是按重量计的, 并且所有制剂以常规的方式制备。化合物编号是指索引表A中的化合物。无需进一步详尽说明, 据信本领域技术人员使用前述说明可将本发明利用至其最大程度。因此, 以下实例应被解释为仅仅是说明性的, 并非以任何方式限制本披露。除非另外说明, 否则百分比按重量计。

[0461] 实例A

[0462] 高强度浓缩物

[0463] 化合物1 98.5%

[0464]	二氧化硅气凝胶	0.5%	
[0465]	合成无定形精细二氧化硅	1.0%	
[0466]	<u>实例B</u>		
[0467]	<u>可润湿的粉末</u>		
	化合物 1		65.0%
	十二烷基酚聚乙二醇醚		2.0%
[0468]	木质素磺酸钠		4.0%
	硅铝酸钠		6.0%
	蒙脱土 (煅烧的)		23.0%
[0469]	<u>实例C</u>		
[0470]	<u>颗粒剂</u>		
[0471]	化合物1	10.0%	
[0472]	凹凸棒石颗粒剂 (低挥发性物质, 0.71/0.30 筛)	90.0%	mm; U.S.S.No. 25-50
[0473]	<u>实例D</u>		
[0474]	<u>挤出球剂</u>		
	化合物 1		25.0%
	无水硫酸钠		10.0%
[0475]	粗木质素磺酸钙		5.0%
	烷基萘磺酸钠		1.0%
	钙/镁膨润土		59.0%
[0476]	<u>实例E</u>		
[0477]	<u>可乳化的浓缩物</u>		
[0478]	化合物1	10.0%	
[0479]	聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	20.0%	
[0480]	C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%	
[0481]	<u>实例F</u>		
[0482]	<u>微乳液</u>		
	化合物 1		5.0%
	聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物		30.0%
[0483]	烷基多糖苷		30.0%
	单油酸甘油酯		15.0%
	水		20.0%
[0484]	<u>实例G</u>		
[0485]	<u>悬浮浓缩物</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%
	苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
[0486]	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
	基于硅酮的消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	水	53.7%
[0487]	<u>实例H</u>	
[0488]	<u>在水中的乳液</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%
	苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
[0489]	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
	基于硅酮的消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	基于芳族石油的烃	20.0
[0490]	水	58.7%
[0491]	<u>实例I</u>	
[0492]	<u>油分散体</u>	
	化合物 1	25%
	聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	15%
[0493]	有机改性的膨润土	2.5%
	脂肪酸甲酯	57.5%

[0494] 本披露还包括以上制剂实例A至I,除了上述实例A至I中的每一个中的“化合物是1”被“化合物2”、“化合物3”、“化合物4”、“化合物5”、“化合物6”、“化合物7”、“化合物8”、“化合物9”、“化合物10”、“化合物 11”、“化合物12”、“化合物13”、“化合物14”、“化合物15”、“化合物 16”、“化合物17”、“化合物18”、“化合物19”、“化合物20”、“化合物 21”、“化合物22”、“化合物23”、“化合物24”、“化合物25”、“化合物 26”、“化合物27”或“化合物28”替代。

[0495] 测试结果示出,观察到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。观察到本发明的化合物通常对于出苗后杂草控制(即在杂草从土壤中出苗之后施用)和出苗前杂草控制(即在杂草从土壤中出苗之前施用)显示出最高活性。观察到在希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、灌溉与其他水道周围、广告牌与高速公路及铁路结构体周围,它们中许

多对于广范围的出苗前和/或出苗后杂草控制具有效用。观察到本发明的许多化合物经由下列方式可用于选择性控制作物/杂草混生中的禾草与阔叶杂草：借助在作物对比杂草中的选择性代谢，或通过在作物与杂草中的生理抑制位点处具有选择性活性，或通过在作物与杂草混生的环境之上或之中的选择性施放。本领域技术人员将认识到，在化合物或化合物组内，这些选择性因子的优选组合可通过进行常规生物和/或生物化学测定容易地确定。观察到本发明的化合物示出对重要农作物的耐受性，这些农作物包括但不限于苜蓿、大麦、棉、小麦、油菜、甜菜、玉米(玉蜀黍)、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、可可、油棕、橡胶、甘蔗、柑橘、葡萄、果树、坚果树、香蕉、车前草、菠萝、啤酒花、茶和树木诸如桉树和针叶树(例如火炬松)、以及草皮物类(例如肯塔基蓝草、圣奥古斯丁草、肯塔基牛毛草和百慕大草)。本发明的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/或表达其他有用的性状。本领域技术人员将理解，并不是所有的化合物对所有杂草都是同等有效的。可替代地，主题化合物可用于改变植物生长。

[0496] 由于本发明的化合物具有出苗前和出苗后两种除草活性，以通过杀灭或伤害植被或减缓其生长来控制不希望的植被，通常由多种方法来有效地施用化合物，这些方法涉及使除草有效量的本发明的化合物、或包含所述化合物和表面活性剂、固体稀释剂或液体稀释剂中的至少一种的组合物接触不希望植被的叶子或其他部位，或接触不希望植被的环境，诸如土壤或水，该不希望植被生长于该环境中，或该环境包围该不希望植被的种子或其他繁殖体。

[0497] 本发明的化合物的除草有效量是由许多因素决定的。这些因素包括：所选择的制剂、施用方法、所存在植被的量和类型、生长条件等。一般来讲，本发明的化合物的除草有效量为约0.001kg/ha至20kg/ha，其中优选范围为约0.004kg/ha至1 kg/ha。本领域技术人员可以容易地确定希望的杂草控制水平所需的除草有效量。

[0498] 在一个常见的实施例中，将本发明的化合物通常以配制的组合物施用于包括希望植被(例如作物)和不期望植被(即杂草)的所在地，该希望植被和不希望植被二者均可与生长介质(例如土壤)接触的种子、幼苗和/或较大植物。在此所在地，可将包含本发明化合物的组合物直接施用于植物或其一部分，特别是不希望的植被，和/或施用于与植物接触的生长介质。

[0499] 在用本发明的化合物处理的所在地中的希望植被的植物品种和栽培品系可通过常规的繁殖和育种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基因组中的那些。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或转基因事件。

[0500] 可根据本发明处理的该所在地中经基因修饰的植物栽培品系包括抵抗一种或多种生物胁迫的那些(害虫，诸如线虫、昆虫、螨虫、真菌等)或非生物胁迫(干旱、低温、土壤盐化等)，或包含其他希望的特征的那些。植物可经基因修饰以表现出性状，例如除草剂耐受性、昆虫抗性、修饰的油特征或耐旱性。包括单个基因转化事件或转化事件的组合的有用的经基因修饰的植物列出于示例C中。示例C中所列的基因修饰的附加信息可以从例如美国农业部(U.S. Department of Agriculture) 保持的公开可用的数据库中获得。

[0501] 以下缩写T1至T37在示例C中用于性状。“-”表示该条目不可用；“tol.”是指“耐受

性”并且“res.”是指抗性。

	性状	描述	性状	描述	性状	描述
	T1	草甘膦耐受性	T15	寒冷耐受性	T27	高色氨酸
	T2	高月桂酸油	T16	咪唑啉酮除草剂 (herb.) 耐受性	T28	半矮生的直立叶
	T3	草铵膦耐受性	T17	改性的 α -淀粉酶	T29	半矮生的
	T4	肌醇六磷酸分解	T18	授粉控制	T30	低铁耐受性
[0502]	T5	Oxynil 耐受性	T19	2,4-D 耐受性	T31	改性的油/脂肪酸
	T6	病害抗性	T20	增加的赖氨酸	T32	HPPD 耐受性
	T7	昆虫抗性	T21	耐旱性	T33	高油
	T9	修饰的花色	T22	延缓成熟/衰老	T34	芳氧基链烷酸酯耐 受性
	T11	ALS 除草剂耐受性	T23	改性的产品品质	T35	甲基磺草酮耐受性
	T12	麦草畏耐受性	T24	高纤维素	T36	减少的烟碱
[0503]	T13	抗过敏	T25	改性的淀粉/碳水化合物	T37	修饰的产品
	T14	盐耐受性	T26	昆虫 & 病害抗性		
[0504]	<u>示例C</u>					

作物	事件名称	事件代码	性状	基因
苜蓿	J101	MON-00101-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
苜蓿	J163	MON-ØØ163-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
低芥酸菜籽*	23-18-17 (事件 18)	CGN-89465-2	T2	te
低芥酸菜籽*	23-198 (事件 23)	CGN-89465-2	T2	te
低芥酸菜籽*	61061	DP-Ø61Ø61-7	T1	gat4621
低芥酸菜籽*	73496	DP-Ø73496-4	T1	gat4621
低芥酸菜籽*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247
低芥酸菜籽*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247
低芥酸菜籽*	HCN10 (Topas 19/2)	-	T3	bar
[0505] 低芥酸菜籽*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	T3	pat (syn)
低芥酸菜籽*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	T3	bar
低芥酸菜籽*	MON88302	MON-883Ø2-9	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
低芥酸菜籽*	MPS961	-	T4	phyA
低芥酸菜籽*	MPS962	-	T4	phyA
低芥酸菜籽*	MPS963	-	T4	phyA
低芥酸菜籽*	MPS964	-	T4	phyA
低芥酸菜籽*	MPS965	-	T4	phyA
低芥酸菜籽*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	T3	bar
低芥酸菜	MS8	ACS-	T3	bar

	籽*		BN005-8		
	低芥酸菜籽*	OXY-235	ACS-BN011-5	T5	bxn
	低芥酸菜籽*	PHY14	-	T3	bar
	低芥酸菜籽*	PHY23	-	T3	bar
	低芥酸菜籽*	PHY35	-	T3	bar
	低芥酸菜籽*	PHY36	-	T3	bar
	低芥酸菜籽*	RF1 (B93-101)	ACS-BN001-4	T3	bar
	低芥酸菜籽*	RF2 (B94-2)	ACS-BN002-5	T3	bar
	低芥酸菜籽*	RF3	ACS-BN003-6	T3	bar
	菜豆	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	T6	ac1 (正义和反义)
	茄子#	EE-1	-	T7	cry1Ac
[0506]	棉	19-51a	DD-01951A-7	T11	S4-HrA
	棉	281-24-236	DAS-24236-5	T3,T7	pat (syn); cry1F
	棉	3006-210-23	DAS-21023-5	T3,T7	pat (syn); cry1Ac
	棉	31707	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	棉	31803	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	棉	31807	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	棉	31808	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	棉	42317	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	棉	BNLA-601	-	T7	cry1Ac
	棉	BXN10211	BXN10211-9	T5	bxn; cry1Ac
	棉	BXN10215	BXN10215-4	T5	bxn; cry1Ac
	棉	BXN10222	BXN10222-2	T5	bxn; cry1Ac
	棉	BXN10224	BXN10224-4	T5	bxn; cry1Ac
	棉	COT102	SYN-IR102-7	T7	vip3A(a)
	棉	COT67B	SYN-IR67B-1	T7	cry1Ab
	棉	COT202	-	T7	vip3A

	棉	事件 1	-	T7	cry1Ac
	棉	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	T7	cry1Ab-Ac
	棉	GHB119	BCS-GH005-8	T7	cry2Ae
	棉	GHB614	BCS-GH002-5	T1	2mepsps
	棉	GK12	-	T7	cry1Ab-Ac
	棉	LLCotton25	ACS-GH001-3	T3	bar
	棉	MLS 9124	-	T7	cry1C
	棉	MON1076	MON-89924-2	T7	cry1Ac
	棉	MON1445	MON-01445-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	棉	MON15985	MON-15985-7	T7	cry1Ac; cry2Ab2
	棉	MON1698	MON-89383-1	T7	cp4 epsps (aroA:CP4)
	棉	MON531	MON-00531-6	T7	cry1Ac
	棉	MON757	MON-00757-7	T7	cry1Ac
[0507]	棉	MON88913	MON-88913-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	棉	Nqwe Chi 6 Bt	-	T7	-
	棉	SKG321	-	T7	cry1A; CpTI
	棉	T303-3	BCS-GH003-6	T3,T7	cry1Ab; bar
	棉	T304-40	BCS-GH004-7	T3,T7	cry1Ab; bar
	棉	CE43-67B	-	T7	cry1Ab
	棉	CE46-02A	-	T7	cry1Ab
	棉	CE44-69D	-	T7	cry1Ab
	棉	1143-14A	-	T7	cry1Ab
	棉	1143-51B	-	T7	cry1Ab
	棉	T342-142	-	T7	cry1Ab
	棉	PV-GHGT07 (1445)	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	棉	EE-GH3	-	T1	mepsps
	棉	EE-GH5	-	T7	cry1Ab
	棉	MON88701	MON-88701-3	T3,T12	经修饰的 dmo; bar
	棉	OsCr11	-	T13	经修饰的 Cry j
	亚麻	FP967	CDC-FL001-2	T11	als
	兵豆	RH44	-	T16	als
	玉蜀黍	3272	SYN-	T17	amy797E

	玉蜀黍	5307	E3272-5 SYN-05307-1	T7	ecry3.1Ab
	玉蜀黍	59122	DAS-59122-7	T3,T7	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	玉蜀黍	676	PH-000676-7	T3,T18	pat; dam
	玉蜀黍	678	PH-000678-9	T3,T18	pat; dam
	玉蜀黍	680	PH-000680-2	T3,T18	pat; dam
	玉蜀黍	98140	DP-098140-6	T1,T11	gat4621; zm-hra
	玉蜀黍	Bt10	-	T3,T7	cry1Ab; pat
	玉蜀黍	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	T3,T7	cry1Ab; bar
	玉蜀黍	BVLA430101	-	T4	phyA2
	玉蜀黍	CBH-351	ACS-ZM004-3	T3,T7	cry9C; bar
	玉蜀黍	DAS40278-9	DAS40278-9	T19	aad-1
	玉蜀黍	DBT418	DKB-89614-9	T3,T7	cry1Ac; pinII; bar
[0508]	玉蜀黍	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	T3	bar
	玉蜀黍	GA21	MON-00021-9	T1	mepsps
	玉蜀黍	GG25	-	T1	mepsps
	玉蜀黍	GJ11	-	T1	mepsps
	玉蜀黍	Fl117	-	T1	mepsps
	玉蜀黍	GAT-ZM1	-	T3	pat
	玉蜀黍	LY038	REN-00038-3	T20	cordapA
	玉蜀黍	MIR162	SYN-IR162-4	T7	vip3Aa20
	玉蜀黍	MIR604	SYN-IR604-5	T7	mcry3A
	玉蜀黍	MON801 (MON80100)	MON801	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247
	玉蜀黍	MON802	MON-80200-7	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247
	玉蜀黍	MON809	PH-MON-809-2	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247
	玉蜀黍	MON810	MON-00810-6	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247
	玉蜀黍	MON832	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247

	玉蜀黍	MON863	MON-00863-5	T7	cry3Bb1
	玉蜀黍	MON87427	MON-87427-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	玉蜀黍	MON87460	MON-87460-4	T21	cspB
	玉蜀黍	MON88017	MON-88017-3	T1,T7	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
	玉蜀黍	MON89034	MON-89034-3	T7	cry2Ab2; cry1A.105
	玉蜀黍	MS3	ACS-ZM001-9	T3,T18	bar; barnase
	玉蜀黍	MS6	ACS-ZM005-4	T3,T18	bar; barnase
	玉蜀黍	NK603	MON-00603-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	玉蜀黍	T14	ACS-ZM002-1	T3	pat (syn)
	玉蜀黍	T25	ACS-ZM003-2	T3	pat (syn)
	玉蜀黍	TC1507	DAS-01507-1	T3,T7	cry1Fa2; pat
	玉蜀黍	TC6275	DAS-06275-8	T3,T7	mocry1F; bar
[0509]	玉蜀黍	VIP1034	-	T3,T7	vip3A; pat
	玉蜀黍	43A47	DP-043A47-3	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	玉蜀黍	40416	DP-040416-8	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	玉蜀黍	32316	DP-032316-8	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	玉蜀黍	4114	DP-004114-3	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	甜瓜	甜瓜 A	-	T22	sam-k
	甜瓜	甜瓜 B	-	T22	sam-k
	番木瓜	55-1	CUH-CP551-8	T6	prsv cp
	番木瓜	63-1	CUH-CP631-7	T6	prsv cp
	番木瓜	Huanong1 号	-	T6	prsv rep
	番木瓜	X17-2	UFL-X17CP-6	T6	prsv cp
	李子	C-5	ARS-PLMC5-6	T6	ppv cp
	低芥酸菜籽**	ZSR500	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247
	低芥酸菜	ZSR502	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4) ;

	籽**				goxv247
	低芥酸菜				cp4 epsps (aroA:CP4) ;
	籽**	ZSR503	-	T1	goxv247
	稻	7Crp#242-95-7	-	T13	7crp
	稻	7Crp#10	-	T13	7crp
	稻	GM Shanyou 63	-	T7	cry1Ab; cry1Ac
	稻	Huahui-1/TT51-1	-	T7	cry1Ab; cry1Ac
	稻	LLRICE06	ACS-OS001-4	T3	bar
	稻	LLRICE601	BCS-OS003-7	T3	bar
	稻	LLRICE62	ACS-OS002-5	T3	bar
	稻	Tarom molaii + cry1Ab	-	T7	cry1Ab (截短的)
	稻	GAT-OS2	-	T3	bar
	稻	GAT-OS3	-	T3	bar
	稻	PE-7	-	T7	Cry1Ac
	稻	7Crp#10	-	T13	7crp
	稻	KPD627-8	-	T27	OASA1D
	稻	KPD722-4	-	T27	OASA1D
	稻	KA317	-	T27	OASA1D
[0510]	稻	HW5	-	T27	OASA1D
	稻	HW1	-	T27	OASA1D
	稻	B-4-1-18	-	T28	Δ OsBRI1
	稻	G-3-3-22	-	T29	OSGA2ox1
	稻	AD77	-	T6	DEF
	稻	AD51	-	T6	DEF
	稻	AD48	-	T6	DEF
	稻	AD41	-	T6	DEF
	稻	13pNasNa800725atAprt1	-	T30	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
	稻	13pAprt1	-	T30	APRT
	稻	gHvNAS1-gHvNAAT-1	-	T30	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B
	稻	gHvIDS3-1	-	T30	HvIDS3
	稻	gHvNAAT1	-	T30	HvNAAT-A; HvNAAT-B
	稻	gHvNAS1-1	-	T30	HvNAS1
	稻	NIA-OS006-4	-	T6	WRKY45
	稻	NIA-OS005-3	-	T6	WRKY45
	稻	NIA-OS004-2	-	T6	WRKY45
	稻	NIA-OS003-1	-	T6	WRKY45
	稻	NIA-OS002-9	-	T6	WRKY45

稻	NIA-OS001-8	-	T6	WRKY45
稻	OsCr11	-	T13	经修饰的 Cry j
稻	17053	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
稻	17314	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
玫瑰	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	T9	5AT; bp40 (f3'5'h)
玫瑰	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	T9	5AT; bp40 (f3'5'h)
大豆	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	-	T9	gm-fad2-1 (沉默位点)
大豆	A2704-12	ACS-GM005-3	T3	pat
大豆	A2704-21	ACS-GM004-2	T3	pat
大豆	A5547-127	ACS-GM006-4	T3	pat
大豆	A5547-35	ACS-GM008-6	T3	pat
大豆	CV127	BPS-CV127-9	T16	csr1-2
大豆	DAS68416-4	DAS68416-4	T3	pat
大豆	DP305423	DP-305423-1	T11,T31	gm-fad2-1 (沉默位点) ; gm-hra
[0511] 大豆	DP356043	DP-356043-5	T1,T31	gm-fad2-1 (沉默位点) ; gat4601
大豆	FG72	MST-FG072-3	T32,T1	2mepsps; hppdPF W336
大豆	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
大豆	GU262	ACS-GM003-1	T3	pat
大豆	MON87701	MON-87701-2	T7	cry1Ac
大豆	MON87705	MON-87705-6	T1,T31	fatb1-A (正义和反义) ; fad2-1A (正义和反义) ; cp4 epsps (aroA:CP4)
大豆	MON87708	MON-87708-9	T1,T12	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
大豆	MON87769	MON-87769-7	T1,T31	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
大豆	MON89788	MON-89788-1	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
大豆	W62	ACS-GM002-9	T3	bar
大豆	W98	ACS-GM001-8	T3	bar
大豆	MON87754	MON-	T33	dgat2A

	大豆	DAS21606	87754-1 DAS-21606	T34,T3	经修饰的 aad-12; pat
	大豆	DAS44406	DAS-44406-6	T1, T3, T34	经修饰的 aad-12; 2mepsps; pat
	大豆	SYHT04R	SYN-0004R-8	T35	经修饰的 avhppd
	大豆	9582.814.19.1	-	T3,T7	cry1Ac, cry1F, PAT
	南瓜	CZW3	SEM-ØCZW3-2	T6	cmv cp, zymv cp, wmv cp
	南瓜	ZW20	SEM-0ZW20-7	T6	zymv cp, wmv cp
[0512]	甜菜	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4) ; goxv247
	甜菜	H7-1	KM-000H71-4	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	甜菜	T120-7	ACS-BV001-3	T3	pat
	甜菜	T227-1	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	甘蔗	NXI-1T	-	T21	Ecbeta
	向日葵	X81359	-	T16	als
	胡椒	PK-SP01	-	T6	cmv cp
	烟草	C/F/93/08-02	-	T5	bxn
	烟草	Vector 21-41	-	T36	NtQPT1 (反义)
	向日葵	X81359	-	T16	als
	小麦	MON71800	MON-71800-3	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)

[0513] *阿根廷油菜(甘蓝型油菜),**波兰白菜(芜菁(B.rapa)),#紫茄子(Eggplant)

[0514] 虽然最典型地,本发明的化合物用于控制不希望的植被,但是使希望的植被在经处理的所在地中与本发明的化合物接触可导致与期望植被的遗传性状的超加性或协同效应,包括通过基因修饰引入的性状。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比希望植被的遗传性状中所希望的更大。

[0515] 本发明的化合物还可与一种或多种其他生物学活性化合物或试剂混合以形成多组分杀虫剂,从而赋予甚至更广范围的农业保护,这些生物学活性化合物或试剂包括除草剂、除草剂安全剂、杀真菌剂、杀昆虫剂、杀线虫剂、杀菌剂、杀螨剂、生长调节剂诸如昆虫蜕皮抑制剂和生根刺激剂、化学不育剂、化学信息素、驱虫剂、引诱剂、信息素、取食刺激剂、植物营养素、其他生物学活性化合物或昆虫病原细菌、病毒或真菌。本发明化合物与其他除草剂的混合物可扩大抵抗附加杂草物种的活性范围,并且抑制任何抗性生物类型的增殖。因此,本发明还涉及包含式1的化合物(处于除草有效量)和至少一种附加生物活性化合物或试剂(处于生物学有效量)的组合物,并且该组合物可进一步包含表面活性剂、固体稀释剂或液体稀释剂中的至少一种。其他生物活性化合物或试剂可以配制到包含表面活性剂、固体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,可将一种或多种其他生物活性化合物或试剂与式1的化合物配制在一起以形成预混物,或者一种或多种其他生物活性化合物或试剂可与式1的化合物分开配制,并且在施用前将制剂组合在一起(例如在喷

雾罐中),或可替代地,依次施用。

[0516] 以下除草剂中的一种或多种与本发明的化合物的混合物可尤其用于杂草控制:乙草胺、三氟羧草醚及其钠盐、苯草醚、丙烯醛(2-丙烯醛)、甲草胺、禾草灭、莠灭净、氨基草酮、酰嘧磺隆、环丙嘧啶酸及其酯(例如甲基、乙基)和盐(例如钠、钾)、氯氨吡啶酸、杀草强、氨基磺酸铵、莎稗磷、磺草灵、莠去津、四唑嘧磺隆、氟丁酰草胺、草除灵、草除灵乙酯、苯唑磺隆(bencarbazonone)、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、丁乐灵、丁苯草酮、丁草特、苯酮唑、卡草胺、三唑酮草酯、儿茶素、甲氧除草醚、草灭平、氯溴隆、氯甲丹、杀草敏、氯嘧磺隆、绿麦隆、氯苯胺灵、氯磺隆、氯酞酸二甲酯、赛草青、吡啶酮草酯、环庚草醚、醚磺隆、氯酞草膦、环苯草酮、烯草酮、炔草酯、异噁草酮、稗草胺、二氯吡啶酸、二氯吡啶酸乙醇胺、氯酯磺草胺、苄草隆、氰草津、环草特、环比瑞摩、环丙嘧磺隆、噻草酮、氰氟草酯、2,4-D及其丁氧基酯、丁酯、异辛酯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、茅草枯钠、棉隆、2,4-DB及其二甲基铵盐、钾盐和钠盐、甜菜安、敌草净、麦草畏及其二乙二醇铵盐、二甲基铵盐、钾盐和钠盐、敌草腈、滴丙酸、禾草灵、双氯磺草安、野燕枯硫酸二甲酯、吡氟草胺、氟吡草胺、噁唑隆、哌草丹、二甲草胺、异戊净、噻吩草胺、噻吩草胺-P、噻节因、二甲胂酸及其钠盐、敌乐胺、特乐酚、双苯酰草胺、敌草快、氟硫草定、敌草隆、DNOC、草多索、EPTC、戊草丹、乙丁烯氟灵、胺苯磺隆、乙嗪草酮、乙呋草黄、氯氟草醚、乙氧嘧磺隆、乙氧苯草胺、噁唑禾草灵、精噁唑禾草灵、异噁苯砜、芬昆诺三酮、四唑酰草胺、非草隆、非草隆-TCA、麦草氟甲酯、麦草氟异丙酯、麦草氟甲酯、啶嘧磺隆、双氟磺草胺、吡氟禾草灵、精吡氟禾草灵、异丙吡草酯、氟酮磺隆、氟吡磺隆、氟消草、氟噻草胺、氟吡嗪、氟吡嗪草酯、唑嘧磺草胺、氟胺草酯、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、苄醇丁酯、氟啶草酮、氟咯草酮、氯氟吡氧乙酸、呋草酮、氟噻甲草酯、氟磺胺草醚、甲酰胺磺隆、调节膦-铵、草胺膦、草胺膦铵、精草胺膦、草甘膦及其盐诸如铵、异丙基铵、钾、钠(包括倍半钠)和三甲基铊(可替代地称为草硫膦)、氟氯吡啶酯、氟氯吡啶甲酯、氯吡嘧磺隆、氟吡乙禾灵、氟吡甲禾灵、环嗪酮、海丹托西丁、咪草酸、甲氧咪草烟、甲咪唑烟酸、灭草烟、灭草嗪、灭草嗪铵、咪草烟、咪草烟铵、唑吡嘧磺隆、茚草酮、三嗪茚草胺、碘嗪磺隆、甲基碘磺隆、碘苯腈、碘苯腈辛酸酯、碘苯腈钠、三唑酰草胺、异丙隆、异噁隆、异噁草胺、异噁唑草酮、异噁氯草酮、乳氟禾草灵、环草定、利谷隆、抑芽丹、MCPA及其盐(例如,MCPA-二甲基铵、MCPA-钾和MCPA-钠、酯(例如,MCPA-2-乙基己基酯、MCPA-丁氧乙酯)和硫酯(例如,MCPA-乙硫酯)、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、苯噻草胺、氟磺酰草胺、甲磺胺磺隆、甲基磺草酮、威百亩钠、噁唑酰草胺、苯嗪草酮、吡唑草胺、嗪吡嘧磺隆、甲基苯噻隆、甲胂酸及其钙盐、单铵盐、单钠盐和二钠盐、甲基杀草隆、甲氧苯草隆、溴谷隆、异丙甲草胺、精异丙甲草胺、磺草唑胺、甲氧隆、嗪草酮、甲磺隆、草达灭、绿谷隆、萘丙胺、敌草胺、敌草胺-M、萘草胺、草不隆、烟嘧磺隆、哒草伏、坪草丹、嘧苯胺磺隆、氨基磺乐灵、丙炔噁草酮、噁草酮、环氧嘧磺隆、噁嗪草酮、乙氧氟草醚、百草枯二氯盐、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、氟草磺胺、烯草胺(pethoxamid)、百特胺(pethoxyamid)、苯敌草、毒莠定、毒莠定钾、氟吡酰草胺、唑啉草酯、哌草磷、丙草胺、氟嘧磺隆、氨基丙氟灵、环苯草酮、扑灭通、扑草净、毒草胺、敌稗、噁草酯、扑灭津、苯胺灵、异丙草

胺、丙苯磺隆、丙嗪磺隆、戊炔草胺、苜草丹、氟磺隆、双唑草腈、吡草醚、磺酰草吡脱、双唑草腈 (pyrazogyl)、吡唑特、苜草唑、吡啶磺隆、苯嘧磺草胺、稗草畏、达草特、环酯草醚、嘧草醚、嘧啶硫磺 (pyrimisulfan)、嘧硫草醚、嘧硫草醚钠、罗克杀草砒、甲氧磺草胺、二氯喹啉酸、氯甲喹啉酸、灭藻醌、喹禾灵、精喹禾灵、喹禾糠酯、砒啶磺隆、嘧啶肟草醚、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、特丁噻草隆、特吠三酮、环磺酮、得杀草、特草定、特丁通、特丁津、去草净、甲氧噻草胺、噻草啶、噻酮磺隆、噻吩磺隆、禾草丹、氟丙嘧草酯、仲草丹、托派拉雷 (tolpyralate)、苯吡唑草酮、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、三氯比、绿草定三乙铵、灭草环、草达津、三氟啶磺隆、三氟草嗪 (trifludimoxazin)、氟乐灵、氟胺磺隆、三氟甲磺隆、灭草敌、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-氧基-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-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)-哒嗪酮)、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 (前述为methioxolin)、4-(4-氟苯基)-6-[(2-羟基-6-氧基-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-2-吡啶甲酸甲酯、2-甲基-3-(甲基磺酰基)-N-(1-甲基-1H-四唑-5-基)-4-(三氟甲基)苯甲酰胺以及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。其他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.) 和菥蓂柄锈菌 (*Puccinia thlaspeos* Schub)。

[0517] 本发明的化合物还可与植物生长调节剂诸如艾维激素、N-(苯基甲基)-1H-嘌呤-6-胺、丙酰芸苔素内酯、赤霉酸、赤霉素_{A₄}和_{A₇}、超敏蛋白、甲哌鎗、调环酸钙、茉莉酮、硝酚钠和抗倒酯-甲基,以及植物生长改性生物体诸如蜡状芽孢杆菌 (*Bacillus cereus*) 菌株 BP01 结合地使用。

[0518] 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、和生物试剂)的一般参考文献包括The Pesticide Manual[农药手册],第13版,C.D.S.Tomlin编辑,British Crop Protection Council[英国作物保护委员会],Farnham,Surrey,U.K.,2003和The BioPesticide Manual[生物农药手册],第2版,L.G.Copping编辑,英国作物保护委员会,Farnham,Surrey,U.K.,2001。

[0519] 对于其中使用这些不同混合组分中的一种或多种的实施例,这些混合组分通常以类似于单独使用混合物组分时的常规量的量使用。更具体地,在混合物中,活性成分通常在产品标签上指明的用于单独使用活性成分的施用率的二分之一至满施用率之间的施用率来施用。这些量列在参考文献诸如The Pesticide Manual和The BioPesticide Manual中。这些不同混合组分(总量)与式1的化合物的重量比通常在约1:3000与约3000:1之间。值得注意的是在约1:300与约300:1之间的重量比(例如在约1:30与约30:1之间的比率)。本领域技术人员可以通过简单的实验容易地确定所希望的生物活性范围所必需的活性成分

的生物有效量。将明显的是,包含这些附加组分可使杂草控制范围扩展超出由单独的式1的化合物所控制的范围。

[0520] 在某些情况下,本发明化合物与其他生物活性(特别是除草)化合物或试剂(即活性成分)的组合可导致对杂草的大于累加(即协同)的效应和/或对作物或其他期望植物的小于累加(即安全化)的效应。降低释放在环境中的活性成分的量,同时确保有效的害虫防治一直是人们所希望的。使用较大量的活性成分以提供更有效的杂草控制而没有过度作物伤害的能力也是期望的。当除草活性成分以获得农艺上令人满意的杂草控制水平的施用率对杂草产生协同作用时,此类组合可有利地用于降低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增加作物保护。

[0521] 值得注意的是本发明化合物与至少一种其他除草活性成分的组合。特别值得注意的是其他除草活性成分与本发明化合物具有不同作用位点的组合。在某些情况下,与至少一种具有相似控制范围但是不同作用位点的其他除草活性成分的组合对于抗性管理将是特别有利的。因此,本发明的组合物可以进一步包含(处于除草有效量的)至少一种具有相似控制范围但是不同作用位点的附加除草活性成分。

[0522] 本发明的化合物也可与诸如以下各项的除草剂安全剂结合使用以增加对某些作物的安全性:二丙烯草胺、解草酮、解草酯、苜草隆、解草胺腈、环丙磺酰胺、杀草隆、二氯丙烯胺、大赛克农、增效磷、哌草丹、解草唑、解草啶、解草安、氟草肟、解草噁唑、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、梅芬内、去草酮、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-氮杂螺[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-氧基-2-苯基-5-嘧啶羧酸乙酯、2-羟基-N,N-二甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3-甲酰胺、以及3-氧基-1-环己烯-1-基1-(3,4-二甲基苯基)-1,6-二氢-6-氧基-2-苯基-5-嘧啶羧酸酯、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一种包含本发明的化合物和解毒有效量的除草剂安全剂的除草混合物。种子处理对于选择性杂草控制是特别有用的,因为它将解毒作用物理地限制在作物植物上。因此,本发明的特别有用的实施例是用于选择性控制作物中不希望的植被生长的方法,该方法包括使该作物的所在地与除草有效量的本发明的化合物接触,其中该作物自其长成的种子用解毒有效量的安全剂处理。解毒有效量的安全剂可以由本领域技术人员通过简单的实验容易地确定。

[0523] 本发明的化合物还可以与以下各项混合:(1)多核苷酸,包括但不限于DNA、RNA和/或化学修饰的核苷酸,这些核苷酸通过减量调节、干扰、抑制或沉默呈现除草效果的基因衍生的转录物来影响特定靶的量;或(2)多核苷酸,包括但不限于DNA、RNA和/或化学修饰的核苷酸,这些核苷酸通过减量调节、干扰、抑制或沉默呈现安全化效果的基因衍生的转录物来影响特定靶的量。

[0524] 值得注意的是是一种组合物,该组合物包含本发明的化合物(以除草有效量)、至少一种选自由其他除草剂和除草剂安全剂组成的组的附加活性成分(以除草有效量)、以及至

少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的组分。

[0525] 表A1列出了组分(a)与组分(b)的特定组合,说明了本发明的混合物、组合物和方法。组分(a)列中的化合物1标识在索引表A中。表A1的第二列列出了特定组分(b)化合物(例如第一行中的“2,4-D”)。表A1的第三、第四和第五列列出了对于在将组分(a)化合物典型地施用于田间生长作物时的速率,相对于组分(b)的重量比范围(即(a):(b))。因此,例如,表A1的第一行具体披露了组分(a)(即索引表A至D中的化合物1)与2,4-D的组合典型地以在1:192-6:1之间的重量比施用。表A1的其余行将被类似地构造。

[0526] 表A1

[0527]

<u>组分(a)</u> <u>(化合物#)</u>	<u>组分(b)</u>	<u>典型的</u> <u>重量比</u>	<u>更典型的</u> <u>重量比</u>	<u>最典型的</u> <u>重量比</u>
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
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

[0528]

<u>组分 (a)</u> (化合物 #)	<u>组分 (b)</u>	<u>典型的</u> <u>重量比</u>	<u>更典型的</u> <u>重量比</u>	<u>最典型的</u> <u>重量比</u>
1	环丙嘧啶酸	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	磺草灵	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	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	双草醚钠	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	苯唑酮	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	三唑酮草酯	1:128 - 1:9	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	吲哚酮草酯	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	稗草胺	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

[0529]

<u>组分 (a)</u> (化合物 #)	<u>组分 (b)</u>	<u>典型的</u> <u>重量比</u>	<u>更典型的</u> <u>重量比</u>	<u>最典型的</u> <u>重量比</u>
1	氟草津	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	环比瑞摩	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	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	异戊净	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	噻吩草胺-P	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	氟乳醚	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	异噁苯砒	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2
1	芬昆诺三酮	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

[0530]

<u>组分 (a)</u> (化合物 #)	<u>组分 (b)</u>	<u>典型的</u> <u>重量比</u>	<u>更典型的</u> <u>重量比</u>	<u>最典型的</u> <u>重量比</u>
1	氟胺草酯	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
1	氯氟吡氧乙酸	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	吡草酮	1:857 - 2:1	1:285 - 1:3	1:107 - 1:12
1	氟噻草酯	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	甲酰胺磺隆	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1
1	草铵膦	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	环嗪酮	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	海丹托西丁	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	灭草嗪	1:34 - 34:1	1:11 - 12:1	1:4 - 3:1
1	咪草酯	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	三唑啉草胺	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

[0531]

<u>组分 (a)</u> (化合物 #)	<u>组分 (b)</u>	<u>典型的</u> <u>重量比</u>	<u>更典型的</u> <u>重量比</u>	<u>最典型的</u> <u>重量比</u>
1	2-甲-4-氯丙酸	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	苯噻草胺	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	甲磺胺磺隆	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	吡唑草胺	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
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	草达灭	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	萘草胺	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	哒草伏	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	氨磺乐灵	1:514 - 3:1	1:171 - 1:2	1:64 - 1:8
1	丙炔噁草酮	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	环氧嘧磺隆	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	氟吡酰草胺	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	氟嘧磺隆	1:8 - 135:1	1:2 - 45:1	1:1 - 9:1

[0532]

<u>组分 (a)</u> (化合物 #)	<u>组分 (b)</u>	<u>典型的</u> <u>重量比</u>	<u>更典型的</u> <u>重量比</u>	<u>最典型的</u> <u>重量比</u>
1	氨基丙氟灵	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	毒草安	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	啶草酯	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	丙嗪啉磺隆	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	苜草丹	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
1	磺酰草吡脱	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	吡啉磺隆	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	苜草唑	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	啉啉草醚	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	哒草特	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	啉草醚	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	啉啉硫磺	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	啉硫草醚	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	砒啉磺隆	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1
1	苯啉磺草胺	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	甲啉磺隆	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	特呋三酮	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1

<u>组分 (a)</u> (化合物 #)	<u>组分 (b)</u>	<u>典型的</u> <u>重量比</u>	<u>更典型的</u> <u>重量比</u>	<u>最典型的</u> <u>重量比</u>
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	特丁津	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	噻草啞	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	氟丙嘧草酯	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
[0533]	托派拉雷	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	脞草酮	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
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	三氟啞磺隆	1:2 - 420:1	1:1 - 140:1	2:1 - 27:1
1	三氟草啞	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

[0534] 表A2如以上表A1相同构造,除了“组分(a)”列标题下面的条目被下文所示的相应组分(a)列条目替代。组分(a)列中的化合物1标识在索引表A中。因此,例如,在表A2中,“组分(a)”列标题下面的条目全都叙述“化合物2”(即,索引表A中所标识的化合物2),并且表A2中的列标题下面的第一行具体披露了化合物2与2,4-D的混合物。表A3至A7类似地构造。

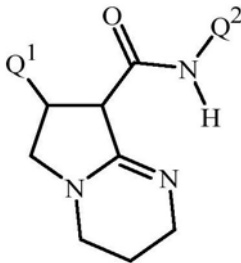
<u>表编号</u>	<u>组分 (a) 列条目</u>	<u>表编号</u>	<u>组分 (a) 列条目</u>
A2	化合物 2	A8	化合物 8
A3	化合物 3	A9	化合物 9
[0535]	A4	A10	化合物 10
A5	化合物 5	A11	化合物 11
A6	化合物 6	A12	化合物 12
A7	化合物 7	A13	化合物 13

表编号	组分 (a) 列条目	表编号	组分 (a) 列条目
A14	化合物 14	A22	化合物 22
A15	化合物 15	A23	化合物 23
A16	化合物 16	A24	化合物 24
[0536] A17	化合物 17	A25	化合物 25
A18	化合物 18	A26	化合物 26
A19	化合物 19	A27	化合物 27
A20	化合物 20	A28	化合物 28
A21	化合物 21		

[0537] 优选用于更好地控制不希望的植被 (例如, 诸如来自协同作用的较低使用率、更广的受控杂草的范围或增强的作物安全性) 或用于防止抗性杂草的发展的是本发明的化合物与选自下组的除草剂的混合物, 该组由以下各项组成: 氯嘧磺隆、烟嘧磺隆、硝磺草酮、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。

[0538] 以下测试证明本发明的化合物对特定杂草的控制功效。然而, 由化合物提供的杂草控制不限于这些物种。化合物描述参见索引表A至D。缩写“Cmpd.No.”代表“化合物编号”。缩写“Ex.”代表“实例”并且后面是数字, 该数字表示化合物在哪个合成实例中制备。质谱 (MS) 以 ± 0.5 Da 内的估计精度报道为通过使用液相色谱法与质谱仪结合 (LCMS) 使用大气压化学电离 (AP+) 观察到的通过向分子中加入 H^+ (分子量为1) 形成的最高同位素丰度母离子 (M+1) 或从分子损失 H^+ (分子量为1) 形成的 (M-1) 的分子量, 其中“amu”代表统一原子质量单位。

[0539] 索引表A

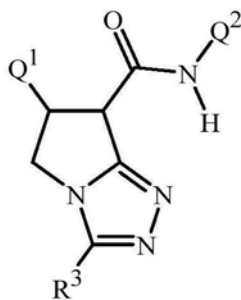


[0540]

Cmpd.No.	Q^1	Q^2	M.S.(AP+)
1	Ph(3-CF ₃)	Ph(2-F)	406.4

[0541]

[0542] 索引表B

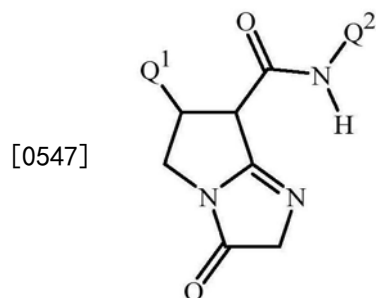


[0543]

Cmpd.No.	Q ¹	Q ²	R ³	熔点 (m.p.) (°C)
2 (实例 1)	Ph(3-CF ₃)	Ph(2-F)	H	**
5	Ph(4-Cl)	Ph(2,3-二-F)	CH ₃	389.5 (M+1)
6	Ph(4-CF ₃)	Ph(2-CF ₃)	CH ₃	455.5(M+1)
7	Ph(4-Cl)	Ph(2,3-二-F)	H	375.4 (M+1)
8 (实例 4)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	CH ₂ CH ₃	437.5 (M+1)
9	Ph(4-CH ₂ CH ₃)	Ph(3-F,2-CH ₃)	CH ₃	379.6(M+1)
10	Ph(3,4-二-CH ₃)	Ph(3-F,2-CH ₃)	CH ₃	379.6(M+1)
11	Ph(4-CH ₂ CH ₃)	Ph(2,3-二-F)	H	369.5(M+1)
12	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	H	409.5(M+1)
13	Ph(4-CH ₃)	Ph(2-F)	H	337.2(M+1)
14	Ph(3,4-二-CH ₃)	Ph(2-SCH ₃)	CH ₃	393.6(M+1)
15	Ph(4-CH ₂ CH ₃)	Ph(2-SCH ₃)	CH ₃	393.6(M+1)
16	Ph(3,4-二-CH ₃)	Ph(2,3-二-F)	H	369.5(M+1)
17	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	<i>n</i> -Pr	451.6(M+1)
18	Ph(3,4-二-CH ₃)	Ph(2-SCH ₃)	H	379.6(M+1)
19	Ph(3,4-二-CH ₃)	Ph(2,3-二-F)	CH ₃	383.5(M+1)
20	Ph(4-Cl)	Ph(6-F)	H	357.4 (M+1)
21	Ph(4-Cl)	Ph(2-F)	CH ₃	371.5(M+1)
22 (实例 5)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-二-F)	CF ₃	477.5(M+1)
23	Ph(4-CH ₂ CH ₃)	Ph(2,3-二-F)	CH ₃	383.5(M+1)
24 (实例 3)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2-F)	CH ₃	405.5(M+1)
25	Ph(4-CH ₂ CH ₃)	Ph(2-SCH ₃)	H	379.5(M+1)
26	Ph(3,4-二-CH ₃)	Ph(3-F,2-CH ₃)	H	365.6(M+1)
27	Ph(4-CH ₃)	Ph(2-F)	CH ₃	351.5(M+1)
28	Ph(4-CH ₂ CH ₃)	Ph(3-F,2-CH ₃)	H	365.6(M+1)

[0545] **对于¹HNMR数据参见合成实例。

[0546] 索引表C

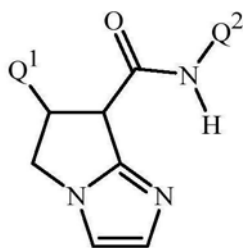


Cmpd.No.	Q ¹	Q ²	熔点 (°C)
3 (实例 2)	Ph(3-CF ₃)	Ph(2-F)	**

[0549] **对于¹HNMR数据参见合成实例。

[0550] 索引表D

[0551]



[0552]

Cmpd.No.	Q ¹	Q ²	M.S.(AP+)
4	Ph(3-CF ₃)	Ph(2-F)	390

[0553] 本发明的生物学实例[0554] 测试A

[0555] 将选自无芒稗 (barnyardgrass) (稗草 (*Echinochloa crus-galli*))、地肤 (*kochia*) (扫帚菜 (*Kochia scoparia*))、豚草 (ragweed) (猪草, 豕草 (common ragweed, *Ambrosia elatior*))、意大利黑麦草 (ryegrass, Italian) (意大利黑麦草, 多花黑麦草 (*Italian ryegrass, Lolium multiflorum*))、大狗尾草 (foxtail, giant) (大狗尾草, 狗毛草 (large crabgrass, *Setaria faberii*)) 和野苋菜 (pigweed) (反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*)) 的植物物种的种子种植到壤土和砂土的共混物中并且采用定向土壤喷雾使用配制在包含表面活性剂的无植物毒性溶剂混合物中的测试化学品进行出苗前处理。

[0556] 同时, 将选自这些杂草物种以及还有黑草 (大穗看麦娘 (*Alopecurus myosuroides*))、猪殃殃 (*galium*) (八仙草, 拉拉藤 (catchweed bedstraw, *Galium aparine*))、小麦 (wheat) (小麦 (*Triticum aestivum*))、和玉米 (corn) (玉蜀黍 (*Zea mays*)) 的植物种植于包含相同的壤土和砂土的共混物的盆中, 并且用以相同方式配制的测试化合物来进行出苗后施用处理。将高度范围在从2cm至10cm并且在一叶至二叶阶段的植物用于出苗后处理。将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视觉评估损伤。总结于表A中的植株响应评级基于0至100标度, 其中0为无效果并且 100为完全控制。破折号 (-) 响应意指无测试结果。

表 A	化合物				表 A	化合物			
500 g ai/ha	1	2	3	4	125 g ai/ha	1	2	3	4
出苗后					出苗后				
无芒稗	60	80	30	60	无芒稗	0	60	0	20
黑草	0	70	0	40	黑草	0	40	0	20
玉米	20	40	0	0	玉米	0	20	0	0
大狗尾草	40	90	50	70	大狗尾草	0	50	20	20
猪殃殃	0	50	0	0	猪殃殃	0	50	0	0
地肤	0	30	0	0	地肤	0	0	0	0
野苋菜	0	10	0	0	野苋菜	0	0	0	0
豚草	0	10	0	0	豚草	0	0	0	0
意大利黑麦草	0	50	10	0	意大利黑麦草	0	0	0	0
小麦	0	50	0	20	小麦	0	0	0	0

表 A	化合物										
500 g ai/ha	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15
出苗后											
无芒稗	80	40	70	50	70	90	80	90	90	20	0
黑草	20	20	0	0	70	70	20	60	40	20	0
玉米	30	0	30	0	0	40	30	60	20	0	0
[0557] 大狗尾草	80	30	70	60	50	80	70	90	80	20	0
猪殃殃	70	30	50	50	20	50	50	70	40	0	0
地肤	30	0	40	40	0	30	50	60	30	0	0
野苋菜	20	0	50	60	0	0	0	70	0	0	0
豚草	20	0	60	20	0	20	30	50	30	0	0
意大利黑麦草	20	20	20	0	20	30	50	60	0	0	0
小麦	20	0	20	0	0	30	20	40	0	0	0

表 A	化合物													
500 g ai/ha	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28	
出苗后														
无芒稗	80	30	30	90	60	40	0	90	80	30	80	90	80	
黑草	60	20	0	70	0	20	0	20	50	0	50	20	40	
玉米	70	0	0	30	80	0	0	20	40	0	0	0	0	
大狗尾草	80	30	20	80	70	70	0	70	80	30	80	90	60	
猪殃殃	50	50	20	50	50	50	0	30	60	0	0	40	30	
地肤	30	50	20	20	40	0	0	30	0	30	0	0	50	
野苋菜	0	40	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	
豚草	50	0	0	20	20	0	0	0	0	0	0	0	0	
意大利黑麦草	50	0	0	20	0	20	0	0	20	0	20	30	50	
小麦	50	0	0	30	20	0	0	0	30	0	0	0	0	

表 A	化合物										
125 g ai/ha	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15
出苗后											
无芒稗	20	0	20	20	30	50	70	30	50	0	0
黑草	0	0	0	0	20	0	0	0	20	0	0
玉米	20	0	20	0	0	20	0	0	0	0	0
大狗尾草	30	0	20	20	0	30	40	30	60	0	0
猪殃殃	40	0	40	30	0	0	20	30	40	0	0
地肤	0	0	0	0	0	0	40	20	0	0	0
野苋菜	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0
豚草	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
意大利黑麦草	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
小麦	0	0	0	0	0	30	0	0	0	0	0

[0558]

表 A	化合物												
125 g ai/ha	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28
出苗后													
无芒稗	60	0	0	60	20	0	0	50	30	20	50	40	50
黑草	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20
玉米	0	0	0	0	20	0	0	0	0	0	20	0	0
大狗尾草	60	0	0	30	20	0	0	30	40	0	50	30	40
猪殃殃	40	40	20	0	30	0	0	0	0	0	30	0	20
地肤	30	20	20	0	0	0	0	30	0	30	0	0	20
野苋菜	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
豚草	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
意大利黑麦草	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
小麦	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	0

表 A	化合物				表 A	化合物			
500 g ai/ha	1	2	3	4	125 g ai/ha	1	2	3	4
出苗前					出苗前				
无芒稗	70	90	60	90	无芒稗	0	60	0	20
大狗尾草	60	90	80	90	大狗尾草	0	90	0	60
地肤	0	0	0	0	地肤	0	0	0	0
野苋菜	0	0	0	0	野苋菜	0	0	0	0
豚草	0	0	0	0	豚草	0	0	0	0
意大利黑麦草	0	0	0	0	意大利黑麦草	0	0	0	0

[0559]

表 A	化合物										
500 g ai/ha	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15

出苗前													
无芒稗	80	40	70	70	70	90	90	80	70	30	0		
大狗尾草	90	90	80	90	90	90	90	90	90	60	0		
地肤	50	0	40	-	0	50	70	80	70	0	0		
野苋菜	0	40	20	50	0	20	30	80	0	0	0		
豚草	40	0	50	0	0	0	40	50	80	0	0		
意大利黑麦草	30	60	0	0	0	70	30	60	0	0	0		

[0560] 表 A 化合物

500 g ai/ha	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28
出苗前													
无芒稗	90	50	60	90	70	40	20	90	40	40	90	90	90
大狗尾草	90	90	80	90	90	70	30	90	90	40	90	90	90
地肤	80	30	0	30	90	40	0	40	60	20	30	0	60
野苋菜	0	20	0	0	0	0	0	20	20	0	0	0	0
豚草	50	0	30	0	50	0	0	0	30	0	0	0	30
意大利黑麦草	60	0	20	20	0	40	0	0	30	0	50	20	30

表 A 化合物

125 g ai/ha	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15
出苗前											
无芒稗	30	0	30	30	40	50	70	20	60	0	0
大狗尾草	50	0	40	30	60	80	80	90	70	0	0
地肤	0	0	0	0	0	0	60	30	70	0	0
野苋菜	0	0	0	20	0	0	30	30	0	0	0
豚草	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
意大利黑麦草	20	40	0	0	0	0	0	40	0	0	0

[0561] 表 A 化合物

125 g ai/ha	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28
出苗前													
无芒稗	70	0	20	50	20	0	0	60	0	0	60	0	60
大狗尾草	90	30	0	70	30	0	0	70	30	0	80	80	70
地肤	70	0	0	0	30	0	0	20	0	0	20	0	60
野苋菜	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
豚草	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
意大利黑麦草	0	0	0	0	0	40	0	0	0	0	0	20	0

[0562] 测试B

[0563] 在淹水稻田测试中使选自稻(rice)(水稻(*Oryza sativa*))、小花轮伞草(sedge, umbrella)(小花伞莎草,异型莎草(*small-flower umbrella sedge*, *Cyperus difformis*))、沼生异蕊花(ducksalad)(*Heteranthera limosa*)、和无芒稗(稗草)的植物物

种生长至2叶阶段用于测试。在处理时,将测试盆注水至在土壤表面上方3cm,通过向田水直接施用测试化合物来处理,并且然后在测试期间保持该水深。将经处理的植物与对照物在温室中保持13至15天,之后将所有物种与对照物比较并且视觉评估。总结于表B中的植株响应评级基于0至100的标度,其中0为无效果并且100为完全控制。破折号(-)响应意指无测试结果。

表 B	化合物		表 B	化合物
500 g ai/ha	2	4	250 g ai/ha	1
淹没			淹没	
无芒稗	0	0	无芒稗	0
沼生异蕊花	0	0	沼生异蕊花	70
稻	0	0	稻	0
小花轮伞草	0	0	小花轮伞草	50

表 B	化合物												
250 g ai/ha	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17
淹没													
[0564] 无芒稗	40	0	0	0	20	20	0	0	40	20	0	50	0
沼生异蕊花	20	0	50	40	75	45	95	75	45	60	50	75	30
稻	0	0	15	0	15	0	0	0	20	0	20	15	0
小花轮伞草	0	0	0	0	0	0	70	0	0	0	0	0	0

表 B	化合物											
250 g ai/ha	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28	
淹没												
无芒稗	0	30	40	0	0	0	0	0	0	0	40	
沼生异蕊花	40	20	70	40	30	80	0	65	85	70	90	
稻	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	20	
小花轮伞草	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	75	