



(12) 发明专利申请



(10) 申请公布号 CN 117615652 A

(43) 申请公布日 2024. 02. 27

(21) 申请号 202280048760.2

E • 加茨魏勒 G • 博杰克

(22) 申请日 2022.06.23

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

(30) 优先权数据

公司 11285

21181914.9 2021.06.25 EP

专利代理师 谢小寒 钟守期

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

(51) Int.Cl.

2024.01.09

A01N 43/56 (2006.01)

(86) PCT国际申请的申请数据

C07D 401/14 (2006.01)

PCT/EP2022/067124 2022.06.23

C07D 401/04 (2006.01)

(87) PCT国际申请的公布数据

C07D 231/22 (2006.01)

W02022/268933 DE 2022.12.29

(71) 申请人 拜耳公司

地址 德国勒沃库森

(72) 发明人 E • 巴斯卡托 H • 何默克

H • 詹科比 T • 穆勒

B • 博伦巴克-沃尔 J • 迪特根

权利要求书8页 说明书157页

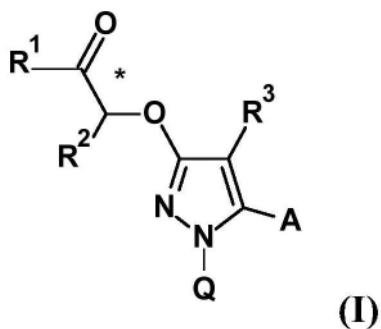
(54) 发明名称

(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基) 氧基-2-烷氧基羧酸及其衍生物、其盐及其作为除草剂的用途

(57) 摘要

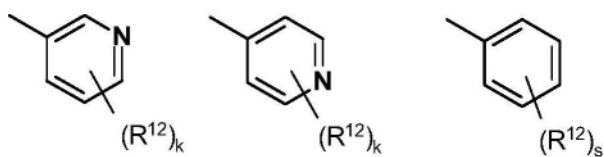
本发明涉及新的通式(I)的除草有效的(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基羧酸及其衍生物及其农业化学上相容/可接受的盐、N-氧化物、水合物以及盐和N-氧化物的水合物,其制备方法及其用于防治有用植物作物中的杂草和禾本科杂草以及用于一般性防治不希望植物生长的环境区域中的杂草和禾本科杂草的用途。(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基羧酸的衍生物尤其包括其酯和/或酰胺。

1. 通式 (I) 的 (1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基) 氧基-2-烷氧基烷基酸及其衍生物及其农业化学上可接受的盐、N-氧化物、水合物以及盐和N-氧化物的水合物,



其中

A选自A1、A2和A3

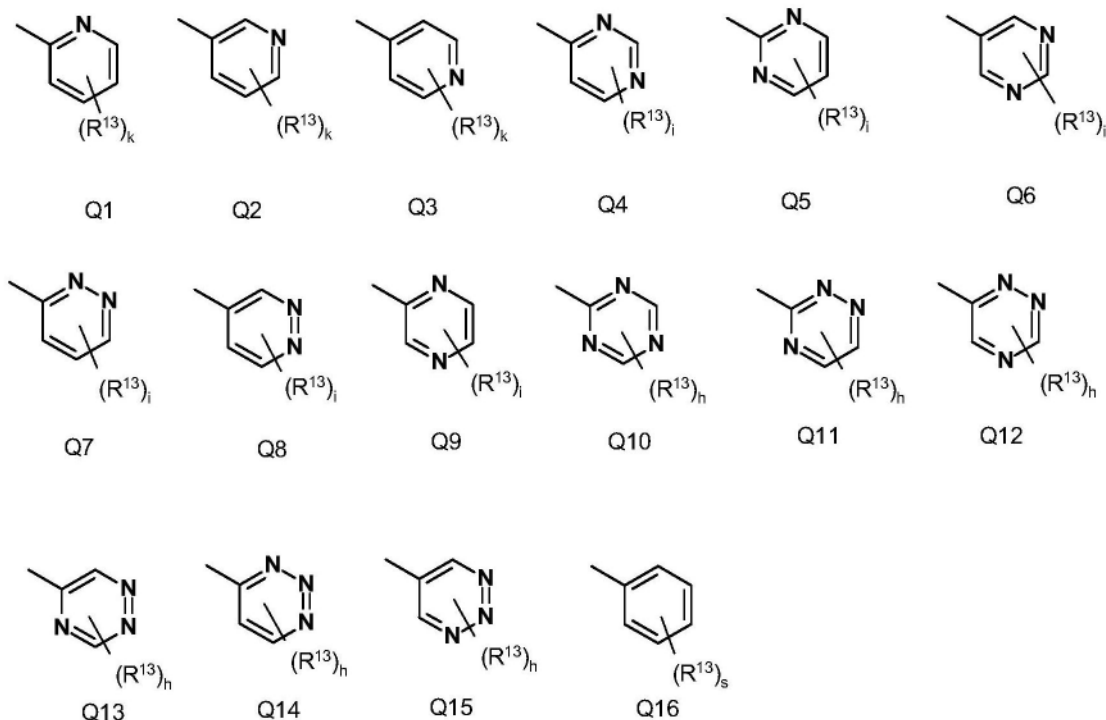


A1

A2

A3

Q选自Q1-Q16:



Q13

Q14

Q15

Q16

R^1 为 OR^{1a} 、 NR^9R^{10} ;

R^{1a} 为氢或

为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自 $COOR^5$ 、卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基、氰基和硝基的基团取代或

为 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基或

为 (C_1-C_6) -烷基-SO- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基-SO₂- (C_1-C_6) -烷基或
为杂环基、杂芳基、芳基或

为杂环基- (C_1-C_4) -烷基、杂芳基- (C_1-C_4) -烷基、芳基- (C_1-C_4) -烷基,其未被取代或在
每种情况独立地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基的基团取代;

R⁹为氢、 (C_1-C_{12}) -烷基;

R¹⁰为氢、芳基、杂芳基、杂环基、 (C_1-C_{12}) -烷基、 (C_3-C_8) -环烷基、 (C_3-C_8) -环烷基- (C_1-C_7) -烷基、 (C_2-C_{12}) -烯基、 (C_5-C_7) -环烯基、

(C_2-C_{12}) -炔基、S(O)_nR⁵、氰基、OR⁵、SO₂NR⁶R⁷、CO₂R⁸、COR⁸,

其中上述烷基、环烷基、烯基、环烯基和炔基基团未被取代或各自独立地被“m”个选自
任选地单或多取代的芳基、卤素、氰基、硝基、OR⁵、S(O)_nR⁵、SO₂NR⁶R⁷、CO₂R⁸、CONR⁶R⁸、COR⁶、
NR⁶R⁸、NR⁶COR⁸、NR⁶CONR⁸R⁸、NR⁶CO₂R⁸、NR⁶SO₂R⁸、NR⁶SO₂NR⁶R⁸、C(R⁶)=NOR⁸的基团取代;

或

R⁹和R¹⁰与它们所连接的氮原子共同形成饱和的或部分或完全不饱和的五、六或七元
环,其任选地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、OR⁵、S(O)_nR⁵、CO₂R⁸、
CONR⁶R⁸、COR⁶和C(R⁶)=NOR⁸的基团取代,且其除该氮原子外还包含“r”个碳原子、“o”个氧原
子、“p”个硫原子和“q”个来自NR⁷、CO和NCOR⁷的元素作为环原子;

R⁵为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、芳基;

R⁶为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、芳基;R⁷为氢、 (C_1-C_6) -烷基、
 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_4) -烯基、 (C_3-C_4) -炔基;

R⁸为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_4) -烯基、 (C_1-C_6) -烷基-COO (C_1-C_2) -烷基
或 (C_3-C_4) -炔基;

R²为甲氧基、乙氧基;

R³为卤素、氰基、异氰基、NO₂、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -
卤代环烷基、 (C_1-C_6) -烷基羰基、

(C_1-C_6) -卤代烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基、 (C_2-C_3) -烯基、

(C_2-C_3) -卤代烯基、 (C_2-C_3) -炔基、 (C_2-C_3) -卤代炔基、 (C_1-C_6) -烷基-S(O)_n和 (C_1-C_6) -卤
代烷基-S(O)_n、CHO以及NH₂;

R¹²为卤素、氰基、NO₂、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基;

R¹³为卤素、氰基、NO₂、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_6) -烷基羰基、 (C_1-C_6) -卤
代烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_6) -烷基-S
(O)_n、 (C_2-C_3) -烯基、 (C_2-C_3) -卤代烯基、 (C_2-C_3) -炔基、 (C_2-C_3) -卤代炔基;

h为0、1或2;

i为0、1、2或3;

k为0、1、2、3或4;

m为0、1或2;

n为0、1或2;

o为0、1或2;

p为0或1;

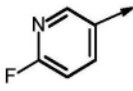
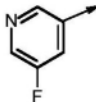
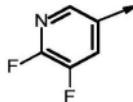
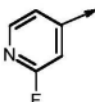
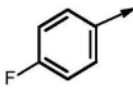
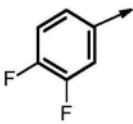
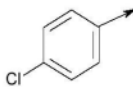
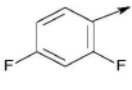
q为0或1;

r为3、4、5或6;

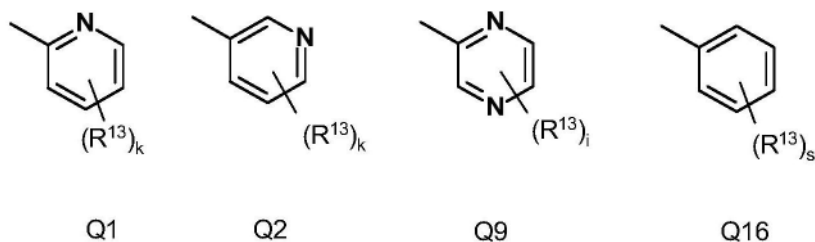
s为0、1、2、3、4或5。

2. 根据权利要求1所述的式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐、N-氧化物、水合物或盐或N-氧化物的水合物, 其中

A为A1-1、A1-2、A1-3、A1-4、A2-1、A3-1、A3-2、A3-3、A3-4和A3-5

				
A1-1	A1-2	A1-3	A1-4	
				
A2-1				
				
A3-1	A3-2	A3-3	A3-4	A3-5

Q选自Q1、Q2、Q9和Q16



R^1 为 OR^{1a} 、 NR^9R^{10} ,

R^{1a} 为氢或

为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基, 其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自 $COOR^5$ 、卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基、氰基和硝基的基团取代或

为 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基或

为 (C_1-C_6) -烷基-SO- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基-SO₂- (C_1-C_6) -烷基、芳基- (C_1-C_4) -烷基, 其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基的基团取代;

R^9 为氢、 (C_1-C_6) -烷基;

R^{10} 为氢、苯基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_5-C_7) -环烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 $S(O)_n R^5$ 、氰基、 OR^5 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 、 COR^8 , 其中上述烷基、环烷基、烯基、环烯基和炔基基团未被取代或各自独立地被“m”个选自任选地单或多取

代的苯基、卤素、氰基、硝基、 OR^5 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^5$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^6\text{R}^7$ 、 CO_2R^8 、 CONR^6R^8 、 COR^6 、 NR^6R^8 、 NR^6COR^8 、 $\text{NR}^6\text{CONR}^8\text{R}^8$ 、 $\text{NR}^6\text{CO}_2\text{R}^8$ 的基团取代,或 R^9 和 R^{10} 与它们所连接的氮原子共同形成饱和的或部分或完全不饱和的五、六或七元环,其任选地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 OR^5 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^5$ 、 CO_2R^8 、 CONR^6R^8 、 COR^6 和 $\text{C}(\text{R}^6)=\text{NOR}^8$ 的基团取代,且其除该氮原子外还包含“r”个碳原子、“o”个氧原子、“p”个硫原子和“q”个来自 NR^7 、 CO 和 NCOR^7 的元素作为环原子;

R^5 为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基或苯基;

R^6 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基或苯基; R^7 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_4) -烯基或 (C_3-C_4) -炔基;

R^8 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_4) -烯基或 (C_3-C_4) -炔基;

R^2 为甲氧基、乙氧基;

R^3 为卤素、氰基、异氰基、 NO_2 、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -卤代环烷基、 (C_2-C_3) -烯基、 (C_2-C_3) -卤代烯基、 (C_2-C_3) -炔基、 (C_2-C_3) -卤代炔基;

R^{13} 为卤素、氰基、硝基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_6) -烷基- $\text{S}(\text{O})_n$ 、 (C_2-C_3) -烯基、 (C_2-C_3) -卤代烯基、 (C_2-C_3) -炔基、 (C_2-C_3) -卤代炔基;

i为0、1或2;

k为0、1、2、3或4;

m为0、1、2;

n为0、1、2;

o为0、1、2;

p为0或1;

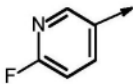
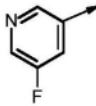
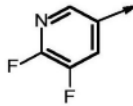
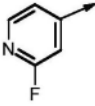
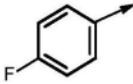
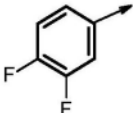
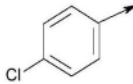
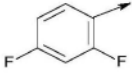
q为0或1;

r为3、4、5或6;

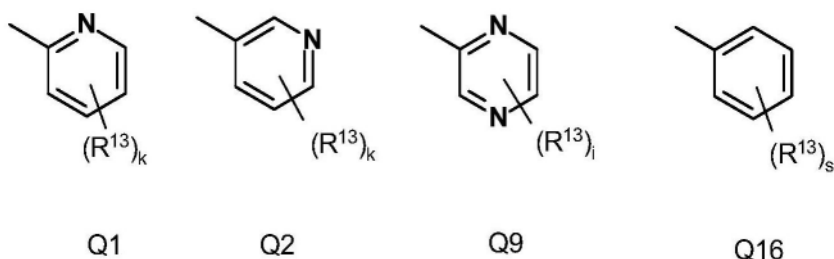
s为0、1、2、4、5。

3. 根据权利要求1或2所述的式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐、N-氧化物、水合物或盐或N-氧化物的水合物,其中

A为A1-1、A1-2、A1-3、A1-4、A2-1、A3-1、A3-2、A3-3、A3-4和A3-5

				
A1-1	A1-2	A1-3	A1-4	
				
A2-1				
				
A3-1	A3-2	A3-3	A3-4	A3-5

Q选自Q1、Q2、Q9和Q16



R^1 为 OR^{1a} 、 NR^9R^{10} ;

R^{1a} 为氢或

为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自 $COOR^5$ 、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团取代或

为芳基- (C_1-C_4) -烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团取代;

R^9 为氢;

R^{10} 为 (C_1-C_4) -烷基、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 ,其中上述基团未被取代或各自独立地被“m”个选自苯基、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 、 $NR^6CO_2R^8$ 的基团取代;

R^5 为乙基、甲基、 CF_3 或 CH_2CF_3 ;

R^6 为氢;

R^7 为氢、甲基或乙基;

R^8 为甲基或乙基;

R^2 为甲氧基、乙氧基;

R^3 为卤素、氰基、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -卤代环烷基;

R^{13} 为氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、 CF_3 、 OCF_3 ; i为0、1或2;

k为0、1或2;

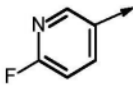
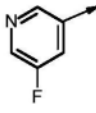
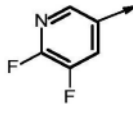
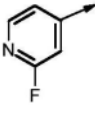
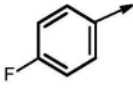
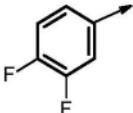
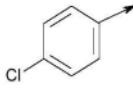
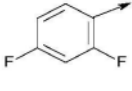
m为0、1或2;

n为0、1或2；

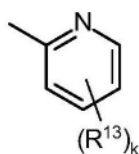
s为0、1或2。

4. 根据权利要求1至3中任一项所述的式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐、N-氧化物、水合物或盐或N-氧化物的水合物,其中

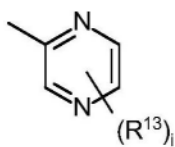
A为A1-1、A1-2、A1-3、A1-4、A2-1、A3-1、A3-2、A3-3、A3-4和A3-5

				
A1-1	A1-2	A1-3	A1-4	
				
A2-1				
				
A3-1	A3-2	A3-3	A3-4	A3-5

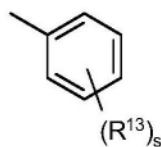
Q选自Q1、Q9和Q16



Q1



Q9



Q16

R¹为OR^{1a},

R^{1a}为氢、乙基、甲基、-CH₂CH(CH₃)COO甲基、-CH₂CH₂COO甲基；

R²为乙氧基、甲氧基；

R³为氯、溴、碘、氰基、环丙基、CF₂CF₃、CHF₂或CF₃；

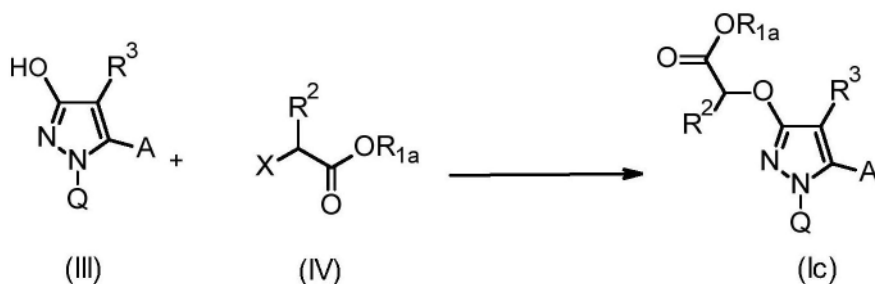
R¹³为氟、氯、甲基、MeS(O)、MeS或CF₃；

i为0、1或2；

k为0、1或2；

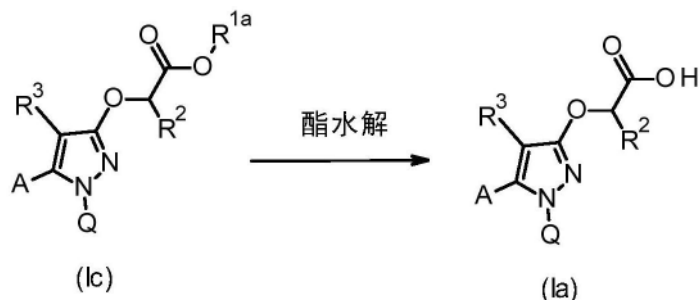
s为0、1或2。

5. 根据权利要求1至4中任一项所述的式(Ic)的化合物或其农业化学上可接受的盐的制备方法,所述方法如下进行:在硫化剂(例如五硫化二磷或Lawesson试剂)的存在下转化通式(III)和(IV)的化合物,



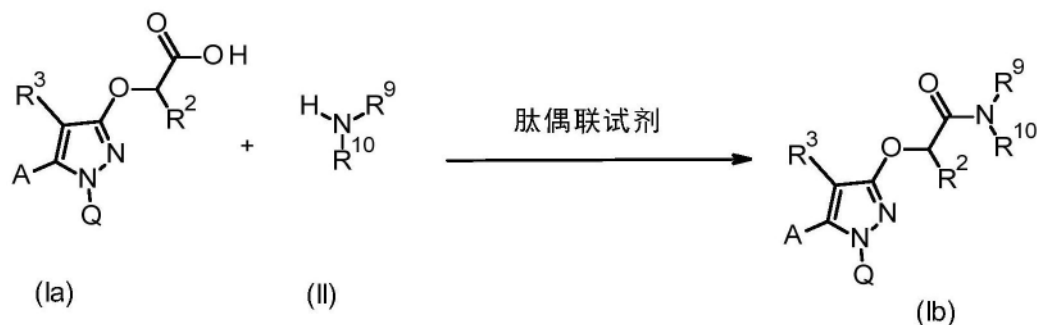
其中 R^2 、 R^{1a} 、 R^3 、A和Q具有上述定义且X为氯、溴或碘。

6. 根据权利要求1至4中任一项所述的式(Ia)的化合物或其农业化学上可接受的盐的制备方法,所述方法如下进行:在碱或路易斯酸的存在下转化通式(Ic)的化合物,



其中 R^2 、 R^{1a} 、 R^3 、A和Q具有上述定义。

7. 根据权利要求1至4中任一项所述的式(Ib)的化合物或其农业化学上可接受的盐的制备方法,所述方法如下进行:在酰胺偶联试剂的存在下转化通式(Ia)和(II)的化合物,



其中 R^9 、 R^{10} 、 R^2 、 R^{1a} 、 R^3 、A和Q具有上述定义。

8. 农业化学组合物,其包含a)至少一种如权利要求1至4中一项或多项所限定的式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐,和b)作物保护中常规的助剂和添加剂。

9. 农业化学组合物,其包含

a)至少一种如权利要求1至4中一项或多项所限定的式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐、

b)一种或多种非组分a)的活性农业化学成分,和任选地

c)作物保护中常规的助剂和添加剂。

10. 防治不想要的植物或调节植物生长的方法,其中将有效量的至少一种如权利要求1至4中一项或多项所限定的式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐施用于植物、种子或植物生长的区域。

11. 如权利要求1至4中一项或多项所限定的式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐作为除草剂或植物生长调节剂的用途。

12. 根据权利要求11所述的用途, 其中将式(I)的化合物或其农业化学上可接受的盐用于防治有害植物或用于调节植物作物中的生长。

13. 根据权利要求12所述的用途, 其中作物植物为转基因或非转基因作物植物。

(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基烷基酸及其衍生物、其盐及其作为除草剂的用途

[0001] 本发明涉及新的除草活性的通式(I)的(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基烷基酸及其衍生物及其农业化学上相容的盐、N-氧化物、水合物以及盐和N-氧化物的水合物,其制备方法及其用于防治有用植物作物中的阔叶杂草和禾本科杂草以及用于一般性防治不期望植物生长的环境区域中的阔叶杂草和禾本科杂草的用途。

[0002] (1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基烷基酸的衍生物尤其包括其酯、盐和/或酰胺。

[0003] 现有技术公开了取代的1,5-二苯基吡唑基-3-氧基乙酸的生物学作用及制备这些化合物的方法。DE 2828529 A1描述了1,5-二苯基吡唑基-3-氧基乙酸的制备和降脂作用。

[0004] CN 101284815公开了作为具有杀细菌活性农用化学品的1,5-二苯基吡唑基-3-氧基乙酸。Journal of Heterocyclic Chemistry (2012), 49(6), 1370-1375进一步描述了1,5-二苯基吡唑基-3-氧基乙酸的合成和杀真菌作用。

[0005] WO 2008/083233 A2描述了作为适于分散细胞聚集体的物质的在吡唑4位取代的1,5-二苯基吡唑基-3-氧基烷基酸及其衍生物。特别公开了[(4-氯-1,5-二苯基-1H-吡唑-3-基)氧基]乙酸乙酯。

[0006] WO2020/245044A1描述了作为具有除草作用物质的在吡唑1位取代的1-苯基-5-吡嗪基吡唑基-3-氧基烷基酸及其衍生物。

[0007] 本发明的(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基烷基酸及其衍生物与先前已知的1,5-二苯基吡唑基-3-氧基乙酸的区别在于独特的R²基团=甲氧基、乙氧基。

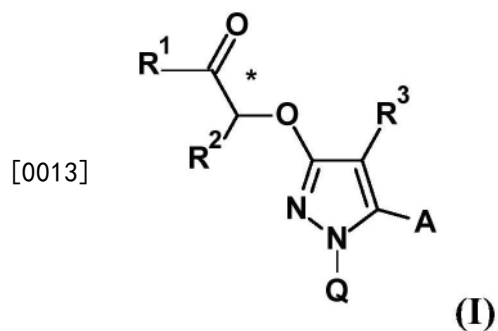
[0008] 此外,European Journal of Organic Chemistry (2011), 2011(27), 5323-5330中描述了一些4-氯-1,5-二苯基吡唑基-3-氧基乙酸及其乙酯的合成。

[0009] 本发明的一个目的是提供新的吡唑衍生物,即(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基烷基酸及其衍生物,其可用作除草剂或植物生长调节剂,具有良好的除草作用和对有害植物的广谱功效和/或对有用植物作物具有高选择性。

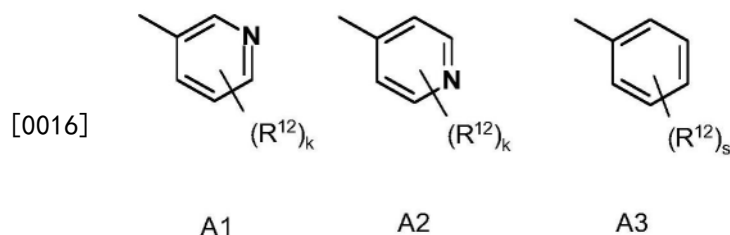
[0010] 此目的通过(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基烷基酸实现,其中取代基R²=甲氧基或乙氧基,且其具有非常好的除草作用,此外还具有非常好的选择性。

[0011] 令人惊奇的是,这些化合物对广泛的经济上重要的禾本科杂草和阔叶杂草非常有效。同时,这些化合物表现出良好的作物植物相容性。因此,鉴于对有害植物的良好功效,它们可选择性地用于作物植物。

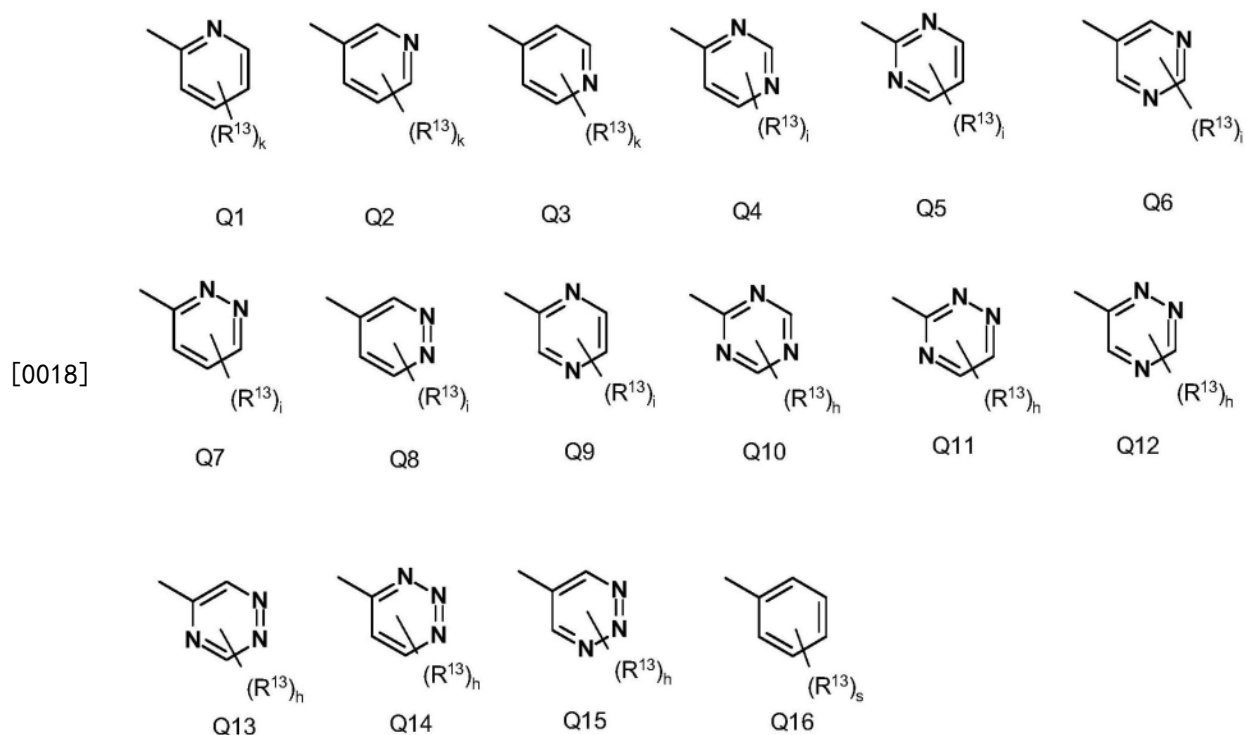
[0012] 因此,本发明提供通式(I)的(1,4,5-三取代-1H-吡唑-3-基)氧基-2-烷氧基烷基酸及其衍生物



[0014] 及其农业化学上可接受的盐、N-氧化物、水合物以及盐和N-氧化物的水合物,其中
 [0015] A选自A1、A2和A3



[0017] Q选自Q1-Q16:



[0019] R^1 为 OR^{1a} 、 NR^9R^{10} ;

[0020] R^{1a} 为氢或

[0021] 为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自 $COOR^5$ 、卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基、氰基和硝基的基团取代

[0022] 或

[0023] 为 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基或

[0024] 为 (C_1-C_6) -烷基-SO- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基-SO₂- (C_1-C_6) -烷基或

[0025] 为杂环基、杂芳基、芳基或

[0026] 为杂环基- (C_1-C_4) -烷基、杂芳基- (C_1-C_4) -烷基、芳基- (C_1-C_4) -烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基的基团取代;

[0027] R^9 为氢、 (C_1-C_{12}) -烷基;

[0028] R^{10} 为氢、芳基、杂芳基、杂环基、 (C_1-C_{12}) -烷基、 (C_3-C_8) -环烷基、 (C_3-C_8) -环烷基- (C_1-C_7) -烷基、 (C_2-C_{12}) -烯基、 (C_5-C_7) -环烯基、 (C_2-C_{12}) -炔基、 $S(O)_nR^5$ 、氰基、 OR^5 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 、 COR^8 ,其中上述烷基、环烷基、烯基、环烯基和炔基基团未被取代或各自独立地被“m”个选自任选地单或多取代的芳基、卤素、氰基、硝基、 OR^5 、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 COR^6 、 NR^6R^8 、 NR^6COR^8 、 $NR^6CONR^8R^8$ 、 $NR^6CO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2NR^6R^8$ 、 $C(R^6)=NOR^8$ 的基团取代;

[0029] 或

[0030] R^9 和 R^{10} 与它们所连接的氮原子共同形成饱和的或部分或完全不饱和的五、六或七元环,其任选地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 OR^5 、 $S(O)_nR^5$ 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 COR^6 和 $C(R^6)=NOR^8$ 的基团取代,且其除该氮原子外还包含“r”个碳原子、“o”个氧原子、“p”个硫原子和“q”个来自 NR^7 、 CO 和 $NCOR^7$ 的元素作为环原子;

[0031] R^5 为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、芳基;

[0032] R^6 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、芳基;

[0033] R^7 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_4) -烯基、 (C_3-C_4) -炔基;

[0034] R^8 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_4) -烯基、 (C_1-C_6) -烷基- $COO(C_1-C_2)$ -烷基或 (C_3-C_4) -炔基;

[0035] R^2 为甲氧基、乙氧基;

[0036] R^3 为卤素、氰基、异氰基、硝基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -卤代环烷基、 (C_1-C_6) -烷基羰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基、 (C_2-C_3) -烯基、 (C_2-C_3) -卤代烯基、 (C_2-C_3) -炔基、 (C_2-C_3) -卤代炔基、 (C_1-C_6) -烷基- $S(O)_n$ 和 (C_1-C_6) -卤代烷基- $S(O)_n$ 、 CHO 以及 NH_2 ;

[0037] R^{12} 为卤素、氰基、硝基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基;

[0038] R^{13} 为卤素、氰基、硝基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_6) -烷基羰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_6) -烷基- $S(O)_n$ 、 (C_2-C_3) -烯基、 (C_2-C_3) -卤代烯基、 (C_2-C_3) -炔基、 (C_2-C_3) -卤代炔基;

[0039] h为0、1或2;

[0040] i为0、1、2或3;

[0041] k为0、1、2、3或4;

[0042] m为0、1或2;

[0043] n为0、1或2;

[0044] o为0、1或2;

[0045] p为0或1;

[0046] q为0或1;

[0047] r为3、4、5或6;

[0048] s为0、1、2、3、4或5。

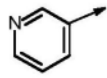
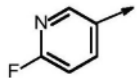
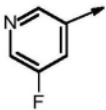
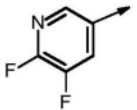
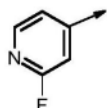
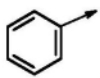
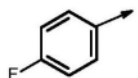
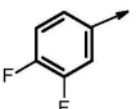
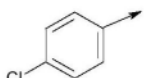
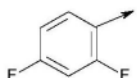
[0049] 下面描述了每个单独取代基的优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0050] 这导致通式(I)的化合物的各种实施方案。

[0051] 优选通式(I)的化合物,其中

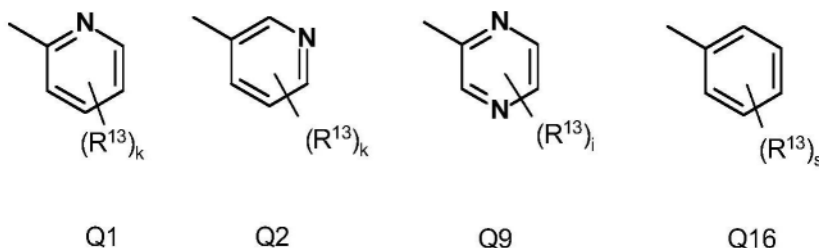
[0052] A为A1-1、A1-2、A1-3、A1-4、A2-1、A3-1、A3-2、A3-3、A3-4和A3-5

[0053]

				
A1-1	A1-2	A1-3	A1-4	
				
A2-1				
				
A3-1	A3-2	A3-3	A3-4	A3-5

[0054] Q选自Q1、Q2、Q9和Q16

[0055]



[0056] R^1 为 OR^{1a} 、 NR^9R^{10} ,

[0057] R^{1a} 为氢或

[0058] 为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自 $COOR^5$ 、卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基、氰基和硝基的基团取代

[0059] 或

[0060] 为 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基或

[0061] 为 (C_1-C_6) -烷基-SO- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基-SO₂- (C_1-C_6) -烷基、芳基- (C_1-C_4) -烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基的基团取代;

[0062] R^9 为氢、 (C_1-C_6) -烷基;

[0063] R^{10} 为氢、苯基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_5-C_7) -环烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 $S(O)_nR^5$ 、氰基、 OR^5 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 、 COR^8 ,其中上述烷基、环烷基、烯基、环烯基和炔基基团未被取代或各自独立地被“m”个选自任选地单或多取代的苯基、卤素、氰基、硝基、 OR^5 、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 COR^6 、 NR^6R^8 、 NR^6COR^8 、 $NR^6CONR^8R^8$ 、 $NR^6CO_2R^8$ 的基团取代,或

[0064] R^9 和 R^{10} 与它们所连接的氮原子共同形成饱和的或部分或完全不饱和的五、六或七元环,其任选地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 OR^5 、 $S(O)_nR^5$ 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 COR^6 和 $C(R^6)=NOR^8$ 的基团取代,且其除该氮原子外还包含“r”个碳原子、“o”个氧原子、“p”个硫原子和“q”个来自 NR^7 、 CO 和 $NCOR^7$ 的元素作为环原子;

[0065] R^5 为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基或苯基;

[0066] R^6 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基或苯基;

[0067] R^7 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_4) -烯基或 (C_3-C_4) -炔基;

[0068] R^8 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_4) -烯基或 (C_3-C_4) -炔基;

[0069] R^2 为甲氧基、乙氧基;

[0070] R^3 为卤素、氰基、异氰基、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -卤代环烷基、 (C_2-C_3) -烯基、 (C_2-C_3) -卤代烯基、 (C_2-C_3) -炔基、 (C_2-C_3) -卤代炔基;

[0071] R^{13} 为卤素、氰基、硝基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_6) -烷基- $S(O)_n$ 、 (C_2-C_3) -烯基、 (C_2-C_3) -卤代烯基、 (C_2-C_3) -炔基、 (C_2-C_3) -卤代炔基;

[0072] i为0、1或2;

[0073] k为0、1、2、3或4;

[0074] m为0、1、2;

[0075] n为0、1、2;

[0076] o为0、1、2;

[0077] p为0或1;

[0078] q为0或1;

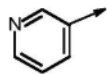
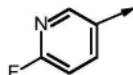
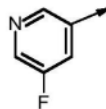
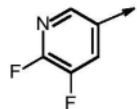
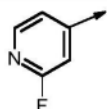
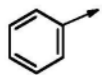
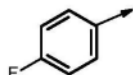
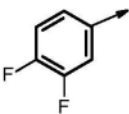
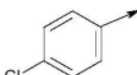
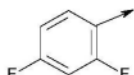
[0079] r为3、4、5或6;

[0080] s为0、1、2、4、5。

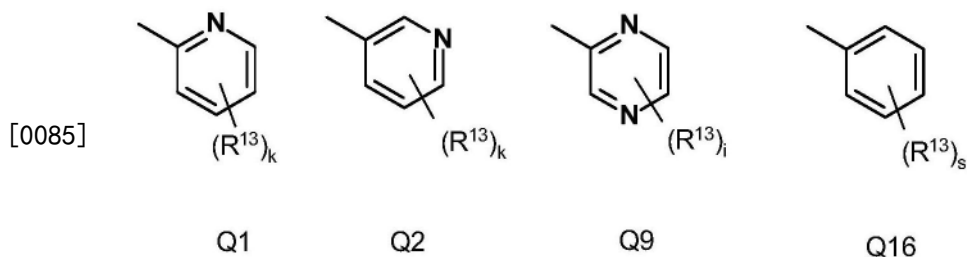
[0081] 特别优选通式(I)的化合物,其中

[0082] A为A1-1、A1-2、A1-3、A1-4、A2-1、A3-1、A3-2、A3-3、A3-4和A3-5

[0083]

				
A1-1	A1-2	A1-3	A1-4	
				
A2-1				
				
A3-1	A3-2	A3-3	A3-4	A3-5

[0084] Q选自Q1、Q2、Q9和Q16



[0086] R^1 为 OR^{1a} 、 NR^9R^{10} ;

[0087] R^{1a} 为氢或

[0088] 为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自 $COOR^5$ 、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团取代或

[0089] 为芳基- (C_1-C_4) -烷基,其未被取代或在每种情况独立地被“m”个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团取代;

[0090] R^9 为氢;

[0091] R^{10} 为 (C_1-C_4) -烷基、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 ,其中上述基团未被取代或各自独立地被“m”个选自苯基、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^7$ 、 CO_2R^8 、 $NR^6CO_2R^8$ 的基团取代;

[0092] R^5 为乙基、甲基、 CF_3 或 CH_2CF_3 ;

[0093] R^6 为氢;

[0094] R^7 为氢、甲基或乙基;

[0095] R^8 为甲基或乙基;

[0096] R^2 为甲氧基、乙氧基;

[0097] R^3 为卤素、氰基、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_3-C_6) -卤代环烷基;

[0098] R^{13} 为氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、 CF_3 、 OCF_3 ;

[0099] i为0、1或2;

[0100] k为0、1或2;

[0101] m为0、1或2;

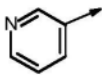
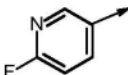
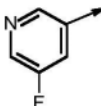
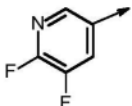
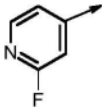
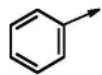
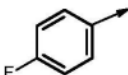
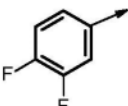
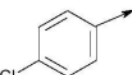
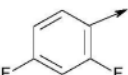
[0102] n为0、1或2;

[0103] s为0、1或2。

[0104] 非常特别优选通式(I)的化合物,其中

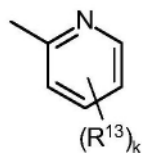
[0105] A为A1-1、A1-2、A1-3、A1-4、A2-1、A3-1、A3-2、A3-3、A3-4和A3-5

[0106]

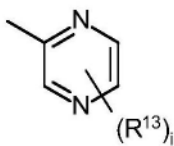
				
A1-1	A1-2	A1-3	A1-4	
				
A2-1				
				
A3-1	A3-2	A3-3	A3-4	A3-5

[0107] Q选自Q1、Q9和Q16

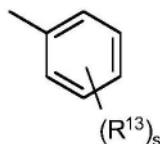
[0108]



Q1



Q9



Q16

[0109] R^1 为 OR^{1a} ,[0110] R^{1a} 为氢、乙基、甲基、 $-CH_2CH(CH_3)COO$ 甲基、 $-CH_2CH_2COO$ 甲基;[0111] R^2 为乙氧基、甲氧基;[0112] R^3 为氯、溴、碘、氰基、环丙基、 CF_2CF_3 、 CHF_2 或 CF_3 ;[0113] R^{13} 为氟、氯、甲基、MeS(O)、MeS或 CF_3 ;

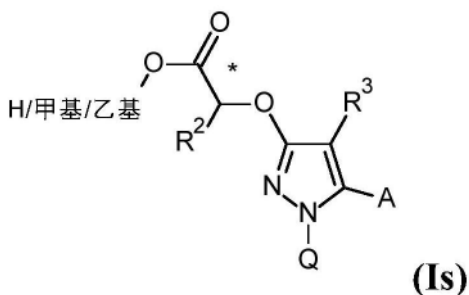
[0114] i为0、1或2;

[0115] k为0、1或2;

[0116] s为0、1或2。

[0117] 本发明还提供式(Is)的化合物

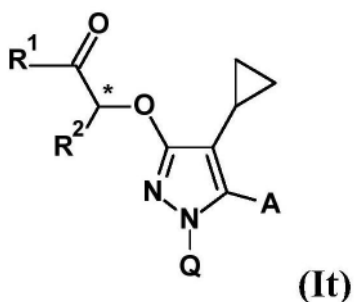
[0118]



[0119] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0120] 本发明还提供式(It)的化合物

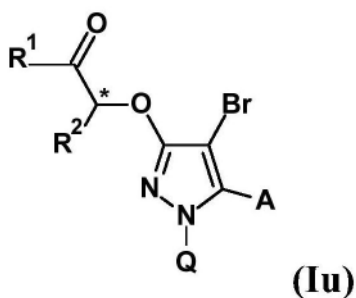
[0121]



[0122] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0123] 本发明还提供式 (Iu) 的化合物

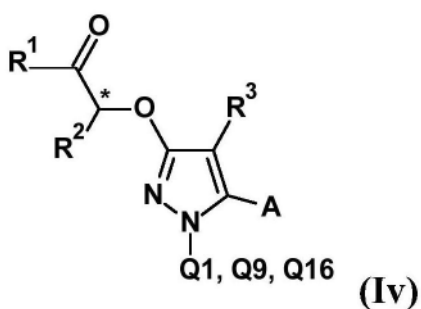
[0124]



[0125] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0126] 本发明还提供式 (Iv) 的化合物

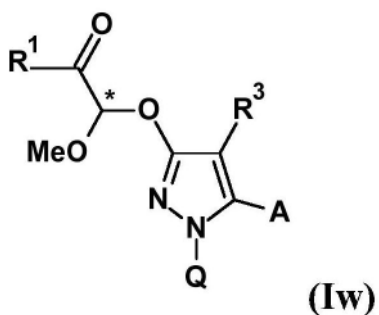
[0127]



[0128] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0129] 本发明还提供式 (Iw) 的化合物

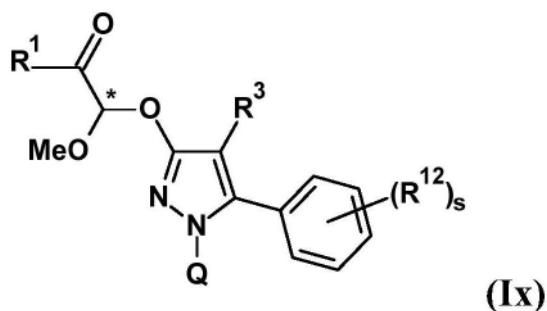
[0130]



[0131] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0132] 本发明还提供式 (Ix) 的化合物

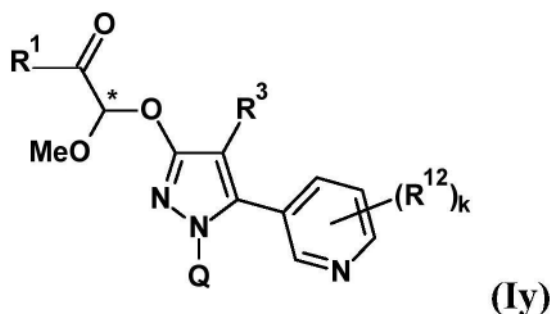
[0133]



[0134] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0135] 本发明还提供式 (Iy) 的化合物

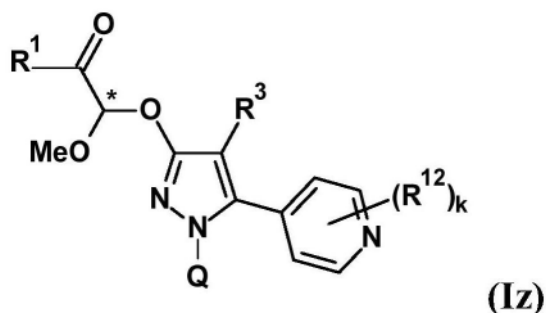
[0136]



[0137] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0138] 本发明还提供式 (Iz) 的化合物

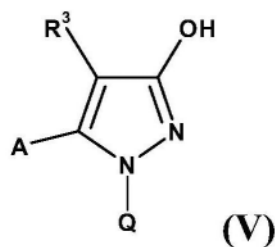
[0139]



[0140] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0141] 本发明还提供式 (V) 的化合物

[0142]



[0143] 其中上文所述的定义适用,包括所有优选、特别优选和非常特别优选的定义。

[0144] 在下文具体说明的所有式中,取代基和符号具有与式 (I) 中所述相同的含义,除非另有定义。

[0145] 违反自然规律并且本领域普通技术人员因此将基于他们的知识排除的组合不包括在内。

[0146] 烷基指具有在每种情况下指定的碳原子数的饱和的直链或支链烃基,例如 C_1 - C_{12} -烷基,优选 C_1 - C_6 -烷基,如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,

1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基和1-乙基-2-甲基丙基。

[0147] 卤素取代的烷基指部分或全部的氢原子可被卤素原子替代的直链或支链烷基,例如 C_1-C_6 -卤代烷基,优选 C_1-C_2 -卤代烷基,如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基和1,1,1-三氟丙-2-基。

[0148] 烯基指具有在每种情况下指定的碳原子数且在任意位置具有一个双键的不饱和的直链或支链烃基,例如 C_2-C_8 -烯基,优选 C_2-C_6 -烯基,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基和1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。

[0149] 炔基指具有在每种情况下指定的碳原子数且在任意位置具有一个三键的直链或支链烃基,例如 C_2-C_{12} -炔基,优选 C_2-C_6 -炔基,如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基(或炔丙基)、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、3-甲基-1-丁炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、3-甲基-1-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、1-甲基-2-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基和1-乙基-1-甲基-2-丙炔基。

[0150] 环烷基指具有优选3-8个环碳原子的碳环饱和的环体系,例如环丙基、环丁基、环戊基或环己基。在任选取代的环烷基的情况下,包括具有取代基的环体系,还包括在环烷基

上具有双键的取代基,例如亚烷基,如亚甲基。

[0151] 在任选取代的环烷基的情况下,还包括多环脂族体系,例如双环[1.1.0]丁-1-基、双环[1.1.0]丁-2-基、双环[2.1.0]戊-1-基、双环[2.1.0]戊-2-基、双环[2.1.0]戊-5-基、双环[2.2.1]庚-2-基(降冰片基)、金刚烷-1-基和金刚烷-2-基。

[0152] 在取代的环烷基的情况下,还包括螺环脂族体系,例如螺[2.2]戊-1-基、螺[2.3]己-1-基和螺[2.3]己-4-基、螺[2.3]己-5-基。

[0153] 环烯基指具有优选4-8个碳原子的碳环、非芳族的、部分不饱和的环体系,例如1-环丁烯基、2-环丁烯基、1-环戊烯基、2-环戊烯基、3-环戊烯基,或1-环己烯基、2-环己烯基、3-环己烯基、1,3-环己二烯基或1,4-环己二烯基,还包括在环烯基基团上具有双键的取代基,例如亚烷基基团,如亚甲基。在任选取代的环烯基的情况下,对取代的环烷基的说明相应地适用。

[0154] 烷氧基指具有在每种情况下指定的碳原子数的饱和直链或支链烷氧基,例如 C_1 - C_6 -烷氧基,如甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基、戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基和1-乙基-2-甲基丙氧基。卤素取代的烷氧基指下列具有在每种情况下指定的碳原子数的直链或支链烷氧基:其中在这些基团中,部分或全部的氢原子可被如上所述的卤素原子替代,例如 C_1 - C_2 -卤代烷氧基,如氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-1,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基和1,1,1-三氟丙-2-氧基。

[0155] 芳基指任选地被0-5个基团取代的苯基,所述基团选自氟、氯、溴、碘、氰基、羟基、(C_1 - C_3)-烷基、(C_1 - C_3)-烷氧基、(C_3 - C_4)-环烷基、(C_2 - C_3)-烯基或(C_2 - C_3)-炔基。

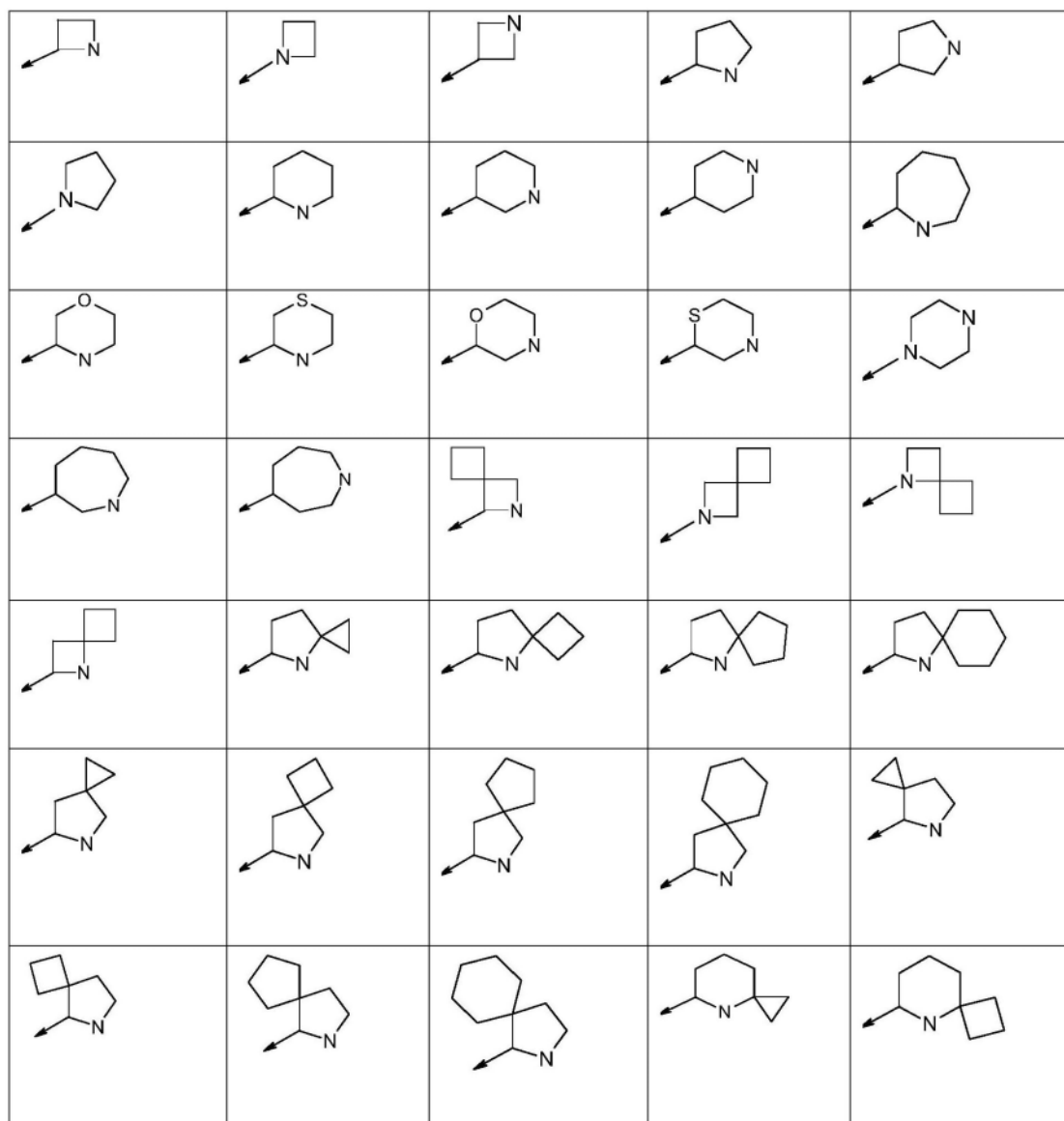
[0156] 杂环基团(杂环基)含有至少一个杂环(=其中至少一个碳原子被杂原子(优选被选自N、O、S、P的杂原子)替代的碳环),其为饱和、不饱和、部分饱和或杂芳族的,并且可为未取代或取代的,在这种情况下,键合位点位于环原子上。若杂环基基团或杂环任选地被取代,则其可与其他碳环或杂环稠合。在任选取代的杂环基的情况下,还包括多环体系,例如8-氮杂双环[3.2.1]辛基、8-氮杂双环[2.2.2]辛基或1-氮杂双环[2.2.1]庚基。任选取代的杂环基还包括螺环体系,例如1-氧杂-5-氮杂螺[2.3]己基。除非另有不同定义,否则杂环优选含有3至9个环原子,特别是3至6个环原子,并且在杂环中含有一个或多个、优选1至4个、特别是1、2或3个杂原子,所述杂原子优选选自N、O和S,但两个氧原子不应直接相邻,例如具有一个选自N、O和S的杂原子:1-或2-或3-吡咯烷基、3,4-二氢-2H-吡咯-2-或-3-基、2,3-二氢-1H-吡咯-1-或-2-或-3-或-4-或-5-基、2,5-二氢-1H-吡咯-1-或-2-或-3-基、1-或2-或3-或4-哌啶基、2,3,4,5-四氢吡啶-2-或-3-或-4-或-5-基或-6-基、1,2,3,6-四氢吡啶-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、1,2,3,4-四氢吡啶-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、1,4-二氢吡啶-1-或-2-或-3-或-4-基、2,3-二氢吡啶-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、2,5-二氢

吡啶-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、1-或2-或3-或4-氮杂环庚基、2,3,4,5-四氢-1H-氮杂**草**-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,7-四氢-1H-氮杂**草**-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢-1H-氮杂**草**-1-或-2-或-3-或-4-基、3,4,5,6-四氢-2H-氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,5-二氢-1H-氮杂**草**-1-或-2-或-3-或-4-基、2,5-二氢-1H-氮杂**草**-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,7-二氢-1H-氮杂**草**-1-或-2-或-3-或-4-基、2,3-二氢-1H-氮杂**草**-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、3,4-二氢-2H-氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、3,6-二氢-2H-氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、5,6-二氢-2H-氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,5-二氢-3H-氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、1H-氮杂**草**-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2H-氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、3H-氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4H-氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2-或3-氧杂环戊基(=2-或3-四氢呋喃基)、2,3-二氢呋喃-2-或-3-或-4-或-5-基、2,5-二氢呋喃-2-或-3-基、2-或3-或4-氧杂环己基(=2-或3-或4-四氢吡喃基)、3,4-二氢-2H-吡喃-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,6-二氢-2H-吡喃-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、2H-吡喃-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、4H-吡喃-2-或-3-或-4-基、2-或3-或4-氧杂环庚基、2,3,4,5-四氢氧杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,7-四氢氧杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢氧杂**草**-2-或-3-或-4-基、2,3-二氢氧杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,5-二氢氧杂**草**-2-或-3-或-4-基、2,5-二氢氧杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、氧杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2-或3-四氢噻吩基、2,3-二氢噻吩-2-或-3-或-4-或-5-基、2,5-二氢噻吩-2-或-3-基、四氢-2H-噻喃-2-或-3-或-4-基、3,4-二氢-2H-噻喃-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,6-二氢-2H-噻喃-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、2H-噻喃-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、4H-噻喃-2-或-3-或-4-基。优选的3元和4元杂环为例如1-或2-氮丙啶基、环氧乙烷基、硫杂环丙烷基、1-或2-或3-氮杂环丁烷基、2-或3-氧杂环丁烷基、2-或3-硫杂环丁烷基、1,3-二氧杂环丁烷-2-基。“杂环基”的其他实例为具有两个选自N、O和S的杂原子的部分氢化或完全氢化的杂环基团,例如1-或2-或3-或4-吡唑烷基、4,5-二氢-3H-吡唑-3-或-4-或-5-基、4,5-二氢-1H-吡唑-1-或-3-或-4-或-5-基、2,3-二氢-1H-吡唑-1-或-2-或-3-或-4-或-5-基、1-或2-或3-或4-咪唑烷基、2,3-二氢-1H-咪唑-1-或-2-或-3-或-4-基、2,5-二氢-1H-咪唑-1-或-2-或-4-或-5-基、4,5-二氢-1H-咪唑-1-或-2-或-4-或-5-基、六氢哒嗪-1-或-2-或-3-或-4-基、1,2,3,4-四氢哒嗪-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、1,2,3,6-四氢哒嗪-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、1,4,5,6-四氢哒嗪-1-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,4,5,6-四氢哒嗪-3-或-4-或-5-基、4,5-二氢哒嗪-3-或-4-基、3,4-二氢哒嗪-3-或-4-或-5-或-6-基、3,6-二氢哒嗪-3-或-4-基、1,6-二氢哒嗪-1-或-3-或-4-或-5-或-6-基、六氢嘧啶-1-或-2-或-3-或-4-基、1,4,5,6-四氢嘧啶-1-或-2-或-4-或-5-或-6-基、1,2,5,6-四氢嘧啶-1-或-2-或-4-或-5-或-6-基、1,2,3,4-四氢嘧啶-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、1,6-二氢嘧啶-1-或-2-或-4-或-5-或-6-基、1,2-二氢嘧

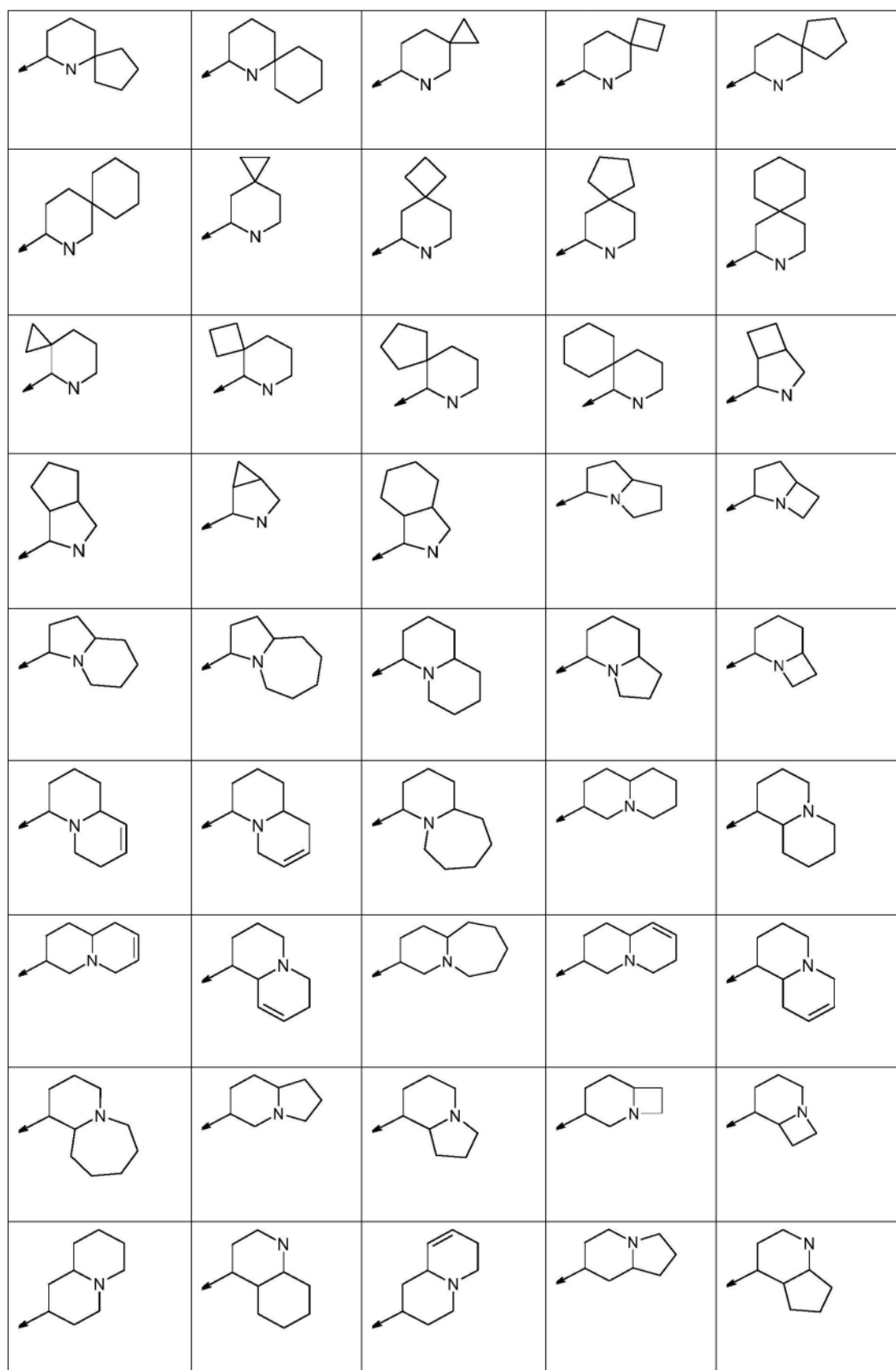
啉-1-或-2-或-4-或-5-或-6-基、2,5-二氢嘧啶-2-或-4-或-5-基、4,5-二氢嘧啶-4-或-5-或-6-基、1,4-二氢嘧啶-1-或-2-或-4-或-5-或-6-基、1-或2-或3-哌嗪基、1,2,3,6-四氢吡嗪-1-或-2-或-3-或-5-或-6-基、1,2,3,4-四氢吡嗪-1-或-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、1,2-二氢吡嗪-1-或-2-或-3-或-5-或-6-基、1,4-二氢吡嗪-1-或-2-或-3-基、2,3-二氢吡嗪-2-或-3-或-5-或-6-基、2,5-二氢吡嗪-2-或-3-基、1,3-二氧杂环戊-2-或-4-或-5-基、1,3-二氧杂环戊烯-2-或-4-基、1,3-二噁烷-2-或-4-或-5-基、4H-1,3-二氧杂环己烯-2-或-4-或-5-或-6-基、1,4-二噁烷-2-或-3-或-5-或-6-基、2,3-二氢-1,4-二氧杂环己烯-2-或-3-或-5-或-6-基、1,4-二氧杂环己二烯-2-或-3-基、1,2-二硫杂环戊-3-或-4-基、3H-1,2-二硫杂环戊烯-3-或-4-或-5-基、1,3-二硫杂环戊-2-或-4-基、1,3-二硫杂环戊烯-2-或-4-基、1,2-二噻烷-3-或-4-基、3,4-二氢-1,2-二硫杂环己烯-3-或-4-或-5-或-6-基、3,6-二氢-1,2-二硫杂环己烯-3-或-4-基、1,2-二硫杂环己二烯-3-或-4-基、1,3-二噻烷-2-或-4-或-5-基、4H-1,3-二硫杂环己烯-2-或-4-或-5-或-6-基、异噻唑烷-2-或-3-或-4-或-5-基、2,3-二氢异噻唑-2-或-3-或-4-或-5-基、2,5-二氢异噻唑-2-或-3-或-4-或-5-基、4,5-二氢异噻唑-3-或-4-或-5-基、1,3-噻唑烷-2-或-3-或-4-或-5-基、2,3-二氢-1,3-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-基、2,5-二氢-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-基、4,5-二氢-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-基、1,2-噻唑烷-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,4-二氢-2H-1,2-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,6-二氢-2H-1,2-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、5,6-二氢-2H-1,2-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、5,6-二氢-4H-1,2-噻唑-3-或-4-或-5-或-6-基、2H-1,2-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、6H-1,2-噻唑-3-或-4-或-5-或-6-基、4H-1,2-噻唑-3-或-4-或-5-或-6-基、1,3-噻唑烷-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,4-二氢-2H-1,3-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,6-二氢-2H-1,3-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、5,6-二氢-2H-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-或-6-基、5,6-二氢-4H-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-或-6-基、2H-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-或-6-基、6H-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-或-6-基、4H-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-或-6-基、吗啉-2-或-3-或-4-基、3,4-二氢-2H-1,4-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,6-二氢-2H-1,4-噻唑-2-或-3-或-5-或-6-基、2H-1,4-噻唑-2-或-3-或-5-或-6-基、4H-1,4-噻唑-2-或-3-基、1,2-氧氮杂环庚烷-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,5-四氢-1,2-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,7-四氢-1,2-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢-1,2-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,5,6,7-四氢-1,2-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,5,6,7-四氢-1,2-氧氮杂**草**-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3-二氢-1,2-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,5-二氢-1,2-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,7-二氢-1,2-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,5-二氢-1,2-氧氮杂**草**-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,7-二氢-1,2-氧氮杂**草**-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、6,7-二氢-1,2-氧氮杂**草**-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、1,2-氧氮杂**草**-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、1,3-氧氮杂环庚烷-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,5-四氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,7-四氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,5,6,7-四

氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,5,6,7-四氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3-二氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,5-二氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,7-二氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,5-二氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,7-二氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-4-或-5-或-6-或-7-基、6,7-二氢-1,3-氧氮杂**草**-2-或-4-或-5-或-6-或-7-基、1,3-氧氮杂**草**-2-或-4-或-5-或-6-或-7-基、1,4-氧氮杂环庚烷-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,5-四氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,4,7-四氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3,6,7-四氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、2,5,6,7-四氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、4,5,6,7-四氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、2,3-二氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、2,5-二氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、2,7-二氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、4,5-二氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、4,7-二氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-4-或-5-或-6-或-7-基、6,7-二氢-1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、1,4-氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、异噻唑烷-2-或-3-或-4-或-5-基、2,3-二氢异噻唑-2-或-3-或-4-或-5-基、2,5-二氢异噻唑-2-或-3-或-4-或-5-基、4,5-二氢异噻唑-3-或-4-或-5-基、1,3-噻唑烷-2-或-3-或-4-或-5-基、2,3-二氢-1,3-噻唑-2-或-3-或-4-或-5-基、2,5-二氢-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-基、4,5-二氢-1,3-噻唑-2-或-4-或-5-基、1,3-噻嗪烷-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,4-二氢-2H-1,3-噻嗪-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、3,6-二氢-2H-1,3-噻嗪-2-或-3-或-4-或-5-或-6-基、5,6-二氢-2H-1,3-噻嗪-2-或-4-或-5-或-6-基、5,6-二氢-4H-1,3-噻嗪-2-或-4-或-5-或-6-基、2H-1,3-噻嗪-2-或-4-或-5-或-6-基、6H-1,3-噻嗪-2-或-4-或-5-或-6-基、4H-1,3-噻嗪-2-或-4-或-5-或-6-基。“杂环基”的其他实例为具有3个选自N、O和S的杂原子的部分氢化或完全氢化的杂环基团,例如1,4,2-二噁唑烷-2-或-3-或-5-基、1,4,2-二噁唑-3-或-5-基、1,4,2-二噁嗪烷-2-或-3-或-5-或-6-基、5,6-二氢-1,4,2-二噁嗪-3-或-5-或-6-基、1,4,2-二噁嗪-3-或-5-或-6-基、1,4,2-二氧氮杂环庚烷-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、6,7-二氢-5H-1,4,2-二氧氮杂**草**-3-或-5-或-6-或-7-基、2,3-二氢-7H-1,4,2-二氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、2,3-二氢-5H-1,4,2-二氧氮杂**草**-2-或-3-或-5-或-6-或-7-基、5H-1,4,2-二氧氮杂**草**-3-或-5-或-6-或-7-基、7H-1,4,2-二氧氮杂**草**-3-或-5-或-6-或-7-基。下面还列出了任选地被进一步取代的杂环的结构实例:

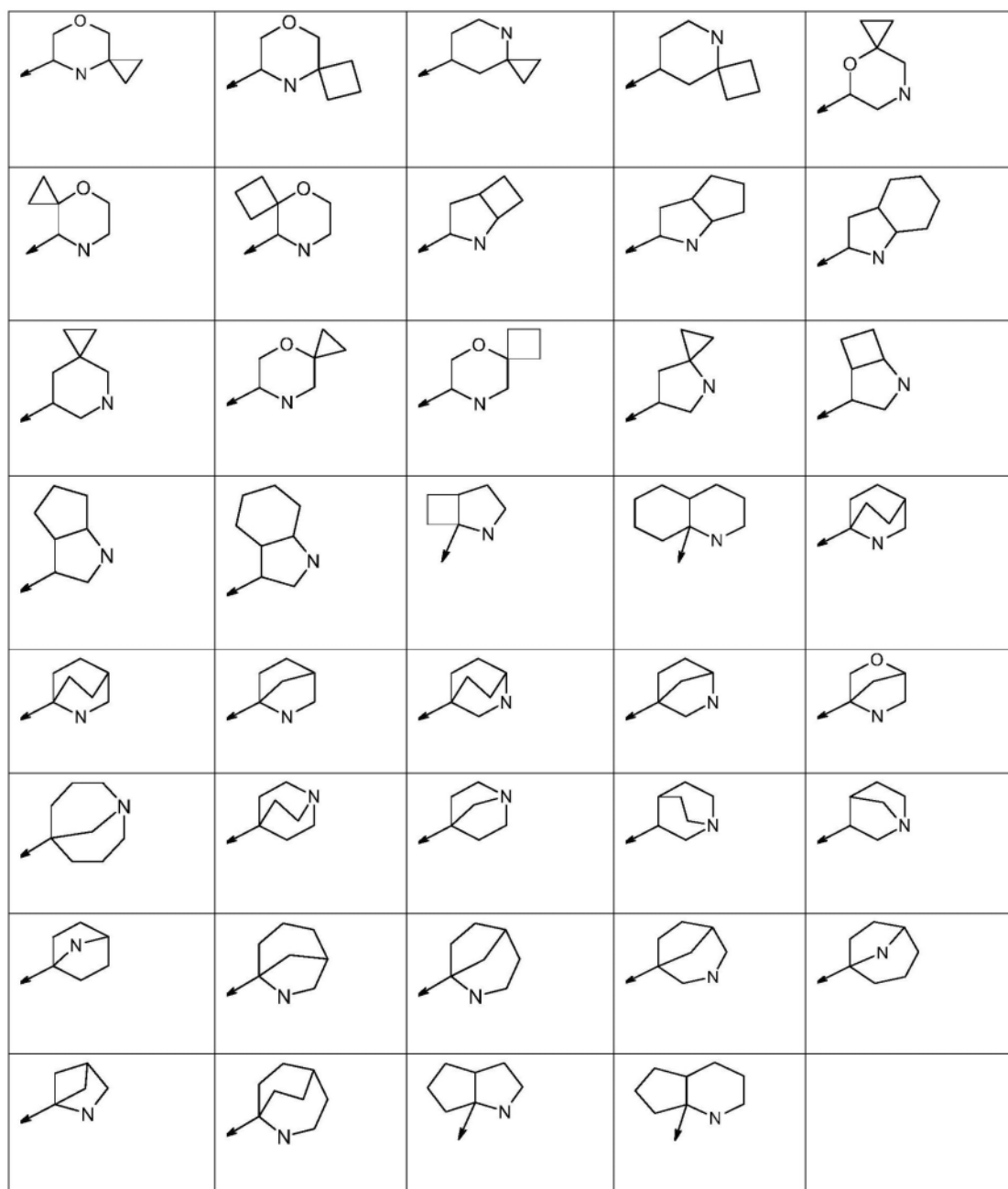
[0157]



[0158]



[0159]



[0160] 上文列出的杂环优选被例如以下基团取代：氢、卤素、烷基、卤代烷基、羟基、烷氧基、环烷氧基、芳氧基、烷氧基烷基、烷氧基烷氧基、环烷基、卤代环烷基、芳基、芳基烷基、杂芳基、杂环基、烯基、烷基羰基、环烷基羰基、芳基羰基、杂芳基羰基、烷氧基羰基、羟基羰基、环烷氧基羰基、环烷基烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、芳基烷氧基羰基、芳基烷氧基羰基烷基、炔基、炔基烷基、烷基炔基、三烷基甲硅烷基炔基、硝基、氨基、氰基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、烷硫基、氢硫基、羟基烷基、氧代、杂芳基烷氧基、芳基烷氧基、杂环基烷氧基、杂环基烷硫基、杂环氧基、杂环硫基、杂芳氧基、双烷基氨基、烷基氨基、环烷基氨基、羟基羰基烷基氨基、烷氧基羰基烷基氨基、芳基烷氧基羰基烷基氨基、烷氧基羰基烷基(烷基)氨基、氨基羰基、烷基氨基羰基、双烷基氨基羰基、环烷基氨基羰基、羟基羰基烷基氨基羰基、烷氧基羰基烷基氨基羰基、芳基烷氧基羰基烷基氨基羰基。

[0161] 当基础结构被选自基团列表或一般定义的基团组的“一个或多个基团”取代时，这

在每种情况下包括被多个相同和/或结构不同的基团同时取代。

[0162] 在部分或完全饱和的氮杂环的情况下,其可通过碳或通过氮连接到分子的其余部分。

[0163] 用于取代的杂环基团的合适的取代基为上述取代基,另外还有氧代和硫代。作为环碳原子上的取代基的氧代基团则为例如杂环中的羰基。因此,优选还包括内酯和内酰胺。氧代基团还可出现在环杂原子上,所述环杂原子可以以不同的氧化态存在,例如在N和S的情况下,并且在这种情况下,在杂环中形成例如二价的-N(O)-、-S(O)- (也简称为SO) 和-S(O)₂- (也简称为SO₂) 基团。在-N(O)-和-S(O)-基团的情况下,包括在每种情况下的两种对映体。

[0164] 根据本发明,表述“杂芳基”指杂芳族化合物,即完全不饱和的芳族杂环化合物,优选具有1至4个、优选1个或2个相同或不同的杂原子(优选O、S或N)的5元至7元环。本发明的杂芳基为例如1H-吡咯-1-基、1H-吡咯-2-基、1H-吡咯-3-基、呋喃-2-基、呋喃-3-基、噻吩-2-基、噻吩-3-基、1H-咪唑-1-基、1H-咪唑-2-基、1H-咪唑-4-基、1H-咪唑-5-基、1H-吡唑-1-基、1H-吡唑-3-基、1H-吡唑-4-基、1H-吡唑-5-基、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-1,2,3-三唑-4-基、1H-1,2,3-三唑-5-基、2H-1,2,3-三唑-2-基、2H-1,2,3-三唑-4-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、1H-1,2,4-三唑-3-基、4H-1,2,4-三唑-4-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,2,3-噁二唑-4-基、1,2,3-噁二唑-5-基、1,2,5-噁二唑-3-基、氮杂**草**基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、吡嗪-2-基、吡嗪-3-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、嘧啶-5-基、哒嗪-3-基、哒嗪-4-基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基、1,2,4-三嗪-6-基、1,2,3-三嗪-4-基、1,2,3-三嗪-5-基、1,2,4-噁嗪基、1,3,2-噁嗪基、1,3,6-噁嗪基和1,2,6-噁嗪基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、1,3-噁唑-2-基、1,3-噁唑-4-基、1,3-噁唑-5-基、异噻唑-3-基、异噻唑-4-基、异噻唑-5-基、1,3-噻唑-2-基、1,3-噻唑-4-基、1,3-噻唑-5-基、氧杂**草**基、硫杂**草**基、1,2,4-三唑酮基和1,2,4-三氮杂**草**基、2H-1,2,3,4-四唑-5-基、1H-1,2,3,4-四唑-5-基、1,2,3,4-噁三唑-5-基、1,2,3,4-噻三唑-5-基、1,2,3,5-噁三唑-4-基、1,2,3,5-噻三唑-4-基。本发明的杂芳基也可被一个或多个相同或不同的基团取代。若两个相邻的碳原子是另一芳环的一部分,则该体系为稠合的杂芳族体系,例如苯稠合的或多重稠合的杂芳族化合物。优选的实例为喹啉类(例如喹啉-2-基、喹啉-3-基、喹啉-4-基、喹啉-5-基、喹啉-6-基、喹啉-7-基、喹啉-8-基)、异喹啉类(例如异喹啉-1-基、异喹啉-3-基、异喹啉-4-基、异喹啉-5-基、异喹啉-6-基、异喹啉-7-基、异喹啉-8-基)、喹喔啉、喹唑啉、噌啉、1,5-萘啶、1,6-萘啶、1,7-萘啶、1,8-萘啶、2,6-萘啶、2,7-萘啶、酞嗪、吡啶并吡嗪类、吡啶并嘧啶类、吡啶并哒嗪类、蝶啶类、嘧啶并嘧啶类。杂芳基的实例还有选自以下的5元或6元苯稠合环:1H-吡啶-1-基、1H-吡啶-2-基、1H-吡啶-3-基、1H-吡啶-4-基、1H-吡啶-5-基、1H-吡啶-6-基、1H-吡啶-7-基、1-苯并呋喃-2-基、1-苯并呋喃-3-基、1-苯并呋喃-4-基、1-苯并呋喃-5-基、1-苯并呋喃-6-基、1-苯并呋喃-7-基、1-苯并噻吩-2-基、1-苯并噻吩-3-基、1-苯并噻吩-4-基、1-苯并噻吩-5-基、1-苯并噻吩-6-基、1-苯并噻吩-7-基、1H-吡唑-1-基、1H-吡唑-3-基、1H-吡唑-4-基、1H-吡唑-5-基、1H-吡唑-6-基、1H-吡唑-7-基、2H-吡唑-2-基、2H-吡唑-3-基、2H-吡唑-4-基、2H-吡唑-5-基、2H-吡唑-6-基、2H-吡唑-7-基、2H-异吡唑-2-基、2H-异吡唑-1-基、2H-异吡唑-3-基、2H-异吡唑-4-基、2H-异吡唑-5-基、2H-异吡唑-6-基、2H-异吡唑-7-基、1H-苯并咪唑-1-基、1H-苯并咪

唑-2-基、1H-苯并咪唑-4-基、1H-苯并咪唑-5-基、1H-苯并咪唑-6-基、1H-苯并咪唑-7-基、1,3-苯并噁唑-2-基、1,3-苯并噁唑-4-基、1,3-苯并噁唑-5-基、1,3-苯并噁唑-6-基、1,3-苯并噁唑-7-基、1,3-苯并噻唑-2-基、1,3-苯并噻唑-4-基、1,3-苯并噻唑-5-基、1,3-苯并噻唑-6-基、1,3-苯并噻唑-7-基、1,2-苯并异噁唑-3-基、1,2-苯并异噁唑-4-基、1,2-苯并异噁唑-5-基、1,2-苯并异噁唑-6-基、1,2-苯并异噁唑-7-基、1,2-苯并异噻唑-3-基、1,2-苯并异噻唑-4-基、1,2-苯并异噻唑-5-基、1,2-苯并异噻唑-6-基、1,2-苯并异噻唑-7-基。

[0165] 术语“卤素”指氟、氯、溴或碘。如果将该术语用于基团,则“卤素”指氟、氯、溴或碘原子。

[0166] 根据以上定义的取代基的性质,式(I)的化合物具有酸性,并且能够与无机或有机碱或金属离子形成盐,而且若合适还能够形成内盐或加合物。若式(I)的化合物带有羟基、羧基或其他导致酸性的基团,这些化合物可以与碱反应生成盐。合适的碱例如碱金属和碱土金属(特别是钠、钾、镁和钙)的氢氧化物、碳酸盐、碳酸氢盐,以及氨,具有(C₁-C₄)-烷基的伯、仲和叔胺,(C₁-C₄)-烷醇的单、二和三烷醇胺,胆碱和氯胆碱,以及有机胺如三烷基胺、吗啉、哌啶或吡啶。这些盐是其中酸性氢被农业上合适的阳离子替代的化合物,例如金属盐,特别是碱金属盐或碱土金属盐,尤其是钠盐和钾盐,或者铵盐(与有机胺的盐或季铵盐,例如与式[NRR'R''']⁺的阳离子,其中R至R'''各自独立地为有机基团,特别是烷基、芳基、芳烷基或烷基芳基)。烷基铈和烷基氧化铈盐同样有用,例如(C₁-C₄)-三烷基铈和(C₁-C₄)-三烷基氧化铈盐。

[0167] 式(I)的化合物可通过将合适的无机或有机酸(例如矿物酸如HCl、HBr、H₂SO₄、H₃PO₄或HNO₃,或有机酸如羧酸(诸如甲酸、乙酸、丙酸、草酸、乳酸或水杨酸)或磺酸(诸如对甲苯磺酸))加到碱性基团(例如氨基、烷基氨基、二烷基氨基、哌啶基、吗啉基或吡啶基)上形成盐。这些盐则含有酸的共轭碱作为阴离子。

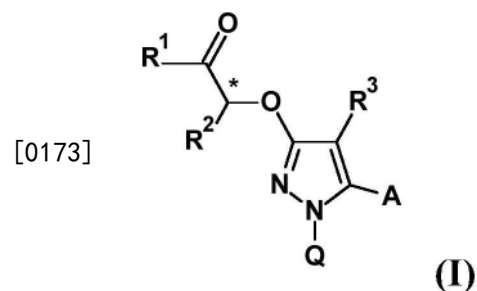
[0168] 以去质子化形式存在的合适的取代基如磺酸或羧酸能够与氨基等能被质子化的基团形成内盐。

[0169] 如果一个基团被基团多取代,这意味着该基团被一个或多个与上述基团相同或不同的基团取代。

[0170] 在下文具体说明的所有式中,取代基和符号具有与式(I)中所述相同的含义,除非另有定义。化学式中的箭头表示其与分子其余部分连接的点。

[0171] 下面描述了每个单独取代基的优选、特别优选和非常特别优选的定义。以下未具体说明的通式(I)的其他取代基具有以上给出的定义。

[0172] 通式(I)的本发明化合物在烷基酸结构的第二个碳处具有手性碳原子,其在下面所示结构中由标记(*)标示:



[0174] 根据Cahn、Ingold和Prelog规则(CIP规则),该碳原子可具有(R)构型或(S)构型。

[0175] 本发明涵盖具有(S)构型和(R)构型的通式(I)的化合物,这意味着本发明涵盖通式(I)的化合物,其中所讨论的碳原子具有

[0176] (1) (R)构型;或

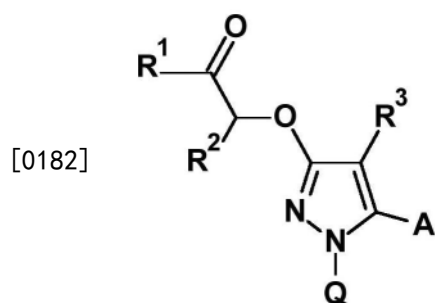
[0177] (2) (S)构型。

[0178] 此外,本发明的范围还涵盖

[0179] (3) 具有(R)构型的通式(I)的化合物(通式(I-R))的化合物)与具有(S)构型的通式(I)的化合物(通式(I-S)的化合物)的任意混合物,本发明还涵盖具有(R)和(S)构型的通式(I)的化合物的外消旋混合物。

[0180] 此外,取决于所选择的相应基团,根据本发明的通式(I)的化合物中可能存在其他立体元素。

[0181] 表A:



[0183]

实施例 编号	Q	R ³	A	R ²	R ¹
I-01	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	乙氧基
I-02	3-氟吡啶-2-基	Br	4-氟苯基	乙氧基	乙氧基

[0184]

实施例 编号	Q	R ³	A	R ²	R ¹
I-03	3-氟吡啶-2-基	Br	4-氟苯基	甲氧基	甲氧基
I-04	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-05	3-氟吡啶-2-基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-06	3-氟吡啶-2-基	Br	苯基	甲氧基	甲氧基
I-07	3-氟吡啶-2-基	Br	2,4-二氟苯基	甲氧基	甲氧基
I-08	3-氟吡啶-2-基	Br	2,4-二氟苯基	乙氧基	乙氧基
I-09	4-氟-2-氟苯基	Br	2,4-二氟苯基	乙氧基	乙氧基
I-10	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	外消旋(2 <i>R</i>)-3-甲 氧基-2-甲基-3-氧 代丙氧基
I-11	4-氟-2-氟苯基	Br	2,4-二氟苯基	甲氧基	甲氧基
I-12	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-13	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-14	3-氟吡啶-2-基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-15	6-氟吡啶-3-基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-16	3-氟-2-氟苯基	Cl	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-17	3-氟-2-氟苯基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-18	3-氟-2-氟苯基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-19	3-氟-2-氟苯基	I	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-20	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-21	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-22	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-23	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-24	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH

[0185]

实施例 编号	Q	R ³	A	R ²	R ¹
I-25	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-26	苯基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-27	2-氟-3-甲基苯基	Cl	3,4-二氟苯基	甲氧基	甲氧基
I-28	2,5-二氟苯基	I	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-29	2,5-二氟苯基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-30	苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-31	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-32	2,5-二氟苯基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-33	2,5-二氟苯基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-34	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-35	吡嗪-2-基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-36	吡嗪-2-基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-37	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-38	3-氟吡啶-2-基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-39	3-氟吡啶-2-基	I	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-40	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-41	3-氟吡啶-2-基	三氟甲基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-42	吡嗪-2-基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-43	吡嗪-2-基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-44	3-氟吡啶-2-基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-45	3-氟吡啶-2-基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-46	吡嗪-2-基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-47	吡嗪-2-基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基

[0186]

实施例 编号	Q	R ³	A	R ²	R ¹
I-48	3-氟吡啶-2-基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-49	2-氟苯基	I	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-50	2-氟苯基	Cl	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	乙氧基
I-51	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	OH
I-52	2-氟苯基	Cl	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	OH
I-53	2-氟苯基	Cl	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-54	2-氟苯基	Cl	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	外消旋(2 <i>R</i>)-3-甲 氧基-2-甲基-3-氧 代丙氧基
I-55	3-氟吡啶-2-基	三氟甲基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-56	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-57	3-氟吡啶-2-基	三氟甲基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-58	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-59 (外消 旋)	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-60	2-氟苯基	1,1,2,2,2- 五氟乙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-61	2-氟苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-62	2-氟苯基	三氟甲基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-63 (对映 体1)	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-64 (对映 体2)	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-65	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	OH
I-66 (对映 体1)	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	乙氧基

[0187]

实施例 编号	Q	R ³	A	R ²	R ¹
I-67 (对映 体2)	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	乙氧基
I-67	2-氟苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	乙氧基	乙氧基
I-68	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-69	2-氟苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-70	2-氟苯基	三氟甲基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-71	2-氟苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-72	3-氟吡啶-2-基	I	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-73	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-74	2-氟苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-75	2-氟苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-76	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-77	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-78	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-79	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-80	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-81	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-82	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-83	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-84	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-85	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH

[0188]

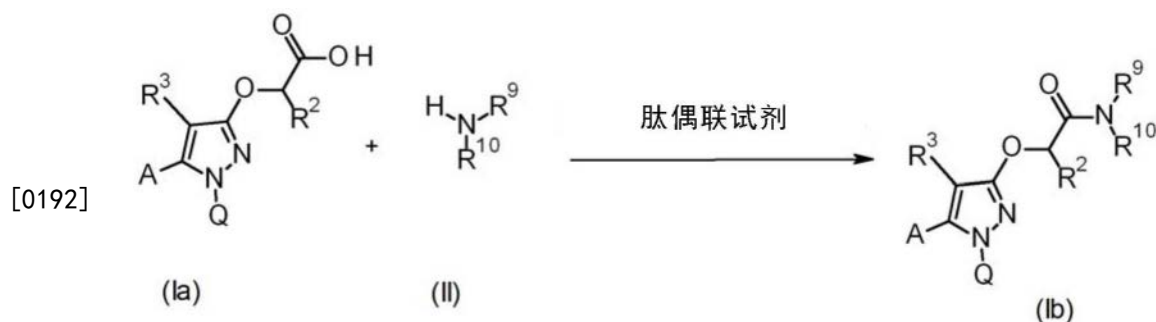
实施例 编号	Q	R ³	A	R ²	R ¹
I-86	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-87	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-88	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-89	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-90	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-91	3-氟吡啶-2-基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-92	2-氟-3-甲基苯基	Br	2-氟吡啶-4-基	甲氧基	OH
I-93	2-氟-3-甲基苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-94	2-氟-3-甲基苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-95	2-氟-3-甲基苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-96	2-氟-3-甲基苯基	Br	2-氟吡啶-4-基	甲氧基	乙氧基
I-97	2-氟-3-甲基苯基	Br	2-氟吡啶-4-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-98	2-氟-3-甲基苯基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-99	2-氟-3-甲基苯基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-100	2-氟-3-甲基苯基	Cl	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-101	3-甲硫基吡啶-2-基	I	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-102	3-(氯甲硫基) 吡 啶-2-基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-103	3-甲基亚磺酰基 吡啶-2-基	Cl	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-104	3-甲基亚磺酰基 吡啶-2-基	I	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-105	吡啶-2-基	Cl	4-氟苯基	甲氧基	甲氧基
I-106	2-氟苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-106	2-氟苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基

[0189]

实施例 编号	Q	R ³	A	R ²	R ¹
I-107	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-108	3-氟吡啶-2-基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-109	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-110	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	OH
I-111	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-112	2,5-二氟苯基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-113	3-氟吡啶-2-基	环丙基	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-114	2-氟-3-甲基苯基	Br	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-115	2-氟-3-甲基苯基	Br	2-氟吡啶-4-基	甲氧基	甲氧基
I-116	2-氟-3-甲基苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-117	2-氟-3-甲基苯基	环丙基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-118	3-氯-2-氟苯基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	乙氧基
I-119	3-氯-2-氟苯基	Br	5-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-120	2-氟苯基	二氟甲基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	甲氧基
I-121	2-氟苯基	二氟甲基	6-氟吡啶-3-基	甲氧基	3-甲氧基-3-氧代 丙氧基
I-122	吡啶-2-基	Br	4-氟苯基	甲氧基	甲氧基

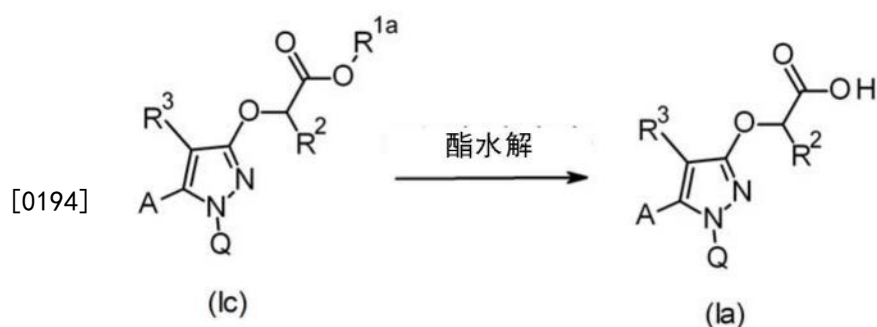
[0190] 本发明的又一个方面涉及本发明通式(I)的化合物的制备。本发明的化合物可以多种方式制备。

[0191] 如方案1所示,根据本发明的通式(Ib)的化合物通过通式(Ia)的酸与通式(II)的胺在酰胺偶联试剂(例如T3P、二环己基碳二亚胺、N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺、N,N'-羰基二咪唑、2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯盐或2-氯-1-甲基吡啶鎓碘盐)的存在下的酰胺偶联合成(见Chemistry of Peptide Synthesis,Ed.N.Leo Benoiton,Taylor&Francis,2006,ISBN-10:1-57444-454-9)。聚合物负载试剂如聚合物负载二环己基碳二亚胺同样适于此偶联反应。反应优选在0℃至80℃的温度范围内在合适的溶剂(例如二氯甲烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或乙酸乙酯)中并在碱(例如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺或1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯)的存在下进行。对于T3P肽偶联条件,见Organic Process Research&Development 2009,13,900-906。



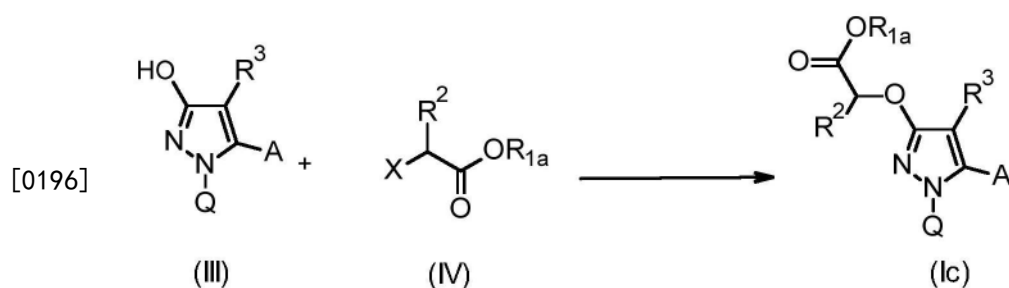
方案 1

[0193] 通式 (Ia) 的酸通过类似于本领域普通技术人员已知的方法通过通式 (Ic) 的化合物的酯水解合成。(方案2)。水解可在碱或路易斯酸的存在下进行。碱可为碱金属(例如锂、钠或钾)的氢氧化物盐,且水解反应优选在室温和120℃之间的温度范围内进行。



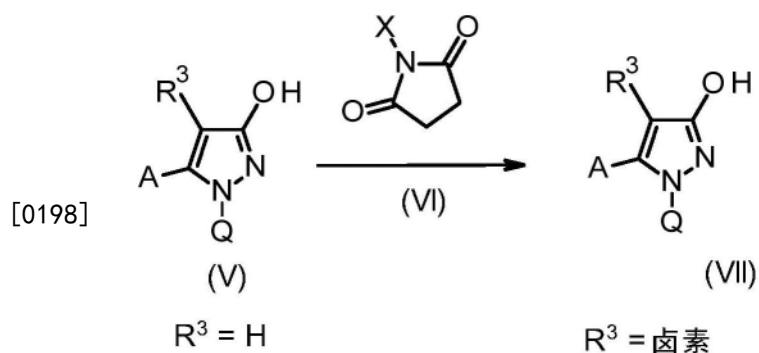
方案 2

[0195] 通式 (Ic) 的化合物通过通式 (III) 的羟基吡唑与通式 (IV) 的 α -卤代羧酸酯在碱的存在下通过本领域普通技术人员已知的方法或类似于本领域普通技术人员已知的方法的烷基化合成(见方案3)。所用碱可为碱金属的碳酸盐。碱优选为选自锂、钠、钾和铯的碱金属的碳酸盐,且反应优选在室温至150℃的温度范围内在适宜的溶剂例如二氯甲烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或乙酸乙酯中进行。参见例如J.Med.Chem.2011,54(16),5820-5835和W02010/010154。“X”基团为例如氯、溴或碘。



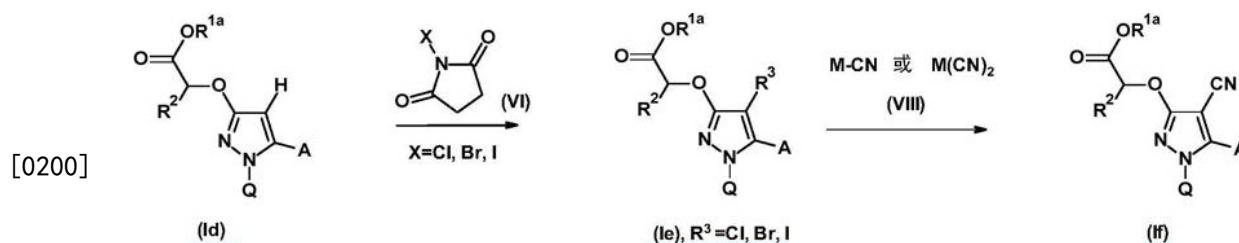
方案 3

[0197] 方案4描述了通过通式 (V) 的3-羟基吡唑与通式 (VI) 的亲电卤化试剂例如N-氯琥珀酰亚胺(VI,X=Cl)、N-溴琥珀酰亚胺(VI,X=Br)或N-碘琥珀酰亚胺(VI,X=I)的反应合成通式(VII,R³=Cl、Br、I)的化合物。以类似的方式,也可使用其他亲电试剂,例如亲电硝化试剂如硝化酸、四氟硼酸硝鎓或硝酸铵/三氟乙酸(当R³=硝基时),或亲电氟化试剂如DAST、Selectfluor或N-氟苯磺酰亚胺(当R³=F时)。反应优选在0℃至120℃的温度范围内在适宜的溶剂例如N,N-二甲基甲酰胺、1,2-二氯乙烷或乙腈中进行。



方案 4

[0199] 方案5描述了通过通式 (Id) 的4H-吡唑与通式 (VI) 的卤代琥珀酰亚胺在适宜的溶剂例如N,N-二甲基甲酰胺中的反应合成通式 (Ie) 的卤代吡唑。



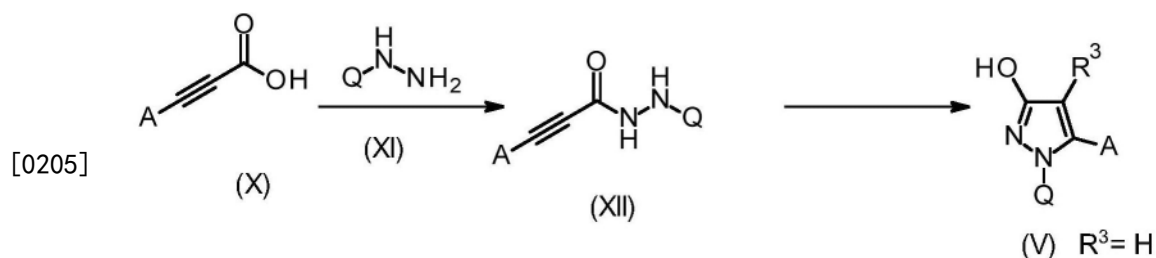
方案 5

[0202] 通式 (If) 的4-氰基吡唑可例如通过在合适溶剂中的式 (Ie) 的化合物与金属氰化物M-CN或 $M(CN)_2$ (VIII) 再加入适量的过渡金属催化剂 (尤其是钯催化剂如四(三苯基膦)钯(0)或二乙酸钯或双(三苯基膦)二氯化钯(II)) 优选在升高的温度下在有机溶剂例如1,2-二甲氧基乙烷或N,N-二甲基甲酰胺中的反应制备 (方案5)。或者,在升高的温度下在有机溶剂例如1,2-二甲氧基乙烷或N,N-二甲基甲酰胺中优选使用镍催化剂如乙酰丙酮镍(II)或双(三苯基膦)氯化镍(II)。金属氰化物M-CN或 $M(CN)_2$ (VIII) 中的“M”基团代表例如锌、锂、钾或钠。通常合适的交叉偶联方法描述于R.D.Larsen, *Organometallics in Process Chemistry* 2004Springer Verlag; I.Tsuiji, *Palladium Reagents and Catalysts* 2004Wiley; 和M.Beller, C.Bolm, *Transition Metals for Organic Synthesis* 2004VCH-Wiley。其他合适的合成方法见述于Chem.Rev.2006,106,2651; Platinum Metals Review, 2009,53,183; Platinum Metals Review 2008,52,172; 和Acc.Chem.Res.2008,41,1486。

[0203] 3-羟基吡唑 (V) 可类似于文献中已知的方法 (如例如Adv.Synth.Catal.2014,356,3135-3147所述) 在二阶段合成法中由取代的3-吡嗪基丙酸衍生物和苯肼 (XI) 制备 (方案6)。此处通式 (XII) 的化合物通过通式 (X) 的酸与通式 (XI) 的芳基肼或杂芳基肼在酰胺偶联试剂 (例如T3P、二环己基碳二亚胺、N-(3-二甲氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺、N,N'-羰基二咪唑、2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯盐或2-氯-1-甲基吡啶鎓碘盐) 的存在下的酰胺偶联合成 (见Chemistry of Peptide Synthesis, Ed.N.Leo Benoiton, Taylor&Francis, 2006, ISBN-10:1-57444-454-9)。聚合物负载试剂如聚合物负载二环己基碳二亚胺同样适于此偶联反应。反应优选在0℃至80℃的温度范围内在合适的溶剂 (例如二氯甲烷、四氢呋喃、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或乙酸乙酯) 中并在碱 (例如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺或1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯) 的存在下进行 (见方案6)。对于T3P肽偶联条件, 见Organic

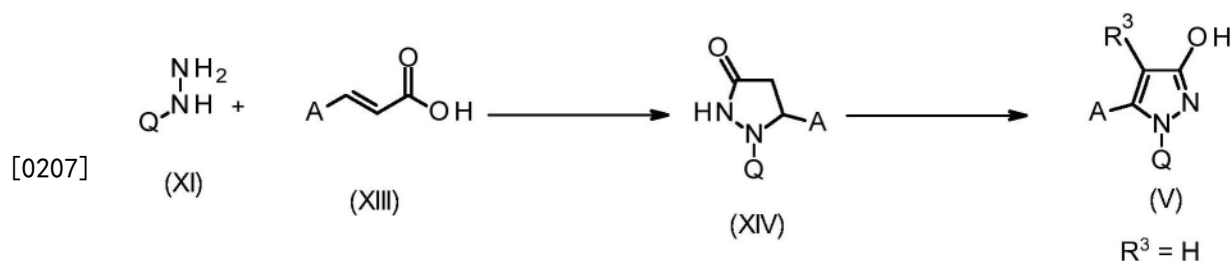
Process Research&Development 2009,13,900-906。

[0204] 然后在卤化铜(例如碘化亚铜(I)、溴化亚铜(I))或酸(例如甲磺酸)的存在下使酰肼(XII)环化。反应优选在0℃和120℃之间的温度范围内在适宜的溶剂(例如1,2-二氯乙烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、正丙醇或乙酸乙酯)中进行。



方案 6

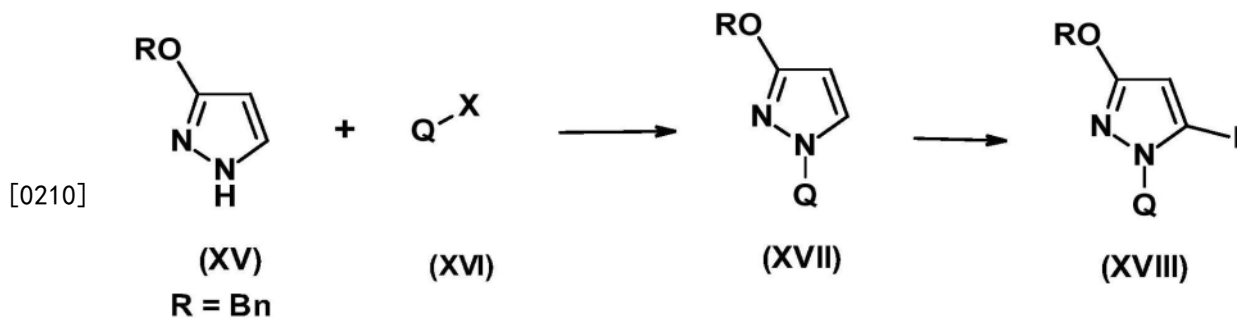
[0206] 或者,通式(V; $R^3 = H$)的羟基吡唑由取代的吡嗪基丙烯酸衍生物(XIII)和苯肼(XI)合成,如例如J.Heterocyclic Chem.,49,130(2012)所述,如方案7所示。



方案 7

[0208] 此处通式(XIV)的化合物可通过通式(XIII)的取代的丙炔酸与通式(XI)的芳基肼或杂芳基肼在酰胺偶联试剂(例如T3P、二环己基碳二亚胺、N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺、N,N'-羰基二咪唑、2-氯-1,3-二甲基咪唑鎓氯盐或2-氯-1-甲基吡啶鎓碘盐)的存在下的酰胺偶联合成。反应优选在0℃至80℃的温度范围内在合适的溶剂(例如二氯甲烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或乙酸乙酯)中并在碱(例如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺或1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯)的存在下进行(见方案7)。通式(V)的3-羟基吡唑通过第二步反应中通式(XIV)的化合物在卤化铁如氯化铁(III)的存在下的反应合成。反应优选在0℃和120℃之间的温度范围内在适宜的溶剂(例如1,2-二氯乙烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或乙酸乙酯)中进行。

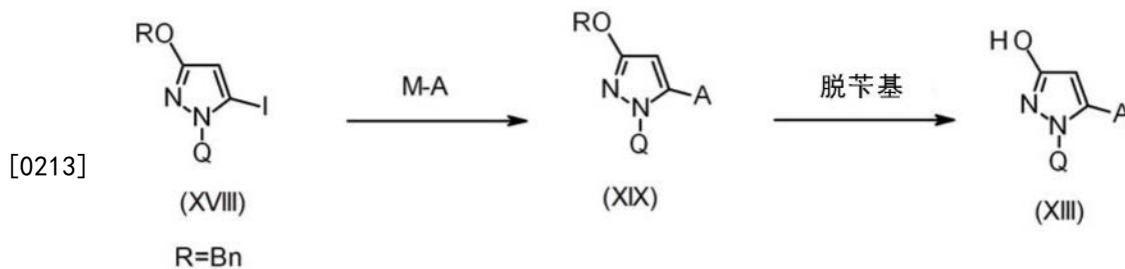
[0209] 通式(XVII)的N-芳基吡唑可通过通式(XV)的受保护的3-羟基吡唑与通式(XVI)的卤代芳烃在卤化铜例如碘化亚铜(I)的存在下的N-芳基化制备。反应优选在0℃至120℃的温度范围内在适宜的溶剂例如乙腈或N,N-二甲基甲酰胺中并在碱例如三乙胺或碳酸铯的存在下进行(见方案8)。作为起始原料的通式(XV)的受保护的3-羟基吡唑可按本领域普通技术人员已知的类似方法制备(Chem.Med.Chem.2015,10,1184-1199)。



方案 8

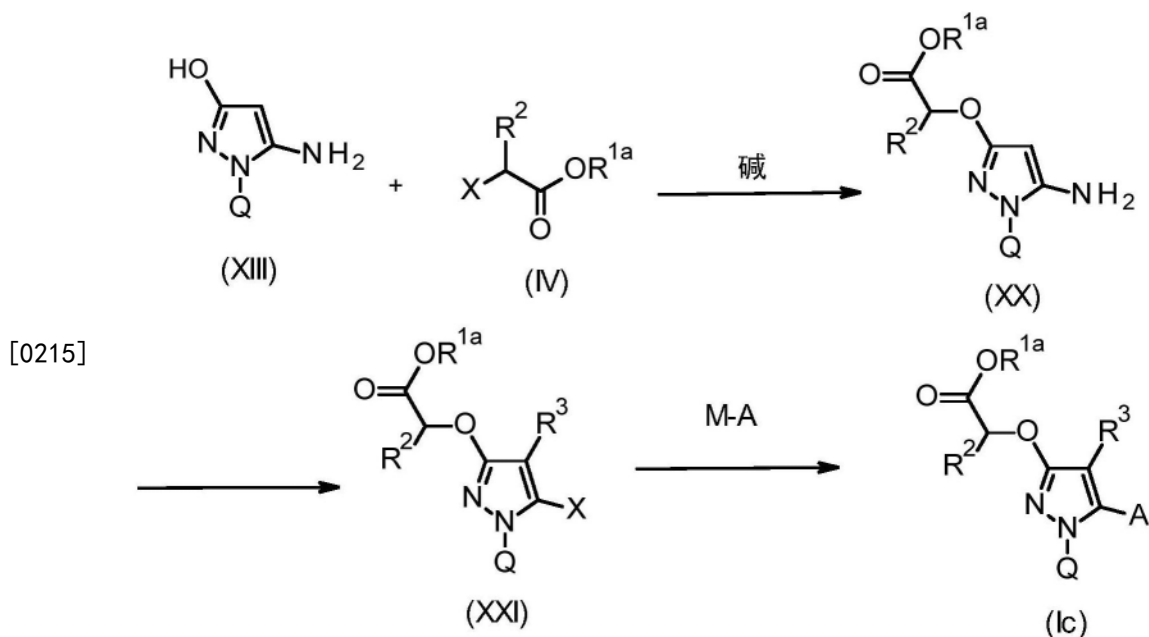
[0211] 然后通式 (XVIII) 的 5-碘吡唑通过通式 (XVII) 的 N-芳基吡唑在碱例如二异丙基氨基锂和碘的存在下的反应合成。反应优选在 -78°C 至 -60°C 的温度范围内在适宜的溶剂例如乙醚或四氢呋喃中进行 (见方案 8)。

[0212] 式 (XIX) 的二芳基吡唑可例如通过在合适溶剂中的式 (XVIII) 的碘吡唑与试剂 M-A、加入适量的过渡金属催化剂 (尤其是钯催化剂如二乙酸钯或双 (三苯基膦) 二氯化钯 (II), 或镍催化剂如乙酰丙酮镍 (II) 或双 (三苯基膦) 氯化镍 (II)) 优选在升高的温度下在有机溶剂如 1,2-二甲氧基乙烷中的反应制备。此处 “M” 基团代表例如 $\text{B}(\text{OR}^b)(\text{OR}^c)$, 其中 R^b 和 R^c 基团独立地为例如氢或 (C_1-C_4) -烷基, 或者如果基团 R^b 和 R^c 彼此键合, 则它们一起为亚乙基或亚丙基 (方案 9)。



方案 9

[0214] 通式 (XX) 的 5-氨基吡唑可通过通式 (XIII) 的化合物与通式 (IV) 的 α -卤代羧酸酯在碱的存在下通过本领域普通技术人员已知的方法或类似于本领域普通技术人员已知的方法的烷基化合成 (见方案 10)。碱可为碱金属 (例如锂、钠、钾或铯) 的碳酸盐, 且反应优选在室温至 150°C 的温度范围内在适宜的溶剂例如二氯甲烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或乙酸乙酯中进行。

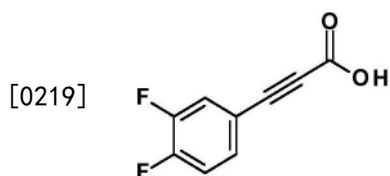


方案 10

[0216] 之后,同样如方案10所示,通式(XXI)的5-卤代吡唑由通式(XX)的5-氨基吡唑通过和常规的有机或无机亚硝酸酯(例如亚硝酸1,1-二甲基乙酯、亚硝酸叔丁酯或亚硝酸异戊酯)在溴化亚铜(I)和/或铜(II)、氯化亚铜(I)和/或铜(II)的存在下,或在碘化亚铜(I)或单质碘的存在下反应的重氮化合成。反应优选在0℃至120℃的温度范围内在适宜的溶剂例如二氯甲烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或N,N-二甲基乙酰胺中进行。通式(XXI)的5-卤代吡唑的“X”基团为例如氯、溴或碘。后续转化至式(Ic)的化合物通过在合适溶剂中的通式(XXI)的5-卤代吡唑与(杂)芳基衍生物A-M、加入适量的过渡金属催化剂(尤其是钯催化剂如二乙酸钯或双(三苯基膦)二氯化钯(II),或镍催化剂如乙酰丙酮镍(II)或双(三苯基膦)氯化镍(II))优选在升高的温度下在有机溶剂如1,2-二甲氧基乙烷中的反应实现。此处“M”基团代表例如Mg-Hal、Zn-Hal、Sn((C₁-C₄)-烷基)₃、锂、铜或B(OR^b)(OR^c),其中R^b和R^c基团独立地为例如氢、(C₁-C₄)-烷基,或者当R^b和R^c基团彼此键合时,它们一起为亚乙基或亚丙基。

[0217] 下文举出了本发明通式(I)的化合物的选定的详细合成实施例。给出的实施例编号对应下表A中给出的编号。在以下部分中描述的化学实施例中所记录的¹H-NMR、¹³C-NMR和¹⁹F-NMR波谱数据(¹H-NMR为400MHz,¹³C-NMR为150MHz,¹⁹F-NMR为375MHz,溶剂CDCl₃、CD₃OD或d₆-DMSO,内标:四甲基硅烷δ=0.00ppm)在Bruker仪器上获得,且所列信号具有以下给出的含义:br=宽峰;s=单峰,d=双峰,t=三重峰,dd=双重双峰,ddd=双重双重双峰,m=多重峰,q=四重峰,quint=五重峰,sext=六重峰,sept=七重峰,dq=双重四重峰,dt=双重三重峰。在非对映异构体混合物的情况下,记录了两种非对映异构体各自的显著信号或主要的非对映异构体的特征信号。用于化学基团的缩写具有例如以下含义:Me=CH₃,Et=CH₂CH₃,t-Hex=C(CH₃)₂CH(CH₃)₂,t-Bu=C(CH₃)₃,n-Bu=无支链的丁基,n-Pr=无支链的丙基,i-Pr=支链丙基,c-Pr=环丙基,c-Hex=环己基。

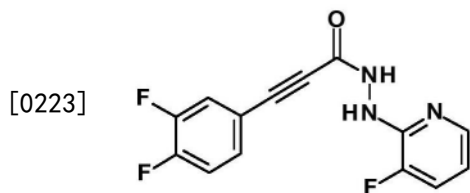
[0218] 3-(3,4-二氟苯基)丙-2-炔酸:



[0220] 在氩气氛下,向溶于30mL干燥四氢呋喃的5.00g (20.83mmol) 1,2-二氟-4-碘苯中依次加入以下物质:1.46g (20.83mmol) 丙炔酸、0.29g (0.42mmol) 双(三苯基膦)二氯化钯(11)、0.16g (0.83mmol) 碘化亚铜(I)和7.38g (72.92mmol) 二异丙胺。将混合物于室温搅拌2小时,将反应混合物加到水中,加入15.00mL 2N盐酸并用乙酸乙酯反复进行萃取。将合并的有机相用硫酸钠干燥并减压浓缩。通过柱色谱法在硅胶上用庚烷/乙酸乙酯(从庚烷/乙酸乙酯=95:5开始,在15min内到庚烷/乙酸乙酯=40:60)纯化后,得到2.89g (76%) 产物, $m/z = 183 [M^+]$ 。

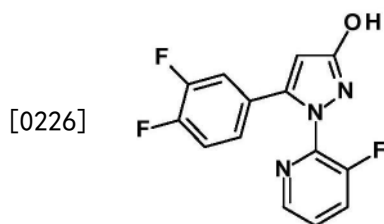
[0221] ^1H NMR (400MHz, d_6 -DMSO): $\delta = 7.56$ (m, 2H), 7.86 (m, 1H), 13.95 (bs, 1H)。

[0222] 3-(3,4-二氟苯基)-N'-(3-氟吡啶-2-基)丙-2-炔酰肼



[0224] 向2.20g (12.08mmol) 3-(3,4-二氟苯基)丙-2-炔酸、1.77g (13.90mmol) 2-氟-6-吡基吡啶和3.06g (30.20mmol) 三乙胺在180mL THF中的溶液中逐滴加入15.34g (24.16mmol) 50%丙烷膦酸酐THF溶液,并将此混合物于室温搅拌一小时。为了后处理,加入 H_2O ,去除有机相,并用 CH_2Cl_2 反复萃取水相。将合并的有机相用 Na_2SO_4 干燥并浓缩。得到3.20g (72%) 纯度80%的粗产物,其不进一步纯化即用于下一反应阶段。

[0225] 5-(3,4-二氟苯基)-1-(3-氟吡啶-2-基)-1H-吡唑-3-醇



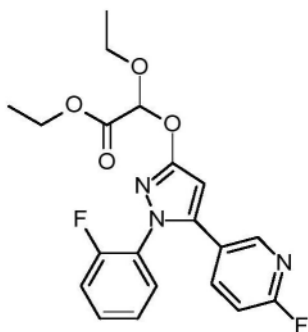
[0227] 向3.20g (9.89mmol) 3-(3,4-二氟苯基)-N'-(3-氟吡啶-2-基)丙-2-炔酰肼在50mL 乙腈和8mL DMF的溶液中加入151mg (0.79mmol) CuI,并将混合物回流三小时。然后滤出、浓缩并通过柱色谱法使用硅胶用庚烷/乙酸乙酯(3:7)纯化粗产物。以此方式,得到1.96g (67%) 固体形式的产物。

[0228] ^1H NMR (400MHz, $\text{DMSO}-d_6$): $\delta 6.15$ (s, 1H), 6.95 (m, 1H), 7.30-7.40 (m, 2H), 7.55 (m, 1H), 7.95 (m, 1H), 8.25 (m, 1H)。

[0229] (2RS)-{[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (乙氧基) 乙酸乙酯 (I-01)

[0230] (2RS)-乙氧基{[1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} 乙酸乙酯

[0231]

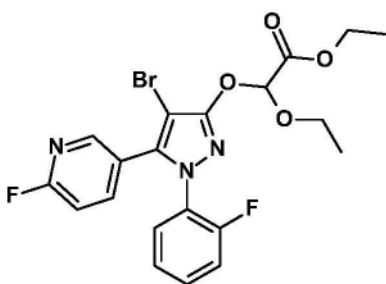


[0232] 向0.25g (0.91mmol) 1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-醇在10mL乙腈的溶液中依次加入253mg (1.83mmol) K_2CO_3 和186mg (1.83mmol) (2RS)-氯(乙氧基)乙酸乙酯,然后将混合物于回流下搅拌4小时。之后将 CH_2Cl_2 和 H_2O 加入反应混合物(各约10mL)。通过分离筒的方法分离两相然后减压浓缩有机相。通过柱色谱法使用硅胶用庚烷/乙酸乙酯纯化产生237mg (63%收率) 目标产物。

[0233] ^1H NMR (400MHz, $CDCl_3$): δ 1.31 (t, 6H), 3.84-4.02 (br m, 2H), 4.30 (m, 2H), 5.94 (s, 1H), 6.16 (s, 1H), 6.87 (dd, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.44 (dt, 1H), 7.59 (dt, 1H), 8.08 (m, 1H)。

[0234] (2RS)-{[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(乙氧基)乙酸乙酯(I-01)

[0235]



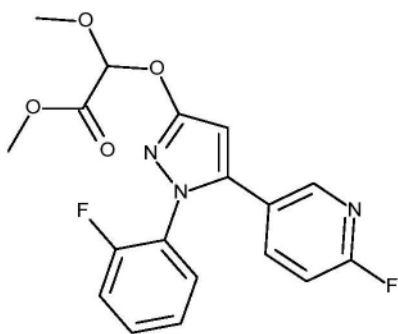
[0236] 向118mg (0.29mmol) (2RS)-乙氧基{[1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}乙酸乙酯在5mL乙腈的溶液中加入156mg (0.87mmol) N-溴代琥珀酰亚胺,并将混合物于回流条件下搅拌3小时。然后将反应混合物于室温静置过夜,并将 CH_2Cl_2 和 H_2O 加入反应混合物(各约10mL)。通过分离筒的方法分离两相然后减压浓缩有机相。使用硅胶用庚烷/乙酸乙酯的柱色谱法纯化产生141mg (98%) (2RS)-{[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(乙氧基)乙酸乙酯(I-1)。

[0237] ^1H NMR (400MHz, $CDCl_3$): δ 1.32 (pseudo q, 6H), 3.86-4.06 (br m, 2H), 4.30 (m, 2H), 5.96 (s, 1H), 6.92 (dd, 1H), 7.02 (dt, 1H), 7.22 (dt, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.39 (dt, 1H), 7.74 (dt, 1H), 8.10 (m, 1H)。

[0238] (2RS)-{[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-04)

[0239] (2RS)-甲氧基{[1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}乙酸甲酯

[0240]

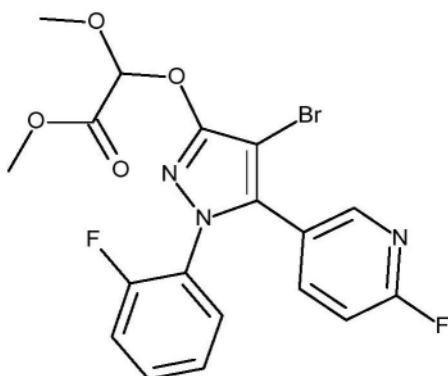


[0241] 向0.25g (0.91mmol) 1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-醇在10mL乙腈的溶液中依次加入253mg (1.83mmol) K_2CO_3 和139mg (1.83mmol) (2RS)-氯(甲氧基)乙酸甲酯,然后将混合物于回流下搅拌4小时。之后将 CH_2Cl_2 和 H_2O 加入反应混合物(各约10mL)。通过分离筒的方法分离两相然后减压浓缩有机相。通过柱色谱法使用硅胶用庚烷/乙酸乙酯纯化产生240mg (69%收率) 目标产物。

[0242] ^1H NMR (400MHz, $CDCl_3$): δ 3.66 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 5.93 (s, 1H), 6.17 (s, 1H), 6.85 (dd, 1H), 7.06 (dt, 1H), 7.24 (dt, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.44 (dt, 1H), 7.59 (dt, 1H), 8.09 (m, 1H)。

[0243] (2RS)-{[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-04)

[0244]



[0245] 向120mg (0.32mmol) (2RS)-甲氧基{[1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}乙酸甲酯在5mL乙腈的溶液中加入171mg (0.95mmol) N-溴代琥珀酰亚胺,并将混合物于回流条件下搅拌6小时。之后将反应混合物冷却至室温再加入 CH_2Cl_2 和 H_2O (各约10mL)。通过分离筒的方法分离两相然后减压浓缩有机相。使用硅胶用庚烷/乙酸乙酯的柱色谱法纯化产生134mg (91%) (2RS)-{[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-1)。

[0246] ^1H NMR (400MHz, $CDCl_3$): δ 3.69 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 5.96 (s, 1H), 6.93 (dd, 1H), 7.03 (dt, 1H), 7.21 (dt, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.41 (dt, 1H), 7.74 (dt, 1H), 8.11 (m, 1H)。

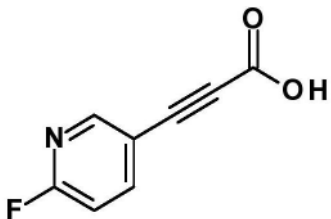
[0247] ({5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(I-101)

[0248] 和

[0249] ({5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1-[3-(甲基亚磺酰基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(I-104)

[0250] 3-(6-氟吡啶-3-基)丙-2-炔酸

[0251]

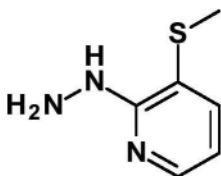


[0252] 在氩气氛下,向溶于400mL干燥四氢呋喃的20.00g (130.05mmol, 1.0当量) 2-氟-5-碘吡啶中依次加入以下物质: 10.02g (143.06mmol, 1.10当量) 丙炔酸、1.83g (2.60mmol, 0.20当量) 双(三苯基膦)二氯化钯(11)、0.99g (5.02mmol, 0.04当量) 碘化亚铜(I) 和 63.80mL (455.19mmol, 3.50当量) 二异丙胺。将混合物于室温搅拌2小时并用乙酸乙酯(300mL)稀释,将反应混合物加到冰水(200mL)中,加入2N盐酸并用乙酸乙酯反复进行萃取。将合并的有机相用硫酸钠干燥并减压浓缩。将残留物与乙酸乙酯和正庚烷的混合物(1:1)搅拌后抽滤。滤饼减压干燥后不进一步纯化即用于下一合成阶段。得到19.96g (74%, 80% 纯) 棕色固体形式的3-(6-氟吡啶-3-基)丙-2-炔酸。

[0253] ^1H NMR (400MHz, d_6 -DMSO δ , ppm) 14.03 (bs, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.32 (m, 1H), 7.32 (m, 1H)。

[0254] 2-胍基-3-(甲硫基)吡啶

[0255]

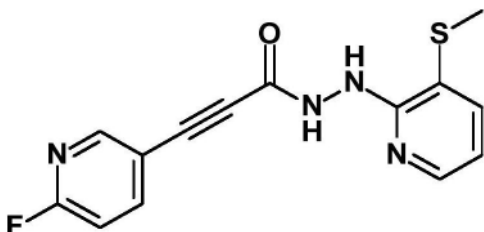


[0256] 将2-氟-3-(甲硫基)吡啶(10.0g, 69.84mmol, 1.0当量)悬浮于叔丁醇(50mL),然后加入水合肼(14.61mL, 300.32mmol, 4.30当量)和碳酸钾(8.10g, 58.61mmol, 0.83当量)。将悬浮液加热至沸腾过夜。冷却至室温后,将混合物用水(200mL)稀释并用二氯甲烷(每次200mL)萃取三次。将合并的有机相用饱和氯化钠溶液洗涤并用硫酸钠干燥。然后减压去除溶剂。所得粗产物通过柱色谱法(梯度乙酸乙酯/庚烷)的最终纯化,分离得到淡棕色固体形式的2-胍基-3-(甲硫基)吡啶(10.12g, 理论的88%)。

[0257] ^1H NMR (400MHz, d_6 -DMSO δ , ppm) 7.98 (m, 1H), 7.47 (m, 1H), 7.01 (bs, 1H), 6.64 (m, 1H), 4.21 (bs, 2H), 2.36 (s, 3H)。

[0258] 3-(6-氟吡啶-3-基)-N'-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]丙-2-炔酰肼

[0259]

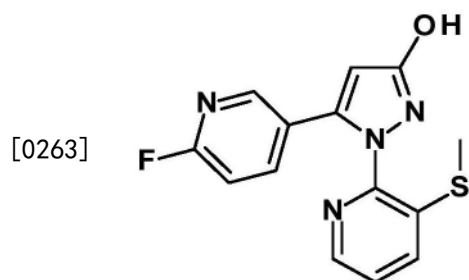


[0260] 将3-(6-氟吡啶-3-基)丙-2-炔酸(2.40g, 14.53mmol, 1.0当量)溶于THF(100mL), 并加入2-胍基-3-(甲硫基)吡啶(2.48g, 15.99mmol, 1.1当量)和三乙胺(6.08mL, 43.60mmol, 3.0当量)。于10℃在20分钟内加入50% T3P的THF溶液(17.30mL, 29.07mmol,

2.0当量)。将所得反应混合物于室温搅拌过夜。然后减压去除溶剂,并加入乙酸乙酯(200mL)和1M pH=4.65缓冲溶液(40mL)。将有机相用饱和氯化钠溶液(20mL)洗涤并用硫酸钠干燥,再减压去除溶剂。所得粗产物通过柱色谱法(梯度乙酸乙酯/庚烷)的最终纯化,分离得到棕色固体形式的3-(6-氟吡啶-3-基)-N'-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]丙-2-炔酰肼(1.83g,理论的39%)。

[0261] ^1H NMR (400MHz, d_6 -DMSO δ , ppm) 10.60 (bs, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.26 (m, 1H), 8.18 (bs, 1H), 7.97 (m, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.21 (dd, 1H), 6.81 (m, 1H), 2.46 (s, 3H)。

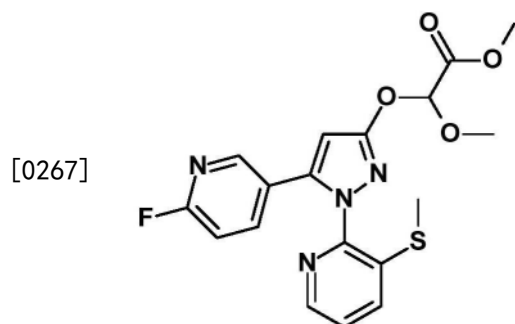
[0262] 5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-醇



[0264] 将3-(6-氟吡啶-3-基)-N'-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]丙-2-炔酰肼(4.00g, 13.23mmol, 1.0当量)溶于DMF(50mL)和1,2-二氯乙烷(150mL)的混合物。将碘化亚铜(I)(0.50g, 2.65mmol, 0.20当量)加入溶液。将所得棕色反应混合物加热至90℃两天。冷却至室温后,减压去除溶剂。所得粗产物通过柱色谱法(梯度乙酸乙酯/庚烷)的最终纯化,分离得到棕色固体形式的5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-醇(1.79g, 理论的42%)。

[0265] ^1H NMR (400MHz, d_6 -DMSO δ , ppm) 10.33 (bs, 1H), 8.17 (m, 1H), 8.02 (m, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.66 (m, 1H), 7.49 (m, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.17 (bs, 1H), 2.43 (s, 3H)。

[0266] ({5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯

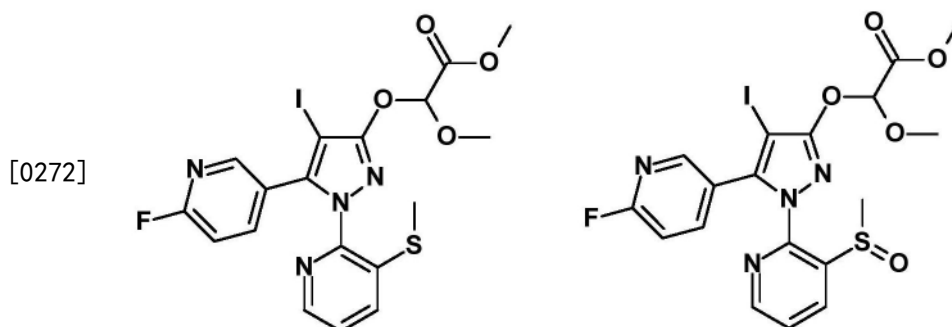


[0268] 将5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-醇(277mg, 0.92mmol, 1.0当量)溶于乙腈(20mL),然后加入氯(甲氧基)乙酸甲酯(190mg, 1.37mmol, 1.50当量)和碳酸钾(380mg, 2.75mmol, 3.0当量)。将悬浮液加热至90℃3小时。冷却后,抽滤除固体,将残留物用乙腈(每次4mL)洗涤两次,并减压去除溶剂。所得粗产物通过柱色谱法(梯度乙酸乙酯/庚烷)的最终纯化,分离得到棕色固体形式的({5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(330mg, 理论的84%)。

[0269] ^1H NMR (400MHz, $\text{CDCl}_3\delta$, ppm) 8.17 (m, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.68-7.61 (m, 21H), 7.30 (dd, 1H), 6.85 (dd, 1H), 6.19 (s, 1H), 5.99 (s, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 2.38 (s, 3H)。

[0270] ({5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(I-101)和

[0271] ({5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1-[3-(甲基亚磺酰基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(I-104)

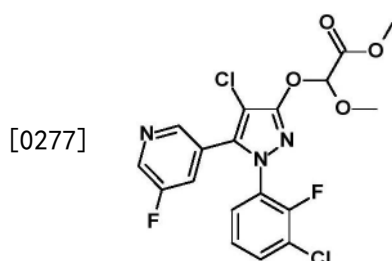


[0273] 将({5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(180mg, 0.44mmol, 1.0当量)溶于乙腈(12mL), 并于室温加入1,3-二碘-5,5-二甲基咪唑烷-2,4-二酮(101mg, 0.27mmol, 0.6当量)。于室温搅拌反应过夜。然后向反应混合物加入一滴浓硫酸并于室温搅拌过夜。通过薄层色谱检查反应后, 再加入一滴浓硫酸, 并将混合物于室温搅拌3小时。之后, 向反应溶液加入水(5mL)和饱和碳酸氢钠溶液并用二氯甲烷(70mL)萃取两次。将有机相用硫酸镁干燥并减压去除溶剂。所得粗产物通过柱色谱法(梯度乙酸乙酯/庚烷)的最终纯化, 分离得到白色固体形式的({5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(130mg, 理论的52%)和白色固体形式的({5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1-[3-(甲基亚磺酰基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(83mg, 理论的32%)。

[0274] I-101: ({5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯¹H NMR (400MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.15-8.10 (m, 2H), 7.85 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.27 (m, 1H), 6.91 (m, 1H), 5.99 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 2.39 (s, 3H)。

[0275] I-104: ({5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1-[3-(甲基亚磺酰基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯¹H NMR (400MHz, CDCl₃ δ, ppm) 8.15-8.10 (m, 2H), 7.85 (m, 1H), 7.27-7.25 (m, 2H), 6.91 (m, 1H), 5.99 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 2.39 (s, 3H)。

[0276] {[4-氯-1-(3-氯-2-氟苯基)-5-(5-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-26):



[0278] 将{[1-(3-氯-2-氟苯基)-5-(5-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(100mg, 0.24mmol, 1.0当量)溶于乙腈(10mL), 并于室温加入1,3-二氯-5,5-二甲基咪唑烷-2,4-二酮(29mg, 0.14mmol, 0.6当量)。于室温搅拌反应过夜。然后将反应混合物于室温搅拌过夜。之后, 向反应溶液加入水(5mL)和饱和碳酸氢钠溶液并用二氯甲烷(70mL)萃

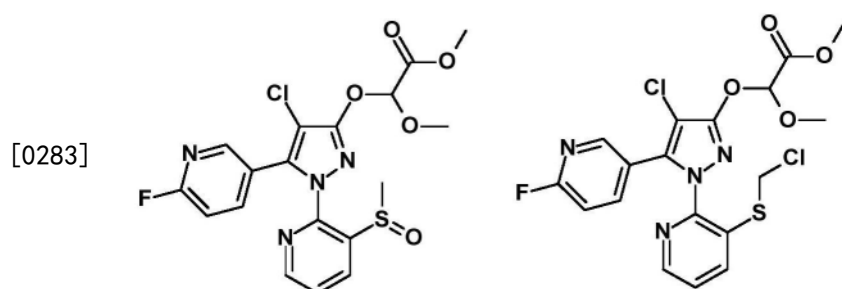
取两次。将有机相用硫酸镁干燥并减压去除溶剂。所得粗产物通过柱色谱法(梯度乙酸乙酯/庚烷)的最终纯化,分离得到白色固体形式的{[4-氯-1-(3-氯-2-氟苯基)-5-(5-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(94mg,理论的82%)。

[0279] ^1H NMR (400MHz, CDCl_3 , ppm) 8.49 (d, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.45-7.41 (m, 2H), 7.29 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 5.94 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.69 (s, 3H)。

[0280] ({4-氯-5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲基亚磺酰基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(I-103)

[0281] 和

[0282] {[4-氯-1-{3-[(氯甲基)硫基]吡啶-2-基}-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-102)

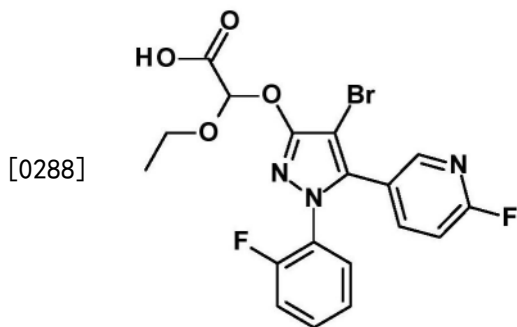


[0284] 将({5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲硫基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(60mg, 0.14mmol, 1.0当量)溶于乙腈(5mL),并于室温加入1,3-二氯-5,5-二甲基咪唑烷-2,4-二酮(18mg, 0.08mmol, 0.6当量)。于室温搅拌反应过夜。然后将反应混合物于室温搅拌过夜。之后,向反应溶液加入水(5mL)和饱和碳酸氢钠溶液并用二氯甲烷(70mL)萃取两次。将有机相用硫酸镁干燥并减压去除溶剂。所得粗产物通过柱色谱法(梯度乙酸乙酯/庚烷)的最终纯化,分离得到({4-氯-5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲基亚磺酰基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯(11mg,理论的15%) and {[4-氯-1-{3-[(氯甲基)硫基]吡啶-2-基}-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(20mg,理论的27%)。

[0285] I-103: ({4-氯-5-(6-氟吡啶-3-基)-1-[3-(甲基亚磺酰基)吡啶-2-基]-1H-吡唑-3-基}氧基)(甲氧基)乙酸甲酯 ^1H NMR (400MHz, CDCl_3 , ppm) 8.59 (m, 1H), 8.23-8.17 (m, 2H), 7.81 (m, 1H), 7.45 (m, 1H), 6.98 (m, 1H), 5.84 (s, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 2.94 (d, 3H)。

[0286] I-102: {[4-氯-1-{3-[(氯甲基)硫基]吡啶-2-基}-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯 ^1H NMR (400MHz, CDCl_3 , ppm) 8.25 (m, 1H), 8.13 (d, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.83 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 6.9 (dd, 1H), 5.93 (s, 1H), 4.90 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.68 (s, 3H)。

[0287] (2RS) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(乙氧基)乙酸(I-51)



[0289] 向285.0mg (0.591mmol) (2RS) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (乙氧基) 乙酸乙酯在3.6mL四氢呋喃和1.2mL水的初始进料中加入49.5mg (1.182mmol) 单水氢氧化锂。将反应混合物于室温搅拌两小时。

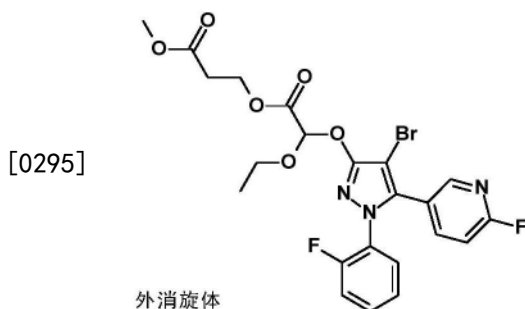
[0290] 加入乙酸乙酯,再用0.6mL (1.182mmol) 2M盐酸水溶液酸化混合物并用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相干燥并减压浓缩。

[0291] 得到265.8mg (94%收率) 纯度95%的淡黄色油状物。

[0292] 3- {[(2RS) - 2- {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} - 2-乙氧基乙酰基]氧基} 丙酸甲酯 (I-59)

[0293] 3- {[(2R*) - 2- {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} - 2-乙氧基乙酰基]氧基} 丙酸甲酯 (对映体1, I-64)

[0294] 3- {[(2R*) - 2- {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} - 2-乙氧基乙酰基]氧基} 丙酸甲酯 (对映体2, I-63)



[0296] 向1000.0mg (2.202mmol) (2RS) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (乙氧基) 乙酸在32.2mL四氢呋喃的初始进料中依次加入723.8mg (6.605mmol) 3-羟基丙酸甲酯、2101.5mg (3.302mmol) 丙基膦酸酐 (T3P)、2.7mg (0.022mmol) 4-二甲氨基吡啶 (DMAP) 和445.6mg (4.403mmol) 三乙胺。将反应混合物于50℃搅拌两小时。加入二氯甲烷和饱和氯化铵水溶液,并将混合物用二氯甲烷反复萃取。将合并的有机相用分离器分离,干燥并减压浓缩。将残留物用少量二氯甲烷溶解并用Biotage Isolera层析 (柱:MN CHROMABOND RS 40,梯度:8个柱体积内10%至90% EA)。弃去59.4mg由未知成分的混合物组成的无色油状物的第一轮后,得到737.0mg (59%收率) 无色油状物形式的3- {[(2RS) - 2- {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} - 2-乙氧基乙酰基]氧基} 丙酸甲酯 (I-59)。

[0297] 然后通过手性超临界流体色谱法 (SFC) 通过以下方法将此混合物分为对映体: Chir_C1_IC_B1_90C02_MeOH_QDA1.2.904min后,得到240.8mg (20%收率) 无色油状物 (对映体1, I-64)。

[0298] ^1H NMR (400MHz, CDCl_3): $\delta=1.30$ (t, 3H), 2.70 (t, 2H), 3.65 (s, 3H), 3.85 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 4.50 (t, 2H), 5.95 (s, 1H), 6.95 (dd, 1H), 7.05 (dt, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.45 (dt, 1H), 7.75 (dt, 1H), 8.10 (d, 1H)。

[0299] 且

[0300] 2.987min后,得到320.9mg (26%收率) 无色油状物(对映体2, I-63)。

[0301] ^1H NMR (400MHz, CDCl_3): $\delta=1.30$ (t, 3H), 2.70 (t, 2H), 3.65 (s, 3H), 3.85 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 4.50 (t, 2H), 5.95 (s, 1H), 6.95 (dd, 1H), 7.05 (dt, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.45 (dt, 1H), 7.75 (dt, 1H), 8.10 (d, 1H)。

[0302] 然后将由此获得的对映纯双酯分别水解然后分别再酯化:

[0303] (2R*) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (乙氧基) 乙酸(对映体1)

[0304] 向120.4mg (0.223mmol) 3- {[(2R*) - 2- {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} - 2-乙氧基乙酰基]氧基} 丙酸甲酯(对映体1) 在5.0mL四氢呋喃和2.0mL水的初始进料中加入18.7mg (0.446mmol) 单水氢氧化锂。将反应混合物于室温搅拌两小时。加入乙酸乙酯,再用0.22mL (0.446mmol) 2M盐酸水溶液酸化混合物并用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相干燥并减压浓缩。得到101.0mg (97%收率) 纯度98%的淡黄色油状物,之后结晶。

[0305] (2R*) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (乙氧基) 乙酸(对映体2, I-65)

[0306] 向214.0mg (0.396mmol) 3- {[(2R*) - 2- {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} - 2-乙氧基乙酰基]氧基} 丙酸甲酯(对映体2) 在5.0mL四氢呋喃和2.0mL水的初始进料中加入33.2mg (0.792mmol) 单水氢氧化锂。将反应混合物于室温搅拌两小时。

[0307] 加入乙酸乙酯,再用0.40mL (0.792mmol) 2M盐酸水溶液酸化混合物并用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相干燥并减压浓缩。

[0308] 得到188.9mg (99%收率) 纯度95%的淡黄色油状物,之后结晶。

[0309] (2R*) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (乙氧基) 乙酸乙酯(对映体1, I-66)

[0310] 向101.0mg (0.222mmol) (2R*) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (乙氧基) 乙酸(对映体1) 在5.0mL四氢呋喃的初始进料中依次加入32.3mg (0.667mmol) 乙醇、212.3mg (0.334mmol) 丙基膦酸酐(T3P)、0.27mg (0.002mmol) 4-二甲氨基吡啶(DMAP) 和45.0mg (0.445mmol) 三乙胺。将反应混合物于50℃搅拌两小时。加入二氯甲烷和饱和氯化铵水溶液,并将混合物用二氯甲烷反复萃取。将合并的有机相用相分离器分离,干燥并减压浓缩。将残留物用少量二氯甲烷溶解并用Biotage Isolera层析(柱:MN CHROMABOND RS 40,梯度:8个柱体积内10%至90% EA)。得到40.3mg (36%收率) 纯度98%的无色油状物。

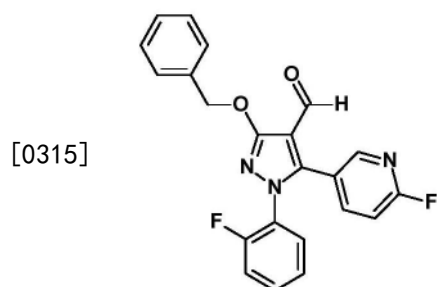
[0311] (2R*) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (乙氧基) 乙酸乙酯(对映体2, I-67)

[0312] 向100.0mg (0.220mmol) (2R*) - {[4-溴-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡

唑-3-基]氧基)乙酸(对映体2)在5.0mL四氢呋喃的初始进料中依次加入32.0mg (0.660mmol)乙醇、210.1mg (0.330mmol)丙基膦酸酐(T3P)、0.27mg (0.002mmol)4-二甲氨基吡啶(DMAP)和44.6mg (0.440mmol)三乙胺。将反应混合物于50℃搅拌两小时。加入二氯甲烷和饱和氯化铵水溶液,并将混合物用二氯甲烷反复萃取。将合并的有机相用相分离器分离,干燥并减压浓缩。将残留物用少量二氯甲烷溶解并用Biotage Isolera层析(柱:MN CHROMABOND RS 40,梯度:8个柱体积内10%至90% EA)。得到34.8mg (32%收率)纯度98%的无色油状物。

[0313] (2RS) - {[4-(二氟甲基)-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-120)

[0314] 3-(苄氧基)-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-4-甲醛

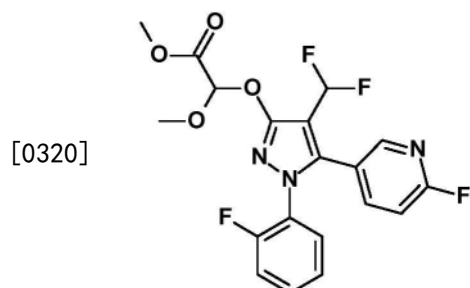


[0316] 在氩气氛下加入6mL四氢呋喃,并将混合物冷却至-70℃。向其逐滴加入0.7mL (0.971mmol)异丙基氯化镁-氯化锂络合物溶液。然后,逐滴加入溶于3mL四氢呋喃的485.0mg (0.971mmol)5-[3-(苄氧基)-1-(2-氟苯基)-4-碘-1H-吡唑-5-基]-2-氟吡啶。于-70℃搅拌一小时后,逐滴加入177.5mg (2.429mmol)N,N-二甲基甲酰胺并将反应混合物于室温搅拌两小时。

[0317] 然后向反应混合物加入饱和氯化铵水溶液,并用乙酸乙酯萃取两次。合并有机相,用硫酸镁干燥,过滤并减压浓缩。将残留物用少量二氯甲烷溶解并层析(Biotage Isolera, 柱:MN CHROMABOND RS 40,8个柱体积内5%至50% EA)。得到303.6mg (79%收率)纯度99%的油状物。

[0318] ^1H NMR (400MHz, CDCl_3): δ = 5.40 (s, 2H), 6.95 (dd, 1H), 7.05 (dt, 1H), 7.25 (dt, 1H), 7.35-7.45 (m, 4H), 7.45-7.55 (m, 3H), 7.85 (dt, 1H), 8.05 (m, 1H), 9.90 (s, 1H)。

[0319] (2RS) - {[4-(二氟甲基)-1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-120)

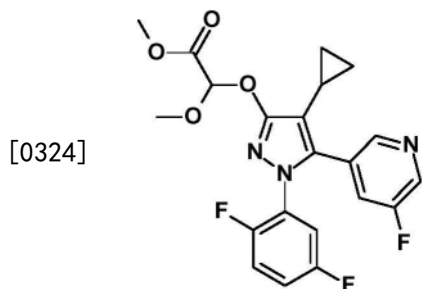


[0321] 将由此制备的248.0mg (0.604mmol) (2RS) - {[1-(2-氟苯基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-4-甲酰基-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯在10.0mL二氯甲烷中的初始进料冷却至0℃。然后,逐滴加入291.8mg (1.811mmol)二乙氨基三氟化硫(DAST),并使反应混合物逐渐

达到室温。加入水,并将混合物用二氯甲烷反复萃取。将合并的有机相用相分离器分离,干燥并减压浓缩。将残留物用少量二氯甲烷溶解并层析(Biotage Isolera,柱:MN CHROMABOND RS 40,9个柱体积内5%至65% EA)。

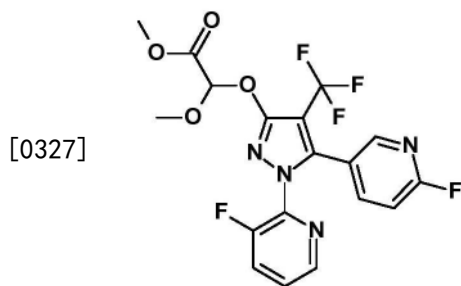
[0322] 得到239.3mg (88%收率)纯度95%的无色油状物。

[0323] {[4-环丙基-1-(2,5-二氟苯基)-5-(5-氟吡啶-3-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-31)



[0325] 在氮气氛围下向溶于25.0mL二噁烷的0.530g (0.970mmol) {[1-(2,5-二氟苯基)-5-(5-氟吡啶-3-基)-4-碘-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯加入0.250g (2.909mmol) 环丙基硼酸、0.295g (1.939mmol) 氟化铯和0.079g (0.097mmol) [1,1'-双(二苯基膦)二茂铁]二氯化钡(II)(和二氯甲烷的络合物),并将混合物于回流下搅拌3h。将反应混合物减压浓缩,将残留物用二氯甲烷和水溶解,用二氯甲烷反复萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥,并减压去除溶剂。通过柱色谱法在硅胶上用庚烷/乙酸乙酯纯化后,得到0.424g (理论的96%)油状物。

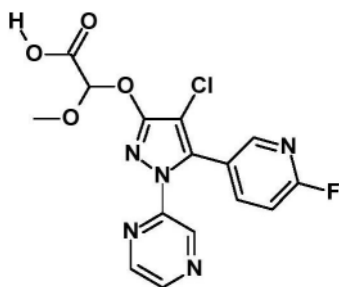
[0326] {[1-(3-氟吡啶-2-基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-4-(三氟甲基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-41)



[0328] 向溶于25.0mL二甲基乙酰胺的0.500g (0.996mmol) {[1-(3-氟吡啶-2-基)-5-(6-氟吡啶-3-基)-4-碘-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯加入0.956g (4.978mmol) 二氟(氟磺酰)乙酸甲酯和0.379g (1.991mmol) 碘化亚铜(I),并将混合物于85℃搅拌5h。向反应混合物加入乙酸乙酯并过滤,将滤液减压浓缩,将残留物用二氯甲烷和水溶解,用二氯甲烷反复萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥,并减压去除溶剂。通过柱色谱法在硅胶上用庚烷/乙酸乙酯纯化后,得到0.241g (理论的52%)油状物。

[0329] {[4-氯-5-(6-氟吡啶-3-基)-1-(吡嗪-2-基)-1H-吡唑-3-基]氧基}(甲氧基)乙酸甲酯(I-42)

[0330]



[0331] 向溶于10.0mL四氢呋喃的0.180g (0.457mmol) {[4-氯-5-(6-氟吡啶-3-基)-1-(吡嗪-2-基)-1H-吡唑-3-基]氧基} (甲氧基) 乙酸甲酯加入0.027g (1.143mmol) 氢氧化锂在3mL水的溶液,并将混合物于25℃搅拌2h。用2M盐酸水溶液将水相调至pH=2-3,减压去除溶剂,再将残留物用水溶解并用二氯甲烷萃取三次。将合并的有机相用硫酸钠干燥,并减压去除溶剂。得到无色固体 (0.179g,理论的96%)。

[0332] 本发明式(I)的化合物(和/或其盐)(在下文中统称为“本发明的化合物”)对广谱的经济上重要的单子叶和双子叶一年生有害植物具有优异的除草功效。

[0333] 因此,本发明还提供一种防治不想要的植物或调节植物生长(优选在植物作物中)的方法,其中将一种或多种本发明的化合物施用于植物(例如有害植物,如单子叶或双子叶杂草或不想要的作物植物)、种子(例如谷粒、种子或营养繁殖体如块茎或带芽的嫩枝部位)或植物生长的区域(例如栽培区域)。本发明的化合物可以例如在播种前(如果合适,还通过掺入土壤中)、出苗前或出苗后施用。可通过本发明的化合物防治的单子叶和双子叶杂草区系的一些代表的具体实例如下,但该列举并不旨在施加限于特定物种的限制。

[0334] 以下属的单子叶有害植物:山羊草属(Aegilops)、冰草属(Agropyron)、剪股颖属(Agrostis)、看麦娘属(Alopecurus)、阿披拉草属(Apera)、燕麦属(Avena)、臂形草属(Brachiaria)、雀麦属(Bromus)、蒺藜草属(Cenchrus)、鸭跖草属(Commelina)、狗牙根属(Cynodon)、莎草属(Cyperus)、龙爪茅属(Dactyloctenium)、马唐属(Digitaria)、稗属(Echinochloa)、荸荠属(Eleocharis)、稊属(Eleusine)、画眉草属(Eragrostis)、野黍属(Eriochloa)、羊茅属(Festuca)、飘拂草属(Fimbristylis)、沼车前属(Heteranthera)、白茅属(Imperata)、鸭嘴草属(Ischaemum)、千金子属(Leptochloa)、黑麦草属(Lolium)、雨久花属(Monochoria)、黍属(Panicum)、雀稗属(Paspalum)、藨草属(Phalaris)、梯牧草属(Phleum)、早熟禾属(Poa)、筒轴茅属(Rottboellia)、慈姑属(Sagittaria)、藨草属(Scirpus)、狗尾草属(Setaria)、高粱属(Sorghum)。

[0335] 以下属的双子叶杂草:苘麻属(Abutilon)、苋属(Amaranthus)、豚草属(Ambrosia)、扁果葵属(Anoda)、春黄菊属(Anthemis)、霓裳草属(Aphanes)、蒿属(Artemisia)、滨藜属(Atriplex)、雏菊属(Bellis)、鬼针草属(Bidens)、芥属(Capsella)、飞廉属(Carduus)、决明属(Cassia)、矢车菊属(Centaurea)、藜属(Chenopodium)、蓟属(Cirsium)、旋花属(Convolvulus)、曼陀罗属(Datura)、山蚂蝗属(Desmodium)、角刺酸模属(Emex)、糖芥属(Erysimum)、大戟属(Euphorbia)、鼬瓣花属(Galeopsis)、牛膝菊属(Galinsoga)、拉拉藤属(Galium)、木槿属(Hibiscus)、番薯属(Ipomoea)、地肤属(Kochia)、野芝麻属(Lamium)、独行菜属(Lepidium)、母草属(Lindernia)、母菊属(Matricaria)、薄荷属(Mentha)、山黧属(Mercurialis)、粟米草属(Mullugo)、勿忘我属(Myosotis)、罂粟属(Papaver)、牵牛属(Pharbitis)、车前属(Plantago)、蓼属(Polygonum)、马齿苋属

(Portulaca)、毛茛属(Ranunculus)、萝卜属(Raphanus)、蔊菜属(Rorippa)、节节菜属(Rotala)、酸模属(Rumex)、猪毛菜属(Salsola)、千里光属(Senecio)、田菁属(Sesbania)、黄花稔属(Sida)、白芥属(Sinapis)、茄属(Solanum)、苦苣菜属(Sonchus)、尖瓣花属(Sphenoclea)、繁缕属(Stellaria)、蒲公英属(Taraxacum)、苣荬菜属(Thlaspi)、车轴草属(Trifolium)、荨麻属(Urtica)、婆婆纳属(Veronica)、堇菜属(Viola)、苍耳属(Xanthium)。

[0336] 当将本发明的化合物在萌发前施用至土壤表面时,完全阻止杂草幼苗的出苗,或者杂草生长直至其已达到子叶期,但之后停止生长。

[0337] 如果在出苗后将活性成分施用至植物的绿色部位,则生长在处理处停止,并且有害植物停留在施用时的生长阶段,或其在一时间后彻底死亡,从而以此方式非常早地并以持久的方式消除对作物植物有害的杂草竞争。

[0338] 本发明的化合物可在有用植物的作物中具有选择性,并且还可用作非选择性除草剂。

[0339] 活性成分凭借其除草和植物生长调节特性还可用于防治已知的或尚未开发的转基因植物的作物中的有害植物。通常,转基因植物的特征在于特别有利的特性,例如对农用化学品工业中使用的某些活性成分(特别是某些除草剂)的抗性、对植物病害或植物病害的病原体(例如某些昆虫或微生物如真菌、细菌或病毒)的抗性。其他具体特征涉及例如采收物的数量、品质、储存性、组成和具体成分。例如,存在已知的具有增加的淀粉含量或改变的淀粉品质的转基因植物,或采收物中具有不同脂肪酸组成的那些转基因植物。其他特定性能在于对非生物胁迫因素例如热、冷、干旱、盐度和紫外线辐射的耐受性或抗性。

[0340] 优选在经济上重要的有用植物和观赏植物的转基因作物中使用本发明式(I)的化合物或其盐。

[0341] 式(I)的化合物可在对除草剂的植物毒性作用具有抗性或已通过基因工程使其具有抗性的有用植物的作物中用作除草剂。

[0342] 产生与现有植物相比具有改良特性的新植物的常规方法例如传统培育方法和产生突变体。或者,具有改变特性的新植物可借助重组方法产生(见例如EP 0221044、EP 0131624)。例如,已记载了以下几种情况:以改性植物中合成的淀粉为目的对作物植物进行遗传修饰(例如WO 92/011376A、WO 92/014827A、WO 91/019806A);通过“基因叠加”对草铵膦类(参见例如EP 0242236 A、EP 0242246 A)或草甘膦类(WO 92/000377A)或磺酰脲类(EP 0257993 A、US 5,013,659)的某些除草剂或这些除草剂的组合或混合物具有抗性的转基因作物植物,例如转基因作物植物,如具有商品名或名称OptimumTMGATTM的玉米或大豆(耐受草甘膦ALS),

[0343] -能产生苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis)毒素(Bt毒素)的转基因作物植物,例如棉花,所述毒素使所述植物对特定害虫具有抗性(EP 0142924 A、EP 0193259 A),

[0344] -具有改变的脂肪酸组成的转基因作物植物(WO 91/013972A),

[0345] -具有新成分或次级代谢产物(例如新的植保素)的转基因作物植物,所述新成分或次级代谢产物导致抗病性增强(EP 0309862 A、EP 0464461A),

[0346] -具有降低的光呼吸作用的转基因植物,其具有更高的产量和更高的胁迫耐受性(EP 0305398 A),

[0347] -产生药学上或诊断学上重要的蛋白质的转基因作物植物(“分子医药农业”),

[0348] -转基因作物植物,其特征在于更高的产量或更好的品质,

[0349] -转基因作物植物,其以例如上述新特性的组合(“基因叠加”)为特征。

[0350] 原则上,可用于产生具有改良特性的新的转基因植物的许多分子生物学技术是已知的;见例如I.Potrykus和G.Spangenberg(编辑),Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual(1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg或Christou, “Trends in Plant Science” 1(1996) 423-431。

[0351] 对于这种基因操作,可将允许诱变或通过重组DNA序列进行序列改变的核酸分子引入到质粒中。借助于标准方法,可例如进行碱基交换、去除部分序列或添加天然或合成序列。为了将DNA片段彼此连接,可将衔接子或接头加至片段上;见例如Sambrook等人,1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 第2版, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; 或Winnacker “Gene und Klone” [Genes and Clones], VCH Weinheim, 第2版, 1996。

[0352] 例如,具有降低活性的基因产物的植物细胞的产生可通过以下方式实现:表达至少一种相应的反义RNA、用于实现共抑制作用的正义RNA,或表达至少一种适当构建的特异性切割上述基因产物的转录物的核酶。为此,首先可使用包含基因产物的完整编码序列(包括可存在的任何侧翼序列)的DNA分子,以及仅包含部分编码序列的DNA分子,在这种情况下这些部分编码序列必须足够长以在细胞中具有反义效应。还可使用与基因产物的编码序列具有高度同源性但与其不完全相同的DNA序列。

[0353] 当在植物中表达核酸分子时,所合成的蛋白质可位于植物细胞的任意所需区室中。然而,为实现在特定区室内的定位,可例如将编码区与确保定位于特定区室中的DNA序列相连。这类序列是本领域普通技术人员已知的(见例如Braun等人,EMBO J. 11(1992), 3219-3227; Wolter等人,Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85(1988), 846-850; Sonnewald等人, Plant J. 1(1991), 95-106)。核酸分子还可在植物细胞的细胞器中表达。

[0354] 可通过已知技术使转基因植物细胞再生,以产生完整植物。原则上,转基因植物可为任何所需植物物种的植物,即不仅为单子叶植物,还为双子叶植物。由此可获得这样的转基因植物,其特性通过过表达、阻遏或抑制同源(=天然)基因或基因序列或表达异源(=外源)基因或基因序列而改变。

[0355] 本发明的化合物(I)可优选用于转基因作物中,所述转基因作物对生长调节剂(例如2,4-D、麦草畏)具有抗性,或对抑制必需植物酶(例如乙酰乳酸合酶(ALS)、EPSP合酶、谷氨酰胺合酶(GS)或羟基苯丙酮酸双加氧酶(HPPD))的除草剂具有抗性,或对选自磺酰脲类、草甘膦类、草铵膦类或苯甲酰基异噁唑类和类似活性成分的除草剂具有抗性,或对这些活性成分的任意所需组合具有抗性。

[0356] 本发明的化合物可特别优选用于对草甘膦类和草铵膦类、草甘膦类和磺酰脲类或咪唑啉酮类的组合具有抗性的转基因作物植物。最优选地,本发明的化合物可用于转基因作物植物,例如商品名或名称为OptimumTMGATTM(耐受草甘膦ALS)的玉米或大豆。

[0357] 当将本发明的活性成分用于转基因作物时,不仅产生在其他作物中观察到的对有害植物的效果,而且经常产生在特定转基因作物中的施用特有的效果,例如改变的或特别是拓宽的可防治的杂草谱、改变的可用于施用的施用率、优选与转基因作物对其具有抗性

的除草剂的良好相容性以及影响转基因作物植物的生长和产量。

[0358] 因此,本发明还涉及本发明的式(I)的化合物作为除草剂用于防治转基因作物植物中的有害植物的用途。

[0359] 本发明的化合物可以常规剂型中的可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、可喷雾溶液剂、撒粉产品或颗粒剂的形式施用。因此,本发明还提供包含本发明的化合物的除草组合物和植物生长调节组合物。

[0360] 根据所需的生物和/或物理化学参数,可以多种方式配制本发明的化合物。可能的剂型包括,例如:可湿性粉剂(WP)、水溶性粉剂(SP)、水溶性浓缩剂、可乳化浓缩剂(EC)、乳剂(EW)如水包油乳剂和油包水乳剂、可喷雾溶液剂、悬浮浓缩剂(SC)、基于油或水的分散剂、油混溶性溶液剂、胶囊悬浮剂(CS)、撒粉产品(DP)、拌种剂、用于撒播和土壤施用的颗粒剂、微颗粒形式的颗粒剂(GR)、喷雾颗粒剂、吸收和吸附颗粒剂、水分散性颗粒剂(WG)、水溶性颗粒剂(SG)、ULV制剂、微胶囊剂和蜡剂。这些单独的制剂类型原则上是已知的,并且记载于例如以下文献中:Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”[Chemical Technology],第7卷,C.Hanser Verlag Munich,第4版,1986;Wade van Valkenburg,“Pesticide Formulations”,Marcel Dekker,N.Y.,1973;K.Masters,“Spray Drying Handbook”,第3版,1979,G.Godwin Ltd.London。

[0361] 所需的制剂助剂,例如惰性材料、表面活性剂、溶剂和其他添加剂同样是已知的,并且记载于例如以下文献中:Watkins,“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”,第2版,Dorland Books,Caldwell N.J.;H.v.Olphen,“An Introduction to Clay Colloid Chemistry”,第2版,J.Wiley&Sons,N.Y.;C.Marsden,“Solvents Guide”,第2版,Interscience,N.Y.1963;McCutcheon’s“Detergents and Emulsifiers Annual”,MC Publ.Corp.,Ridgewood N.J.;Sisley和Wood,“Encyclopedia of Surface Active Agents”,Chem.Publ.Co.Inc.,N.Y.1964;Schönfeldt,“Grenzflächenaktive Äthylenoxid-addukte”[Interface-active Ethylene Oxide Adducts],Wiss.Verlagsgesell.,Stuttgart1976;Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”,第7卷,C.Hanser Verlag Munich,第4版,1986。

[0362] 基于这些制剂,还可制备与其他活性成分(例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂)以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的组合,例如以成品制剂的形式或作为桶混物。可在混合制剂或桶混物中用于本发明的化合物的组合伴侣为例如已知的基于抑制以下物质的活性成分:例如乙酰乳酸合酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合酶、烯醇式丙酮酰莽草酸-3-磷酸合酶、谷氨酰胺合成酶、对羟基苯丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素去饱和酶、光系统I、光系统II或原卟啉原氧化酶,如从例如Weed Research 26(1986)441-445或“The Pesticide Manual”,第16版,The British Crop Protection Council和the Royal Soc.of Chemistry,2006以及其中引用的文献可知。可与本发明的化合物组合的已知的除草剂或植物生长调节剂为例如以下物质,其中所述活性成分以根据国际标准化组织(ISO)的“通用名称”命名,或以化学名称或代码编号提及。即使未明确提及,它们也总是包括所有的施用形式,例如酸、盐、酯以及所有的异构体形式,例如立体异构体和光学异构体。

[0363] 这种除草混合伴侣的实例为:

[0364] 乙草胺、三氟羧草醚、三氟羧草醚甲酯、三氟羧草醚钠、苯草醚、甲草胺、二丙烯草

胺、禾草灭、禾草灭钠、莠灭净、氨唑草酮、先甲草胺、酰嘧磺隆、4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲基苯基)-5-氟吡啶-2-甲酸、环丙嘧啶酸、环丙嘧啶酸钾、环丙嘧啶酸甲酯、氯氨吡啶酸、氯氨吡啶酸二甲基铵、氯氨吡啶酸三异丙醇胺、杀草强、氨基磺酸铵、莎稗磷、磺草灵、磺草灵钾、磺草灵钠、莠去津、唑啶草酮、四唑嘧磺隆、氟丁酰草胺、(S)-(-)-氟丁酰草胺、精氟丁酰草胺、草除灵、草除灵乙酯、草除灵二甲基铵、草除灵钾、乙丁氟灵、呋草黄、苄嘧磺隆、苄嘧磺隆甲酯、地散磷、灭草松、灭草松钠、双环磺草酮、吡草酮、氟吡草酮、甲羧除草醚、双丙氨膦、双丙氨膦钠、双唑草酮、双草醚、双草醚钠、二氯异噁草酮、除草定、除草定锂、除草定钠、溴丁酰草胺、溴酚脞、溴苯腈、溴苯腈丁酸酯、溴苯腈钾、溴苯腈庚酸酯和溴苯腈辛酸酯、羟草酮、丁草胺、氟丙嘧草酯、抑草磷、丁烯草胺、仲丁灵、丁苯草酮、丁草敌、唑草胺、克草胺酯、双酰草胺、唑草酸、唑草酮、草灭畏、草灭畏铵、草灭畏二乙醇胺、草灭畏甲酯、草灭畏甲基铵、草灭畏钠、氯溴隆、伐草克、伐草克铵、伐草克钠、燕麦酸、燕麦酯、氯苋素、氯苋素甲酯、氯草敏、氯嘧磺隆酸、氯嘧磺隆、氯酰亚胺、绿麦隆、氯磺隆、氯酞酸、氯酞酸二甲酯、氯酞酸单甲酯、吡啶酮草酸、吡啶酮草酯、环庚草醚、外-(+)-环庚草醚即(1R,2S,4S)-4-异丙基-1-甲基-2-[(2-甲基苄基)氧基]-7-氧杂双环[2.2.1]庚烷、外-(-)-环庚草醚即(1R,2S,4S)-4-异丙基-1-甲基-2-[(2-甲基苄基)氧基]-7-氧杂双环[2.2.1]庚烷、醚磺隆、氯酞草膦、烯草酮、炔草酸、炔草酸乙酯、炔草酯、异噁草松、氯甲酰草胺、二氯吡啶酸、二氯吡啶酸甲酯、二氯吡啶酸乙醇胺、二氯吡啶酸钾、二氯吡啶酸三异丙醇胺、氯酯磺草胺酸、氯酯磺草胺、苄草隆、氨基氰、氰草津、环草敌、环丙吡草腈、环吡嗪草酯、环丙嘧磺隆、噻草酮、氰氟草酸、氰氟草酯、环丙津、2,4-D(包括其铵、丁氧基乙酯、丁基酯、胆碱、二乙基铵、二甲基铵、二乙醇胺、丁氧丙酯、十二烷基铵、2-乙基己酯、乙基酯、庚基铵、异丁基酯、异辛基酯、异丙基酯、异丙基铵、锂、1-甲基庚酯、甲基酯、钾、十四烷基铵、三乙基铵、三异丙醇铵、三异丙醇胺和三乙醇胺盐)、2,4-DB、2,4-DB丁基酯、2,4-DB二甲基铵、2,4-DB异辛基酯、2,4-DB钾和2,4-DB钠、杀草隆、茅草枯、茅草枯钙、茅草枯镁、茅草枯钠、棉隆、棉隆钠、正癸醇、7-脱氧-D-景天庚酮糖、甜菜安、吡啶特-去甲苯磺酰基(dTP)、麦草畏及其盐(例如麦草畏N,N-双(3-氨基丙基)甲胺、麦草畏丁氧基乙酯、麦草畏胆碱、麦草畏二甘醇胺、麦草畏二甲基铵、麦草畏二乙醇胺、麦草畏二乙基铵、麦草畏异丙基铵、麦草畏甲酯、麦草畏单乙醇胺、麦草畏乙醇胺、麦草畏钾、麦草畏钠、麦草畏三乙醇胺)、敌草腈、2-(2,5-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、2,4-滴丙酸、2,4-滴丙酸丁氧基乙酯、2,4-滴丙酸二甲基铵、2,4-滴丙酸-2-乙基己酯、2,4-滴丙酸乙基铵、2,4-滴丙酸异辛酯、2,4-滴丙酸甲酯、2,4-滴丙酸钾、2,4-滴丙酸钠、精2,4-滴丙酸、精2,4-滴丙酸二甲基铵、精2,4-滴丙酸-2-乙基己酯、精2,4-滴丙酸钾、精2,4-滴丙酸钠、禾草灵酸、禾草灵、精禾草灵酸、精禾草灵、双氯磺草胺、野燕枯、甲基磺酸野燕枯、吡氟酰草胺、二氟吡隆、二氟吡隆钠、噁唑隆、哌草丹、二甲草磺酰胺、二甲草胺、异戊乙净、二甲吩草胺、精二甲吩草胺、氨氟灵、特乐酚、特乐酯、双苯酰草胺、敌草快、二溴化敌草快、二氯化敌草快、氟硫草定、敌草隆、DNOC、DNOC铵、DNOC钾、DNOC钠、茵多酸、茵多酸二铵、茵多酸二钾、茵多酸二钠、氟嘧草啶(S-3100)、ePTC、戊草丹、乙丁烯氟灵、胺苯磺隆酸、胺苯磺隆、乙噻草酮、乙氧呋草黄、氟乳醚酸、氟乳醚、乙氧嘧磺隆、乙氧苯草胺、F-5231即N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧代-1H-四唑-1-基]苯基]乙磺酰胺、F-7967即3-[7-氯-5-氟-2-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑-4-基]-1-甲基-6-(三氟甲基)嘧啶-2,4-(1H,3H)-二酮、噁唑禾草灵酸、精噁唑禾草灵酸、噁唑禾草灵、精噁唑禾草灵、苯磺噁唑草、

苯唑氟草酮、芬啶酮、四唑酰草胺、麦草氟、麦草氟异丙酯、麦草氟甲酯、精麦草氟异丙酯、精麦草氟甲酯、啶嘧磺隆、双氟磺草胺、氯氟吡啶酸、氯氟吡啶酯、吡氟禾草灵酸、吡氟禾草灵、吡氟禾草灵甲酯、精吡氟禾草灵酸、精吡氟禾草灵、氟酮磺隆、氟酮磺隆钠、氟吡磺隆、氯乙氟灵、氟噻草胺、氟吡啶草酸、氟吡啶草酯、啶嘧磺草胺、氟烯草酸、氟烯草酯、丙炔氟草胺、氟草隆、茚丁酸、茚丁酯、茚丁酸二甲基铵、茚甲酯、乙羧氟草醚酸、乙羧氟草醚、四氟丙酸、四氟丙酸钠、氟啶嘧磺隆酸、氟啶嘧磺隆、氟啶嘧磺隆钠、氟啶草酮、氟咯草酮、氯氟吡氧乙酸、氯氟吡氧乙酸丁氧异丙酯、氯氟吡氧乙酸-1-甲基庚酯、呋草酮、噻草酸、噻草酸甲酯、氟磺胺草醚、氟磺胺草醚钠、甲酰氨基嘧磺隆、甲酰氨基嘧磺隆钠、杀木磷、磷胺素、草铵膦酸、草铵膦、草铵膦钠、L-草铵膦、L-草铵膦钠、精草铵膦钠盐、精草铵膦铵盐、草甘膦、草甘膦铵、草甘膦异丙基铵、草甘膦二铵、草甘膦二甲基铵、草甘膦钾、草甘膦钠、草甘膦倍半钠和草硫膦、H-9201即0-(2,4-二甲基-6-硝基苯基)-0-乙基异丙基硫代磷酰胺、氟氯吡啶酸、氟氯吡啶酯、氟硝磺酰胺、氯吡嘧磺隆酸、氯吡嘧磺隆、氟吡禾灵、高效氟吡禾灵酸、氟吡乙禾灵、高效氟吡乙禾灵、氟吡甲禾灵、高效氟吡甲禾灵、氟吡禾灵钠、环嗪酮、HNPC-A8169即丙-2-炔-1-基(2S)-2-[3-[(5-叔丁基吡啶-2-基)氧基]苯氧基]丙酸酯、HW-02即1-(二甲氧基磷酰基)乙基(2,4-二氯苯氧基)乙酸酯、海当西定、咪草酸、咪草酸甲酯、甲氧咪草烟、甲氧咪草烟铵、甲咪唑烟酸、甲咪唑烟酸铵盐、咪唑烟酸、咪唑烟酸异丙铵、咪唑喹啉酸、咪唑喹啉酸铵、咪唑喹啉甲酯、咪唑乙烟酸、咪唑乙烟酸铵、唑吡嘧磺隆、茚草酮、茚啶氟草胺、甲基碘磺隆酸、甲基碘磺隆甲酯、甲基碘磺隆钠、碘苯腈、碘苯腈锂、辛酰碘苯腈、碘苯腈钾和碘苯腈钠、三唑酰草胺、异丙隆、异噁隆、异噁酰草胺、异噁唑草酮、特胺灵、KU-043即3-([5-(二氟甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基]甲基)磺酰基)-5,5-二甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑、缩酮环磺草酮、缩酮环磺草酮钾、乳氟禾草灵、环草定、利谷隆、MCPA、MCPA丁氧基乙酯、MCPA丁酯、MCPA二甲基铵、MCPA二乙醇胺、MCPA-2-乙基己酯、MCPA乙酯、MCPA异丁酯、MCPA异辛酯、MCPA异丙酯、MCPA异丙基铵、MCPA甲酯、MCPA乙醇胺、MCPA钾、MCPA钠和MCPA三乙醇胺、MCPB、MCPB甲酯、MCPB乙酯和MCPB钠、2-甲-4-氯丙酸、2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙酯、2-甲-4-氯丙酸二甲基铵、2-甲-4-氯丙酸二乙醇胺、2-甲-4-氯丙酸-2-乙基己酯、乙二基双2-甲-4-氯丙酸、2-甲-4-氯丙酸异辛酯、2-甲-4-氯丙酸甲酯、2-甲-4-氯丙酸钾、2-甲-4-氯丙酸钠和2-甲-4-氯丙酸三乙醇胺、精2-甲-4-氯丙酸、精2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙酯、精2-甲-4-氯丙酸二甲基铵、精2-甲-4-氯丙酸-2-乙基己酯和精2-甲-4-氯丙酸钾、苯噻酰草胺、氟磺酰草胺、氟磺酰草胺二乙醇胺、氟磺酰草胺钾、二磺隆酸、甲基二磺隆、二磺隆酸钠、甲基磺草酮、甲基苯噻隆、百亩、噁唑酰草胺、苯噻草酮、吡唑草胺、噻吡嘧磺隆、甲基苯噻隆、甲硫嘧磺隆、甲硫唑草啉、异硫氰酸甲酯、溴谷隆、异丙甲草胺、精异丙甲草胺、磺草唑胺、甲氧隆、噻草酮、甲磺隆酸、甲黄隆、草达灭、绿谷隆、单嘧磺隆、单嘧磺酯、MT-5950即N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺、NGGC-011、敌草胺、NC-310即4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄基氧基吡唑、NC-656即3-[(异丙基磺酰基)甲基]-N-(5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基)-5-(三氟甲基)[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡啶-8-甲酰胺、草不隆、烟嘧磺隆、壬酸(天竺葵酸)、氟草敏、油酸(脂肪酸)、坪草丹、嘧苯胺磺隆、氨磺乐灵、丙炔噁草酮、噁草酮、环氧嘧磺隆、噁啉草酮、乙氧氟草醚、百草枯、百草枯二氯盐、双甲基磺酸百草枯、克草猛、二甲戊灵、五氟磺草胺、五氯苯酚、环戊噁草酮、烯草胺、矿物油、甜菜宁、甜菜宁乙酯、氨氯吡啶酸、氨氯吡啶酸二甲基铵、氨氯吡啶酸-2-乙基己酯、氨氯吡啶酸异辛酯、氨氯吡啶酸甲

酯、氨基吡啶酸乙醇胺、氨基吡啶酸钾、氨基吡啶酸三乙基铵、氨基吡啶酸三异丙醇胺、氨基吡啶酸三乙醇胺、氟吡酰草胺、唑啉草酯、吡草磷、丙草胺、氟吡磺隆酸、氟吡磺隆、氨基乐灵、环苯草酮、扑灭通、扑草净、毒草胺、敌稗、噁草酸、扑灭津、苯胺灵、异丙草胺、丙苯磺隆、丙苯磺隆钠、丙噻磺隆、炔苯酰草胺、苄草丹、氟磺隆、双唑草腈、吡草醚酸、吡草醚、磺酰草吡唑、吡唑特、吡啶磺隆酸、吡啶磺隆、苄草唑、草醚酸(pyribambenz)、异丙酯草醚、丙酯草醚、嘧啶肟草醚、稗草丹、氯苯吡啶醇、吡草特、环酯草醚、嘧草醚酸、嘧草醚、嘧氟磺草胺、嘧草硫醚酸、嘧草硫醚、砒吡草唑、啶磺草胺、二氯喹啉酸、二氯喹啉酸二甲基铵、二氯喹啉酸甲酯、氯甲喹啉酸、灭藻醌、喹禾灵酸、喹禾灵、精喹禾灵酸、精喹禾灵、精喹禾糠酯、QYM-201即1-{2-氯-3-[(3-环丙基-5-羟基-1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-6-(三氟甲基)苯基}吡啶-2-酮、砒啶磺隆、苯嘧磺草胺、烯禾啶、环草隆、西玛津、西草净、SL-261、磺草酮、甲磺草胺、嘧磺隆酸、甲嘧磺隆、磺酰磺隆、SYN-249即1-乙氧基-3-甲基-1-氧代丁-3-烯-2-基5-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝基苯甲酸酯、SYP-300即1-[7-氟-3-氧代-4-(丙-2-炔-1-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯并噁嗪-6-基]-3-丙基-2-硫代咪唑烷-4,5-二酮、2,3,6-TBA、TCA(三氯乙酸)及其盐(例如TCA铵、TCA钙、TCA乙酯、TCA镁、TCA钠)、丁噻隆、呋喃磺草酮、环磺酮、吡喃草酮、特草定、特草灵、特丁通、特丁津、特丁净、四氟络草胺、撒克斯特毒素(thaxtomin)、噻吩草胺、噻唑烟酸、噻酮磺隆酸、噻酮磺隆、噻吩磺隆酸、噻吩磺隆、禾草丹、氟吡硫草酯、吡唑草酯、苯唑草酮、三甲苯草酮、氟酮磺草胺、野麦畏、醚苯磺隆、三噻氟草胺、苯磺隆酸、苯磺隆、三氯吡氧乙酸、三氯吡氧乙酸丁氧基乙酯、三氯吡氧乙酸胆碱、三氯吡氧乙酸乙酯、三氯吡氧乙酸三乙基铵、草达津、三氟啶磺隆、三氟啶磺隆钠盐、三氟草啉、氟乐灵、氟胺磺隆酸、氟胺磺隆、三氟甲磺隆、硫酸脲、灭草敌、XDE-848、ZJ-0862即3,4-二氯-N-{2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧基]苄基}苯胺、3-(2-氯-4-氟-5-(3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)苯基)-5-甲基-4,5-二氢异噁唑-5-甲酸乙酯、3-氯-2-[3-(二氟甲基)异噁唑-5-基]苯基5-氯嘧啶-2-基醚、2-(3,4-二甲氧基苯基)-4-[(2-羟基-6-氧代环己-1-烯-1-基)羰基]-6-甲基吡啶-3(2H)-酮、2-({2-[(2-甲氧基乙氧基)甲基]-6-甲基吡啶-3-基}羰基)环己烷-1,3-二酮、(5-羟基-1-甲基-1H-吡唑-4-基)(3,3,4-三甲基-1,1-二氧化-2,3-二氢-1-苯并噁吩-5-基)甲酮、1-甲基-4-[(3,3,4-三甲基-1,1-二氧化-2,3-二氢-1-苯并噁吩-5-基)羰基]-1H-吡唑-5-基丙烷-1-磺酸酯、4-{2-氯-3-[(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)甲基]-4-(甲基磺酰基)苯甲酰基}-1-甲基-1H-吡唑-5-基1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酸酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸氰甲酯、丙-2-炔-1-基4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸甲酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸苄酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸乙酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1-异丁酰基-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸甲酯、6-(1-乙酰基-7-氟-1H-吡啶-6-基)-4-氨基-3-氯-5-氟吡啶-2-甲酸甲酯、4-氨基-3-氯-6-[1-(2,2-二甲基丙酰基)-7-氟-1H-吡啶-6-基]-5-氟吡啶-2-甲酸甲酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-[7-氟-1-(甲氧基乙酰基)-1H-吡啶-6-基]吡啶-2-甲酸甲酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸钾、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸钠、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸丁酯、4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]咪唑

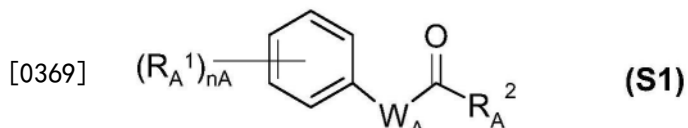
烷-2-酮、3-(5-叔丁基-1,2-噁唑-3-基)-4-羟基-1-甲基咪唑烷-2-酮。

[0365] 作为可能的混合伴侣的植物生长调节剂的实例为：

[0366] 脱落酸、活化酯酸、活化酯、1-氨基环丙-1-基甲酸及其衍生物、5-氨基乙酰丙酸、环丙嘧啶醇、6-苄基氨基嘌呤、芸苔素内酯、乙基芸苔素内酯、儿茶素、壳寡糖(CO; CO与LC0的不同在于它们不具有LC0所特有的脂肪酸侧链。CO,有时也称为N-乙酰基壳寡糖,同样由GlcNAc基团组成,但具有将它们与几丁质分子 $[(C_8H_{13}NO_5)_n]$,CAS编号1398-61-4]和壳聚糖分子 $[(C_5H_{11}NO_4)_n]$,CAS编号9012-76-4]区分开来的侧链修饰)、几丁质化合物、矮壮素、调果酸、环丙酰草胺、3-(环丙-1-烯基)丙酸、丁酰肼、棉隆、棉隆钠、正癸醇、调味酸、调味酸钠、茵多酸、茵多酸二钾、茵多酸二钠和茵多酸单(N,N-二甲基烷基铵)、乙烯利、氟节胺、苋丁酸、苋丁酯、苋甲酯、呋嘧醇、氯吡脞、赤霉素、抗倒胺、吲哚-3-乙酸(IAA)、4-吲哚-3-基丁酸、稻瘟灵、烯丙苯噻唑、茉莉酸或其衍生物(例如茉莉酸甲酯)、脂壳寡糖(LC0,有时也称为共生结瘤(Nod)信号(或Nod因子)或称为Myc因子,由 β -1,4-连接的N-乙酰基-D-葡萄糖胺(“GlcNAc”)残基的寡糖骨架组成,该骨架具有在非还原端缩合的N-连接的脂肪酰基链。如本领域普通技术人员所知,LC0在其骨架中GlcNAc基团的数量、其长度和脂肪酰基链的饱和度以及还原和非还原糖部分的取代方面不同)、亚油酸或其衍生物、亚麻酸或其衍生物、马来酰肼、甲哌鎓、五硼酸甲哌鎓、1-甲基环丙烯、3'-甲基脱落酸、2-(1-萘基)乙酰胺、1-萘基乙酸、2-萘氧基乙酸、硝基酚盐混合物、4-氧代-4[(2-苄基)氨基]丁酸、多效唑、4-苄基丁酸、苯胺胺酸、调环酸、调环酸钙、茉莉酮、水杨酸、水杨酸甲酯、独脚金内酯、四氯硝基苯、噻苯隆、三十烷醇、抗倒酸、抗倒酯、1-苄基-3-(1,2,4-三唑-4-基)脲(tsitodef)、烯效唑、精烯效唑、2-氟-N-(3-甲氧基苯基)-9H-嘌呤-6-胺。

[0367] 可与本发明式(I)的化合物组合并任选地与其他活性成分(如上文所列的杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂)组合使用的安全剂优选选自：

[0368] S1) 式(S1)的化合物，

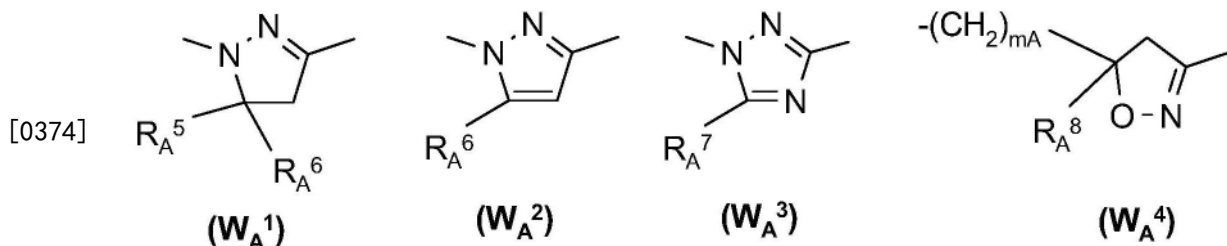


[0370] 其中符号和下标定义如下：

[0371] n_A 为0至5、优选0至3的自然数；

[0372] R_A^1 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、硝基或 (C_1-C_4) -卤代烷基；

[0373] W_A 为未取代或取代的二价杂环基团,其选自具有1至3个选自N和O的环杂原子的部分不饱和的或芳族的五元杂环,其中所述环中存在至少一个氮原子和至多一个氧原子,优选选自 (W_A^1) 至 (W_A^4) 的基团,



[0375] m_A 为0或1；

[0376] R_A^2 为 OR_A^3 、 SR_A^3 或 $NR_A^3R_A^4$ 或具有至少一个氮原子和最高达3个杂原子(优选选自O和S)的饱和或不饱和的3元至7元杂环,所述杂环通过氮原子与(S1)中的羰基连接,并且为未取代的或被选自以下的基团取代: (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基或任选取代的苯基,优选式 OR_A^3 、 NHR_A^4 或 $N(CH_3)_2$ 的基团,尤其是式 OR_A^3 的基团;

[0377] R_A^3 为氢或未取代的或取代的优选具有总共1至18个碳原子的脂族烷基;

[0378] R_A^4 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基或取代的或未取代的苯基;

[0379] R_A^5 为H、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_8) -烷基、氰基或 $COOR_A^9$,其中 R_A^9 为氢、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_6) -羟基烷基、 (C_3-C_{12}) -环烷基或三- (C_1-C_4) -烷基甲硅烷基;

[0380] R_A^6 、 R_A^7 、 R_A^8 是相同或不同的,并且为氢、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -卤代烷基、 (C_3-C_{12}) -环烷基或取代的或未取代的苯基;

[0381] 优选:

[0382] a) 二氯苯基吡唑啉-3-甲酸类的化合物(S1^a), 优选化合物例如1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-甲酸、1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-甲酸乙酯(S1-1) (“吡唑解草酯”), 以及相关化合物, 如W0-A-91/07874中所记载;

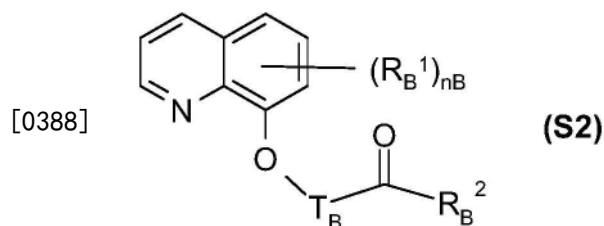
[0383] b) 二氯苯基吡唑甲酸的衍生物(S1^b), 优选化合物例如1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基吡唑-3-甲酸乙酯(S1-2)、1-(2,4-二氯苯基)-5-异丙基吡唑-3-甲酸乙酯(S1-3)、1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)吡唑-3-甲酸乙酯(S1-4)以及相关化合物, 如EP-A-333 131和EP-A-269 806中所记载;

[0384] c) 1,5-二苯基吡唑-3-甲酸的衍生物(S1^c), 优选化合物例如1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基吡唑-3-甲酸乙酯(S1-5)、1-(2-氯苯基)-5-苯基吡唑-3-甲酸甲酯(S1-6)以及相关化合物, 如例如EP-A-268 554中所记载;

[0385] d) 三唑甲酸类的化合物(S1^d), 优选化合物例如解草唑(乙酯)即1-(2,4-二氯苯基)-5-三氯甲基-(1H)-1,2,4-三唑-3-甲酸乙酯(S1-7)以及相关化合物, 如EP-A-174 562和EP-A-346 620中所记载;

[0386] e) 5-苄基-2-异噁唑啉-3-甲酸或5-苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸类的化合物(S1^e), 优选化合物例如5-(2,4-二氯苄基)-2-异噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-8)或5-苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-9)以及相关化合物, 如W0-A-91/08202中所记载, 或者5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸(S1-10)或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-11) (“双苯噁唑酸”)或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸正丙酯(S1-12)或5-(4-氟苄基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-13), 如专利申请W0-A-95/07897中所记载。

[0387] S2) 式(S2)的喹啉衍生物,



[0389] 其中符号和下标具有以下含义:

[0390] R_B^1 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、硝基或 (C_1-C_4) -卤代烷基；

[0391] n_B 为0至5、优选0至3的自然数；

[0392] R_B^2 为 OR_B^3 、 SR_B^3 或 $NR_B^3R_B^4$ 或具有至少一个氮原子和最高达3个杂原子(优选选自O和S)的饱和或不饱和的3元至7元杂环,所述杂环通过氮原子与(S2)中的羰基连接,并且为未取代的或被选自以下的基团取代: (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基或任选取代的苯基,优选式 OR_B^3 、 NHR_B^4 或 $N(CH_3)_2$ 的基团,尤其是式 OR_B^3 的基团；

[0393] R_B^3 为氢或优选具有总共1至18个碳原子的未取代的或取代的脂族烷基；

[0394] R_B^4 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基或取代的或未取代的苯基；

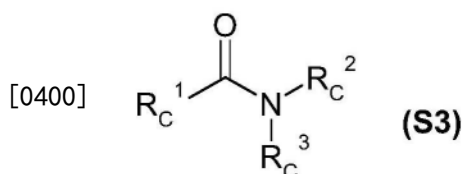
[0395] T_B 为 $(C_1$ 或 $C_2)$ -烷二基链,其为未取代的或被一个或两个 (C_1-C_4) -烷基取代或被 $[(C_1-C_3)$ -烷氧基]羰基取代；

[0396] 优选：

[0397] a) 8-喹啉氧基乙酸类的化合物(S2^a), 优选(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸1-甲基己酯(“解草酯”)(S2-1)、(1,3-二甲基丁-1-基)(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸酯(S2-2)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸4-烯丙氧基丁酯(S2-3)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸1-烯丙氧基丙-2-基酯(S2-4)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸乙酯(S2-5)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸甲酯(S2-6)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸烯丙酯(S2-7)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸2-(2-亚丙基亚氨氧基)-1-乙酯(S2-8)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸2-氧代丙-1-基酯(S2-9)以及相关化合物,如EP-A-86 750、EP-A-94 349和EP-A-191 736或EP-A-0 492 366中所记载,以及(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸(S2-10)、其水合物及其盐,例如其锂盐、钠盐、钾盐、钙盐、镁盐、铝盐、铁盐、铵盐、季铵盐、铊盐或镆盐,如WO-A-2002/34048中所记载；

[0398] b) (5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸类的化合物(S2^b), 优选化合物例如(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二乙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二烯丙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸甲基乙酯以及相关化合物,如EP-A-0 582 198中所记载。

[0399] S3) 式(S3)的化合物



[0401] 其中符号和下标定义如下：

[0402] R_C^1 为 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_3-C_7) -环烷基,优选二氯甲基；

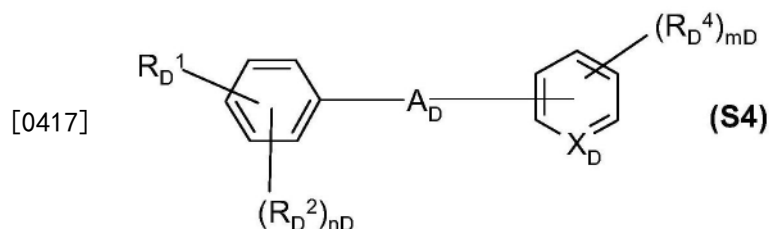
[0403] R_C^2 、 R_C^3 是相同或不同的,并且为氢、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_2-C_4) -卤代烯基、 (C_1-C_4) -烷基氨基甲酰基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基氨基甲酰基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、二氧杂环戊基- (C_1-C_4) -烷基、噻唑基、呋喃基、呋喃基烷基、噻吩基、哌啶基、取代的或未取代的苯基,或者 R_C^2 和 R_C^3 一起形成取代的或未取代的杂环,优选噁唑烷、噻唑烷、哌啶、吗啉、六氢嘧啶或苯并噁嗪环；

[0404] 优选：

[0405] 二氯乙酰胺类的活性成分,其经常用作苗前安全剂(作用于土壤的安全剂),例如

[0406] “二氯丙烯胺”(N,N-二烯丙基-2,2-二氯乙酰胺)(S3-1)、

- [0407] 购自Stauffer的“R-29148”(3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基-1,3-噁唑烷)(S3-2)、
- [0408] 购自Stauffer的“R-28725”(3-二氯乙酰基-2,2-二甲基-1,3-噁唑烷)(S3-3)、
- [0409] “解草嗪”(4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪)(S3-4)、
- [0410] 购自PPG Industries的“PPG-1292”(N-烯丙基-N-[(1,3-二氧杂戊环-2-基)甲基]二氯乙酰胺)(S3-5)、
- [0411] 购自Sagro-Chem的“DKA-24”(N-烯丙基-N-[(烯丙基氨基羰基)甲基]二氯乙酰胺)(S3-6)、
- [0412] 购自Nitrokemia或Monsanto的“AD-67”或“MON 4660”(3-二氯乙酰基-1-氧杂-3-氮杂螺[4.5]癸烷)(S3-7)、
- [0413] 购自TRI-Chemical RT的“TI-35”(1-二氯乙酰基氮杂环庚烷)(S3-8)、
- [0414] 购自BASF的“双环咯酮”或“BAS145138”或“LAB145138”((RS)-1-二氯乙酰基-3,3,8a-三甲基全氢吡咯并[1,2-a]嘧啶-6-酮)(S3-9)、
- [0415] “解草噁唑”或“MON 13900”((RS)-3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷)(S3-10),以及其(R)异构体(S3-11)。
- [0416] S4) 式(S4)的N-酰基磺酰胺及其盐,



[0418] 其中符号和下标定义如下:

[0419] A_D 为 $SO_2-NR_D^3-CO$ 或 $CO-NR_D^3-SO_2$;

[0420] X_D 为 CH 或 N;

[0421] R_D^1 为 $CO-NR_D^5R_D^6$ 或 $NHCO-R_D^7$;

[0422] R_D^2 为卤素、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基或 (C_1-C_4) -烷基羰基;

[0423] R_D^3 为氢、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基或 (C_2-C_4) -炔基;

[0424] R_D^4 为卤素、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_3-C_6) -环烷基、苯基、 (C_1-C_4) -烷氧基、氰基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基或 (C_1-C_4) -烷基羰基;

[0425] R_D^5 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_5-C_6) -环烯基、苯基或含有 v_D 个选自氮、氧和硫的杂原子的 3 元至 6 元杂环基,其中后七个基团被 v_D 个选自以下的取代基取代:卤素、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_2) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_2) -烷基磺酰基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基和苯基,以及在环状基团的情况下,还选自 (C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -卤代烷基;

[0426] R_D^6 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基或 (C_2-C_6) -炔基,其中后三个基团被 v_D 个选自以下的基团取代:卤素、羟基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基和 (C_1-C_4) -烷硫基,或

[0427] R_D^5 和 R_D^6 连同带有它们的氮原子一起形成吡咯烷基或哌啶基;

[0428] R_D^7 为氢、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷

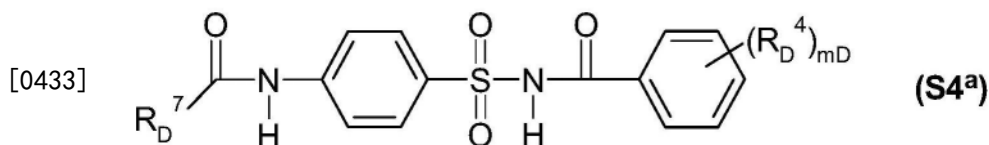
基,其中后2个基团被 v_D 个选自以下的取代基取代:卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基和 (C_1-C_4) -烷硫基,以及在环状基团的情况下,还选自 (C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -卤代烷基;

[0429] n_D 为0、1或2;

[0430] m_D 为1或2;

[0431] v_D 为0、1、2或3;

[0432] 其中,优选N-酰基磺酰胺类的化合物,例如下式(S4^a)的化合物,其由例如W0-A-97/45016已知,



[0434] 其中

[0435] R_D^7 为 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基,其中后2个基团被 v_D 个选自以下的取代基取代:卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基和 (C_1-C_4) -烷硫基,以及在环状基团的情况下,还选自 (C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -卤代烷基;

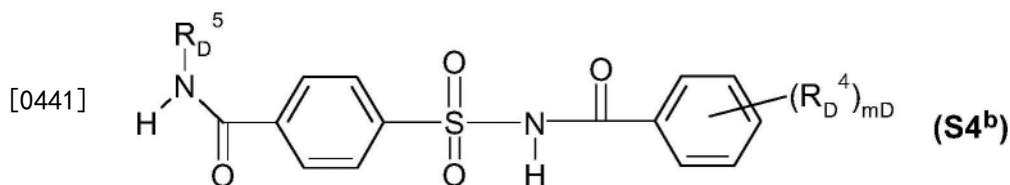
[0436] R_D^4 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 CF_3 ;

[0437] m_D 为1或2;

[0438] v_D 为0、1、2或3;

[0439] 以及

[0440] 酰基氨磺酰基苯甲酰胺类,例如下式(S4^b)的化合物,其由例如W0-A-99/16744已知,



[0442] 例如那些化合物,其中

[0443] R_D^5 =环丙基且 $(R_D^4)=2-OMe$ (“环丙磺酰胺”,S4-1),

[0444] R_D^5 =环丙基且 $(R_D^4)=5-Cl-2-OMe$ (S4-2),

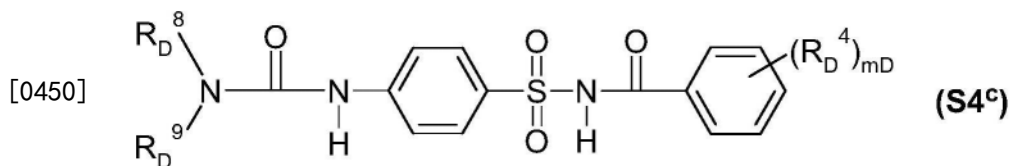
[0445] R_D^5 =乙基且 $(R_D^4)=2-OMe$ (S4-3),

[0446] R_D^5 =异丙基且 $(R_D^4)=5-Cl-2-OMe$ (S4-4),和

[0447] R_D^5 =异丙基且 $(R_D^4)=2-OMe$ (S4-5)

[0448] 以及

[0449] 式(S4^c)的N-酰基氨磺酰基苯基脒类的化合物,其由例如EP-A-365484已知,



[0451] 其中

[0452] R_D^8 和 R_D^9 独立地为氢、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_3-C_8) -环烷基、 (C_3-C_6) -烯基、 (C_3-C_6) -炔基,

[0453] R_D^4 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 CF_3 ,

[0454] m_D 为1或2;

[0455] 例如

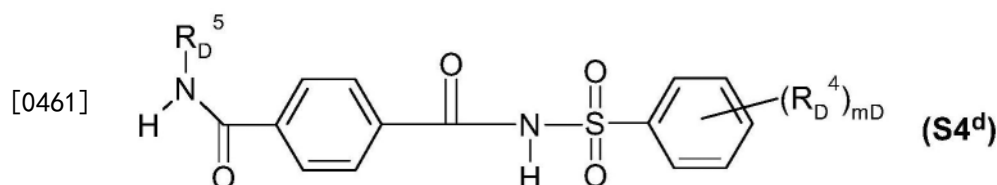
[0456] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲、

[0457] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、

[0458] 1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲、

[0459] 以及

[0460] 式(S4^d)的N-苯基磺酰基对苯二甲酰胺,其由例如CN 101838227已知,



[0462] 例如那些化合物,其中

[0463] R_D^4 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 CF_3 ;

[0464] m_D 为1或2;

[0465] R_D^5 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_5-C_6) -环烯基。

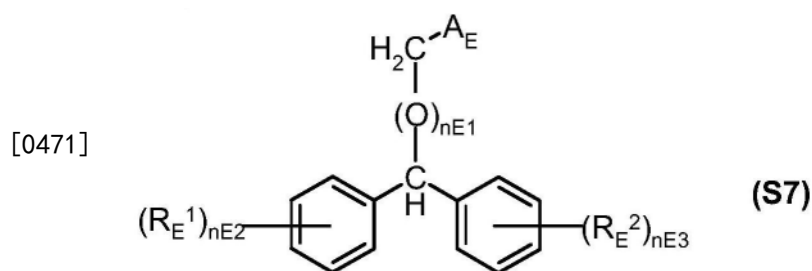
[0466] S5) 来自羟基芳族化合物和芳族-脂族羧酸衍生物类的活性成分(S5),例如

[0467] 3,4,5-三乙酰氧基苯甲酸乙酯、3,5-二甲氧基-4-羟基苯甲酸、3,5-二羟基苯甲酸、4-羟基水杨酸、4-氟水杨酸、2-羟基肉桂酸、2,4-二氯肉桂酸,如W0-A-2004/084631、W0-A-2005/015994、W0-A-2005/016001中所记载。

[0468] S6) 来自1,2-二氢喹啉-2-酮类的活性成分(S6),例如

[0469] 1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮、1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-硫酮、1-(2-氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮盐酸盐、1-(2-甲基磺酰基氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮,如W0-A-2005/112630中所记载。

[0470] S7) 式(S7)的化合物,如W0-A-1998/38856中所记载,



[0472] 其中符号和下标定义如下:

[0473] R_E^1 、 R_E^2 独立地为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、硝基;

[0474] A_E 为 $COOR_E^3$ 或 $COSR_E^4$;

[0475] R_E^3 、 R_E^4 独立地为氢、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、氰基烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、苯基、硝基苯基、苄基、卤代苄基、吡啶基烷基和烷基铵,

[0476] n_E^1 为0或1,

[0477] n_E^2 、 n_E^3 独立地为0、1或2，

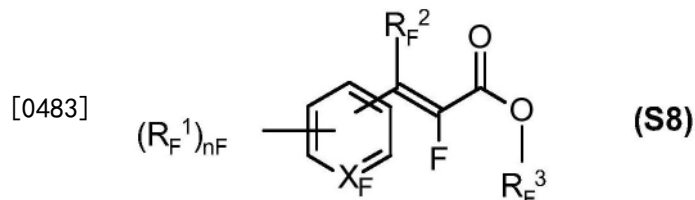
[0478] 优选：

[0479] 二苯基甲氧基乙酸、

[0480] 二苯基甲氧基乙酸乙酯、

[0481] 二苯基甲氧基乙酸甲酯 (CAS登记号41858-19-9) (S7-1)。

[0482] S8) 式 (S8) 的化合物或其盐，如W0-A-98/27049中所记载，



[0484] 其中

[0485] X_F 为CH或N，

[0486] n_F 在 $X_F=N$ 的情况下为0至4的整数，而且

[0487] 在 $X_F=CH$ 的情况下为0至5的整数，

[0488] R_F^1 为卤素、 (C_1-C_4) -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、硝基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基、任选取代的苯基、任选取代的苯氧基，

[0489] R_F^2 为氢或 (C_1-C_4) -烷基，

[0490] R_F^3 为氢、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基或芳基，其中上文提及的含碳的基团各自为未取代的或被一个或多个、优选最高达三个相同或不同的选自卤素和烷氧基的基团取代，

[0491] 优选以下化合物或其盐，其中

[0492] X_F 为CH，

[0493] n_F 为0至2的整数，

[0494] R_F^1 为卤素、 (C_1-C_4) -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，

[0495] R_F^2 为氢或 (C_1-C_4) -烷基，

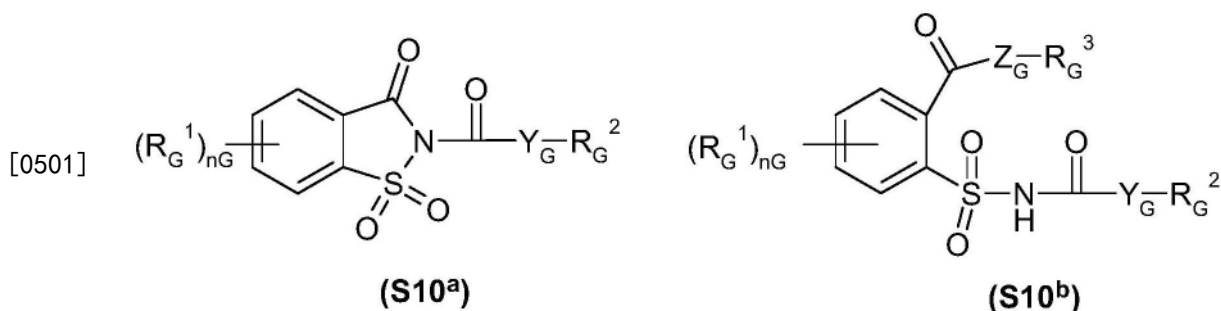
[0496] R_F^3 为氢、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基或芳基，其中上述含碳的基团各自为未取代的或被一个或多个、优选最高达三个相同或不同的选自卤素和烷氧基的基团取代。

[0497] S9) 来自3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮类的活性成分 (S9)，例如

[0498] 1,2-二氢-4-羟基-1-乙基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮 (CAS登记号219479-18-2)、1,2-二氢-4-羟基-1-甲基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮 (CAS登记号95855-00-8)，如W0-A-1999/000020中所记载。

[0499] S10) 式 (S10^a) 或 (S10^b) 的化合物

[0500] 如W0-A-2007/023719和W0-A-2007/023764中所记载，



[0502] 其中

[0503] R_G^1 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、甲氧基、硝基、氰基、 CF_3 、 OCF_3 ,

[0504] Y_G 、 Z_G 彼此独立地代表 O 或 S,

[0505] n_G 为 0 至 4 的整数,

[0506] R_G^2 为 (C_1-C_{16}) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_3-C_6) -环烷基、芳基;苄基、卤代苄基,

[0507] R_G^3 为氢或 (C_1-C_6) -烷基。

[0508] S11) 氧亚氨基化合物类的活性成分 (S11), 其已知为拌种剂, 例如“解草腈”((Z)-1,3-二氧杂戊环-2-基甲氧基亚氨基(苯基)乙腈) (S11-1), 其已知为用于黍/高粱抵抗异丙甲草胺损害的拌种安全剂,

[0509] “氟草肟”(1-(4-氯苯基)-2,2,2-三氟-1-乙酮O-(1,3-二氧杂戊环-2-基甲基)肟) (S11-2), 其已知为用于黍/高粱抵抗异丙甲草胺损害的拌种安全剂, 以及

[0510] “解草胺腈”或“CGA-43089”((Z)-氰基甲氧基亚氨基(苯基)乙腈) (S11-3), 其已知为用于黍/高粱抵抗异丙甲草胺损害的拌种安全剂。

[0511] S12) 来自异二氢苯并噻喃酮类的活性成分 (S12), 例如[(3-氧代-1H-2-苯并噻喃-4(3H)-亚基)甲氧基]乙酸甲酯 (CAS 登记号 205121-04-6) (S12-1), 以及 W0-A-1998/13361 中的相关化合物。

[0512] S13) 一种或多种来自组 (S13) 的化合物:

[0513] “萘二甲酸酐”(1,8-萘二甲酸酐) (S13-1), 其已知为用于玉米抵抗硫代氨基甲酸酯除草剂损害的拌种安全剂,

[0514] “解草啉”(4,6-二氯-2-苯基嘧啶) (S13-2), 其已知为在播种的稻中用于丙草胺的安全剂,

[0515] “解草胺”(2-氯-4-三氟甲基-1,3-噻唑-5-甲酸苄酯) (S13-3), 其已知为用于黍/高粱抵抗甲草胺和异丙甲草胺损害的拌种安全剂,

[0516] 购自 American Cyanamid 的“CL 304415” (CAS 登记号 31541-57-8) (4-羧基-3,4-二氢-2H-1-苯并吡喃-4-乙酸) (S13-4), 其已知为用于玉米抵抗咪唑啉酮损害的安全剂,

[0517] 购自 Nitrokemia 的“MG 191” (CAS 登记号 96420-72-3) (2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧杂戊环) (S13-5), 其已知为用于玉米的安全剂,

[0518] 购自 Nitrokemia 的“MG 838” (CAS 登记号 133993-74-5) (1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷-4-二硫代甲酸2-丙烯基酯) (S13-6), “乙拌磷”(S-2-乙硫基乙基二硫代磷酸0,0-二乙酯) (S13-7), “增效磷”(0-苯基硫代磷酸0,0-二乙酯) (S13-8), “氯解草灵”(甲基氨基甲酸4-氯苯酯) (S13-9)。

[0519] S14) 除了对有害植物具有除草作用外, 还对作物植物如稻具有安全剂作用的活性

成分,例如

[0520] “哌草丹”或“MY-93”(1-苯基乙基哌啶-1-硫代甲酸S-1-甲酯),其已知为用于稻抵抗除草剂禾草敌损害的安全剂,

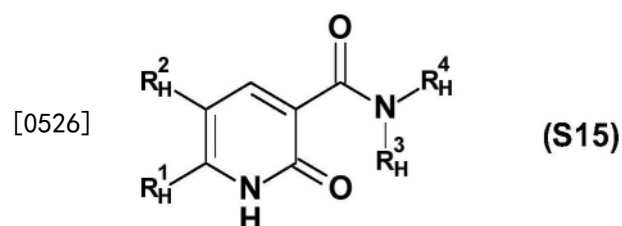
[0521] “杀草隆”或“SK 23”(1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-对甲苯基脲),其已知为用于稻抵抗唑吡嘧磺隆除草剂损害的安全剂,

[0522] “苄草隆”=“JC-940”(3-(2-氯苯基甲基)-1-(1-甲基-1-苯基乙基)脲,参见JP-A-60087254),其已知为用于稻抵抗一些除草剂损害的安全剂,

[0523] “苯草酮”或“NK 049”(3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮),其已知为用于稻抵抗一些除草剂损害的安全剂,

[0524] 购自Kumiai的“CSB”(1-溴-4-(氯甲基磺酰基)苯)(CAS登记号54091-06-4),其已知为用于在稻中抵抗一些除草剂损害的安全剂。

[0525] S15) 式(S15)的化合物或其互变异构体



[0527] 如W0-A-2008/131861和W0-A-2008/131860中所记载,其中

[0528] R_H^1 为 (C_1-C_6) -卤代烷基,且

[0529] R_H^2 为氢或卤素,且

[0530] R_H^3 、 R_H^4 独立地为氢、 (C_1-C_{16}) -烷基、 (C_2-C_{16}) -烯基或 (C_2-C_{16}) -炔基,

[0531] 其中后3个基团各自为未取代的或被一个或多个选自以下的基团取代:卤素、羟基、氰基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二[(C_1-C_4)-烷基]氨基、[(C_1-C_4)-烷氧基]羰基、[(C_1-C_4)-卤代烷氧基]羰基、未取代的或取代的 (C_3-C_6) -环烷基、未取代的或取代的苯基和未取代的或取代的杂环基,或 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_4-C_6) -环烯基、在环的一侧上稠合至4元至6元饱和或不饱和的碳环的 (C_3-C_6) -环烷基,或在环的一侧上稠合至4元至6元饱和或不饱和的碳环的 (C_4-C_6) -环烯基,

[0532] 其中后4个基团各自为未取代的或被一个或多个选自以下的基团取代:卤素、羟基、氰基、 (C_1-C_4) -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_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二[(C_1-C_4)-烷基]氨基、[(C_1-C_4)-烷氧基]羰基、[(C_1-C_4)-卤代烷氧基]羰基、未取代的或取代的 (C_3-C_6) -环烷基、未取代的或取代的苯基和未取代的或取代的杂环基,

[0533] 或

[0534] R_H^3 为 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_2-C_4) -烯氧基、 (C_2-C_6) -炔氧基或 (C_2-C_4) -卤代烷氧基,且

[0535] R_H^4 为氢或 (C_1-C_4) -烷基,或

[0536] R_H^3 和 R_H^4 与直接键合的氮原子一起形成四元至八元杂环,所述杂环除了氮原子外还可包含其他环杂原子,优选最高达两个选自N、O和S的其他环杂原子,并且所述杂环为未取代的或被一个或多个选自以下的基团取代:卤素、氰基、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基和 (C_1-C_4) -烷硫基。

- [0537] S16) 主要用作除草剂但还对作物植物具有安全剂作用的活性化合物,例如
- [0538] (2,4-二氯苯氧基)乙酸(2,4-D)、
- [0539] (4-氯苯氧基)乙酸、
- [0540] (R,S)-2-(4-氯-邻甲苯氧基)丙酸(2-甲-4-氯丙酸)、
- [0541] 4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸(2,4-DB)、
- [0542] (4-氯-邻甲苯氧基)乙酸(MCPA)、
- [0543] 4-(4-氯-邻甲苯氧基)丁酸、
- [0544] 4-(4-氯苯氧基)丁酸、
- [0545] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸(麦草畏)、
- [0546] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸1-(乙氧基羰基)乙酯(lactidichlor-ethyl)。
- [0547] 特别优选的安全剂为吡唑解草酯、环丙磺酰胺、双苯噁唑酸、解草酯、二氯丙烯胺和解草磺酰胺(metcamifen)。
- [0548] 可湿性粉剂为可在水中均匀分散的制剂,并且除了活性成分之外,除了稀释剂或惰性物质之外,还包含离子型和/或非离子型表面活性剂(润湿剂、分散剂),例如聚乙氧基化烷基酚、聚乙氧基化脂肪醇、聚乙氧基化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷基苯磺酸盐、木质素磺酸钠、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰基甲基牛磺酸钠。为制备可湿性粉剂,将活性除草成分细磨,例如在常规设备如锤磨机、鼓风磨机和空气喷射磨机中,并同时或随后与制剂助剂混合。
- [0549] 可乳化浓缩剂通过将活性成分溶于有机溶剂(例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或相对高沸点的芳族化合物或烃类)或有机溶剂的混合物中,并添加一种或多种离子型和/或非离子型表面活性剂(乳化剂)而制备。可使用的乳化剂的实例为:烷基芳基磺酸钙盐,例如十二烷基苯磺酸钙;或非离子型乳化剂,例如脂肪酸聚乙二醇酯、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、环氧丙烷/环氧乙烷缩合产物、烷基聚醚、脱水山梨糖醇酯(例如脱水山梨糖醇脂肪酸酯)或聚氧乙烯脱水山梨糖醇酯(例如聚氧乙烯脱水山梨糖醇脂肪酸酯)。
- [0550] 撒粉产品通过用细分散的固体研磨活性成分而获得,所述细分散的固体为例如滑石、天然粘土(如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。
- [0551] 悬浮浓缩剂可为水基或油基的。其可例如通过借助市售珠磨机并任选地添加例如已在上文针对其他制剂类型所列出的表面活性剂进行湿式研磨法而制备。
- [0552] 乳剂,例如水包油乳剂(EW),可使用含水有机溶剂和任选地已在上文例如针对其他制剂类型所列出的表面活性剂,借助例如搅拌器、胶体磨机和/或静态混合器来制备。
- [0553] 颗粒剂可通过将活性成分喷洒于吸附性颗粒状惰性材料上制备或通过借助胶粘剂(例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油)将活性成分浓缩物施用于载体物质(例如砂、高岭石或颗粒状惰性材料)的表面来制备。还可将合适的活性成分以制备肥料颗粒剂的常规方式——如果需要与肥料混合——进行造粒。
- [0554] 水分散性颗粒剂通常通过常规方法如喷雾干燥法、流化床造粒法、盘式造粒法、用高速混合器混合且在无固体惰性材料的情况下挤出而制备。
- [0555] 关于盘式造粒、流化床造粒、挤出机造粒和喷雾造粒,参见例如“Spray-Drying Handbook”第3版,1979,G.Godwin Ltd.,London;J.E.Browning,“Agglomeration”,

Chemical and Engineering 1967,第147页及后文;“Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”,第5版,McGraw-Hill,New York 1973,第8-57页中的方法。关于作物保护组合物制剂的其他详情,参见例如G.C.Klingman,“Weed Control:as a Science”,John Wiley and Sons,Inc.,New York,1961,第81-96页和J.D.Freyer,S.A.Evans,“Weed Control Handbook”,第5版,Blackwell Scientific Publications,Oxford,1968,第101-103页。

[0556] 农业化学制剂通常包含0.1重量%至99重量%、特别是0.1重量%至95重量%的本发明的化合物。在可湿性粉剂中,活性成分的浓度例如为约10重量%至90重量%,补足至100重量%的余量由常规制剂成分组成。在可乳化浓缩剂中,活性成分的浓度可为约1重量%至90重量%且优选5重量%至80重量%。粉末形式的制剂包含1重量%至30重量%的活性成分,通常优选5重量%至20重量%的活性成分;可喷雾溶液剂包含约0.05重量%至80重量%、优选2重量%至50重量%的活性成分。在水分散性颗粒剂的情况下,活性成分的含量部分取决于活性成分是液体还是固体形式,以及使用何种造粒助剂、填料等。在水分散性颗粒剂中,活性成分的含量例如1重量%至95重量%,优选为10重量%至80重量%。

[0557] 此外,所提及的活性成分制剂任选地包含相应的常规的粘着剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、抗冻剂和溶剂、填料、载体和染料、消泡剂、蒸发抑制剂和影响pH和黏度的试剂。

[0558] 基于这些制剂,还可制备与其他农药活性物质(例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂)以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的组合,例如以成品制剂的形式或作为桶混物。

[0559] 为了施用,如果合适,将市售形式的制剂以常规方式稀释,例如在可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、分散剂和水分散性颗粒剂的情况下,用水稀释。粉末形式的制剂、用于土壤施用的颗粒剂或用于撒播的颗粒剂和可喷雾溶液剂在施用前通常不用其他惰性物质进一步稀释。

[0560] 式(I)的化合物及其盐所需的施用率根据外界条件(尤其例如温度、湿度和所用除草剂的类型)而改变。其可在宽范围内变化,例如0.001至10.0kg/ha或更多的活性物质,但其优选为0.005至5kg/ha、更优选在0.01至1.5kg/ha的范围内、更优选在0.05至1kg/ha的范围内。这适用于出苗前施用和出苗后施用。

[0561] 载体为天然或合成的有机物质或无机物质,将其与活性成分混合或组合以获得更好的适用性,特别是对于向植物或植物部位或种子的施用。载体——其可为固体或液体——通常是惰性的且应适合用于农业。

[0562] 有用的固体或液体载体包括:例如铵盐和天然岩粉(如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、凹凸棒石、蒙脱石或硅藻土)以及合成的岩粉(如细分散的二氧化硅、氧化铝)和天然或合成的硅酸盐、树脂、蜡、固体肥料、水、醇(尤其是丁醇)、有机溶剂、矿物油和植物油,以及它们的衍生物。同样可使用所述载体的混合物。用于颗粒剂的有用的固体载体包括:例如粉碎并分级的天然岩石(如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石)、无机粉和有机粉的合成颗粒以及有机材料(如锯屑、椰壳、玉米穗轴和烟草秆)的颗粒。

[0563] 合适的液化气体填充剂或载体为在标准温度和大气压下为气态的液体,例如气雾剂抛射剂,例如卤代烃,或丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0564] 在制剂中,可以使用增黏剂,例如羧甲基纤维素;粉末、颗粒或胶乳形式的天然和

合成聚合物,例如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯;或天然磷脂(例如脑磷脂和卵磷脂)和合成磷脂。其他添加剂可为矿物油和植物油。

[0565] 当所用的填充剂为水时,还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。有用的液体溶剂主要为:芳族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族化合物或氯代脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷或链烷烃,例如矿物油馏分、矿物油和植物油;醇,例如丁醇或乙二醇及其醚和酯;酮,例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷;以及水。

[0566] 本发明的组合物还可包含其他组分,例如表面活性剂。有用的表面活性剂为具有离子或非离子性质的乳化剂和/或发泡剂、分散剂或润湿剂,或这些表面活性剂的混合物。其实例为聚丙烯酸的盐;木质素磺酸的盐;酚磺酸或萘磺酸的盐;环氧乙烷与脂肪醇或与脂肪酸或与脂肪胺的缩聚物;取代的酚(优选烷基酚或芳基酚);磺基琥珀酸酯的盐;牛磺酸衍生物(优选牛磺酸烷基酯);聚乙氧基化醇或酚的磷酸酯;多元醇的脂肪酸酯;以及含有硫酸根、磺酸根和磷酸根的化合物的衍生物,例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐、蛋白质水解物、木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。如果活性成分之一和/或惰性载体之一不溶于水并且在水中进行施用,则必须存在表面活性剂。表面活性剂的比例为本发明的组合物的5至40重量%。可以使用染料,例如无机色素,如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝;和有机染料,例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料;以及微量营养物,例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0567] 如果合适,还可存在其他额外的组分,例如保护胶体、粘合剂、胶粘剂、增稠剂、触变性物质、渗透剂、稳定剂、螯合剂、络合剂。通常,活性成分可与常用于制剂目的的任何固体或液体添加剂组合。通常,本发明的组合物和制剂包含0.05重量%至99重量%、0.01重量%至98重量%、优选0.1重量%至95重量%且更优选0.5重量%至90重量%的活性成分,最优选10至70重量%。本发明的活性成分或组合物可以其本身的形式使用,或根据其各自的物理和/或化学性质,以其制剂的形式或由其制备的使用形式使用,例如气雾剂、胶囊悬浮剂、冷雾浓缩剂、暖雾浓缩剂、胶囊化颗粒剂、细颗粒剂、用于处理种子的可流动浓缩剂、即用型溶液剂、粉剂、可乳化浓缩剂、水包油乳剂、油包水乳剂、大颗粒剂、微颗粒剂、油分散性粉剂、油混溶性可流动浓缩剂、油混溶性液剂、泡沫剂、糊剂、农药包衣种子、悬浮浓缩剂、悬乳浓缩剂、可溶性浓缩剂、悬浮剂、可喷雾粉剂、可溶性粉剂、粉剂和颗粒剂、水溶性颗粒剂或片剂、用于处理种子的水溶性粉剂、可湿性粉剂、用活性成分浸渍的天然产物和合成物质,以及聚物质和种子包衣材料中的微胶囊,以及ULV冷雾制剂和暖雾制剂。

[0568] 所提及的制剂可以本身已知的方式制备,例如通过将活性成分与至少一种以下常规物质混合:填充剂、溶剂或稀释剂、乳化剂、分散剂和/或粘合剂或固定剂、润湿剂、防水剂、任选地干燥剂和UV稳定剂,以及任选地染料和色素、消泡剂、防腐剂、辅助增稠剂、增黏剂、赤霉素以及其他加工助剂。

[0569] 本发明的组合物不仅包括已现成可用并且可用合适的设备施用到植物或种子上的制剂,还包括在使用前必须用水稀释的市售浓缩物。

[0570] 本发明的活性成分可以其本身或以其(商业标准)制剂或由这些制剂与其他(已知)活性成分混合而制备的使用形式存在,所述其他(已知)活性成分例如杀昆虫剂、引诱剂、不育剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、肥料、安全剂或化

学信息素。

[0571] 本发明使用活性成分或组合物对植物和植物部位进行的处理通过使用常规处理方法直接进行或通过作用于其环境、生境或贮藏空间进行,例如通过浸渍、喷洒、雾化、灌溉、蒸发、撒粉、成雾、撒播、发泡、涂抹、撒布、浇水(浸湿)、滴灌,并且在繁殖材料的情况下,特别是在种子的情况下,还通过干种子处理、湿种子处理、浆料处理、结壳、涂覆一层或多层包衣等。还可通过超低容量法施用活性成分,或将活性成分制剂或活性成分本身注射到土壤中。

[0572] 如下文所述,使用本发明的活性成分或组合物处理转基因种子也是特别重要的。这涉及包含至少一种异源基因的植物的种子,所述异源基因能够表达具有杀虫特性的多肽或蛋白。转基因种子中的异源基因可源自例如以下微生物:芽孢杆菌属(Rhizobium)、假单孢菌属(Pseudomonas)、沙雷氏菌属(Serratia)、木霉属(Trichoderma)、棒状杆菌属(Clavibacter)、球囊霉属(Glomus)或粘帚霉属(Gliocladium)。这种异源基因优选源自芽孢杆菌属物种,在这种情况下,基因产物对欧洲玉米螟和/或西方玉米根虫有效。所述异源基因更优选源自苏云金芽孢杆菌。

[0573] 在本发明的上下文中,将本发明的组合物单独或以合适的剂型施用于种子。优选地,在种子足够稳定的状态下处理种子以使在处理过程中不发生损害。通常,可在采收和播种之间的任何时间处理种子。通常使用已与植物分离并且已去除穗轴、壳、茎、荚、毛或果肉的种子。例如,可使用已采收、清洁并干燥至含水量小于15重量%的种子。或者,还可使用在干燥后例如已用水处理然后再干燥的种子。

[0574] 通常,在处理种子时,必须确保选择施用于种子的本发明的组合物和/或其他添加剂的量,使得不妨害种子的萌发,并且不损害由其长出的植物。特别是在活性成分可在一定施用率下表现出植物毒性作用的情况下,必须确保这一点。

[0575] 本发明的组合物可直接施用,即不含其他任何组分且无需进行稀释。通常,优选以合适的剂型将组合物施用于种子。用于种子处理的合适的制剂和方法是本领域普通技术人员已知的,并且记载于例如以下文献中:US 4,272,417 A、US 4,245,432 A、US 4,808,430、US 5,876,739、US2003/0176428 A1、WO 2002/080675 A1、WO 2002/028186A2。

[0576] 可将本发明的活性成分转化为常规的拌种制剂,例如溶液剂、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、浆剂或其他种子包衣组合物,以及ULV制剂。

[0577] 这些制剂以已知方式通过将活性成分与常规添加剂混合而制备,所述常规添加剂为例如常规的填充剂以及溶剂或稀释剂、染料、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、辅助增稠剂、胶粘剂、赤霉素以及水。

[0578] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的染料为通常用于此目的的所有染料。可使用微溶于水的色素或溶于水的染料。实例包括名称为罗丹明B、C.I. 颜料红112和C.I. 溶剂红1的染料。

[0579] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的润湿剂为促进润湿并常用于配制农业化学活性成分的所有物质。可优选使用萘磺酸烷基酯,例如萘磺酸二异丙酯或萘磺酸二异丁酯。

[0580] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的合适的分散剂和/或乳化剂为常用于配制农业化学活性成分的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。可优选使用非离子或阴离

子分散剂,或者非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂尤其包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙基酚聚乙二醇醚,及其磷酸化或硫酸化衍生物。合适的阴离子分散剂尤其为木质素磺酸盐、聚丙烯酸盐和芳基磺酸盐-甲醛缩合物。

[0581] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的消泡剂为常用于配制农业化学活性成分的所有抑制泡沫的物质。可优选使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。

[0582] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的防腐剂为在农业化学组合中可用于此目的的所有物质。实例包括双氯酚和苧醇半缩甲醛。

[0583] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的辅助增稠剂为在农业化学组合中可用于此目的的所有物质。优选的实例包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土和细分散的二氧化硅。

[0584] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的粘着剂为可用于拌种产品中的所有常规的粘合剂。优选的实例包括聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和纤维乙酸钠。

[0585] 可根据本发明使用的拌种制剂可直接或预先用水稀释后用于处理宽范围的不同种子,包括转基因植物的种子。在这种情况下,在与通过表达形成的物质的相互作用中还可出现额外的协同效应。

[0586] 为了用可根据本发明使用的拌种制剂或通过添加水由其制备的制剂来处理种子,有用的设备为所有可常规用于拌种的混合装置。具体而言,拌种程序为:将种子置于混合器内,加入特定所需量的拌种制剂(以其本身或在预先用水稀释后),并将它们混合直至制剂均匀地分布于种子上。如果合适,随后进行干燥操作。

[0587] 由于具有良好的植物相容性、有利的恒温动物毒性和良好的环境相容性,因此本发明的活性成分适合用于保护植物和植物器官、提高收获量并改善采收作物的品质。它们可优选用作作物保护剂。它们对通常敏感和具有抗性的物种以及对所有或特定的发育阶段均具有活性。

[0588] 可根据本发明处理的植物包括以下主要作物植物:玉米、大豆、棉花、芸薹属(*Brassica*)油料种子如欧洲油菜(*Brassica napus*) (例如坎诺拉油菜)、蔓菁(*Brassica rapa*)、芥菜(*B. juncea*) (例如(野生)芥菜)和埃塞俄比亚芥(*Brassica carinata*)、稻、小麦、甜菜、甘蔗、燕麦、黑麦、大麦、粟和高粱、黑小麦、亚麻、葡萄以及各种植物分类群的各种水果和蔬菜,例如蔷薇科物种(*Rosaceae* sp.) (例如仁果如苹果和梨,以及核果如杏、樱桃、扁桃和桃,以及浆果如草莓)、茶藨子亚科(*Ribesioideae* sp.) 物种、胡桃科物种(*Juglandaceae* sp.)、桦木科物种(*Betulaceae* sp.)、漆树科物种(*Anacardiaceae* sp.)、壳斗科物种(*Fagaceae* sp.)、桑科物种(*Moraceae* sp.)、木犀科物种(*Oleaceae* sp.)、猕猴桃科物种(*Actinidiaceae* sp.)、樟科物种(*Lauraceae* sp.)、芭蕉科物种(*Musaceae* sp.) (例如香蕉树和大蕉)、茜草科物种(*Rubiaceae* sp.) (例如咖啡)、山茶科物种(*Theaceae* sp.)、梧桐科物种(*Sterculiaceae* sp.)、芸香科物种(*Rutaceae* sp.) (例如柠檬、橙和葡萄柚);茄科物种(*Solanaceae* sp.) (例如番茄、马铃薯、胡椒、茄子)、百合科物种(*Liliaceae* sp.)、菊科物种(*Compositae* sp.) (例如莴苣、菜蓟和菊苣——包括根用菊苣、苣荬菜或普通菊苣)、伞形科物种(*Umbelliferae* sp.) (例如胡萝卜、欧芹、芹菜和块根芹)、葫芦科物种

(Cucurbitaceae sp.) (例如黄瓜——包括小黄瓜、南瓜、西瓜、葫芦和甜瓜)、葱科物种 (Alliaceae sp.) (例如韭葱和洋葱)、十字花科物种 (Cruciferae sp.) (例如白球甘蓝、红球甘蓝、西兰花、花椰菜、抱子甘蓝、小白菜、球茎甘蓝、萝卜、辣根、水芹、大白菜)、豆科物种 (Leguminosae sp.) (例如花生、豌豆类和菜豆类——如菜豆和蚕豆)、藜科物种 (Chenopodiaceae sp.) (例如瑞士甜菜、饲用甜菜、菠菜、块根甜菜)、锦葵科 (Malvaceae) (例如秋葵)、天门冬科 (Asparagaceae) (例如芦笋); 园艺和森林中的有用植物和观赏植物; 以及每种情况下这些植物的转基因种类。

[0589] 如上所述, 可根据本发明处理所有植物及其部位。在一个优选的实施方案中, 处理野生植物物种和植物栽培种, 或处理通过常规生物育种技术如杂交或原生质体融合而获得的那些, 及其部位。在更优选的实施方案中, 处理通过基因工程方法——如果合适, 与常规方法结合——获得的转基因植物和植物栽培种 (转基因生物) 及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文中解释。根据本发明特别优选处理相应的市售的常规植物栽培种的植物或正在使用的那些植物。植物栽培种应理解为意指通过常规育种、通过诱变或通过重组DNA技术培育出的具有新特性 (“性状”) 的植物。它们可以是栽培种、变种、生物型和基因型。

[0590] 本发明的处理方法可用于处理转基因生物 (GMO), 例如植物或种子。转基因植物是其中异源基因已被稳定地整合入基因组中的植物。术语“异源基因”本质上意指下述基因: 其在植物外提供或组装, 并且当引入细胞核基因组、叶绿体基因组或线粒体基因组中时, 其赋予转化植物新的或改良的农艺或其他性状, 这是因为它表达目标蛋白质或多肽或存在于植物内的其他基因, 或下调或关闭存在于植物内的其他基因 (例如通过反义技术、共抑制技术或RNAi技术 [RNA干扰])。位于基因组中的异源基因也称为转基因。根据其在植物基因组中的特定存在而定义的转基因称为转化或转基因株系。

[0591] 取决于植物物种或植物栽培种、其所在地和生长条件 (土壤、气候、生长期、营养), 本发明的处理还可产生超加和 (“协同”) 效应。例如, 可出现以下超过实际预期的效果: 可根据本发明使用的活性成分和组合物的施用率降低和/或活性谱拓宽和/或功效提高、植物生长更好、对高温或低温的耐受性增加、对干旱或对水或土壤盐度的耐受性提高、开花表现提高、使采收更容易、加速成熟、采收产量更高、果实更大、植物高度更高、叶子颜色更绿、开花更早、采收产品的品质更高且/或营养价值更高、果实内的糖浓度更高、采收产品的储存稳定性和/或加工性更好。

[0592] 优选根据本发明处理的植物和植物栽培种包括所有具有赋予这些植物特别有利的有用性状的遗传物质的植物 (无论是通过育种手段和/或通过生物技术手段获得)。

[0593] 抗线虫植物的实例记载于例如以下美国专利申请中: 11/765,491、11/765,494、10/926,819、10/782,020、12/032,479、10/783,417、10/782,096、11/657,964、12/192,904、11/396,808、12/166,253、12/166,239、12/166,124、12/166,209、11/762,886、12/364,335、11/763,947、12/252,453、12/209,354、12/491,396和12/497,221。

[0594] 可根据本发明处理的植物为已经表达出杂种优势或杂交效果的特征的杂交植物, 所述杂种优势或杂交效果通常引起更高的产量、活力、更好的健康状况和对生物和非生物胁迫因素的抗性。所述植物通常通过使一种自交雄性不育亲系 (杂交母本) 与另一种自交雄性能育亲系 (杂交父本) 杂交而产生。杂交种子通常采收自雄性不育植物并出售给种植者。

雄性不育植物有时(例如在玉米中)可通过去雄(即机械去除雄性生殖器官或雄花)产生;但更通常地,雄性不育性是由植物基因组中的遗传决定因子产生的。在这种情况下,且特别是当种子是从杂交植物上采收的所需产品时,确保杂交植物(其含有负责雄性不育性的遗传决定因子)中的雄性能育性完全恢复通常有益。这可通过确保杂交父本具有合适的能育性恢复基因来实现,所述能育性恢复基因能够使含有负责雄性不育性的遗传决定因子的杂交植物中的雄性能育性恢复。雄性不育性的遗传决定因子可位于细胞质中。例如,针对芸薹属物种的细胞质雄性不育性(CMS)的实例已有记载。然而,雄性不育性的遗传决定因子还可位于细胞核基因组中。雄性不育植物还可通过植物生物技术方法(例如基因工程)获得。WO 89/10396中记载了一种特别有用的获得雄性不育植物的方法,其中,例如,核糖核酸酶(例如芽孢杆菌RNA酶)在雄蕊中的绒毡层细胞中选择性表达。然后可通过在绒毡层细胞中表达核糖核酸酶抑制因子(例如芽孢杆菌RNA酶抑制剂)来恢复能育性。

[0595] 可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法例如基因工程获得)为除草剂耐受性植物,即对一种或多种给定的除草剂具有耐受性的植物。此类植物可通过遗传转化获得,或通过选择含有赋予这种除草剂耐受性的突变的植物而获得。

[0596] 除草剂耐受性植物例如草甘膦耐受性植物,即对除草剂草甘膦或其盐具有耐受性的植物。可通过不同方法使植物对草甘膦具有耐受性。因此,例如,可通过用编码5-烯醇式丙酮酰莽草酸-3-磷酸合酶(EPSPS)的基因对植物进行转化来获得草甘膦耐受性植物。所述EPSPS基因的实例为细菌鼠伤寒沙门氏菌(*Salmonella typhimurium*)的aroA基因(突变体CT7)(Comai等人,1983,Science,221,370-371)、细菌农杆菌属物种(*Agrobacterium* sp.)的cp4基因(Barry等人,1992,Curr.Topics Plant Physiol.7,139-145)、编码矮牵牛EPSPS的基因(Shah等人,1986,Science 233,478-481)、编码番茄EPSPS的基因(Gasser等人,1988,J.Biol.Chem.263,4280-4289)或编码穆属EPSPS的基因(WO 01/66704)。所述EPSPS还可以是突变的EPSPS。草甘膦耐受性植物还可通过表达编码草甘膦氧化还原酶的基因来获得。草甘膦耐受性植物还可通过表达编码草甘膦乙酰基转移酶的基因来获得。草甘膦耐受性植物还可通过选择包含天然产生的上述基因的突变的植物来获得。表达赋予草甘膦耐受性的EPSPS基因的植物已有记载。表达赋予草甘膦耐受性的其他基因(例如脱羧酶基因)的植物已有记载。

[0597] 其他除草剂抗性植物例如对抑制谷氨酰胺合酶的除草剂(例如双丙氨膦酸、膦丝菌素或草铵膦酸)具有耐受性的植物。这些植物可通过表达解除除草剂毒性的酶或表达对抑制作用具有抗性的突变谷氨酰胺合酶来获得。此类有效的解毒酶的一个实例为膦丝菌素乙酰基转移酶(例如链霉菌属(*Streptomyces*)物种的BAR或PAT蛋白)。表达外源性膦丝菌素乙酰基转移酶的植物已有记载。

[0598] 其他除草剂耐受性植物还为对抑制羟基苯丙酮酸双加氧酶(HPPD)的除草剂已具有耐受性的植物。羟基苯丙酮酸双加氧酶是催化将对羟基苯丙酮酸(HPP)转化成尿黑酸的反应的酶。对HPPD抑制剂具有耐受性的植物可使用编码天然产生的抗性HPPD酶的基因,或编码突变或嵌合的HPPD酶的基因来转化,如WO 96/38567、WO 99/24585、WO 99/24586、WO 2009/144079、WO 2002/046387或US 6,768,044中所记载。对HPPD抑制剂的耐受性还可通过用编码尽管天然HPPD酶被HPPD抑制剂抑制却仍能形成尿黑酸的某些酶的基因转化植物而获得。WO 99/34008和WO 02/36787中记载了此类植物。除使用编码HPPD耐受性酶的基因之

外,还可通过使用编码预苯酸脱氢酶的基因转化植物来提高植物对HPPD抑制剂的耐受性,如WO 2004/024928中所记载。另外,通过向植物的基因组中插入编码代谢或降解HPPD抑制剂的酶(例如CYP450酶)的基因,可使植物对HPPD抑制剂更具耐受性(参见WO 2007/103567和WO 2008/150473)。

[0599] 其他除草剂抗性植物为对乙酰乳酸合酶(ALS)抑制剂具有耐受性的植物。已知的ALS抑制剂包括例如磺酰脲、咪唑啉酮、三唑并嘧啶、嘧啶氧基(硫代)苯甲酸酯和/或磺酰基氨基羰基三唑啉酮除草剂。已知ALS酶(也称作乙酰羟酸合酶,AHAS)中的不同突变赋予对不同除草剂和除草剂组的耐受性,如例如Tranel和Wright(Weed Science,2002,50,700-712)中所记载。磺酰脲耐受性植物和咪唑啉酮耐受性植物的制备已有记载。其他磺酰脲耐受性植物和咪唑啉酮耐受性植物也已有记载。

[0600] 其他对咪唑啉酮和/或磺酰脲具有耐受性的植物可通过诱变、通过在除草剂存在下的细胞培养物中选择或通过诱变育种来获得(参见例如关于大豆的US 5,084,082、关于稻的WO 97/41218、关于甜菜的US 5,773,702和WO 99/057965、关于莴苣的US 5,198,599或关于向日葵的WO 01/065922)。

[0601] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法例如基因工程获得)对非生物胁迫因素具有耐受性。此类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予这种胁迫抗性的突变的植物而获得。特别有用的胁迫耐受性植物包括以下植物:

[0602] a. 包含能够降低植物细胞或植物中的聚(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因的表达和/或活性的转基因的植物;

[0603] b. 包含能够降低植物或植物细胞中的PARG编码基因的表达和/或活性的胁迫耐受性增强转基因的植物;

[0604] c. 含有编码烟酰胺腺嘌呤二核苷酸补救生物合成途径的植物功能酶的胁迫耐受性增强转基因的植物,所述植物功能酶包括烟酰胺酶、烟酸磷酸核糖转移酶、烟酸单核苷酸腺苷酰转移酶、烟酰胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或烟酰胺磷酸核糖转移酶。

[0605] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法例如基因工程获得)显示出改变的采收产品的数量、品质和/或储存稳定性,和/或改变的采收产品的特定成分的特性,所述植物或植物栽培种为例如:

[0606] 1) 合成改性淀粉的转基因植物,与野生型植物细胞或植物中合成的淀粉相比,该改性淀粉在其物理化学特性方面、特别是直链淀粉的含量或直链淀粉/支链淀粉的比例、支化度、平均链长、侧链分布、粘性行为、胶凝强度、淀粉颗粒大小和/或淀粉颗粒形貌发生改变,从而使该改性淀粉更好地适合于特定的应用。

[0607] 2) 合成非淀粉碳水化合物聚合物或合成具有与未经遗传修饰的野生型植物相比改变的特性的非淀粉碳水化合物聚合物的转基因植物。实例为产生多聚果糖(尤其是菊糖和果聚糖型)的植物、产生 α -1,4-葡聚糖的植物、产生 α -1,6-支化 α -1,4-葡聚糖的植物和产生交替糖的植物。

[0608] 3) 产生透明质酸的转基因植物。

[0609] 4) 具有特定特征例如“高可溶性固形物含量”、“低刺激性”(LP)和/或“长期储存性”(LS)的转基因植物或杂交植物,例如洋葱。

[0610] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法例如基因工程

获得) 为具有改变的纤维特性的植物, 例如棉花植株。此类植物可通过遗传转化或者通过选择含有赋予这种改变的纤维特性的突变的植物而获得, 并且包括:

[0611] a) 包含改变形式的纤维素合酶基因的植物, 例如棉花植株;

[0612] b) 包含改变形式的 $rsw2$ 或 $rsw3$ 同源核酸的植物, 例如棉花植株, 例如具有增强的蔗糖磷酸合酶表达的棉花植株;

[0613] c) 具有增强的蔗糖合酶的表达的植物, 例如棉花植株;

[0614] d) 其中例如通过下调纤维选择性 β -1,3-葡聚糖酶而改变在纤维细胞基部胞间连丝门控的时机的植物, 例如棉花植株;

[0615] e) 具有改变的反应性的纤维——例如通过表达N-乙酰葡萄糖胺转移酶基因(包括 $nodC$)和几丁质合酶基因——的植物, 例如棉花植株。

[0616] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法例如基因工程获得) 为具有改变的油成分特性的植物, 例如油菜或相关的芸薹属植物。此类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予这种改变的油特性的突变的植物而获得, 并且包括:

[0617] a) 产生具有高油酸含量的油的植物, 例如油菜植株;

[0618] b) 产生具有低亚麻酸含量的油的植物, 例如油菜植株;

[0619] c) 产生具有低水平的饱和脂肪酸的油的植物, 例如油菜植株。

[0620] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(其可通过植物生物技术方法例如基因工程获得) 为抗病毒(例如抗马铃薯病毒Y)的植物(来自阿根廷Tecnoplant的SY230和SY233株系), 例如马铃薯, 或对病害例如马铃薯晚疫病具有抗性(例如RB基因)的植物, 或表现出降低的低温糖化的植物(其带有基因 $Nt-Inh$ 、 $II-INV$)或表现出矮化表型的植物(A-20氧化酶基因)。

[0621] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法例如基因工程获得) 为具有改变的落粒特性的植物, 例如油菜或相关的芸薹属植物。此类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予这种改变的特性的突变的植物而获得, 并且包括落粒延迟或减少的植物, 例如油菜。

[0622] 可根据本发明处理的特别有用的转基因植物为具有转化株系或转化株系组合的植物, 所述植物是在美国农业部(USDA)的动植物卫生检验局(APHIS)已经批准或待批准的在美国非管制状态的请求的对象。与此相关的信息可在任何时间从APHIS(4700River Road Riverdale, MD 20737, USA)获得, 例如通过网站http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html。在本申请的申请日, 具有以下信息的请求已在APHIS获得批准或待批准:

[0623] -请求: 请求的识别号。转化株系的技术说明可在特定请求文件中找到, 该请求文件可通过请求号从APHIS的网站上获得。这些说明通过引用的方式公开于本说明书。

[0624] -请求的扩展: 要求扩大范围或期限的在先请求的编号。

[0625] -机构: 提交请求的实体的名称。

[0626] -管制项目: 涉及的植物物种。

[0627] -转基因表型: 通过转化株系赋予植物的性状。

[0628] -转化株系或品系: 要求非管制状态的株系(有时也称为品系)的名称。

[0629] -APHIS文件: 已由APHIS出版的与请求相关的或可从APHIS应要求获得的各种文件。

[0630] 可根据本发明处理的特别有用的转基因植物是包含编码一种或多种毒素的一种或多种基因的植物,例如以下列商品名市售的转基因植物:**YieldGard**[®] (例如玉米、棉花、大豆)、**KnockOut**[®] (例如玉米)、**BiteGard**[®] (例如玉米)、**BT-Xtra**[®] (例如玉米)、**StarLink**[®] (例如玉米)、**Bollgard**[®] (棉花)、**NuCotn**[®] (棉花)、**NuCotn33B**[®] (棉花)、**NatureGard**[®] (例如玉米)、**Protecta**[®]和**NewLeaf**[®] (马铃薯)。可提及的除草剂耐受性植物的实例包括以下列商品名市售的玉米变种、棉花变种和大豆变种:**Roundup Ready**[®] (耐受草甘膦,例如玉米、棉花、大豆)、**LibertyLink**[®] (耐受膦丝菌素,例如油菜)、**IMI**[®] (耐受咪唑啉酮)和**SCS**[®] (耐受磺酰脲),例如玉米。可提及的除草剂抗性植物(以常规方式培育的除草剂耐受性植物)包括以名称**Clearfield**[®]出售的变种(例如玉米)。

[0631] 所选实例的NMR数据:通式(I)的化合物的选定实例的¹H NMR数据以两种不同的方式表示,即(a)常规的NMR评价和说明或(b)根据下文所述方法以¹H NMR峰列表的形式。

[0632] a)常规的NMR说明

[0633] 实施例编号I-10:

[0634] ¹H NMR(CDCl₃, ppm): 1.20(d, 3H), 2.85(sext, 1H), 3.65(d, 3H), 3.70(s, 3H), 4.30(dd, 1H), 4.45(dd, 1H), 5.90(s, 1H), 6.95(m, 1H), 7.05(t, 1H), 7.20(t, 1H), 7.35(m, 1H), 7.45(t, 1H), 7.75(m, 1H), 8.10(s, 1H)。

[0635] 实施例编号I-12:

[0636] ¹H NMR(d₆-DMSO: δ, ppm): 3.55(s, 3H), 5.80(s, 1H), 7.25-7.35(m, 3H), 7.50(m, 1H), 7.60(t, 1H), 7.95(m, 1H), 8.20(d, 1H)。

[0637] 实施例编号I-13:

[0638] ¹H NMR(CDCl₃, ppm): 3.70(s, 3H), 3.85(s, 3H), 5.95(s, 1H), 7.15(t, 1H), 7.30(m, 1H), 7.45(m, 2H), 8.30(m, 1H), 8.50(m, 1H)。

[0639] 实施例编号I-18:

[0640] ¹H NMR(CDCl₃, ppm): 3.70(s, 3H), 3.85(s, 3H), 5.95(s, 1H), 7.15(t, 1H), 7.30(m, 1H), 7.45(m, 2H), 8.30(m, 1H), 8.50(m, 1H)。

[0641] 实施例编号I-63:

[0642] ¹H NMR(CDCl₃, ppm): 1.30(t, 3H), 2.70(t, 2H), 3.65(s, 3H), 3.85(m, 1H), 4.05(m, 1H), 4.50(t, 2H), 5.95(s, 1H), 6.95(dd, 1H), 7.05(dt, 1H), 7.20(t, 1H), 7.35(m, 1H), 7.45(dt, 1H), 7.75(dt, 1H), 8.10(d, 1H)。

[0643] 实施例编号I-64:

[0644] ¹H NMR(CDCl₃, ppm): 1.30(t, 3H), 2.70(t, 2H), 3.65(s, 3H), 3.85(m, 1H), 4.05(m, 1H), 4.50(t, 2H), 5.95(s, 1H), 6.95(dd, 1H), 7.05(dt, 1H), 7.20(t, 1H), 7.35(m, 1H), 7.45(dt, 1H), 7.75(dt, 1H), 8.10(d, 1H)。

[0645] b)NMR峰列表方法

[0646] 所选实例的¹H NMR数据以¹H NMR峰列表的形式表示。对于每个信号峰,首先列出以ppm计的δ值,然后在圆括号中列出信号强度。对于不同信号峰的δ值-信号强度数值对,通过

分号彼此间隔列出。

[0647] 因此,一个实例的峰列表采用以下形式:

[0648] δ_1 (强度₁); δ_2 (强度₂); ……; δ_i (强度_i); ……; δ_n (强度_n)

[0649] 尖锐信号的强度与NMR谱的打印实例中的以cm计的信号高度相关,并显示出信号强度的真实比例。在宽峰信号的情况下,可以显示信号的数个峰或中间部分及它们与谱图中的最强信号相比的相对强度。

[0650] 为了校准¹H NMR谱的化学位移,我们使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移,特别是在DMSO中测量的谱图的情况下。因此,四甲基硅烷峰可以但不一定在NMR峰列表中出现。

[0651] ¹H NMR峰的列表类似于常规¹H NMR打印图,因此,其通常含有在常规NMR说明中列出的所有峰。

[0652] 此外,如同常规¹H NMR的打印图,它们可显示出溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其同样构成本发明的部分内容)的信号和/或杂质的峰。

[0653] 在记录溶剂和/或水的 δ 范围内的化合物信号时,我们的¹H NMR峰的列表显示出通常的溶剂峰,例如在DMSO-D₆中的DMSO的峰和水的峰,其通常具有高的平均强度。

[0654] 所述目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比所述目标化合物(例如具有>90%的纯度)的峰更低的平均强度。

[0655] 此类立体异构体和/或杂质可以是特定的制备方法所特有的。因此在此情况下,通过参考“副产物指纹”,它们的峰可有助于确定我们的制备方法的再现性。

[0656] 通过已知方法(MestReC, ACD模拟,以及凭经验评估的预期值)计算目标化合物的峰的专业人员可视需要任选地使用额外的强度过滤器分离出目标化合物的峰。这种分离类似于常规¹H NMR说明中的相关峰挑选。

[0657] ¹H NMR峰列表的其他详情可见于Research Disclosure Database第564025号。

[0658]

I-01: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃):

δ= 8.1084 (1.7); 8.1064 (1.4); 8.1042 (1.4); 8.1022 (1.9); 7.7670 (0.9); 7.7607 (0.9); 7.7483 (1.0); 7.7457 (1.1); 7.7420 (1.1); 7.7395 (1.1); 7.7270 (1.0); 7.7208 (1.0); 7.4214 (0.7); 7.4170 (0.8); 7.4022 (1.2); 7.3978 (1.4); 7.3833 (0.8); 7.3789 (1.0); 7.3759 (0.5); 7.3591 (0.5); 7.3569 (0.7); 7.3551 (0.6); 7.3524 (0.6); 7.3506 (0.6); 7.3447 (0.8); 7.3430 (0.6); 7.3402 (0.6); 7.3384 (0.6); 7.3362 (0.7); 7.3317 (0.6); 7.3240 (0.6); 7.3195 (0.5); 7.2614 (26.1); 7.2282 (0.8); 7.2267 (0.9); 7.2247 (0.9); 7.2053 (1.3); 7.1897 (0.5); 7.1881 (0.6); 7.1864 (0.5); 7.0496 (0.9); 7.0464 (0.9); 7.0288 (0.9); 7.0250 (1.4); 7.0212 (0.9); 7.0037 (0.8); 7.0005 (0.8); 6.9465 (1.2); 6.9450 (1.3); 6.9391 (1.2); 6.9376 (1.2); 6.9254 (1.2); 6.9238 (1.2); 6.9179 (1.2); 6.9164 (1.1); 5.9638 (10.0); 4.3350 (1.0); 4.3323 (1.0); 4.3171 (3.2); 4.3146 (3.2); 4.2993 (3.3); 4.2968 (3.2); 4.2814 (1.1); 4.2791 (1.0); 4.0589 (1.4); 4.0528 (0.6); 4.0413 (1.4); 4.0351 (1.8); 4.0174 (1.8); 3.9997 (0.5); 3.9172 (0.5); 3.8996 (1.7); 3.8819 (1.8); 3.8757 (1.3); 3.8644 (0.6); 3.8581 (1.3); 1.7270 (3.8); 1.5555 (15.4); 1.3509 (6.2); 1.3332 (14.5); 1.3142 (16.0); 1.2963 (6.6); 0.0079 (1.1); -0.0002 (39.4); -0.0085 (1.1)

I-02: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃):

δ= 8.2765 (1.2); 8.2747 (1.3); 8.2727 (1.3); 8.2710 (1.3); 8.2649 (1.3); 8.2631 (1.3); 8.2611 (1.3); 8.2595 (1.2); 7.4813 (0.8); 7.4776 (0.9); 7.4607 (1.3); 7.4586 (1.2); 7.4570 (1.4); 7.4550 (1.0); 7.4380 (1.2); 7.4342 (1.2); 7.3492 (1.2); 7.3401 (1.4); 7.3376 (1.3); 7.3285 (2.1); 7.3195 (1.0); 7.3169 (1.3); 7.3114 (3.1); 7.3101 (2.3); 7.3079 (1.3); 7.3061 (1.3); 7.2949 (1.8); 7.2895 (6.6); 7.2845 (1.2); 7.2606 (54.0); 7.2570 (8.0); 7.2512 (1.8); 7.2403 (1.1); 7.2349 (2.9); 7.2271 (0.6); 6.0342 (9.2); 4.3190 (1.1); 4.3172 (1.1); 4.3011 (3.5); 4.2994 (3.3); 4.2832 (3.6); 4.2817 (3.3); 4.2653 (1.2); 4.0504 (1.4); 4.0443 (0.6); 4.0327 (1.4); 4.0265 (1.8); 4.0088 (1.8); 3.9912 (0.5); 3.9116 (0.6); 3.8941 (1.6); 3.8764 (1.6); 3.8702 (1.2); 3.8589 (0.5); 3.8525 (1.2); 1.5459 (11.7); 1.3375 (5.8); 1.3198 (13.4); 1.3182 (10.4); 1.3019 (7.7); 1.3003 (16.0); 1.2825 (6.6); 0.9234 (0.5); 0.9066 (0.5); 0.0080 (1.9); -0.0002 (77.3); -0.0085 (2.3)

I-03: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃):

δ= 8.2867 (0.6); 8.2848 (0.7); 8.2829 (0.7); 8.2812 (0.6); 8.2751 (0.6); 8.2733 (0.7); 8.2713 (0.7); 8.2697 (0.6); 7.4798 (0.5); 7.4629 (0.7); 7.4608 (0.6); 7.4591 (0.8); 7.4571 (0.6); 7.4402 (0.7); 7.4364 (0.7); 7.3555 (0.7); 7.3464 (0.8); 7.3439 (0.7); 7.3348 (1.2); 7.3257 (0.5); 7.3233 (0.6); 7.3160 (1.8); 7.3145 (1.5); 7.3106 (0.7); 7.2996 (0.9); 7.2941 (3.6); 7.2889 (0.6); 7.2608 (27.0); 7.2577 (3.9); 7.2520 (1.0); 7.2410 (0.7); 7.2368 (1.2); 7.2357 (1.7); 6.0273 (4.8); 3.8444 (14.4); 3.6785 (15.7); 2.9650 (5.6); 2.7764 (0.7); 1.5444 (16.0);

[0659]

0.0079 (1.0); -0.0002 (40.5); -0.0085 (1.1)
I-04: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1127 (0.9); 8.1106 (0.7); 8.1085 (0.7); 8.1065 (0.9); 7.7491 (0.5); 7.7465 (0.6); 7.7429 (0.6); 7.7403 (0.6); 7.7279 (0.5); 7.4115 (0.6); 7.4072 (0.7); 7.3883 (0.5); 7.2606 (29.5); 7.2294 (0.5); 7.2097 (0.6); 7.0296 (0.7); 6.9501 (0.6); 6.9486 (0.6); 6.9427 (0.6); 6.9411 (0.6); 6.9290 (0.6); 6.9274 (0.6); 6.9215 (0.6); 6.9199 (0.6); 5.9592 (5.0); 3.8576 (14.6); 3.6882 (16.0); 1.9660 (1.0); 1.7396 (0.9); 1.5425 (12.4); 0.0079 (1.2); -0.0002 (43.4); -0.0085 (1.2)
I-05: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2427 (0.6); 8.2410 (0.7); 8.2391 (0.7); 8.2373 (0.6); 8.2311 (0.7); 8.2294 (0.7); 8.2275 (0.7); 8.2257 (0.7); 8.1461 (0.8); 8.1441 (0.7); 8.1419 (0.7); 8.1398 (1.0); 7.8635 (0.5); 7.8511 (0.5); 7.8486 (0.6); 7.8448 (0.6); 7.8423 (0.7); 7.8299 (0.5); 7.8236 (0.6); 7.5245 (0.5); 7.5075 (0.7); 7.5049 (0.7); 7.5039 (0.8); 7.5014 (0.6); 7.4844 (0.7); 7.4807 (0.7); 7.3664 (0.6); 7.3574 (0.7); 7.3548 (0.7); 7.3458 (1.1); 7.3367 (0.5); 7.3341 (0.6); 7.2614 (18.2); 6.9702 (0.6); 6.9686 (0.7); 6.9627 (0.6); 6.9611 (0.7); 6.9490 (0.6); 6.9473 (0.7); 6.9415 (0.6); 6.9399 (0.6); 6.0108 (5.2); 3.8525 (14.3); 3.6874 (16.0); 2.9651 (9.0); 2.7762 (0.9); 1.5513 (1.1); 0.0080 (0.6); -0.0002 (24.4); -0.0085 (0.8)
I-06: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2927 (0.7); 8.2910 (0.8); 8.2890 (0.8); 8.2873 (0.7); 8.2811 (0.7); 8.2794 (0.8); 8.2774 (0.8); 8.2758 (0.7); 7.4475 (0.5); 7.4437 (0.5); 7.4268 (0.8); 7.4248 (0.7); 7.4230 (0.8); 7.4212 (0.6); 7.4042 (0.7); 7.4005 (0.7); 7.3381 (1.3); 7.3360 (1.2); 7.3341 (1.3); 7.3317 (0.8); 7.3290 (1.2); 7.3248 (1.2); 7.3210 (3.3); 7.3186 (3.0); 7.3137 (3.8); 7.3105 (2.5); 7.3066 (1.7); 7.3017 (2.1); 7.2927 (0.7); 7.2606 (16.9); 6.0485 (5.0); 3.8463 (14.9); 3.6839 (16.0); 1.5440 (2.2); 0.0080 (0.8); -0.0002 (27.4); -0.0085 (0.8)
I-06: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2924 (0.6); 8.2906 (0.7); 8.2886 (0.7); 8.2869 (0.6); 8.2808 (0.6); 8.2790 (0.7); 8.2770 (0.7); 8.2753 (0.6); 7.4436 (0.5); 7.4267 (0.8); 7.4247 (0.6); 7.4229 (0.8); 7.4210 (0.6); 7.4041 (0.7); 7.4003 (0.7); 7.3379 (1.1); 7.3357 (1.0); 7.3340 (1.1); 7.3315 (0.6); 7.3287 (1.1); 7.3247 (1.0); 7.3207 (3.0); 7.3183 (2.7); 7.3135 (3.5); 7.3102 (2.2); 7.3064 (1.5); 7.3015 (1.9); 7.2926 (0.6); 7.2608 (9.0); 6.0484 (4.8); 3.8459 (14.7); 3.6837 (16.0); 1.5521 (1.3); -0.0002 (14.2)
I-07: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1369 (0.6); 8.1351 (0.7); 8.1332 (0.7); 8.1315 (0.7); 8.1252 (0.7); 8.1234 (0.8); 8.1215 (0.7); 8.1199 (0.7); 7.5255 (0.6); 7.5218 (0.6); 7.5049 (0.7); 7.5015 (1.0); 7.4982 (0.6); 7.4813 (0.7); 7.4776 (0.7); 7.4227 (0.6); 7.4071 (0.6); 7.3038 (0.7); 7.2950 (0.8); 7.2922 (0.7); 7.2833 (1.2); 7.2744 (0.6); 7.2716 (0.6); 7.2608 (17.5); 6.9259 (0.6); 6.7674 (0.5); 6.0087 (5.0); 3.8530 (14.6); 3.6917 (16.0); 2.7761 (4.8); 1.5462 (4.6); 0.0079 (0.7); -0.0002 (26.1); -0.0085 (0.8)
I-08: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1254 (1.2); 8.1237 (1.3); 8.1218 (1.3); 8.1201 (1.2); 8.1138 (1.2); 8.1121 (1.4); 8.1102 (1.4); 8.1086 (1.2); 7.5234 (1.0); 7.5196 (1.1); 7.5027 (1.3); 7.4994 (1.8); 7.4961 (1.1); 7.4792 (1.2); 7.4754 (1.2); 7.4472 (0.7); 7.4315 (0.8); 7.4260 (1.1); 7.4103 (1.1); 7.4057 (0.9); 7.3899 (0.8); 7.2971 (1.2); 7.2883 (1.3); 7.2855 (1.2); 7.2766 (2.1); 7.2677 (1.1); 7.2649 (1.2); 7.2607 (26.9); 7.2561 (1.5); 6.9517 (0.5); 6.9492 (0.6); 6.9454 (0.6); 6.9430 (0.6); 6.9319 (0.7); 6.9297 (1.0); 6.9275 (0.8); 6.9256 (0.8); 6.9235 (1.0); 6.9103 (0.5); 6.9077 (0.5); 6.9040 (0.6); 6.9016 (0.5); 6.7860 (0.8); 6.7798 (0.8); 6.7640 (0.9); 6.7612 (1.0); 6.7579 (0.9); 6.7551 (0.9); 6.7393 (0.8); 6.7332 (0.7); 6.0211 (9.4); 4.3263 (1.4); 4.3086 (4.5); 4.2908 (4.8); 4.2730 (1.6); 4.0671 (1.3); 4.0610 (0.6); 4.0495 (1.4); 4.0432 (1.8); 4.0255 (1.8); 4.0079 (0.6); 3.9057 (1.6); 3.8881 (1.7); 3.8818 (1.3); 3.8705 (0.6); 3.8641 (1.3); 1.5467 (11.0); 1.3445 (6.0); 1.3267 (15.5); 1.3083 (16.0); 1.2903 (6.3); 0.0080 (1.0); -0.0002 (38.1); -0.0085 (1.2)
I-09: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 7.2716 (0.9); 7.2602 (36.6); 7.2521 (0.5); 7.0626 (0.5); 7.0384 (0.5); 5.9346 (2.7); 4.3107 (1.6); 4.2929 (1.7); 4.2751 (0.6); 4.0317 (0.5); 3.8935 (0.5); 3.8759 (0.5); 1.5358 (16.0);

[0660]

1.3462 (1.8); 1.3284 (5.3); 1.3104 (5.3); 1.2924 (1.8); 0.0080 (1.8); 0.0057 (0.7); -0.0002 (58.0); -0.0084 (1.5)
I-11: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 7.3085 (0.5); 7.3029 (0.8); 7.2928 (0.6); 7.2880 (0.8); 7.2822 (1.5); 7.2721 (0.9); 7.2667 (0.8); 7.2604 (18.8); 7.1597 (0.8); 7.1567 (0.8); 7.1542 (0.8); 7.1514 (0.8); 7.1383 (0.6); 7.1354 (0.6); 7.1327 (0.6); 7.1299 (0.6); 7.0678 (1.2); 7.0623 (1.0); 7.0437 (1.2); 7.0381 (1.1); 6.9269 (0.7); 6.9207 (0.7); 6.8368 (0.6); 6.8306 (0.5); 6.8148 (0.7); 6.8124 (0.7); 6.8087 (0.6); 6.8064 (0.6); 6.7906 (0.6); 5.9307 (5.4); 3.8537 (15.6); 3.6829 (16.0); 1.7268 (1.3); 1.5371 (6.3); 0.0078 (1.0); -0.0002 (28.7); -0.0085 (0.8)
I-14: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2440 (0.7); 8.2421 (0.8); 8.2403 (0.8); 8.2386 (0.7); 8.2323 (0.7); 8.2306 (0.8); 8.2287 (0.8); 8.2270 (0.7); 8.1452 (1.0); 8.1432 (0.7); 8.1409 (0.8); 8.1390 (1.0); 7.8699 (0.5); 7.8637 (0.5); 7.8512 (0.6); 7.8487 (0.6); 7.8450 (0.6); 7.8425 (0.6); 7.8301 (0.6); 7.8238 (0.6); 7.5251 (0.6); 7.5214 (0.6); 7.5044 (0.8); 7.5009 (0.8); 7.4984 (0.6); 7.4814 (0.7); 7.4776 (0.7); 7.3649 (0.7); 7.3559 (0.8); 7.3533 (0.7); 7.3443 (1.2); 7.3352 (0.6); 7.3326 (0.6); 7.3236 (0.5); 7.2616 (13.1); 6.9691 (0.7); 6.9676 (0.7); 6.9616 (0.7); 6.9601 (0.7); 6.9479 (0.7); 6.9463 (0.7); 6.9404 (0.7); 6.9389 (0.7); 5.9799 (5.5); 4.3373 (0.6); 4.3361 (0.6); 4.3194 (2.1); 4.3184 (2.0); 4.3015 (2.2); 4.3007 (2.1); 4.2835 (0.8); 3.6874 (16.0); 1.5584 (2.2); 1.3368 (3.7); 1.3190 (7.8); 1.3011 (3.6); -0.0002 (16.6)
I-15: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1990 (1.6); 8.1948 (1.3); 8.1930 (1.4); 8.0201 (1.4); 8.0184 (1.4); 8.0170 (1.3); 8.0147 (1.3); 8.0132 (1.3); 8.0115 (1.2); 7.7431 (0.6); 7.7369 (0.6); 7.7246 (0.9); 7.7220 (0.9); 7.7184 (0.8); 7.7158 (0.7); 7.7035 (0.7); 7.6973 (0.6); 7.6456 (0.6); 7.6385 (0.6); 7.6289 (0.8); 7.6237 (0.9); 7.6221 (0.9); 7.6167 (0.7); 7.6071 (0.7); 7.6000 (0.6); 7.2628 (5.5); 7.0377 (1.0); 7.0315 (0.9); 7.0302 (0.9); 7.0165 (1.0); 7.0103 (0.8); 7.0089 (0.8); 6.9499 (1.0); 6.9415 (1.0); 6.9280 (1.0); 6.9208 (0.9); 6.9197 (0.9); 5.9424 (5.1); 5.3007 (2.1); 3.8696 (15.2); 3.6906 (16.0); 1.5591 (0.9); 0.0699 (2.9); -0.0002 (7.3)
I-16: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4858 (1.7); 8.4789 (1.7); 8.2703 (0.9); 8.2667 (1.6); 8.2632 (0.9); 7.4544 (0.5); 7.4502 (0.6); 7.4472 (0.7); 7.4427 (0.7); 7.4403 (0.8); 7.4380 (0.7); 7.4358 (0.9); 7.4339 (1.2); 7.4299 (0.7); 7.4252 (0.7); 7.4207 (0.7); 7.4180 (1.1); 7.4136 (1.1); 7.3090 (0.5); 7.3048 (1.1); 7.3007 (0.6); 7.2888 (0.7); 7.2846 (0.6); 7.2620 (6.3); 7.1818 (0.7); 7.1780 (0.7); 7.1615 (1.1); 7.1577 (1.2); 5.9423 (5.1); 3.8614 (14.7); 3.6875 (16.0); 1.5650 (0.9); 1.5022 (1.8); 0.0698 (0.9); -0.0002 (8.4)
I-17: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4859 (1.9); 8.4790 (1.9); 8.2755 (1.1); 8.2720 (1.8); 8.2684 (1.0); 7.4547 (0.7); 7.4501 (0.8); 7.4476 (1.0); 7.4432 (1.0); 7.4327 (0.8); 7.4281 (1.2); 7.4259 (1.8); 7.4217 (1.2); 7.4096 (0.6); 7.4054 (0.6); 7.3144 (0.5); 7.3102 (0.5); 7.2983 (0.6); 7.2942 (1.2); 7.2901 (0.6); 7.2782 (0.7); 7.2740 (0.6); 7.2618 (5.7); 7.1726 (0.8); 7.1688 (0.7); 7.1524 (1.2); 7.1486 (1.1); 7.1321 (0.5); 5.9415 (5.1); 5.3000 (0.9); 3.8600 (14.8); 3.6864 (16.0); 1.5647 (0.8); 0.0698 (1.3); -0.0002 (7.8)
I-19: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4835 (1.8); 8.4766 (1.7); 8.2772 (1.0); 8.2735 (1.7); 8.2699 (0.9); 7.4388 (0.6); 7.4343 (0.7); 7.4312 (0.9); 7.4270 (1.0); 7.4169 (0.7); 7.4124 (1.0); 7.4102 (1.7); 7.4060 (1.1); 7.3940 (0.6); 7.3898 (0.6); 7.2921 (0.5); 7.2880 (0.5); 7.2761 (0.6); 7.2719 (1.2); 7.2677 (0.8); 7.2617 (6.4); 7.2559 (0.7); 7.2517 (0.6); 7.1566 (0.7); 7.1528 (0.7); 7.1364 (1.2); 7.1326 (1.2); 5.9330 (5.2); 5.3000 (0.9); 3.8581 (15.1); 3.6894 (0.5); 3.6842 (16.0); 1.5625 (1.2); 0.0696 (3.2); -0.0002 (8.9)
I-20: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1220 (0.8); 7.7551 (0.7); 7.7528 (0.7); 7.7489 (0.7); 7.7467 (0.6); 7.7341 (0.5); 7.4540 (0.5); 7.4390 (0.9); 7.4351 (0.9); 7.4202 (0.6); 7.4159 (0.6); 7.3485 (0.5); 7.2617 (8.7); 7.2359 (0.7); 7.2343 (0.7); 7.2160 (1.0); 7.0503 (0.6); 7.0471 (0.6); 7.0294 (0.6); 7.0256 (1.0); 7.0219 (0.6); 7.0044 (0.6); 6.9492 (0.5); 6.9425 (0.5); 6.9280 (0.5); 5.9063 (5.5); 5.3001 (0.7); 4.5320 (2.0); 4.5157 (4.3); 4.4995 (2.1); 3.6783 (16.0); 3.6596 (14.7); 2.7353

[0661]

(1.9); 2.7190 (3.9); 2.7028 (1.8); 1.5563 (0.8); -0.0002 (12.2); -0.0029 (0.6)
I-21: ¹ H NMR(600.3 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1215 (3.4); 8.1173 (3.9); 8.1118 (1.0); 7.7659 (1.3); 7.7617 (1.4); 7.7534 (1.7); 7.7518 (1.8); 7.7492 (1.8); 7.7476 (2.0); 7.7431 (0.6); 7.7393 (1.5); 7.7351 (1.4); 7.7290 (0.4); 7.4570 (0.3); 7.4542 (0.4); 7.4504 (1.2); 7.4475 (1.4); 7.4443 (0.7); 7.4414 (0.8); 7.4375 (2.2); 7.4348 (2.3); 7.4287 (0.5); 7.4249 (1.4); 7.4220 (1.4); 7.3698 (0.8); 7.3669 (0.8); 7.3645 (0.4); 7.3617 (1.0); 7.3587 (1.0); 7.3571 (1.3); 7.3561 (1.4); 7.3544 (1.4); 7.3490 (1.3); 7.3479 (1.3); 7.3462 (1.2); 7.3450 (1.1); 7.3434 (1.1); 7.3405 (1.0); 7.3353 (0.9); 7.3324 (0.8); 7.2615 (32.0); 7.2359 (0.4); 7.2298 (1.5); 7.2286 (1.6); 7.2229 (0.8); 7.2157 (2.5); 7.2101 (0.4); 7.2041 (1.1); 7.2028 (1.1); 7.0503 (0.4); 7.0483 (0.4); 7.0423 (1.5); 7.0402 (1.5); 7.0365 (0.5); 7.0339 (0.7); 7.0314 (0.6); 7.0284 (1.5); 7.0259 (2.5); 7.0235 (1.6); 7.0198 (0.5); 7.0176 (0.4); 7.0117 (1.4); 7.0096 (1.3); 6.9476 (0.6); 6.9432 (2.5); 6.9386 (2.1); 6.9340 (0.6); 6.9290 (2.4); 6.9245 (2.0); 5.9063 (19.2); 5.3001 (3.2); 4.5265 (5.5); 4.5157 (12.1); 4.5048 (5.8); 3.8707 (0.3); 3.6782 (45.8); 3.6599 (50.0); 3.2490 (0.3); 2.7298 (6.1); 2.7190 (12.4); 2.7082 (5.9); 1.5553 (2.6); 1.2552 (0.4); 0.1573 (0.4); 0.1265 (0.4); -0.0001 (3.6)
I-22: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1122 (1.1); 8.1060 (1.2); 7.7690 (0.5); 7.7628 (0.5); 7.7503 (0.6); 7.7479 (0.7); 7.7441 (0.6); 7.7416 (0.6); 7.7292 (0.6); 7.7229 (0.5); 7.4144 (0.8); 7.4101 (0.9); 7.3956 (0.5); 7.3912 (0.6); 7.2607 (12.8); 7.2276 (0.6); 7.2080 (0.8); 7.0509 (0.6); 7.0478 (0.5); 7.0301 (0.5); 7.0263 (0.9); 7.0226 (0.6); 6.9476 (0.8); 6.9414 (0.8); 6.9276 (0.7); 6.9201 (0.7); 5.9187 (5.5); 5.2999 (0.6); 4.3424 (0.8); 4.3248 (2.6); 4.3069 (2.7); 4.2891 (0.9); 3.6886 (16.0); 1.5438 (4.2); 1.3406 (3.7); 1.3228 (7.7); 1.3050 (3.6); 0.0080 (0.6); -0.0002 (19.2); -0.0085 (0.5)
I-23: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1121 (1.1); 8.1058 (1.1); 7.7691 (0.5); 7.7628 (0.5); 7.7503 (0.6); 7.7478 (0.6); 7.7441 (0.6); 7.7416 (0.6); 7.7291 (0.6); 7.7229 (0.5); 7.4143 (0.7); 7.4101 (0.8); 7.3955 (0.5); 7.3912 (0.6); 7.2607 (13.0); 7.2292 (0.5); 7.2275 (0.5); 7.2080 (0.8); 7.0509 (0.5); 7.0476 (0.5); 7.0301 (0.5); 7.0263 (0.8); 7.0225 (0.6); 6.9490 (0.7); 6.9475 (0.7); 6.9415 (0.7); 6.9400 (0.7); 6.9277 (0.7); 6.9262 (0.7); 6.9202 (0.7); 6.9188 (0.6); 5.9187 (5.6); 5.3000 (0.6); 4.3424 (0.8); 4.3246 (2.4); 4.3068 (2.6); 4.2890 (0.9); 3.6886 (16.0); 1.5438 (4.6); 1.3406 (3.7); 1.3228 (7.8); 1.3050 (3.6); 0.0080 (0.5); -0.0002 (19.4); -0.0085 (0.6)
I-24: ¹ H-NMR(400.6 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.2143 (1.3); 8.2081 (1.4); 7.9769 (0.5); 7.9707 (0.5); 7.9558 (0.7); 7.9495 (0.7); 7.9364 (0.6); 7.9301 (0.5); 7.6087 (0.5); 7.5937 (0.9); 7.5893 (1.0); 7.5741 (0.6); 7.5698 (0.6); 7.3467 (0.6); 7.3438 (0.7); 7.3277 (0.9); 7.3243 (1.4); 7.3199 (0.8); 7.3051 (0.6); 7.2995 (1.4); 7.2941 (1.6); 7.2782 (0.9); 7.2729 (1.2); 7.2711 (1.1); 5.7921 (7.4); 3.6178 (1.3); 3.6156 (0.7); 3.6116 (0.7); 3.6094 (0.6); 3.6075 (1.0); 3.6012 (2.9); 3.5951 (1.0); 3.5909 (0.7); 3.5871 (1.2); 3.5846 (1.3); 3.5544 (16.0); 3.3210 (5.2); 2.5242 (0.7); 2.5195 (1.1); 2.5108 (13.4); 2.5062 (29.6); 2.5016 (41.2); 2.4970 (29.0); 2.4924 (12.7); 1.7761 (1.2); 1.7685 (1.0); 1.7642 (0.6); 1.7595 (3.5); 1.7548 (0.6); 1.7506 (1.0); 1.7430 (1.1); 1.3556 (2.5); -0.0002 (17.7); -0.0085 (0.5)
I-25: ¹ H-NMR(400.6 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.2145 (1.5); 8.2082 (1.5); 7.9770 (0.6); 7.9708 (0.6); 7.9560 (0.8); 7.9497 (0.8); 7.9364 (0.6); 7.9301 (0.6); 7.6088 (0.6); 7.5937 (1.0); 7.5894 (1.2); 7.5742 (0.6); 7.5699 (0.6); 7.5040 (0.5); 7.4988 (0.5); 7.4911 (0.5); 7.4839 (0.5); 7.3469 (0.7); 7.3439 (0.8); 7.3278 (1.0); 7.3244 (1.5); 7.3202 (0.9); 7.3051 (0.7); 7.2997 (1.6); 7.2941 (1.7); 7.2785 (1.0); 7.2729 (1.4); 5.7924 (6.8); 3.6178 (1.2); 3.6156 (0.8); 3.6115 (0.8); 3.6075 (1.0); 3.6012 (2.7); 3.5951 (0.9); 3.5909 (0.7); 3.5870 (1.0); 3.5846 (1.1); 3.5546 (16.0); 3.3205 (4.3); 2.5241 (0.9); 2.5194 (1.3); 2.5108 (14.5); 2.5062 (31.4); 2.5016 (43.5); 2.4970 (30.4); 2.4925 (13.4); 1.7760 (1.1); 1.7683 (1.1); 1.7595 (3.3); 1.7546 (0.7); 1.7507 (1.0); 1.7430 (1.0); 1.3556 (2.7); -0.0002 (14.5)
I-26: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1826 (1.1); 8.1763 (1.0); 7.6998 (0.6); 7.6936 (0.5); 7.6811 (0.6); 7.6786 (0.7); 7.6749 (0.6); 7.6724 (0.6); 7.6599 (0.6); 7.6537 (0.5); 7.3269 (1.7); 7.3229 (0.7); 7.3190 (0.6);

[0662]

7.3126 (1.0); 7.3085 (2.4); 7.3051 (1.6); 7.3007 (1.0); 7.2902 (0.7); 7.2875 (0.6); 7.2604 (15.6); 7.1577 (1.6); 7.1531 (1.6); 7.1476 (0.5); 7.1419 (0.7); 7.1369 (1.5); 7.1334 (1.4); 6.9657 (0.7); 6.9596 (0.7); 6.9445 (0.7); 6.9383 (0.7); 5.9867 (5.1); 3.8675 (15.0); 3.6982 (16.0); 1.5414 (5.3); 0.0079 (0.9); -0.0002 (23.8); -0.0085 (0.6)
I-27: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2605 (10.2); 7.1919 (0.5); 7.1897 (0.6); 7.1464 (1.0); 7.1295 (0.8); 7.1268 (1.3); 7.1218 (1.0); 7.1049 (0.7); 7.1006 (0.7); 7.0800 (0.5); 7.0752 (0.7); 7.0737 (0.7); 7.0549 (0.9); 5.9572 (4.9); 5.2998 (2.3); 3.8510 (14.8); 3.6805 (16.0); 2.1997 (3.4); 2.1943 (3.4); 1.5424 (4.4); -0.0002 (14.9)
I-28: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4852 (1.9); 8.4783 (1.9); 8.2941 (1.1); 8.2904 (1.8); 8.2866 (1.0); 7.4349 (0.6); 7.4304 (0.7); 7.4280 (0.7); 7.4236 (0.6); 7.4130 (0.6); 7.4085 (0.7); 7.4061 (0.6); 7.4017 (0.6); 7.2612 (7.8); 7.1937 (0.5); 7.1802 (0.7); 7.1737 (0.5); 7.0494 (0.5); 7.0399 (0.6); 7.0057 (0.6); 6.9938 (0.6); 6.9828 (0.9); 6.9710 (0.9); 5.9357 (5.2); 3.8652 (15.3); 3.6867 (16.0); 1.5644 (0.8); 0.8818 (0.6); -0.0002 (12.1)
I-29: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4874 (1.6); 8.4805 (1.6); 8.2941 (0.9); 8.2903 (1.6); 8.2867 (0.9); 7.4498 (0.6); 7.4454 (0.6); 7.4429 (0.7); 7.4385 (0.6); 7.4278 (0.6); 7.4234 (0.7); 7.4210 (0.6); 7.4165 (0.6); 7.2615 (6.7); 7.2011 (0.6); 7.0195 (0.5); 7.0077 (0.5); 6.9966 (0.8); 6.9849 (0.8); 5.9444 (5.1); 3.8668 (15.2); 3.6889 (16.0); -0.0002 (10.0)
I-30: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1876 (1.0); 8.1856 (0.8); 8.1834 (0.8); 8.1813 (1.0); 7.7057 (0.5); 7.6995 (0.5); 7.6871 (0.6); 7.6845 (0.6); 7.6808 (0.6); 7.6783 (0.6); 7.6659 (0.6); 7.6596 (0.6); 7.3192 (1.6); 7.3152 (0.7); 7.3112 (0.6); 7.3049 (0.8); 7.3008 (2.2); 7.2974 (1.6); 7.2930 (1.0); 7.2826 (0.7); 7.2799 (0.5); 7.2615 (5.8); 7.1472 (1.6); 7.1425 (1.5); 7.1314 (0.7); 7.1263 (1.4); 7.1228 (1.4); 6.9655 (0.7); 6.9641 (0.7); 6.9580 (0.7); 6.9565 (0.7); 6.9443 (0.6); 6.9429 (0.7); 6.9368 (0.7); 6.9353 (0.6); 5.9882 (5.2); 3.8665 (15.2); 3.6975 (16.0); 1.5569 (2.0); -0.0002 (8.2)
I-31: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4479 (1.6); 8.4412 (1.6); 8.3067 (1.8); 7.3483 (0.7); 7.3425 (0.8); 7.3372 (0.6); 7.3260 (0.7); 7.3207 (0.8); 7.3148 (0.6); 7.2609 (10.1); 7.1618 (0.6); 7.1550 (0.6); 7.1478 (1.0); 7.1411 (0.6); 7.1342 (0.5); 7.1267 (0.5); 7.0040 (0.6); 6.9942 (0.8); 6.9822 (1.0); 6.9694 (0.8); 6.9588 (1.0); 6.9467 (0.9); 5.9490 (5.2); 3.8495 (15.4); 3.6600 (16.0); 1.6010 (0.6); 1.5940 (0.6); 1.5801 (1.1); 1.5672 (1.1); 1.5599 (0.9); 0.8140 (1.6); 0.8066 (1.2); 0.7930 (1.5); 0.7829 (1.4); 0.7752 (1.6); 0.7689 (1.8); 0.7625 (1.5); 0.7577 (1.2); -0.0002 (15.6); -0.0085 (0.5)
I-32: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5250 (2.1); 8.5186 (2.0); 8.3206 (2.4); 7.4933 (0.9); 7.4886 (1.2); 7.4826 (0.8); 7.4716 (0.9); 7.4670 (1.2); 7.4610 (0.8); 7.2609 (6.8); 7.2280 (0.6); 7.2203 (0.7); 7.2137 (0.7); 7.2074 (1.1); 7.2005 (0.8); 7.1940 (0.7); 7.1863 (0.7); 7.0830 (0.6); 7.0775 (0.7); 7.0697 (0.8); 7.0602 (0.8); 7.0515 (0.8); 7.0215 (0.8); 7.0097 (0.8); 6.9985 (1.2); 6.9867 (1.2); 6.9763 (0.5); 5.9588 (6.2); 5.2998 (0.6); 3.7174 (16.0); 1.4321 (2.4); 0.8818 (0.5); -0.0002 (10.4); -0.0007 (10.6)
I-33: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4858 (1.9); 8.4791 (2.0); 8.2903 (2.3); 7.4508 (0.7); 7.4441 (1.0); 7.4398 (0.8); 7.4288 (0.7); 7.4244 (1.0); 7.4220 (1.0); 7.4179 (0.8); 7.2610 (9.2); 7.2259 (0.5); 7.2184 (0.6); 7.2119 (0.6); 7.2046 (1.0); 7.1986 (0.7); 7.1917 (0.6); 7.1840 (0.6); 7.0623 (0.8); 7.0522 (0.7); 7.0426 (0.6); 7.0157 (0.7); 7.0038 (0.7); 6.9927 (1.0); 6.9809 (1.0); 5.9037 (5.4); 4.3508 (0.9); 4.3330 (2.8); 4.3152 (2.8); 4.2977 (1.0); 3.6896 (16.0); 1.5662 (0.8); 1.3504 (3.8); 1.3326 (7.9); 1.3148 (3.8); 0.0077 (0.5); -0.0002 (13.9)
I-34: ¹ H-NMR(400.6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 13.4162 (0.7); 8.6184 (2.3); 8.6115 (2.4); 8.3661 (1.3); 8.3619 (2.4); 8.3580 (1.2); 7.7899 (0.7); 7.7855 (0.8); 7.7830 (0.8); 7.7786 (0.7); 7.7660 (0.7); 7.7616 (0.8); 7.7591 (0.7); 7.7547 (0.7); 7.4690 (0.7); 7.4650 (0.6); 7.3446 (0.5); 7.3380 (1.1); 7.3331 (0.6); 7.3262

[0663]

(1.4); 7.3221 (1.1); 7.3174 (0.9); 7.3052 (0.8); 5.7460 (7.0); 3.5314 (16.0); 3.3209 (2.5); 2.5413 (1.6); 2.5197 (0.6); 2.5109 (10.3); 2.5064 (22.9); 2.5018 (32.4); 2.4971 (23.0); 2.4926 (10.3); 1.6916 (0.5); 1.6835 (0.6); 1.6706 (1.1); 1.6575 (0.6); 1.6496 (0.6); 0.7690 (0.5); 0.7648 (0.6); 0.7580 (1.8); 0.7541 (0.8); 0.7482 (0.8); 0.7436 (0.5); 0.7369 (1.8); 0.7333 (0.8); 0.7279 (0.6); 0.6347 (0.8); 0.6303 (0.6); 0.6216 (0.8); 0.6172 (0.6); 0.6006 (0.7); 0.5951 (0.8); 0.5877 (0.7); 0.5822 (0.7); 0.0081 (0.5); -0.0002 (18.1); -0.0085 (0.5)

I-35: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 9.0565 (2.1); 9.0530 (2.0); 8.4051 (2.0); 8.3988 (2.0); 8.2444 (1.3); 8.2382 (1.2); 8.0212 (1.4); 8.0175 (1.4); 8.0148 (1.4); 8.0112 (1.2); 7.8671 (0.6); 7.8609 (0.6); 7.8482 (0.7); 7.8460 (0.7); 7.8421 (0.7); 7.8399 (0.7); 7.8272 (0.6); 7.8211 (0.6); 7.2606 (24.7); 7.0383 (0.8); 7.0310 (0.8); 7.0172 (0.8); 7.0098 (0.8); 6.0073 (5.2); 3.8961 (15.3); 3.7202 (16.0); 1.5428 (6.9); 0.0078 (1.2); -0.0002 (35.2); -0.0086 (1.1)

I-36: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 9.0570 (1.9); 9.0535 (1.9); 8.4020 (1.9); 8.3956 (1.9); 8.2350 (1.2); 8.2288 (1.2); 8.0138 (1.3); 8.0102 (1.4); 8.0075 (1.4); 8.0038 (1.3); 7.8608 (0.6); 7.8546 (0.6); 7.8421 (0.7); 7.8398 (0.7); 7.8359 (0.6); 7.8336 (0.7); 7.8210 (0.6); 7.8148 (0.6); 7.2622 (7.3); 7.0350 (0.8); 7.0289 (0.8); 7.0277 (0.8); 7.0139 (0.8); 7.0078 (0.7); 7.0065 (0.7); 6.0044 (5.4); 3.8959 (15.4); 3.7191 (16.0); 1.5638 (1.2); -0.0002 (10.1)

I-37: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.4468 (1.6); 8.4400 (1.6); 8.3115 (1.0); 8.3077 (1.6); 8.3040 (0.9); 7.3500 (0.6); 7.3456 (0.7); 7.3432 (0.6); 7.3389 (0.6); 7.3276 (0.6); 7.3232 (0.7); 7.3208 (0.6); 7.3164 (0.6); 7.2615 (7.8); 7.1535 (0.8); 7.0014 (0.5); 6.9916 (0.7); 6.9833 (0.5); 6.9811 (0.6); 6.9787 (0.7); 6.9665 (0.7); 6.9558 (0.8); 6.9437 (0.8); 5.9131 (5.4); 4.3363 (0.6); 4.3317 (0.6); 4.3184 (1.7); 4.3139 (1.7); 4.3005 (1.8); 4.2962 (1.7); 4.2827 (0.6); 4.2784 (0.5); 3.6605 (16.0); 1.5964 (0.6); 1.5876 (0.5); 1.5798 (1.3); 1.5741 (0.7); 1.5672 (0.5); 1.5621 (0.7); 1.3434 (3.8); 1.3255 (7.9); 1.3077 (3.7); 0.8105 (1.6); 0.7909 (3.6); 0.7839 (0.9); 0.7813 (0.8); 0.7777 (2.7); -0.0002 (11.1)

I-38: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.2474 (0.6); 8.2457 (0.7); 8.2438 (0.8); 8.2421 (0.7); 8.2358 (0.7); 8.2340 (0.8); 8.2322 (0.8); 8.2305 (0.7); 8.1388 (1.0); 8.1369 (0.8); 8.1347 (0.8); 8.1325 (1.0); 7.8627 (0.5); 7.8565 (0.5); 7.8441 (0.6); 7.8415 (0.6); 7.8378 (0.6); 7.8353 (0.6); 7.8228 (0.6); 7.8166 (0.6); 7.5366 (0.5); 7.5329 (0.5); 7.5158 (0.7); 7.5123 (0.9); 7.5098 (0.6); 7.4927 (0.7); 7.4890 (0.7); 7.3722 (0.7); 7.3632 (0.8); 7.3606 (0.7); 7.3515 (1.2); 7.3425 (0.6); 7.3399 (0.6); 7.3309 (0.5); 7.2619 (8.5); 6.9749 (0.6); 6.9734 (0.7); 6.9674 (0.7); 6.9660 (0.7); 6.9537 (0.6); 6.9522 (0.7); 6.9462 (0.7); 6.9447 (0.7); 6.0115 (5.1); 3.8538 (14.7); 3.6887 (16.0); 1.5594 (0.7); -0.0002 (12.2)

I-39: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.2306 (0.6); 8.2288 (0.7); 8.2269 (0.7); 8.2252 (0.6); 8.2189 (0.6); 8.2171 (0.7); 8.2153 (0.7); 8.2136 (0.6); 8.1440 (0.9); 8.1419 (0.7); 8.1398 (0.8); 8.1377 (1.0); 7.8586 (0.5); 7.8399 (0.6); 7.8375 (0.6); 7.8337 (0.6); 7.8312 (0.6); 7.8188 (0.5); 7.8125 (0.5); 7.5147 (0.5); 7.5110 (0.5); 7.4940 (0.7); 7.4915 (0.7); 7.4904 (0.8); 7.4879 (0.6); 7.4709 (0.7); 7.4672 (0.6); 7.3518 (0.6); 7.3428 (0.7); 7.3402 (0.7); 7.3311 (1.1); 7.3221 (0.5); 7.3195 (0.5); 7.2614 (12.9); 6.9671 (0.6); 6.9656 (0.7); 6.9597 (0.7); 6.9581 (0.6); 6.9460 (0.6); 6.9444 (0.6); 6.9385 (0.6); 6.9369 (0.6); 6.0029 (5.0); 3.8507 (14.2); 3.6849 (16.0); 2.0454 (1.0); 1.5523 (2.4); 1.2596 (0.7); 0.0080 (0.5); -0.0002 (20.1); -0.0085 (0.5)

I-40: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.2019 (0.6); 8.2001 (0.7); 8.1983 (0.7); 8.1965 (0.7); 8.1902 (0.6); 8.1884 (0.8); 8.1866 (0.7); 8.1849 (0.6); 8.1449 (1.0); 8.1430 (0.8); 8.1407 (0.8); 8.1387 (1.0); 7.7815 (0.5); 7.7753 (0.5); 7.7625 (0.6); 7.7605 (0.6); 7.7563 (0.6); 7.7543 (0.6); 7.7415 (0.5); 7.7353 (0.5); 7.4822 (0.5); 7.4785 (0.5); 7.4616 (0.7); 7.4582 (1.0); 7.4551 (0.6); 7.4382 (0.7); 7.4345 (0.6); 7.2941 (0.7); 7.2852 (0.7); 7.2824 (0.7); 7.2735 (1.2); 7.2618 (10.4); 7.2529 (0.5); 6.9261 (0.7); 6.9247 (0.7); 6.9187 (0.7); 6.9172 (0.7); 6.9050 (0.6); 6.9036 (0.7); 6.8976 (0.6); 6.8961 (0.6); 6.0191 (5.3); 3.8339 (14.8); 3.6578 (16.0); 2.3244 (0.5); 1.5795 (0.8); 1.5627 (1.6); 0.7921 (1.4); 0.7865 (0.7); 0.7745 (2.4); 0.7718 (2.4); 0.7692 (1.7); 0.7652 (0.9); 0.7611 (1.4); 0.7584 (0.9); 0.7561 (0.7); 0.7539 (0.6); 0.7522 (0.6); -0.0002

[0664]

(14.2)
I-41: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3): δ = 8.2448 (0.6); 8.2432 (0.6); 8.2412 (0.7); 8.2397 (0.6); 8.2332 (0.6); 8.2316 (0.7); 8.2297 (0.7); 8.2282 (0.6); 8.1268 (0.8); 8.1207 (0.9); 7.5245 (0.5); 7.5073 (0.7); 7.5056 (0.7); 7.5037 (0.8); 7.5019 (0.6); 7.4848 (0.7); 7.4811 (0.7); 7.3925 (0.6); 7.3832 (0.7); 7.3809 (0.6); 7.3717 (1.0); 7.2624 (6.2); 6.9551 (0.6); 6.9535 (0.6); 6.9476 (0.7); 6.9461 (0.6); 6.9339 (0.6); 6.9323 (0.6); 6.9264 (0.6); 6.9249 (0.6); 6.0131 (4.4); 3.8462 (14.7); 3.6760 (16.0); 1.5629 (1.0); -0.0002 (8.8)
I-42: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3): δ = 9.0861 (1.8); 9.0828 (1.7); 8.4096 (1.9); 8.4030 (2.0); 8.2512 (1.1); 8.2453 (1.2); 8.0492 (1.1); 8.0455 (1.2); 8.0429 (1.2); 8.0392 (1.1); 7.8648 (0.6); 7.8586 (0.6); 7.8461 (0.6); 7.8436 (0.7); 7.8399 (0.7); 7.8374 (0.8); 7.8250 (0.7); 7.8188 (0.6); 7.5186 (0.8); 7.2873 (0.9); 7.2666 (0.7); 7.2658 (0.8); 7.2602 (146.0); 7.2552 (2.3); 7.0434 (0.8); 7.0345 (0.8); 7.0207 (0.8); 7.0147 (0.8); 6.9965 (0.8); 5.9787 (3.4); 5.3002 (1.1); 3.7659 (16.0); 2.2717 (0.7); 1.4322 (7.4); 1.2549 (1.3); 0.1457 (0.6); 0.0269 (1.1); 0.0079 (4.8); -0.0002 (195.7); -0.0053 (3.4); -0.0085 (6.2); -0.1492 (0.6)
I-43: ^1H -NMR(400.6 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.0093 (1.7); 9.0086 (1.7); 9.0058 (1.8); 9.0051 (1.8); 8.5383 (1.7); 8.5376 (1.7); 8.5319 (1.8); 8.3544 (1.0); 8.3481 (1.0); 8.2087 (1.4); 8.2051 (1.5); 8.2023 (1.5); 8.1987 (1.4); 8.1067 (0.6); 8.1004 (0.6); 7.3341 (0.6); 7.3285 (0.6); 7.3128 (0.6); 7.3072 (0.6); 5.9707 (4.6); 3.5952 (11.6); 3.3200 (16.0); 2.5237 (1.3); 2.5191 (1.7); 2.5103 (24.6); 2.5057 (54.4); 2.5011 (77.0); 2.4966 (54.2); 2.4920 (24.8); 0.0079 (2.0); 0.0054 (0.6); 0.0046 (0.7); -0.0002 (71.0); -0.0059 (1.0); -0.0068 (0.9); -0.0085 (2.2)
I-44: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3): δ = 8.2982 (0.7); 8.2965 (0.8); 8.2945 (0.8); 8.2929 (0.8); 8.2865 (0.7); 8.2849 (0.8); 8.2829 (0.8); 8.2813 (0.7); 8.1484 (1.0); 8.1465 (0.8); 8.1442 (0.8); 8.1422 (1.1); 7.8667 (0.6); 7.8604 (0.5); 7.8481 (0.6); 7.8454 (0.7); 7.8418 (0.6); 7.8391 (0.6); 7.8268 (0.6); 7.8205 (0.6); 7.5463 (0.6); 7.5426 (0.6); 7.5255 (0.8); 7.5231 (0.8); 7.5219 (0.9); 7.5195 (0.8); 7.5025 (0.8); 7.4988 (0.7); 7.4009 (0.7); 7.3918 (0.8); 7.3892 (0.8); 7.3801 (1.2); 7.3710 (0.6); 7.3685 (0.6); 7.3594 (0.5); 7.2609 (26.2); 6.9873 (0.7); 6.9857 (0.7); 6.9799 (0.8); 6.9784 (0.7); 6.9661 (0.7); 6.9645 (0.7); 6.9586 (0.7); 6.9571 (0.7); 5.9988 (6.6); 3.7189 (16.0); 1.2640 (0.7); 0.8820 (1.5); 0.8643 (0.6); 0.0080 (1.0); 0.0023 (1.2); -0.0002 (34.1); -0.0085 (0.9)
I-45: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3): δ = 8.3047 (0.8); 8.3030 (0.9); 8.3010 (0.9); 8.2995 (0.8); 8.2930 (0.9); 8.2914 (1.0); 8.2893 (0.9); 8.2879 (0.8); 8.1565 (1.2); 8.1545 (0.8); 8.1521 (1.0); 8.1503 (1.2); 7.8749 (0.6); 7.8686 (0.6); 7.8563 (0.7); 7.8537 (0.7); 7.8501 (0.7); 7.8474 (0.7); 7.8351 (0.6); 7.8288 (0.6); 7.5365 (0.6); 7.5328 (0.6); 7.5157 (0.9); 7.5133 (0.9); 7.5122 (0.9); 7.5099 (0.6); 7.4928 (0.8); 7.4891 (0.7); 7.3980 (0.8); 7.3888 (0.9); 7.3863 (0.8); 7.3772 (1.3); 7.3681 (0.6); 7.3656 (0.6); 7.3564 (0.5); 7.2615 (13.5); 6.9835 (0.8); 6.9821 (0.8); 6.9762 (0.8); 6.9748 (0.7); 6.9623 (0.8); 6.9608 (0.8); 6.9550 (0.8); 6.9535 (0.7); 5.9985 (7.0); 5.3004 (0.7); 3.7137 (16.0); -0.0002 (18.0); -0.0085 (0.5)
I-46: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3): δ = 9.0617 (1.6); 9.0611 (1.6); 9.0582 (1.6); 8.4015 (1.5); 8.4008 (1.5); 8.3951 (1.6); 8.3945 (1.6); 8.2443 (1.0); 8.2422 (0.8); 8.2401 (0.8); 8.2381 (1.0); 8.2361 (0.6); 8.0190 (1.3); 8.0153 (1.3); 8.0126 (1.3); 8.0090 (1.2); 7.8681 (0.5); 7.8619 (0.5); 7.8494 (0.6); 7.8469 (0.6); 7.8432 (0.6); 7.8408 (0.6); 7.8282 (0.6); 7.8220 (0.6); 7.2623 (9.0); 7.0389 (0.7); 7.0374 (0.7); 7.0314 (0.7); 7.0299 (0.7); 7.0177 (0.7); 7.0162 (0.6); 7.0103 (0.7); 7.0088 (0.6); 5.9706 (5.4); 4.3786 (0.5); 4.3644 (1.6); 4.3608 (1.6); 4.3466 (1.7); 4.3430 (1.6); 4.3287 (0.6); 3.7204 (16.0); 1.5652 (1.5); 1.3814 (3.6); 1.3635 (7.7); 1.3457 (3.5); -0.0002 (11.6)
I-47: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3): δ = 9.0626 (1.7); 9.0617 (1.6); 9.0590 (1.7); 9.0582 (1.6); 8.3981 (1.7); 8.3918 (1.8); 8.3908 (1.6); 8.2346 (1.0); 8.2324 (0.8); 8.2303 (0.8); 8.2285 (1.0); 8.0106 (1.3); 8.0070 (1.4);

[0665]

8.0042 (1.3); 8.0006 (1.3); 7.8609 (0.5); 7.8547 (0.5); 7.8422 (0.6); 7.8397 (0.6); 7.8359 (0.6); 7.8336 (0.6); 7.8211 (0.6); 7.8149 (0.6); 7.2616 (13.4); 7.0358 (0.7); 7.0343 (0.7); 7.0284 (0.7); 7.0270 (0.6); 7.0147 (0.7); 7.0132 (0.7); 7.0073 (0.7); 7.0057 (0.6); 5.9675 (5.5); 4.3784 (0.5); 4.3646 (1.6); 4.3606 (1.6); 4.3467 (1.6); 4.3429 (1.6); 4.3288 (0.5); 3.7196 (16.0); 1.5566 (5.0); 1.3816 (3.6); 1.3638 (7.7); 1.3460 (3.5); -0.0002 (17.9)
I-48: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2487 (0.7); 8.2469 (0.8); 8.2451 (0.8); 8.2434 (0.7); 8.2371 (0.8); 8.2353 (0.8); 8.2334 (0.8); 8.2318 (0.7); 8.1376 (1.0); 8.1355 (0.8); 8.1333 (0.9); 8.1314 (1.0); 7.8630 (0.5); 7.8568 (0.5); 7.8443 (0.6); 7.8418 (0.7); 7.8381 (0.6); 7.8355 (0.6); 7.8231 (0.6); 7.8169 (0.6); 7.5335 (0.5); 7.5298 (0.5); 7.5128 (0.8); 7.5093 (0.8); 7.5067 (0.6); 7.4897 (0.7); 7.4860 (0.7); 7.3707 (0.7); 7.3617 (0.8); 7.3591 (0.7); 7.3501 (1.2); 7.3410 (0.6); 7.3385 (0.6); 7.3295 (0.5); 7.2617 (11.1); 6.9740 (0.7); 6.9725 (0.7); 6.9665 (0.8); 6.9650 (0.7); 6.9528 (0.7); 6.9513 (0.7); 6.9453 (0.7); 6.9438 (0.6); 5.9801 (5.5); 4.3383 (0.7); 4.3204 (2.2); 4.3025 (2.4); 4.2846 (0.8); 3.6883 (16.0); 1.5581 (4.5); 1.3374 (3.6); 1.3196 (7.6); 1.3017 (3.6); -0.0002 (14.0)
I-49: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1092 (1.0); 8.1071 (0.7); 8.1048 (0.8); 8.1030 (1.0); 7.7385 (0.6); 7.7361 (0.6); 7.7323 (0.6); 7.7299 (0.6); 7.7175 (0.5); 7.3929 (0.7); 7.3885 (0.8); 7.3698 (0.6); 7.2618 (8.2); 7.2173 (0.5); 7.2156 (0.5); 7.1961 (0.7); 7.0422 (0.5); 7.0176 (0.8); 7.0139 (0.5); 6.9477 (0.7); 6.9462 (0.7); 6.9403 (0.7); 6.9387 (0.6); 6.9265 (0.7); 6.9249 (0.7); 6.9191 (0.7); 6.9175 (0.6); 5.9525 (5.0); 5.3002 (0.6); 3.8555 (14.9); 3.6857 (16.0); 1.5577 (1.8); -0.0002 (9.9)
I-50: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1055 (1.0); 8.1036 (1.5); 8.1015 (1.2); 8.0994 (1.2); 8.0973 (1.6); 8.0954 (1.1); 7.7613 (0.8); 7.7550 (0.8); 7.7426 (1.0); 7.7400 (1.0); 7.7363 (1.0); 7.7338 (1.0); 7.7213 (0.9); 7.7151 (0.9); 7.4301 (0.6); 7.4258 (0.7); 7.4109 (1.1); 7.4065 (1.3); 7.3921 (0.7); 7.3877 (0.9); 7.3642 (0.6); 7.3623 (0.5); 7.3598 (0.5); 7.3579 (0.5); 7.3520 (0.7); 7.3502 (0.5); 7.3475 (0.6); 7.3457 (0.5); 7.3435 (0.6); 7.3390 (0.5); 7.3313 (0.6); 7.2624 (11.2); 7.2360 (0.7); 7.2343 (0.8); 7.2326 (0.8); 7.2311 (0.7); 7.2145 (1.1); 7.2129 (1.2); 7.1957 (0.5); 7.1940 (0.5); 7.0577 (0.8); 7.0545 (0.8); 7.0369 (0.8); 7.0331 (1.3); 7.0293 (0.8); 7.0118 (0.7); 7.0085 (0.7); 6.9514 (1.1); 6.9498 (1.1); 6.9439 (1.1); 6.9423 (1.1); 6.9301 (1.0); 6.9285 (1.1); 6.9226 (1.0); 6.9210 (1.1); 5.9647 (8.7); 4.3359 (0.8); 4.3333 (0.9); 4.3180 (2.8); 4.3155 (2.9); 4.3001 (2.9); 4.2978 (2.9); 4.2823 (1.0); 4.2800 (0.9); 4.0593 (1.2); 4.0416 (1.2); 4.0354 (1.6); 4.0177 (1.6); 3.9017 (1.6); 3.8841 (1.6); 3.8779 (1.2); 3.8665 (0.5); 3.8602 (1.2); 3.7629 (0.8); 3.7526 (0.6); 3.7463 (2.1); 3.7401 (0.6); 3.7297 (0.9); 1.8696 (0.8); 1.8620 (0.7); 1.8530 (2.5); 1.8441 (0.7); 1.8364 (0.8); 1.5681 (5.2); 1.4322 (1.1); 1.3491 (5.6); 1.3316 (14.5); 1.3144 (16.0); 1.2967 (6.0); 0.0023 (0.6); -0.0002 (14.1)
I-51: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1253 (2.5); 8.1234 (1.9); 8.1209 (2.0); 8.1190 (2.6); 7.7718 (1.3); 7.7656 (1.3); 7.7532 (1.4); 7.7506 (1.5); 7.7470 (1.4); 7.7444 (1.4); 7.7320 (1.3); 7.7257 (1.2); 7.4368 (1.0); 7.4324 (1.2); 7.4175 (1.7); 7.4132 (2.0); 7.3987 (1.2); 7.3944 (1.4); 7.3899 (0.7); 7.3855 (0.6); 7.3777 (0.7); 7.3731 (0.7); 7.3710 (1.0); 7.3692 (0.9); 7.3666 (0.9); 7.3648 (0.8); 7.3587 (1.0); 7.3571 (0.8); 7.3543 (0.9); 7.3525 (0.8); 7.3503 (0.9); 7.3458 (0.8); 7.3381 (0.8); 7.3337 (0.7); 7.2619 (43.9); 7.2407 (1.1); 7.2392 (1.2); 7.2373 (1.2); 7.2362 (1.3); 7.2196 (1.8); 7.2179 (1.8); 7.2021 (0.7); 7.2005 (0.8); 7.1988 (0.7); 7.0612 (1.2); 7.0580 (1.2); 7.0404 (1.2); 7.0366 (2.0); 7.0328 (1.2); 7.0153 (1.1); 7.0121 (1.0); 6.9586 (1.7); 6.9571 (1.7); 6.9512 (1.8); 6.9497 (1.6); 6.9373 (1.6); 6.9358 (1.7); 6.9299 (1.6); 6.9284 (1.6); 6.0122 (14.4); 4.1508 (0.5); 4.1329 (1.5); 4.1151 (1.6); 4.0972 (0.6); 4.0888 (1.6); 4.0826 (0.7); 4.0711 (1.7); 4.0649 (2.2); 4.0534 (0.6); 4.0472 (2.2); 4.0295 (0.6); 3.9401 (0.6); 3.9224 (2.1); 3.9162 (0.6); 3.9048 (2.2); 3.8985 (1.7); 3.8872 (0.7); 3.8809 (1.7); 3.8633 (0.5); 2.1131 (1.6); 2.0479 (7.6); 1.4321 (1.3); 1.3631 (7.6); 1.3455 (16.0); 1.3278 (7.4); 1.2773 (2.2); 1.2595 (4.6); 1.2417 (2.4); 1.2215 (0.5); 0.0080 (0.7); -0.0002 (25.4); -0.0085 (0.7)
I-52: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1195 (1.4); 8.1135 (1.5); 7.7661 (0.8); 7.7598 (0.7); 7.7474 (0.9); 7.7448 (0.9); 7.7412

[0666]

(0.9); 7.7386 (0.9); 7.7263 (0.8); 7.7200 (0.7); 7.4458 (0.6); 7.4415 (0.7); 7.4265 (1.1); 7.4224 (1.3); 7.4078 (0.8); 7.4034 (0.9); 7.3771 (0.6); 7.3753 (0.6); 7.3728 (0.6); 7.3649 (0.7); 7.3605 (0.6); 7.3586 (0.5); 7.3566 (0.6); 7.3443 (0.5); 7.2623 (10.9); 7.2473 (0.7); 7.2458 (0.8); 7.2441 (0.8); 7.2248 (1.2); 7.2073 (0.5); 7.0681 (0.8); 7.0649 (0.8); 7.0473 (0.8); 7.0435 (1.3); 7.0397 (0.8); 7.0222 (0.7); 7.0190 (0.7); 6.9620 (1.0); 6.9549 (1.0); 6.9408 (0.9); 6.9336 (0.9); 6.0167 (7.7); 4.1510 (1.1); 4.1332 (3.4); 4.1153 (3.5); 4.0975 (1.2); 4.0897 (1.0); 4.0720 (1.0); 4.0659 (1.4); 4.0482 (1.3); 3.9254 (1.3); 3.9078 (1.3); 3.9015 (1.0); 3.8839 (1.0); 2.1119 (4.6); 2.0481 (16.0); 1.4322 (0.9); 1.3623 (4.8); 1.3447 (9.9); 1.3270 (4.6); 1.2775 (4.4); 1.2597 (8.8); 1.2419 (4.2); -0.0002 (14.1)

I-53: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃):

δ= 8.1147 (1.2); 8.1126 (0.9); 8.1104 (0.9); 8.1083 (1.1); 8.1063 (0.8); 7.7659 (0.7); 7.7596 (0.6); 7.7472 (0.8); 7.7446 (0.8); 7.7410 (0.7); 7.7384 (0.7); 7.7260 (0.7); 7.7197 (0.6); 7.4533 (0.6); 7.4385 (0.8); 7.4341 (0.9); 7.4197 (0.6); 7.4153 (0.6); 7.2618 (38.9); 7.2431 (0.5); 7.2415 (0.5); 7.2397 (0.6); 7.2384 (0.5); 7.2232 (0.8); 7.2200 (0.8); 7.0567 (0.6); 7.0534 (0.6); 7.0358 (0.6); 7.0320 (0.9); 7.0282 (0.6); 7.0107 (0.5); 6.9507 (0.8); 6.9492 (0.9); 6.9433 (0.8); 6.9417 (0.8); 6.9296 (0.8); 6.9280 (0.9); 6.9221 (0.7); 6.9205 (0.7); 5.9538 (6.3); 4.5264 (1.1); 4.5241 (1.2); 4.5100 (2.5); 4.5080 (2.6); 4.4936 (1.2); 4.4919 (1.2); 4.0494 (0.8); 4.0317 (0.9); 4.0256 (1.1); 4.0079 (1.1); 3.8899 (1.1); 3.8723 (1.1); 3.8662 (0.8); 3.8485 (0.8); 3.7009 (0.7); 3.6897 (0.6); 3.6499 (16.0); 2.7295 (1.8); 2.7132 (3.7); 2.6969 (1.8); 1.3397 (3.9); 1.3221 (8.3); 1.3044 (3.7); 0.0080 (0.7); 0.0024 (0.9); -0.0002 (23.7); -0.0084 (0.6)

I-54: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃):

δ= 8.1117 (2.2); 8.1054 (2.4); 7.7656 (1.0); 7.7593 (1.2); 7.7468 (1.2); 7.7444 (1.3); 7.7406 (1.4); 7.7382 (1.4); 7.7257 (1.1); 7.7194 (1.2); 7.4538 (0.7); 7.4508 (0.6); 7.4350 (1.5); 7.4196 (0.6); 7.4156 (0.9); 7.4127 (0.8); 7.3839 (0.5); 7.3794 (0.5); 7.3717 (0.5); 7.3648 (0.9); 7.3604 (0.8); 7.3527 (0.9); 7.3483 (0.8); 7.3443 (0.9); 7.3398 (0.7); 7.3321 (0.8); 7.3277 (0.6); 7.2615 (85.3); 7.2376 (1.4); 7.2183 (1.8); 7.1991 (0.8); 7.0555 (1.1); 7.0522 (1.1); 7.0347 (1.1); 7.0308 (1.9); 7.0271 (1.3); 7.0095 (1.0); 7.0063 (1.0); 6.9978 (0.5); 6.9506 (1.6); 6.9492 (1.6); 6.9431 (1.7); 6.9418 (1.5); 6.9294 (1.6); 6.9280 (1.6); 6.9219 (1.6); 6.9205 (1.5); 6.0064 (0.6); 5.9656 (5.7); 5.9622 (6.0); 5.3004 (0.6); 4.4568 (1.0); 4.4461 (1.0); 4.4392 (1.0); 4.4295 (1.9); 4.4190 (1.4); 4.4121 (1.4); 4.4017 (1.5); 4.3258 (1.3); 4.3105 (2.5); 4.2986 (1.1); 4.2955 (1.5); 4.2834 (1.8); 4.2684 (1.0); 4.0478 (1.4); 4.0418 (0.7); 4.0301 (1.4); 4.0241 (1.8); 4.0064 (1.8); 3.9887 (0.6); 3.9064 (0.5); 3.8888 (1.6); 3.8711 (1.6); 3.8651 (1.2); 3.8534 (0.6); 3.8498 (2.0); 3.8476 (1.4); 3.6982 (0.6); 3.6949 (0.7); 3.6866 (0.7); 3.6829 (0.8); 3.6477 (15.8); 3.6363 (16.0); 2.8825 (0.8); 2.8651 (1.4); 2.8483 (1.4); 2.8313 (0.8); 1.5559 (1.4); 1.3499 (0.7); 1.3398 (7.5); 1.3323 (1.6); 1.3221 (15.1); 1.3146 (1.1); 1.3045 (7.0); 1.2651 (0.6); 1.2553 (1.3); 1.2246 (0.5); 1.2204 (0.6); 1.2025 (0.7); 1.1966 (6.9); 1.1917 (6.8); 1.1787 (6.9); 1.1738 (6.8); 0.0079 (1.2); -0.0002 (50.1); -0.0085 (1.5)

I-55: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃):

δ= 8.2456 (0.9); 8.2438 (0.9); 8.2341 (0.9); 8.2322 (0.9); 8.1243 (1.1); 8.1186 (1.2); 7.8192 (0.6); 7.5205 (0.5); 7.5033 (0.8); 7.4998 (0.9); 7.4809 (0.7); 7.4773 (0.7); 7.3910 (0.6); 7.3817 (0.8); 7.3795 (0.7); 7.3702 (1.1); 7.3609 (0.6); 7.3586 (0.6); 7.2612 (17.2); 6.9533 (0.8); 6.9461 (0.8); 6.9323 (0.7); 6.9249 (0.8); 5.9868 (4.4); 4.3308 (0.6); 4.3287 (0.6); 4.3128 (1.9); 4.3110 (1.8); 4.2949 (2.0); 4.2932 (1.8); 4.2771 (0.7); 3.6768 (13.7); 2.0456 (1.2); 1.5503 (16.0); 1.3258 (3.2); 1.3080 (6.7); 1.2902 (3.2); 1.2597 (0.9); 0.0079 (0.8); -0.0002 (24.0); -0.0084 (0.8)

I-56: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃):

δ= 8.2519 (0.7); 8.2501 (0.8); 8.2482 (0.8); 8.2465 (0.7); 8.2402 (0.7); 8.2384 (0.8); 8.2365 (0.8); 8.2348 (0.7); 8.1605 (1.0); 8.1563 (0.8); 8.1543 (1.1); 7.7884 (0.5); 7.7822 (0.5); 7.7695 (0.6); 7.7673 (0.6); 7.7633 (0.7); 7.7611 (0.6); 7.7484 (0.6); 7.7422 (0.6); 7.5078 (0.6); 7.5040 (0.6); 7.4871 (0.8); 7.4837 (1.0); 7.4806 (0.6); 7.4637 (0.7); 7.4599 (0.7); 7.3349 (0.7); 7.3259 (0.8); 7.3233 (0.7); 7.3142 (1.2); 7.3052 (0.6); 7.3026 (0.6); 7.2936 (0.6); 7.2614 (22.0); 6.9452 (0.7); 6.9437 (0.7); 6.9379 (0.8); 6.9363 (0.7); 6.9241 (0.7); 6.9226 (0.7); 6.9167 (0.7); 6.9152 (0.7); 5.9386 (6.2); 3.6921 (16.0); 2.3457 (0.6); 1.5723

[0667]

(0.8); 1.5513 (0.6); 1.4322 (0.7); 1.2643 (0.8); 0.8820 (1.7); 0.8643 (0.6); 0.8067 (0.7); 0.8030 (1.1); 0.8012 (0.9); 0.7940 (0.9); 0.7863 (1.1); 0.7829 (0.9); 0.7810 (1.1); 0.7732 (0.9); 0.7701 (0.5); 0.7535 (1.0); 0.7438 (1.3); 0.7399 (1.7); 0.7321 (1.2); 0.7270 (1.1); 0.0080 (0.8); -0.0002 (32.6); -0.0085 (0.9)
I-57: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2883 (0.8); 8.2868 (0.9); 8.2847 (0.9); 8.2833 (0.8); 8.2767 (0.8); 8.2752 (0.9); 8.2731 (0.9); 8.1342 (1.1); 8.1282 (1.1); 7.8345 (0.5); 7.5348 (0.6); 7.5311 (0.6); 7.5139 (0.9); 7.5124 (0.8); 7.5102 (0.9); 7.5088 (0.7); 7.4915 (0.8); 7.4878 (0.8); 7.4183 (0.8); 7.4090 (1.0); 7.4068 (0.8); 7.3975 (1.3); 7.3882 (0.6); 7.3859 (0.6); 7.3766 (0.5); 7.2616 (11.9); 6.9686 (0.8); 6.9671 (0.8); 6.9613 (0.8); 6.9599 (0.8); 6.9474 (0.8); 6.9459 (0.8); 6.9401 (0.8); 6.9386 (0.8); 6.0169 (5.8); 3.7026 (16.0); 1.4322 (2.2); 1.2626 (0.6); 1.2549 (0.6); 0.8819 (0.9); -0.0002 (17.7); -0.0085 (0.5)
I-58: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2034 (0.7); 8.2017 (0.8); 8.1999 (0.8); 8.1982 (0.8); 8.1918 (0.7); 8.1900 (0.8); 8.1883 (0.8); 8.1866 (0.7); 8.1446 (1.1); 8.1384 (1.2); 7.7818 (0.5); 7.7756 (0.5); 7.7628 (0.6); 7.7608 (0.7); 7.7566 (0.6); 7.7546 (0.7); 7.7418 (0.6); 7.7356 (0.6); 7.4794 (0.5); 7.4757 (0.6); 7.4587 (0.7); 7.4554 (1.0); 7.4523 (0.6); 7.4353 (0.7); 7.4316 (0.7); 7.2926 (0.7); 7.2837 (0.8); 7.2810 (0.7); 7.2720 (1.2); 7.2615 (15.8); 7.2515 (0.6); 6.9243 (0.8); 6.9181 (0.8); 6.9168 (0.8); 6.9031 (0.8); 6.8957 (0.7); 5.9956 (5.5); 4.3199 (0.5); 4.3163 (0.6); 4.3020 (1.7); 4.2985 (1.7); 4.2841 (1.8); 4.2808 (1.7); 4.2663 (0.6); 4.2630 (0.6); 3.6579 (16.0); 1.5957 (0.5); 1.5788 (0.8); 1.5569 (14.9); 1.3286 (3.7); 1.3108 (7.7); 1.2929 (3.6); 0.7884 (3.5); 0.7715 (9.1); 0.0080 (0.6); -0.0002 (21.3); -0.0085 (0.6)
I-59: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1205 (1.2); 8.1184 (1.0); 8.1163 (1.0); 8.1143 (1.2); 7.7723 (0.6); 7.7660 (0.6); 7.7536 (0.7); 7.7511 (0.8); 7.7474 (0.7); 7.7448 (0.7); 7.7324 (0.6); 7.7261 (0.6); 7.4472 (0.5); 7.4322 (0.8); 7.4279 (0.9); 7.4134 (0.6); 7.4091 (0.6); 7.2621 (28.0); 7.2588 (0.5); 7.2345 (0.6); 7.2324 (0.6); 7.2310 (0.5); 7.2127 (0.8); 7.0486 (0.6); 7.0453 (0.6); 7.0278 (0.6); 7.0239 (1.0); 7.0202 (0.6); 7.0026 (0.5); 6.9990 (0.6); 6.9463 (0.8); 6.9447 (0.9); 6.9388 (0.8); 6.9373 (0.8); 6.9250 (0.8); 6.9234 (0.9); 6.9175 (0.8); 6.9160 (0.7); 5.9527 (6.2); 4.5254 (1.1); 4.5226 (1.1); 4.5090 (2.5); 4.5064 (2.4); 4.4926 (1.2); 4.4903 (1.2); 4.0491 (0.8); 4.0314 (0.8); 4.0253 (1.1); 4.0076 (1.1); 3.8880 (1.1); 3.8704 (1.1); 3.8642 (0.8); 3.8466 (0.8); 3.7013 (0.6); 3.6902 (0.5); 3.6497 (16.0); 2.7292 (1.8); 2.7129 (3.8); 2.6966 (1.9); 1.3414 (3.8); 1.3237 (8.1); 1.3061 (3.7); -0.0002 (17.6)
I-60: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.0517 (0.9); 8.0462 (1.0); 7.3871 (0.5); 7.3721 (0.6); 7.3679 (1.4); 7.3611 (0.6); 7.3499 (0.9); 7.3483 (1.1); 7.2612 (13.4); 7.2036 (0.5); 7.2019 (0.6); 7.2004 (0.6); 7.1826 (0.9); 7.1811 (0.8); 7.0378 (0.5); 7.0170 (0.5); 7.0132 (0.8); 6.9188 (0.8); 6.9175 (0.7); 6.9114 (0.8); 6.8976 (0.8); 6.8962 (0.7); 6.8901 (0.8); 5.9847 (4.7); 3.8401 (15.5); 3.6541 (16.0); 1.5485 (7.4); 0.0079 (0.5); -0.0002 (19.0); -0.0029 (0.8); -0.0036 (0.5); -0.0085 (0.6)
I-61: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1234 (1.1); 8.1172 (1.1); 7.6793 (0.5); 7.6603 (0.6); 7.6583 (0.6); 7.6541 (0.6); 7.6521 (0.6); 7.6393 (0.5); 7.6331 (0.5); 7.3783 (0.8); 7.3740 (0.9); 7.3594 (0.5); 7.3550 (0.6); 7.2652 (0.5); 7.2616 (12.9); 7.1905 (0.5); 7.1884 (0.6); 7.1716 (0.8); 7.1687 (0.8); 7.0196 (0.6); 7.0163 (0.5); 6.9988 (0.5); 6.9948 (0.8); 6.9909 (0.6); 6.9045 (0.7); 6.9031 (0.8); 6.8971 (0.7); 6.8956 (0.7); 6.8834 (0.7); 6.8819 (0.7); 6.8759 (0.7); 6.8745 (0.7); 5.9242 (5.5); 5.3002 (0.6); 4.5183 (1.9); 4.5020 (4.3); 4.4857 (2.0); 3.6784 (0.6); 3.6677 (14.5); 3.6597 (0.7); 3.6458 (16.0); 2.7284 (1.7); 2.7121 (3.6); 2.6958 (1.7); 1.5716 (0.7); 1.5694 (0.7); 1.5628 (1.2); 1.5552 (1.4); 1.5498 (0.7); 1.5375 (0.6); 0.7819 (0.8); 0.7799 (1.5); 0.7761 (0.9); 0.7731 (0.8); 0.7594 (3.2); 0.7541 (1.4); 0.7488 (0.9); 0.7449 (1.8); 0.7411 (1.1); -0.0002 (16.2)
I-62: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.0850 (0.9); 8.0791 (0.9); 7.4276 (0.6); 7.4234 (0.7); 7.4046 (0.5); 7.2613 (14.2); 7.2232 (0.5); 7.2035 (0.8); 7.0440 (0.5); 7.0231 (0.5); 7.0195 (0.9); 7.0159 (0.5); 6.9980 (0.5); 6.9393 (0.7); 6.9378 (0.7); 6.9319 (0.7); 6.9303 (0.6); 6.9181 (0.7); 6.9166 (0.7); 6.9106 (0.7); 6.9091 (0.6); 5.9209 (5.1); 4.5212 (1.5); 4.5052 (3.6); 4.4892 (1.7); 3.8499 (0.7);

[0668]

3.6744 (0.8); 3.6667 (16.0); 3.6493 (14.0); 2.7187 (1.6); 2.7027 (3.2); 2.6867 (1.5); 1.5730 (0.9); 0.0080 (0.7); -0.0002 (23.0); -0.0085 (0.6)

I-65: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1246 (1.4); 8.1184 (1.5); 7.7712 (0.6); 7.7650 (0.6); 7.7526 (0.7); 7.7500 (0.8); 7.7464 (0.7); 7.7437 (0.7); 7.7314 (0.6); 7.7251 (0.6); 7.4371 (0.5); 7.4328 (0.6); 7.4179 (0.9); 7.4136 (1.1); 7.3991 (0.6); 7.3947 (0.8); 7.3708 (0.6); 7.3585 (0.6); 7.3501 (0.5); 7.2620 (9.8); 7.2404 (0.6); 7.2389 (0.7); 7.2372 (0.7); 7.2177 (1.0); 7.0608 (0.7); 7.0576 (0.6); 7.0400 (0.6); 7.0362 (1.0); 7.0324 (0.7); 7.0149 (0.6); 7.0117 (0.5); 6.9580 (0.9); 6.9567 (1.0); 6.9507 (0.9); 6.9494 (0.9); 6.9368 (0.8); 6.9354 (0.9); 6.9294 (0.8); 6.9281 (0.8); 6.0116 (6.3); 4.0877 (0.9); 4.0700 (0.9); 4.0639 (1.2); 4.0461 (1.2); 3.9214 (1.2); 3.9037 (1.4); 3.8975 (0.9); 3.8799 (0.9); 2.0087 (16.0); 1.4321 (2.4); 1.3626 (4.0); 1.3449 (8.4); 1.3273 (3.9); -0.0002 (14.0)

I-66: ^1H NMR(400.0 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1085 (2.0); 8.1023 (2.0); 7.7666 (0.9); 7.7603 (0.9); 7.7477 (1.1); 7.7454 (1.2); 7.7416 (1.1); 7.7391 (1.1); 7.7266 (0.9); 7.7203 (0.9); 7.4209 (0.8); 7.4165 (0.9); 7.4018 (1.4); 7.3973 (1.6); 7.3828 (0.9); 7.3783 (1.1); 7.3631 (0.5); 7.3564 (0.8); 7.3438 (0.8); 7.3358 (0.7); 7.3312 (0.6); 7.3234 (0.7); 7.3190 (0.5); 7.2607 (30.8); 7.2240 (1.0); 7.2047 (1.5); 7.1878 (0.6); 7.0494 (1.0); 7.0461 (1.0); 7.0285 (1.0); 7.0248 (1.6); 7.0035 (0.8); 7.0004 (0.8); 6.9452 (1.4); 6.9379 (1.4); 6.9237 (1.3); 6.9161 (1.2); 5.9638 (8.0); 4.3323 (1.0); 4.3168 (3.0); 4.3145 (3.0); 4.2989 (3.1); 4.2968 (3.0); 4.2792 (1.1); 4.0586 (1.2); 4.0410 (1.2); 4.0347 (1.6); 4.0170 (1.6); 3.9993 (0.5); 3.9174 (0.6); 3.8998 (1.6); 3.8820 (1.6); 3.8758 (1.2); 3.8643 (0.6); 3.8581 (1.2); 1.5451 (16.0); 1.3507 (5.6); 1.3327 (14.5); 1.3142 (14.2); 1.2961 (5.7); 1.2547 (1.1); 0.0079 (1.6); -0.0002 (44.1); -0.0084 (1.5)

I-67: ^1H NMR(400.0 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1085 (2.0); 8.1021 (2.0); 7.7666 (0.9); 7.7603 (0.9); 7.7476 (1.1); 7.7453 (1.1); 7.7413 (1.1); 7.7266 (1.0); 7.7203 (0.9); 7.4208 (0.8); 7.4164 (0.9); 7.4015 (1.4); 7.3973 (1.6); 7.3827 (1.0); 7.3783 (1.1); 7.3629 (0.5); 7.3564 (0.8); 7.3436 (0.8); 7.3359 (0.8); 7.3311 (0.6); 7.3234 (0.7); 7.3190 (0.5); 7.2606 (33.0); 7.2242 (1.0); 7.2070 (1.5); 7.1866 (0.6); 7.0494 (1.0); 7.0462 (0.9); 7.0284 (1.0); 7.0247 (1.6); 7.0209 (1.0); 7.0033 (0.9); 7.0001 (0.8); 6.9451 (1.4); 6.9377 (1.4); 6.9234 (1.3); 6.9165 (1.2); 5.9637 (8.3); 4.3347 (1.1); 4.3322 (1.0); 4.3168 (3.1); 4.3145 (3.0); 4.2989 (3.2); 4.2968 (3.0); 4.2809 (1.1); 4.0587 (1.2); 4.0524 (0.6); 4.0409 (1.3); 4.0347 (1.6); 4.0171 (1.6); 3.9994 (0.5); 3.8996 (1.6); 3.8934 (0.5); 3.8820 (1.7); 3.8758 (1.2); 3.8644 (0.6); 3.8582 (1.2); 1.5436 (16.0); 1.3507 (5.7); 1.3327 (14.6); 1.3142 (14.4); 1.2961 (5.8); 1.2552 (1.0); 0.0079 (1.8); -0.0002 (47.1); -0.0084 (1.4)

I-68: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.4582 (1.8); 8.4514 (1.9); 8.3447 (1.1); 8.3411 (1.9); 8.3376 (1.2); 8.2268 (1.0); 8.2249 (1.1); 8.2168 (0.9); 8.2152 (1.0); 8.2132 (1.0); 7.5034 (0.7); 7.4998 (0.7); 7.4827 (0.9); 7.4794 (1.3); 7.4762 (0.9); 7.4739 (0.9); 7.4695 (0.8); 7.4670 (0.8); 7.4626 (0.8); 7.4593 (0.9); 7.4556 (0.9); 7.4517 (0.8); 7.4473 (0.8); 7.4448 (0.8); 7.4405 (0.7); 7.3243 (0.8); 7.3153 (0.9); 7.3127 (0.9); 7.3036 (1.3); 7.2947 (0.7); 7.2920 (0.7); 7.2830 (0.6); 7.2626 (7.7); 5.9646 (5.6); 3.7037 (0.8); 3.6819 (16.0); 1.6186 (0.5); 1.6116 (0.6); 1.5981 (0.9); 1.5843 (0.5); 1.5774 (0.6); 1.4321 (0.5); 0.8278 (0.7); 0.8252 (0.9); 0.8222 (1.6); 0.8194 (1.2); 0.8145 (1.3); 0.8044 (0.8); 0.8008 (1.3); 0.7978 (1.2); 0.7940 (1.2); 0.7900 (1.4); 0.7820 (1.3); 0.7763 (1.7); 0.7715 (1.2); 0.7700 (1.2); 0.7643 (1.0); -0.0002 (11.5)

I-69: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1421 (1.7); 8.1362 (1.7); 7.6879 (0.6); 7.6817 (0.6); 7.6688 (0.9); 7.6668 (0.9); 7.6627 (0.9); 7.6607 (0.8); 7.6479 (0.6); 7.6418 (0.6); 7.3852 (0.6); 7.3810 (0.7); 7.3659 (1.1); 7.3620 (1.3); 7.3471 (1.0); 7.3430 (0.9); 7.3324 (0.7); 7.3281 (0.6); 7.3202 (0.7); 7.3157 (0.6); 7.3139 (0.6); 7.3120 (0.6); 7.2622 (7.7); 7.2023 (0.9); 7.2006 (0.9); 7.1826 (1.3); 7.1638 (0.5); 7.0491 (0.8); 7.0462 (0.7); 7.0281 (0.8); 7.0245 (1.2); 7.0209 (0.8); 7.0030 (0.7); 7.0002 (0.6); 6.9242 (1.0); 6.9169 (1.1); 6.9031 (1.0); 6.8958 (1.0); 5.8716 (5.5); 5.3003 (9.8); 3.7155 (0.7); 3.6974 (16.0); 1.5859 (0.6); 1.5782 (0.6); 1.5650 (1.1); 1.5517 (0.6); 1.5440 (0.6); 1.4322 (0.7); 0.8193 (0.5); 0.8060 (1.2); 0.8025 (1.8); 0.7929 (1.2); 0.7857 (1.2); 0.7810 (1.5); 0.7721 (0.9); 0.7319 (0.9); 0.7223 (1.7); 0.7185 (2.2); 0.7140

[0669]

(1.1); 0.7097 (1.6); 0.7054 (1.7); -0.0002 (10.8)
I-70: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.0643 (0.8); 8.0582 (0.8); 7.3963 (0.8); 7.3812 (1.0); 7.3763 (1.2); 7.3626 (1.0); 7.3614 (0.9); 7.3578 (0.6); 7.3570 (0.6); 7.2620 (10.7); 7.2009 (0.8); 7.1991 (0.8); 7.0264 (0.8); 6.9425 (0.6); 6.9409 (0.7); 6.9351 (0.6); 6.9335 (0.6); 6.9213 (0.7); 6.9197 (0.7); 6.9138 (0.6); 6.9123 (0.7); 5.9847 (0.5); 5.9737 (4.5); 3.8555 (0.8); 3.8498 (15.0); 3.8400 (1.8); 3.6858 (0.8); 3.6744 (16.0); 3.6541 (1.8); -0.0002 (12.1)
I-71: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1195 (0.9); 8.1133 (1.0); 7.6575 (0.5); 7.6554 (0.6); 7.6513 (0.6); 7.6492 (0.6); 7.3618 (0.7); 7.3574 (0.8); 7.3384 (0.5); 7.2645 (3.9); 7.1673 (0.7); 7.1646 (0.7); 6.9978 (0.7); 6.9939 (0.5); 6.9056 (0.6); 6.9043 (0.6); 6.8982 (0.6); 6.8968 (0.6); 6.8845 (0.6); 6.8831 (0.6); 6.8770 (0.6); 6.8757 (0.6); 5.9711 (5.1); 5.2999 (6.6); 3.8569 (0.6); 3.8397 (15.1); 3.6880 (0.6); 3.6599 (16.0); 1.5936 (1.8); 1.5665 (0.8); 0.7901 (0.6); 0.7870 (1.3); 0.7841 (0.9); 0.7798 (1.0); 0.7710 (0.5); 0.7695 (0.6); 0.7655 (1.1); 0.7630 (1.7); 0.7597 (1.5); 0.7557 (1.0); 0.7541 (0.9); 0.7511 (0.8); 0.7481 (1.2); 0.7439 (1.3); 0.7405 (0.7); 0.7379 (0.7); 0.7366 (0.7); -0.0002 (4.4)
I-72: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4563 (1.4); 8.4494 (1.4); 8.3117 (0.8); 8.3080 (1.4); 8.3043 (0.9); 8.2158 (0.7); 8.2141 (0.8); 8.2122 (0.8); 8.2106 (0.8); 8.2042 (0.7); 8.2024 (0.8); 8.2006 (0.8); 8.1989 (0.8); 7.5288 (0.6); 7.5251 (0.6); 7.5196 (0.8); 7.5153 (0.7); 7.5128 (0.7); 7.5082 (1.3); 7.5047 (1.0); 7.5020 (0.8); 7.4976 (0.7); 7.4932 (0.7); 7.4907 (0.7); 7.4852 (0.9); 7.4813 (0.7); 7.3536 (0.7); 7.3446 (0.8); 7.3420 (0.8); 7.3329 (1.2); 7.3239 (0.6); 7.3213 (0.6); 7.3123 (0.6); 7.2609 (21.6); 6.0000 (5.1); 3.8533 (15.1); 3.6875 (16.0); 2.0454 (0.5); 1.5556 (5.6); 0.0080 (0.9); 0.0042 (0.6); -0.0002 (32.1); -0.0085 (1.1)
I-73: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4181 (1.4); 8.4113 (1.4); 8.3210 (0.8); 8.3172 (1.5); 8.3135 (0.9); 8.1912 (0.6); 8.1893 (0.8); 8.1875 (0.8); 8.1858 (0.8); 8.1795 (0.7); 8.1776 (0.8); 8.1758 (0.8); 8.1742 (0.7); 7.4996 (0.6); 7.4959 (0.6); 7.4790 (0.7); 7.4757 (1.0); 7.4724 (0.7); 7.4555 (0.7); 7.4518 (0.7); 7.4347 (0.6); 7.4303 (0.6); 7.4278 (0.7); 7.4234 (0.6); 7.4121 (0.6); 7.4077 (0.7); 7.4052 (0.6); 7.4008 (0.6); 7.2998 (0.7); 7.2909 (0.8); 7.2882 (0.8); 7.2792 (1.2); 7.2703 (0.6); 7.2675 (0.7); 7.2625 (7.8); 7.2588 (0.9); 6.0153 (5.2); 3.8549 (0.8); 3.8360 (14.8); 3.6898 (0.8); 3.6597 (16.0); 2.0454 (0.7); 1.6227 (0.6); 1.6163 (0.5); 1.6084 (1.1); 1.6025 (0.6); 1.5958 (0.5); 1.5927 (0.5); 1.5888 (0.6); 1.2596 (0.6); 0.8819 (0.6); 0.8235 (0.7); 0.8192 (1.2); 0.8181 (1.2); 0.8165 (1.2); 0.8125 (0.8); 0.7974 (2.6); 0.7931 (1.7); 0.7847 (1.3); 0.7836 (1.3); 0.7812 (1.0); 0.7800 (0.9); 0.7767 (0.8); 0.7741 (0.6); -0.0002 (10.6)
I-76: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4184 (1.3); 8.4116 (1.4); 8.3223 (0.8); 8.3186 (1.4); 8.3149 (0.8); 8.1930 (0.7); 8.1911 (0.8); 8.1893 (0.8); 8.1875 (0.7); 8.1814 (0.7); 8.1795 (0.8); 8.1777 (0.8); 8.1760 (0.7); 7.4995 (0.6); 7.4958 (0.6); 7.4789 (0.7); 7.4755 (1.0); 7.4723 (0.6); 7.4554 (0.7); 7.4517 (0.7); 7.4346 (0.6); 7.4303 (0.6); 7.4277 (0.6); 7.4234 (0.6); 7.4121 (0.6); 7.4077 (0.7); 7.4051 (0.6); 7.4008 (0.6); 7.3005 (0.7); 7.2916 (0.8); 7.2888 (0.7); 7.2799 (1.2); 7.2710 (0.6); 7.2682 (0.7); 7.2625 (9.4); 7.2595 (0.8); 5.9766 (5.9); 4.5173 (1.9); 4.5008 (4.2); 4.4844 (2.0); 3.6815 (14.3); 3.6454 (16.0); 2.7325 (1.7); 2.7161 (3.6); 2.6996 (1.6); 1.6070 (0.5); 1.5997 (1.4); 1.5929 (0.9); 1.5869 (0.6); 1.5848 (0.6); 1.5804 (0.5); 0.8183 (0.6); 0.8128 (1.5); 0.8094 (1.2); 0.8025 (1.2); 0.7985 (2.0); 0.7957 (1.7); 0.7928 (2.2); 0.7899 (1.6); 0.7874 (1.7); 0.7850 (1.9); 0.7822 (0.8); 0.7805 (0.8); -0.0002 (13.8)
I-77: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4186 (1.0); 8.4119 (1.0); 8.3187 (1.2); 8.1929 (0.7); 8.1911 (0.8); 8.1893 (0.8); 8.1877 (0.7); 8.1812 (0.8); 8.1795 (0.8); 8.1777 (0.8); 7.4994 (0.5); 7.4957 (0.6); 7.4787 (0.7); 7.4754 (1.0); 7.4722 (0.6); 7.4552 (0.7); 7.4516 (0.7); 7.4344 (0.6); 7.4300 (0.6); 7.4275 (0.6); 7.4232 (0.5); 7.4118 (0.6); 7.4075 (0.6); 7.4049 (0.6); 7.4006 (0.5); 7.3004 (0.7); 7.2914 (0.8); 7.2888 (0.7); 7.2798 (1.2); 7.2708 (0.6); 7.2681 (0.6); 7.2623 (9.6); 7.2595 (0.7); 5.9766 (5.6); 4.5172 (1.9); 4.5008 (4.3); 4.4843 (2.0); 3.6815 (14.6); 3.6454 (16.0); 2.7325 (1.8); 2.7160 (3.7); 2.6996 (1.7); 1.5996 (1.1); 1.5925 (0.8); 1.5866 (1.2); 1.5848 (1.2); 1.5806 (0.9); 0.8182 (0.7); 0.8128 (1.5); 0.8093 (1.2); 0.8024 (1.3); 0.7984 (2.1);

[0670]

0.7957 (1.8); 0.7927 (2.3); 0.7899 (1.6); 0.7873 (1.8); 0.7850 (1.9); 0.7821 (0.8); 0.7805 (0.8); -0.0002 (14.8)
I-78: ¹ H NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4447 (0.6); 8.3152 (0.6); 7.3493 (0.7); 7.3287 (0.7); 7.2610 (16.2); 7.1937 (0.5); 7.1866 (0.6); 7.1795 (0.9); 7.1732 (0.5); 7.1661 (0.5); 7.0039 (0.6); 6.9945 (0.7); 6.9846 (0.6); 6.9792 (0.8); 6.9674 (0.7); 6.9566 (0.9); 6.9446 (0.9); 5.9047 (5.6); 4.5248 (2.1); 4.5087 (4.5); 4.4925 (2.2); 3.6749 (15.6); 3.6460 (16.0); 2.7315 (2.1); 2.7154 (4.2); 2.6992 (2.0); 1.5851 (0.9); 1.5688 (3.0); 1.5513 (0.8); 0.8101 (1.3); 0.8069 (1.3); 0.7983 (1.1); 0.7853 (2.4); 0.7781 (1.5); 0.7733 (1.2); 0.7690 (1.6); 0.7644 (1.7); 0.7598 (0.9); 0.0079 (0.8); -0.0002 (24.3); -0.0084 (0.8)
I-79: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 7.3288 (0.5); 7.2611 (18.8); 7.1796 (0.7); 6.9945 (0.5); 6.9798 (0.6); 6.9677 (0.6); 6.9569 (0.7); 6.9449 (0.7); 5.9047 (5.8); 4.5250 (1.8); 4.5089 (4.1); 4.4928 (2.0); 3.6750 (14.8); 3.6461 (16.0); 2.7319 (1.8); 2.7157 (3.7); 2.6996 (1.7); 1.5712 (0.7); 1.5681 (0.6); 1.5552 (5.3); 0.8102 (1.0); 0.8068 (1.0); 0.7980 (0.8); 0.7850 (1.8); 0.7776 (1.1); 0.7730 (1.0); 0.7689 (1.2); 0.7641 (1.3); 0.7598 (0.7); 0.0080 (0.8); -0.0002 (28.8); -0.0085 (0.8)
I-80: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2045 (0.6); 8.2026 (0.8); 8.2009 (0.8); 8.1991 (0.7); 8.1929 (0.7); 8.1910 (0.8); 8.1892 (0.8); 8.1875 (0.7); 8.1455 (1.0); 8.1394 (1.1); 7.7817 (0.5); 7.7627 (0.6); 7.7606 (0.6); 7.7565 (0.6); 7.7544 (0.6); 7.7417 (0.5); 7.7355 (0.5); 7.4824 (0.6); 7.4787 (0.6); 7.4618 (0.7); 7.4584 (1.0); 7.4552 (0.6); 7.4384 (0.7); 7.4346 (0.7); 7.2956 (0.7); 7.2867 (0.8); 7.2840 (0.7); 7.2750 (1.3); 7.2659 (0.7); 7.2618 (21.3); 7.2544 (0.6); 6.9268 (0.7); 6.9254 (0.7); 6.9194 (0.7); 6.9180 (0.7); 6.9058 (0.7); 6.9043 (0.7); 6.8983 (0.7); 6.8968 (0.6); 5.9794 (5.8); 4.5157 (1.9); 4.4992 (4.2); 4.4828 (1.9); 3.6808 (14.3); 3.6434 (16.0); 2.7322 (1.7); 2.7158 (3.6); 2.6993 (1.6); 1.5697 (1.5); 1.5618 (12.9); 1.5508 (0.6); 0.7927 (0.6); 0.7875 (1.5); 0.7842 (1.2); 0.7786 (1.3); 0.7749 (1.8); 0.7722 (1.3); 0.7699 (1.4); 0.7668 (2.0); 0.7630 (2.2); 0.0080 (0.9); -0.0002 (33.4); -0.0085 (0.8)
I-81: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2046 (0.6); 8.2027 (0.8); 8.2010 (0.8); 8.1992 (0.7); 8.1930 (0.7); 8.1911 (0.8); 8.1893 (0.8); 8.1876 (0.7); 8.1456 (1.0); 8.1415 (0.8); 8.1395 (1.1); 7.7757 (0.5); 7.7629 (0.6); 7.7608 (0.6); 7.7567 (0.6); 7.7546 (0.6); 7.7418 (0.5); 7.7356 (0.5); 7.4828 (0.6); 7.4791 (0.6); 7.4622 (0.7); 7.4588 (1.0); 7.4556 (0.6); 7.4388 (0.7); 7.4350 (0.7); 7.2960 (0.7); 7.2871 (0.8); 7.2844 (0.7); 7.2754 (1.3); 7.2664 (0.7); 7.2626 (12.3); 7.2549 (0.6); 6.9271 (0.7); 6.9256 (0.7); 6.9197 (0.7); 6.9182 (0.7); 6.9060 (0.6); 6.9045 (0.7); 6.8986 (0.7); 6.8970 (0.7); 5.9795 (5.8); 4.5157 (2.0); 4.4992 (4.3); 4.4828 (2.0); 3.6808 (14.4); 3.6772 (1.7); 3.6434 (16.0); 2.7323 (1.7); 2.7159 (3.6); 2.6994 (1.6); 1.5851 (0.6); 1.5745 (5.5); 0.7927 (0.6); 0.7875 (1.4); 0.7842 (1.2); 0.7786 (1.3); 0.7749 (1.7); 0.7722 (1.4); 0.7700 (1.4); 0.7668 (2.0); 0.7653 (2.1); 0.7631 (2.2); 0.7568 (0.7); -0.0002 (19.1); -0.0085 (0.6)
I-82: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4181 (1.8); 8.4112 (1.8); 8.3221 (1.0); 8.3182 (1.8); 8.3144 (1.0); 8.1929 (0.8); 8.1911 (0.9); 8.1893 (0.9); 8.1876 (0.8); 8.1813 (0.8); 8.1795 (0.9); 8.1777 (0.9); 8.1761 (0.7); 7.4993 (0.6); 7.4956 (0.6); 7.4786 (0.8); 7.4754 (1.1); 7.4721 (0.6); 7.4551 (0.7); 7.4515 (0.7); 7.4336 (0.7); 7.4292 (0.7); 7.4267 (0.7); 7.4224 (0.6); 7.4110 (0.7); 7.4066 (0.7); 7.4041 (0.7); 7.3998 (0.6); 7.3003 (0.8); 7.2913 (0.8); 7.2886 (0.8); 7.2797 (1.3); 7.2707 (0.7); 7.2680 (0.7); 7.2626 (8.9); 7.2592 (0.8); 5.9767 (5.8); 4.5173 (2.2); 4.5008 (4.4); 4.4844 (2.0); 3.6815 (14.9); 3.6454 (16.0); 2.7325 (1.8); 2.7161 (3.8); 2.6996 (1.7); 2.1720 (2.3); 1.5999 (1.0); 1.5816 (1.5); 1.2647 (0.7); 0.8819 (1.3); 0.8642 (0.5); 0.8181 (0.8); 0.8128 (1.6); 0.8093 (1.3); 0.8025 (1.3); 0.7987 (2.1); 0.7961 (1.8); 0.7926 (2.4); 0.7874 (1.9); 0.7854 (2.0); -0.0002 (13.2)
I-83: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4468 (1.3); 8.4400 (1.4); 8.3163 (0.8); 8.3125 (1.4); 8.3088 (0.8); 7.3538 (0.6); 7.3494 (0.6); 7.3469 (0.6); 7.3425 (0.6); 7.3314 (0.6); 7.3270 (0.7); 7.3245 (0.6); 7.3202 (0.6); 7.2610 (19.7); 7.1795 (0.7); 6.9942 (0.6); 6.9796 (0.6); 6.9675 (0.6); 6.9567 (0.7); 6.9447 (0.7); 5.9048 (5.7); 4.5250 (1.7); 4.5088 (3.9); 4.4927 (1.8); 3.6750 (14.0); 3.6461 (16.0); 2.7318 (1.6); 2.7156 (3.4); 2.6995 (1.6); 1.5713 (0.7); 1.5679 (0.6); 1.5521 (6.2); 0.8133

[0671]

(0.6); 0.8101 (1.0); 0.8067 (1.1); 0.8016 (0.7); 0.7980 (0.9); 0.7885 (0.8); 0.7850 (1.8); 0.7824 (1.3); 0.7778 (1.2); 0.7733 (1.0); 0.7691 (1.1); 0.7642 (1.4); 0.7600 (0.7); 0.0080 (0.9); -0.0002 (29.9); -0.0085 (0.8)
I-84: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4578 (1.9); 8.4509 (1.9); 8.3401 (1.1); 8.3364 (1.9); 8.3328 (1.1); 8.2419 (0.8); 8.2403 (0.9); 8.2384 (1.0); 8.2302 (0.9); 8.2286 (1.0); 8.2266 (1.0); 7.5021 (0.6); 7.4985 (0.6); 7.4814 (0.8); 7.4782 (1.2); 7.4750 (0.7); 7.4607 (0.8); 7.4578 (1.1); 7.4565 (1.0); 7.4541 (1.4); 7.4496 (0.7); 7.4385 (0.7); 7.4342 (0.8); 7.4317 (0.7); 7.4273 (0.6); 7.3247 (0.8); 7.3156 (0.8); 7.3130 (0.8); 7.3040 (1.3); 7.2950 (0.6); 7.2924 (0.6); 7.2834 (0.6); 7.2626 (7.9); 5.9655 (5.7); 3.6829 (16.0); 1.6076 (0.6); 1.5941 (0.8); 1.5804 (0.5); 1.5734 (0.6); 0.8191 (0.8); 0.8159 (1.4); 0.8135 (1.2); 0.8078 (1.2); 0.7983 (0.8); 0.7941 (1.2); 0.7901 (0.8); 0.7874 (1.1); 0.7824 (1.3); 0.7746 (1.2); 0.7686 (1.7); 0.7658 (0.9); 0.7622 (1.2); 0.7568 (1.0); -0.0002 (11.6)
I-85: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4615 (2.4); 8.4548 (2.4); 8.3409 (2.6); 8.2453 (1.4); 8.2437 (1.5); 8.2420 (1.5); 8.2337 (1.5); 8.2319 (1.6); 8.2303 (1.5); 7.5034 (0.7); 7.4999 (0.8); 7.4826 (1.0); 7.4795 (1.6); 7.4670 (0.9); 7.4624 (1.2); 7.4597 (1.6); 7.4559 (1.7); 7.4449 (0.9); 7.4403 (1.1); 7.4342 (0.8); 7.3267 (0.8); 7.3175 (1.0); 7.3156 (1.1); 7.3060 (1.5); 7.2949 (0.9); 7.2854 (0.7); 7.2644 (4.2); 7.2635 (4.5); 5.9899 (2.2); 5.9870 (5.8); 3.6855 (16.0); 1.6159 (0.6); 1.6089 (0.7); 1.5951 (1.1); 1.5906 (0.6); 1.5817 (0.7); 1.5746 (0.7); 0.8143 (1.9); 0.8085 (1.8); 0.7985 (1.1); 0.7923 (1.9); 0.7862 (2.2); 0.7779 (2.0); 0.7722 (2.2); 0.7661 (2.1); 0.7602 (1.6); 0.0003 (6.3); -0.0002 (6.4)
I-86: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4179 (1.2); 8.4110 (1.3); 8.3207 (0.7); 8.3169 (1.3); 8.3131 (0.7); 8.1911 (0.6); 8.1892 (0.7); 8.1874 (0.7); 8.1856 (0.6); 8.1794 (0.6); 8.1776 (0.7); 8.1758 (0.7); 8.1739 (0.6); 7.4992 (0.5); 7.4955 (0.5); 7.4786 (0.7); 7.4752 (0.9); 7.4720 (0.6); 7.4551 (0.6); 7.4514 (0.6); 7.4346 (0.6); 7.4303 (0.6); 7.4277 (0.6); 7.4234 (0.5); 7.4120 (0.6); 7.4077 (0.6); 7.4051 (0.6); 7.4008 (0.5); 7.2994 (0.6); 7.2905 (0.7); 7.2878 (0.7); 7.2788 (1.2); 7.2699 (0.6); 7.2671 (0.6); 7.2612 (17.6); 7.2585 (1.1); 6.0152 (5.0); 3.8360 (14.4); 3.6596 (16.0); 1.6081 (0.8); 1.5883 (0.7); 1.5739 (1.2); 0.8234 (0.5); 0.8193 (1.0); 0.8180 (1.0); 0.8164 (0.9); 0.8123 (0.7); 0.7973 (2.2); 0.7929 (1.4); 0.7847 (1.0); 0.7833 (1.1); 0.7811 (0.8); 0.7797 (0.7); 0.7765 (0.7); 0.0079 (0.8); 0.0030 (0.5); 0.0022 (0.9); -0.0002 (24.8); -0.0027 (1.4); -0.0043 (0.6); -0.0085 (0.8)
I-87: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4182 (1.8); 8.4113 (1.8); 8.3206 (1.1); 8.3171 (1.9); 8.3134 (1.1); 8.1873 (1.0); 8.1774 (1.0); 7.4992 (0.6); 7.4956 (0.6); 7.4785 (0.8); 7.4754 (1.2); 7.4721 (0.7); 7.4551 (0.7); 7.4515 (0.7); 7.4347 (0.6); 7.4303 (0.7); 7.4279 (0.7); 7.4235 (0.6); 7.4121 (0.7); 7.4076 (0.8); 7.4054 (0.7); 7.4009 (0.6); 7.2994 (0.7); 7.2904 (0.8); 7.2878 (0.8); 7.2788 (1.2); 7.2697 (0.8); 7.2669 (0.9); 7.2609 (20.9); 6.0155 (5.3); 3.8362 (15.3); 3.6598 (16.0); 1.6227 (0.6); 1.6084 (1.0); 1.5926 (0.5); 1.5887 (0.8); 1.5742 (0.8); 1.5632 (0.9); 0.8191 (1.5); 0.7975 (3.3); 0.7844 (1.6); 0.7765 (0.9); 0.0080 (1.0); -0.0002 (30.6); -0.0083 (1.1)
I-89: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2970 (1.4); 8.2954 (1.4); 8.2871 (1.3); 8.2854 (1.4); 8.2837 (1.4); 8.1551 (1.8); 8.1493 (1.9); 7.7802 (0.6); 7.7741 (0.6); 7.7607 (1.0); 7.7547 (1.0); 7.7403 (0.7); 7.7341 (0.6); 7.4986 (0.6); 7.4950 (0.7); 7.4750 (1.4); 7.4546 (0.8); 7.4511 (0.8); 7.3405 (0.8); 7.3311 (1.0); 7.3289 (1.0); 7.3198 (1.3); 7.3083 (0.7); 7.2991 (0.6); 7.2625 (6.7); 6.9433 (1.1); 6.9361 (1.2); 6.9222 (1.1); 6.9149 (1.1); 5.9687 (6.1); 3.7118 (1.0); 3.6904 (16.0); 1.5865 (0.6); 1.5791 (0.6); 1.5654 (1.0); 1.5524 (0.6); 1.5448 (0.6); 0.7882 (2.4); 0.7782 (0.8); 0.7672 (2.5); 0.7569 (1.2); 0.7491 (0.8); 0.7388 (2.3); 0.7271 (2.2); -0.0002 (10.1)
I-90: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2669 (1.4); 8.2553 (1.5); 8.1579 (1.8); 8.1530 (1.9); 7.7853 (0.6); 7.7793 (0.6); 7.7657 (1.1); 7.7596 (1.1); 7.7453 (0.7); 7.7393 (0.7); 7.5075 (0.6); 7.5048 (0.7); 7.4842 (1.4); 7.4635 (0.8); 7.4607 (0.9); 7.3386 (0.8); 7.3288 (1.1); 7.3179 (1.3); 7.3080 (0.8); 7.2972 (0.6); 7.2611 (15.4); 6.9459 (1.2); 6.9386 (1.3); 6.9248 (1.2); 6.9175 (1.2); 5.9413 (5.6); 5.3004 (1.4); 3.6970 (16.0); 1.5903 (0.6); 1.5826 (0.6); 1.5688 (1.1); 1.5561 (0.7); 1.5484

[0672]

(0.6); 0.7986 (2.1); 0.7911 (1.0); 0.7818 (1.7); 0.7779 (2.0); 0.7681 (0.8); 0.7550 (0.6); 0.7464 (1.0); 0.7373 (2.2); 0.7337 (2.1); 0.7253 (2.1); 0.0078 (0.9); -0.0002 (23.3)
I-91: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4575 (1.5); 8.4506 (1.6); 8.3062 (0.8); 8.3025 (1.5); 8.2988 (0.8); 8.2298 (0.6); 8.2280 (0.7); 8.2262 (0.8); 8.2245 (0.7); 8.2182 (0.7); 8.2164 (0.8); 8.2145 (0.8); 8.2129 (0.7); 7.5427 (0.5); 7.5390 (0.6); 7.5312 (0.6); 7.5268 (0.7); 7.5243 (0.7); 7.5220 (0.9); 7.5196 (1.4); 7.5159 (0.7); 7.5090 (0.7); 7.5046 (0.7); 7.5021 (0.7); 7.4986 (1.0); 7.4951 (0.7); 7.3692 (0.7); 7.3602 (0.8); 7.3576 (0.7); 7.3486 (1.2); 7.3395 (0.6); 7.3369 (0.6); 7.3279 (0.5); 7.2613 (13.5); 6.0089 (5.1); 3.8549 (14.6); 3.6899 (16.0); 2.9637 (0.8); 1.5521 (6.4); 0.0080 (0.6); -0.0002 (20.6); -0.0085 (0.6)
I-93: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1231 (1.2); 8.1170 (1.3); 7.6770 (0.5); 7.6709 (0.5); 7.6579 (0.7); 7.6560 (0.7); 7.6518 (0.7); 7.6499 (0.7); 7.6370 (0.6); 7.6307 (0.6); 7.2621 (6.3); 7.1343 (1.0); 7.1267 (1.0); 7.1178 (0.7); 7.1161 (0.6); 7.1102 (0.7); 7.0413 (0.9); 7.0213 (1.1); 6.9012 (0.8); 6.9000 (0.8); 6.8938 (0.8); 6.8801 (0.8); 6.8788 (0.8); 6.8727 (0.8); 5.9766 (5.2); 3.8364 (15.3); 3.6570 (16.0); 2.1662 (4.3); 2.1610 (4.3); 1.5808 (0.5); 1.5646 (3.6); 1.5534 (0.5); 1.5466 (0.6); 0.7876 (0.9); 0.7845 (1.5); 0.7826 (1.2); 0.7796 (0.9); 0.7769 (1.1); 0.7671 (0.9); 0.7629 (1.4); 0.7608 (1.6); 0.7574 (1.9); 0.7513 (1.5); 0.7440 (1.5); 0.7388 (1.5); 0.7361 (1.1); 0.7332 (1.0); -0.0002 (7.0)
I-94: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1184 (1.2); 8.1123 (1.3); 7.7743 (0.5); 7.7680 (0.5); 7.7555 (0.7); 7.7531 (0.7); 7.7493 (0.7); 7.7469 (0.7); 7.7343 (0.6); 7.7281 (0.6); 7.2618 (7.4); 7.1883 (0.9); 7.1785 (1.0); 7.1715 (0.7); 7.1617 (0.7); 7.0829 (0.8); 7.0640 (1.1); 6.9478 (0.8); 6.9464 (0.8); 6.9403 (0.8); 6.9390 (0.8); 6.9265 (0.8); 6.9251 (0.8); 6.9191 (0.8); 6.9178 (0.8); 5.9222 (5.4); 4.3392 (0.8); 4.3215 (2.6); 4.3037 (2.7); 4.2860 (1.0); 3.6853 (16.0); 2.1761 (4.2); 2.1709 (4.4); 1.3396 (3.7); 1.3218 (7.8); 1.3039 (3.7); -0.0002 (8.2)
I-95: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1271 (1.4); 8.1210 (1.4); 7.7780 (0.6); 7.7718 (0.6); 7.7592 (0.7); 7.7569 (0.8); 7.7531 (0.8); 7.7507 (0.7); 7.7381 (0.6); 7.7319 (0.6); 7.2620 (9.7); 7.2151 (0.6); 7.1962 (1.3); 7.1793 (0.9); 7.1758 (0.8); 7.0893 (0.9); 7.0689 (1.2); 7.0493 (0.5); 6.9459 (0.9); 6.9393 (0.9); 6.9247 (0.9); 6.9182 (0.9); 5.9083 (5.6); 4.5288 (2.0); 4.5125 (4.5); 4.4962 (2.2); 4.1309 (0.5); 4.1131 (0.6); 3.6749 (16.0); 3.6623 (15.3); 2.7336 (2.0); 2.7173 (4.2); 2.7010 (2.0); 2.1772 (4.8); 2.1721 (4.8); 2.0454 (2.5); 1.2774 (0.7); 1.2596 (1.3); 1.2417 (0.7); -0.0002 (10.6)
I-96: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1943 (1.5); 8.1812 (1.6); 7.2619 (7.3); 7.2224 (0.8); 7.2206 (0.8); 7.2067 (0.8); 7.1915 (0.9); 7.1748 (0.6); 7.1099 (0.9); 7.0898 (1.2); 7.0715 (1.2); 7.0682 (1.4); 7.0640 (0.8); 7.0586 (0.8); 7.0548 (1.2); 7.0510 (0.7); 6.8860 (1.8); 5.9138 (5.5); 4.3391 (0.8); 4.3214 (2.7); 4.3036 (2.8); 4.2857 (1.0); 3.6830 (16.0); 2.1935 (4.7); 2.1884 (4.7); 1.3381 (3.7); 1.3203 (7.8); 1.3025 (3.7); -0.0002 (7.9)
I-97: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1948 (1.6); 8.1818 (1.7); 7.2619 (8.3); 7.2329 (0.6); 7.2221 (1.0); 7.2125 (1.2); 7.1957 (0.8); 7.1143 (0.9); 7.0951 (1.3); 7.0766 (1.2); 7.0733 (1.4); 7.0692 (0.8); 7.0638 (0.8); 7.0599 (1.2); 7.0563 (0.8); 6.8927 (1.9); 5.9011 (5.6); 4.5284 (2.0); 4.5122 (4.4); 4.4959 (2.2); 3.6726 (16.0); 3.6612 (15.4); 2.7313 (2.0); 2.7151 (4.1); 2.6988 (1.9); 2.1942 (4.8); 2.1893 (5.0); -0.0002 (8.7)
I-98: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4486 (0.8); 8.4419 (0.8); 8.2907 (0.9); 7.4338 (0.5); 7.4294 (0.6); 7.4269 (0.6); 7.4225 (0.5); 7.4115 (0.6); 7.4071 (0.6); 7.4046 (0.6); 7.4002 (0.5); 7.2619 (5.6); 7.2017 (0.6); 7.1975 (0.7); 7.1858 (0.8); 7.1810 (0.6); 7.0932 (0.6); 7.0916 (0.6); 7.0729 (0.9); 5.9636 (5.1); 3.8555 (14.9); 3.6866 (16.0); 2.1799 (3.4); 2.1746 (3.4); -0.0002 (8.7)
I-99: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1144 (0.6); 8.1127 (0.9); 8.1106 (0.7); 8.1085 (0.7); 8.1064 (1.0); 7.7674 (0.5); 7.7611 (0.5); 7.7487 (0.6); 7.7462 (0.6); 7.7425 (0.6); 7.7399 (0.6); 7.7275 (0.5); 7.7212 (0.5);

[0673]

7.2626 (3.8); 7.2023 (0.6); 7.2008 (0.6); 7.1980 (0.6); 7.1857 (0.8); 7.1812 (0.6); 7.0939 (0.6); 7.0922 (0.6); 7.0736 (0.9); 6.9528 (0.6); 6.9512 (0.7); 6.9453 (0.7); 6.9437 (0.7); 6.9315 (0.6); 6.9299 (0.7); 6.9240 (0.6); 6.9224 (0.6); 5.9620 (5.0); 3.8550 (14.7); 3.6861 (16.0); 2.1834 (3.3); 2.1780 (3.3); 1.5641 (0.9); -0.0002 (6.2)
I-100: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4487 (0.8); 8.4419 (0.8); 8.2847 (1.0); 7.4263 (0.6); 7.4219 (0.6); 7.4195 (0.6); 7.4151 (0.6); 7.4040 (0.6); 7.3996 (0.6); 7.3972 (0.6); 7.3928 (0.5); 7.2618 (5.9); 7.2063 (0.6); 7.1964 (0.7); 7.1027 (0.6); 7.1010 (0.6); 7.0824 (0.9); 5.9630 (4.9); 3.8569 (14.8); 3.6877 (16.0); 2.1851 (3.2); 2.1797 (3.3); -0.0002 (9.3)
I-101: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5863 (1.3); 8.5816 (1.8); 8.5765 (1.4); 8.5667 (1.4); 8.5617 (1.9); 8.5569 (1.4); 8.2174 (1.0); 8.2111 (1.0); 8.1992 (1.0); 8.1930 (1.1); 8.1829 (1.2); 8.1786 (1.3); 8.1712 (1.3); 8.1668 (1.3); 8.1619 (1.3); 8.1576 (1.3); 8.1502 (1.4); 8.1458 (1.3); 7.8112 (0.6); 7.8050 (0.6); 7.8005 (0.6); 7.7927 (0.7); 7.7901 (0.7); 7.7863 (0.7); 7.7838 (0.8); 7.7819 (0.7); 7.7794 (0.7); 7.7756 (0.6); 7.7730 (0.8); 7.7716 (0.7); 7.7652 (0.6); 7.7607 (0.6); 7.7545 (0.6); 7.4473 (1.3); 7.4355 (2.7); 7.4276 (1.3); 7.4238 (1.4); 7.4159 (2.6); 7.4041 (1.4); 7.2622 (24.4); 7.0102 (0.7); 7.0088 (0.7); 7.0028 (0.8); 7.0011 (0.9); 6.9998 (0.9); 6.9983 (0.9); 6.9921 (0.8); 6.9894 (0.9); 6.9877 (0.8); 6.9817 (0.8); 6.9800 (0.8); 6.9787 (0.8); 6.9771 (0.7); 6.9711 (0.7); 6.9696 (0.6); 5.8413 (6.6); 5.3006 (10.0); 3.8970 (14.4); 3.8856 (15.2); 3.6778 (16.0); 3.6573 (15.2); 2.9498 (12.8); 2.8989 (13.6); 2.1343 (0.8); 1.5659 (7.4); 1.2596 (0.6); 1.2552 (0.5); 0.0696 (1.0); 0.0079 (0.8); -0.0002 (29.8); -0.0085 (0.9)
I-102: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2523 (1.2); 8.2482 (1.3); 8.2405 (1.3); 8.2364 (1.3); 8.1369 (1.0); 8.1349 (0.8); 8.1328 (0.8); 8.1307 (1.0); 8.1288 (0.7); 8.0570 (1.2); 8.0529 (1.2); 8.0371 (1.3); 8.0330 (1.2); 7.8606 (0.6); 7.8543 (0.6); 7.8419 (0.6); 7.8393 (0.7); 7.8356 (0.6); 7.8331 (0.6); 7.8206 (0.6); 7.8143 (0.6); 7.3779 (1.4); 7.3661 (1.3); 7.3580 (1.3); 7.3463 (1.3); 7.2614 (12.5); 6.9485 (0.6); 6.9470 (0.7); 6.9410 (0.7); 6.9395 (0.7); 6.9273 (0.6); 6.9257 (0.7); 6.9198 (0.7); 6.9183 (0.7); 5.9314 (5.2); 5.3003 (2.9); 4.9054 (5.0); 4.9047 (5.1); 3.8522 (14.9); 3.6841 (0.5); 3.6797 (16.0); 1.5539 (0.8); 0.0694 (0.8); -0.0002 (15.5)
I-103: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.6053 (1.0); 8.6009 (1.2); 8.5994 (1.3); 8.5950 (1.3); 8.5856 (1.1); 8.5812 (1.2); 8.5797 (1.4); 8.5753 (1.3); 8.2345 (0.8); 8.2324 (0.6); 8.2303 (0.6); 8.2282 (0.8); 8.2206 (0.9); 8.2185 (0.7); 8.2164 (0.7); 8.2143 (0.9); 8.2047 (1.0); 8.2003 (1.0); 8.1930 (1.1); 8.1884 (1.2); 8.1874 (1.3); 8.1829 (1.2); 8.1755 (1.2); 8.1711 (1.2); 7.8284 (0.5); 7.8221 (0.5); 7.8098 (1.0); 7.8073 (0.6); 7.8035 (0.6); 7.8010 (0.6); 7.7975 (0.5); 7.7949 (0.5); 7.7912 (0.5); 7.7886 (1.0); 7.7824 (0.6); 7.4679 (1.1); 7.4575 (1.4); 7.4563 (1.2); 7.4482 (1.1); 7.4459 (1.3); 7.4379 (1.4); 7.4365 (1.2); 7.4262 (1.2); 7.2630 (16.3); 7.0127 (0.6); 7.0111 (0.7); 7.0036 (1.2); 6.9961 (0.6); 6.9945 (0.6); 6.9915 (0.7); 6.9900 (0.7); 6.9824 (1.1); 6.9749 (0.5); 6.9734 (0.5); 5.8468 (4.1); 5.8443 (4.9); 5.3008 (16.0); 3.8977 (11.6); 3.8884 (13.7); 3.6794 (14.8); 3.6631 (12.4); 2.9632 (10.2); 2.9170 (12.0); 2.1332 (0.6); 1.5755 (2.2); 0.0699 (2.2); 0.0080 (0.5); -0.0002 (20.2); -0.0085 (0.6)
I-104: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1452 (0.9); 8.1432 (0.7); 8.1411 (0.7); 8.1389 (1.0); 8.1372 (0.7); 8.1203 (1.1); 8.1163 (1.2); 8.1086 (1.2); 8.1046 (1.2); 7.8746 (0.5); 7.8684 (0.5); 7.8558 (0.6); 7.8535 (0.6); 7.8496 (0.6); 7.8472 (0.6); 7.8347 (0.6); 7.8284 (0.6); 7.5995 (0.8); 7.5955 (0.8); 7.5794 (0.9); 7.5755 (0.9); 7.2849 (1.4); 7.2732 (1.3); 7.2650 (1.4); 7.2614 (14.1); 7.2532 (1.2); 6.9241 (0.6); 6.9226 (0.7); 6.9167 (0.7); 6.9152 (0.7); 6.9029 (0.6); 6.9013 (0.7); 6.8955 (0.6); 6.8940 (0.6); 5.9944 (5.1); 5.3003 (3.8); 3.8842 (0.6); 3.8413 (14.8); 3.6781 (16.0); 2.3851 (11.1); 1.5517 (4.6); -0.0002 (17.3); -0.0085 (0.5)
I-105: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.1801 (0.6); 8.1781 (0.7); 8.1754 (0.7); 8.1734 (0.7); 8.1680 (0.6); 8.1660 (0.7); 8.1633 (0.7); 8.1612 (0.7); 7.7539 (0.6); 7.7491 (0.6); 7.7353 (0.7); 7.7334 (0.8); 7.7306 (0.7); 7.7286 (0.8); 7.7149 (0.7); 7.7101 (0.7); 7.4963 (0.8); 7.4940 (1.4); 7.4918 (0.8); 7.4758 (0.7); 7.4735 (1.2); 7.4713 (0.7); 7.3307 (1.3); 7.3252 (0.5); 7.3174 (1.4); 7.3139 (0.6); 7.3121 (0.6); 7.3084 (1.7); 7.3008 (0.6); 7.2952 (1.6); 7.2607 (9.8); 7.1497 (0.7); 7.1472

[0674]

(0.7); 7.1375 (0.7); 7.1350 (0.7); 7.1312 (0.7); 7.1287 (0.7); 7.1190 (0.7); 7.1165 (0.6); 7.0922 (1.6); 7.0705 (2.6); 7.0653 (0.5); 7.0485 (1.4); 6.0289 (5.0); 3.8670 (15.0); 3.6959 (16.0); 1.5529 (0.9); -0.0002 (11.1)
I-106: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.1190 (0.9); 8.1170 (0.7); 8.1149 (0.8); 8.1128 (1.0); 7.6577 (0.5); 7.6556 (0.6); 7.6515 (0.6); 7.6493 (0.6); 7.3651 (0.7); 7.3607 (0.8); 7.3417 (0.5); 7.2613 (13.1); 7.1655 (0.6); 7.1626 (0.7); 6.9944 (0.7); 6.9905 (0.5); 6.9041 (0.6); 6.9026 (0.7); 6.8966 (0.7); 6.8951 (0.7); 6.8830 (0.6); 6.8814 (0.6); 6.8755 (0.6); 6.8739 (0.6); 5.9353 (5.5); 4.3267 (0.5); 4.3237 (0.6); 4.3089 (1.6); 4.3059 (1.7); 4.2910 (1.7); 4.2882 (1.6); 4.2732 (0.6); 4.2704 (0.5); 3.6887 (0.6); 3.6602 (16.0); 1.5643 (1.0); 1.5544 (5.6); 1.5483 (0.8); 1.5452 (0.6); 1.3335 (3.6); 1.3157 (7.6); 1.2979 (3.5); 0.7856 (1.3); 0.7835 (2.1); 0.7792 (0.6); 0.7745 (0.6); 0.7704 (2.0); 0.7677 (1.5); 0.7638 (2.1); 0.7561 (1.9); -0.0002 (17.8); -0.0085 (0.6)
I-107: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2002 (1.5); 8.1886 (1.5); 8.1450 (2.0); 8.1406 (2.0); 7.7818 (0.6); 7.7756 (0.6); 7.7625 (1.1); 7.7564 (1.1); 7.7417 (0.6); 7.7356 (0.6); 7.4822 (0.7); 7.4586 (1.4); 7.4382 (0.8); 7.2944 (0.7); 7.2851 (1.2); 7.2739 (1.3); 7.2619 (9.4); 7.2534 (0.6); 6.9265 (1.2); 6.9191 (1.2); 6.9054 (1.1); 6.8980 (1.1); 6.0194 (5.2); 3.8527 (1.0); 3.8342 (15.5); 3.6875 (1.0); 3.6580 (16.0); 1.5948 (0.6); 1.5800 (1.2); 1.5615 (4.5); 0.7929 (2.8); 0.7741 (4.7); 0.7609 (2.3); 0.0079 (0.6); -0.0002 (13.4)
I-108: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.2001 (1.5); 8.1884 (1.5); 8.1449 (1.9); 8.1405 (1.9); 7.7816 (0.6); 7.7755 (0.6); 7.7624 (1.2); 7.7563 (1.2); 7.7417 (0.7); 7.7356 (0.6); 7.4819 (0.7); 7.4584 (1.4); 7.4379 (0.9); 7.2942 (0.8); 7.2849 (1.2); 7.2735 (1.4); 7.2631 (10.3); 7.2614 (12.2); 7.2539 (0.6); 6.9264 (1.2); 6.9189 (1.2); 6.9052 (1.2); 6.8978 (1.2); 6.0193 (5.3); 3.8342 (15.6); 3.6579 (16.0); 1.5946 (0.6); 1.5800 (1.2); 1.5541 (6.2); 0.7930 (2.9); 0.7742 (4.8); 0.7609 (2.3); 0.0078 (0.9); 0.0016 (14.6); -0.0002 (17.7)
I-109: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4961 (1.7); 8.4894 (1.8); 8.3534 (1.0); 8.3499 (1.8); 8.3466 (1.2); 7.3890 (0.6); 7.3847 (0.7); 7.3822 (0.7); 7.3779 (0.6); 7.3671 (0.7); 7.3628 (0.8); 7.3603 (0.7); 7.3560 (0.7); 7.2627 (5.1); 7.1644 (0.8); 7.1580 (0.5); 7.1511 (0.5); 7.0113 (0.5); 7.0025 (0.6); 6.9928 (0.5); 6.9850 (0.9); 6.9730 (0.6); 6.9622 (0.9); 6.9502 (0.9); 5.9315 (4.5); 3.6850 (16.0); 1.5955 (0.5); 1.5879 (0.6); 1.5746 (0.9); 1.5612 (0.6); 1.5538 (0.6); 0.8819 (0.6); 0.8197 (0.8); 0.8160 (1.3); 0.8096 (0.8); 0.8066 (0.7); 0.7997 (1.2); 0.7940 (1.2); 0.7857 (0.7); 0.7643 (0.8); 0.7590 (0.8); 0.7562 (1.4); 0.7532 (1.1); 0.7505 (1.3); 0.7461 (0.9); 0.7431 (1.6); 0.7402 (1.1); 0.7373 (0.6); -0.0002 (6.4)
I-110: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4912 (1.8); 8.4843 (1.8); 8.3482 (1.0); 8.3445 (1.8); 8.3409 (1.0); 7.3840 (0.6); 7.3797 (0.7); 7.3771 (0.7); 7.3728 (0.6); 7.3620 (0.7); 7.3576 (0.7); 7.3551 (0.6); 7.3508 (0.6); 7.2620 (8.0); 7.1621 (0.7); 7.0080 (0.6); 6.9982 (0.5); 6.9928 (0.6); 6.9810 (0.6); 6.9702 (0.8); 6.9582 (0.8); 5.9321 (7.1); 3.6938 (16.0); 1.5977 (0.5); 1.5901 (0.5); 1.5768 (0.9); 1.5634 (0.5); 1.5559 (0.6); 1.4322 (0.5); 0.8239 (0.8); 0.8201 (1.2); 0.8131 (0.6); 0.8105 (0.8); 0.8034 (0.8); 0.7997 (1.0); 0.7982 (1.4); 0.7896 (0.5); 0.7616 (0.7); 0.7553 (0.9); 0.7527 (1.4); 0.7495 (0.9); 0.7477 (1.2); 0.7422 (1.0); 0.7396 (1.4); 0.7365 (1.0); 0.7342 (0.6); -0.0002 (10.7); -0.0027 (0.7)
I-111: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.4479 (1.4); 8.4410 (1.4); 8.3101 (0.8); 8.3063 (1.5); 8.3025 (0.8); 7.3489 (0.6); 7.3445 (0.6); 7.3420 (0.6); 7.3376 (0.6); 7.3265 (0.6); 7.3221 (0.6); 7.3196 (0.6); 7.3153 (0.6); 7.2617 (10.9); 7.1483 (0.7); 6.9947 (0.6); 6.9824 (0.6); 6.9701 (0.5); 6.9593 (0.7); 6.9473 (0.7); 5.9490 (5.1); 3.8499 (14.9); 3.6602 (16.0); 1.5943 (0.5); 1.5807 (0.7); 1.5763 (0.6); 1.5675 (3.2); 1.5602 (0.8); 0.8174 (0.6); 0.8145 (1.3); 0.8114 (0.9); 0.8069 (0.9); 0.7967 (0.6); 0.7935 (1.1); 0.7901 (0.8); 0.7864 (0.8); 0.7823 (1.0); 0.7746 (1.0); 0.7702 (0.8); 0.7683 (1.4); 0.7655 (0.8); 0.7630 (0.9); 0.7619 (0.9); 0.7598 (0.8); 0.7571 (0.7); 0.7559 (0.7); -0.0002 (14.1)
I-112: ¹ H NMR(400.6 MHz, CDCl ₃):

[0675]

δ = 8.4479 (1.3); 8.4410 (1.3); 8.3102 (0.7); 8.3064 (1.4); 8.3026 (0.8); 7.3489 (0.6); 7.3445 (0.6); 7.3420 (0.6); 7.3376 (0.5); 7.3265 (0.6); 7.3222 (0.6); 7.3197 (0.6); 7.3153 (0.5); 7.2621 (7.8); 7.1484 (0.6); 6.9947 (0.5); 6.9826 (0.6); 6.9595 (0.6); 6.9475 (0.6); 5.9491 (5.1); 3.8499 (14.7); 3.6603 (16.0); 1.5809 (0.8); 1.5734 (2.4); 1.5682 (0.6); 1.5603 (0.5); 0.8174 (0.6); 0.8145 (1.2); 0.8114 (0.9); 0.8069 (0.9); 0.7966 (0.5); 0.7935 (1.0); 0.7901 (0.8); 0.7865 (0.8); 0.7823 (1.0); 0.7763 (0.8); 0.7747 (0.9); 0.7735 (0.8); 0.7704 (0.8); 0.7683 (1.3); 0.7655 (0.7); 0.7631 (0.8); 0.7620 (0.8); 0.7599 (0.7); 0.7573 (0.7); 0.7559 (0.7); -0.0002 (11.0)

I-113: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.4165 (1.4); 8.4097 (1.5); 8.3213 (0.8); 8.3174 (1.5); 8.3136 (0.8); 8.1922 (0.6); 8.1903 (0.7); 8.1885 (0.7); 8.1868 (0.7); 8.1806 (0.7); 8.1787 (0.8); 8.1769 (0.7); 8.1752 (0.7); 7.4965 (0.5); 7.4928 (0.6); 7.4759 (0.7); 7.4726 (0.9); 7.4693 (0.6); 7.4524 (0.7); 7.4487 (0.6); 7.4347 (0.6); 7.4303 (0.6); 7.4278 (0.6); 7.4234 (0.6); 7.4121 (0.6); 7.4077 (0.6); 7.4052 (0.6); 7.4008 (0.6); 7.2976 (0.7); 7.2887 (0.7); 7.2860 (0.7); 7.2770 (1.2); 7.2681 (0.6); 7.2653 (0.7); 7.2614 (13.1); 7.2564 (0.7); 5.9921 (5.5); 4.3178 (0.5); 4.3037 (1.6); 4.3000 (1.6); 4.2859 (1.6); 4.2822 (1.6); 4.2680 (0.5); 4.2645 (0.5); 3.6600 (16.0); 1.6083 (0.8); 1.5917 (0.6); 1.5902 (0.5); 1.5741 (0.5); 1.3297 (3.6); 1.3118 (7.6); 1.2940 (3.5); 0.8172 (1.6); 0.8150 (1.7); 0.8104 (1.9); 0.8061 (0.7); 0.7964 (8.0); 0.0080 (0.5); -0.0002 (20.4); -0.0085 (0.6)

I-114: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1181 (1.1); 8.1161 (0.8); 8.1137 (0.9); 8.1119 (1.1); 7.7721 (0.5); 7.7659 (0.5); 7.7533 (0.6); 7.7509 (0.6); 7.7471 (0.6); 7.7447 (0.6); 7.7322 (0.6); 7.7259 (0.5); 7.2616 (6.5); 7.1917 (0.8); 7.1760 (1.0); 7.1602 (0.5); 7.0854 (0.7); 7.0652 (1.0); 6.9478 (0.7); 6.9464 (0.7); 6.9403 (0.8); 6.9390 (0.7); 6.9265 (0.7); 6.9251 (0.7); 6.9191 (0.7); 6.9177 (0.7); 5.9623 (5.2); 3.8537 (15.2); 3.6848 (16.0); 2.1785 (3.9); 2.1732 (3.8); 1.5548 (2.4); 0.8819 (0.7); -0.0002 (9.6)

I-115: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1952 (1.4); 8.1822 (1.4); 7.2619 (6.8); 7.2227 (0.7); 7.2085 (0.6); 7.2055 (0.7); 7.1890 (0.7); 7.1724 (0.5); 7.1098 (0.8); 7.0907 (1.1); 7.0701 (1.0); 7.0661 (1.1); 7.0622 (0.7); 7.0570 (0.6); 7.0530 (1.0); 7.0492 (0.6); 6.8848 (1.5); 5.9539 (5.2); 3.8540 (15.3); 3.6823 (16.0); 2.1958 (4.0); 2.1905 (4.0); 1.5599 (2.5); 0.8817 (0.5); -0.0002 (7.8)

I-116: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1234 (1.4); 8.1174 (1.5); 7.6784 (0.6); 7.6723 (0.6); 7.6577 (0.8); 7.6516 (0.8); 7.6383 (0.6); 7.6321 (0.6); 7.2615 (8.7); 7.1496 (1.0); 7.1314 (2.0); 7.1132 (1.4); 7.0389 (1.0); 7.0195 (1.2); 7.0001 (0.6); 6.8996 (1.0); 6.8922 (1.0); 6.8785 (0.9); 6.8711 (1.0); 5.9413 (5.4); 4.3233 (0.6); 4.3204 (0.7); 4.3055 (2.0); 4.3026 (2.0); 4.2877 (2.1); 4.2849 (2.0); 4.2698 (0.7); 4.2672 (0.7); 3.6572 (16.0); 2.1639 (5.1); 2.1588 (5.2); 1.5804 (0.6); 1.5654 (1.2); 1.5577 (3.2); 1.5492 (0.6); 1.5463 (0.7); 1.3323 (3.8); 1.3145 (7.9); 1.2966 (3.8); 0.7814 (3.0); 0.7765 (1.1); 0.7668 (2.7); 0.7620 (4.3); 0.7530 (2.7); -0.0002 (9.6)

I-117: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1314 (1.3); 8.1254 (1.4); 7.6847 (0.5); 7.6785 (0.5); 7.6655 (0.7); 7.6636 (0.8); 7.6594 (0.8); 7.6575 (0.7); 7.6446 (0.6); 7.6384 (0.6); 7.2623 (8.3); 7.1583 (0.9); 7.1396 (1.9); 7.1215 (1.4); 7.0448 (0.9); 7.0254 (1.2); 6.9046 (0.8); 6.8974 (0.9); 6.8834 (0.8); 6.8762 (0.8); 5.9270 (5.6); 4.5155 (2.0); 4.4991 (4.5); 4.4827 (2.2); 3.6695 (15.0); 3.6427 (16.0); 2.7274 (1.9); 2.7111 (4.1); 2.6947 (1.9); 2.1662 (4.4); 2.1611 (4.6); 1.5567 (0.8); 0.7854 (0.6); 0.7793 (1.6); 0.7751 (1.2); 0.7708 (0.9); 0.7583 (3.2); 0.7538 (2.3); 0.7493 (1.4); 0.7407 (1.9); 0.7367 (1.1); -0.0002 (9.2)

I-118: ^1H NMR(400.6 MHz, CDCl_3):

δ = 8.4843 (1.7); 8.4775 (1.8); 8.2751 (1.0); 8.2715 (1.8); 8.2679 (1.0); 7.4561 (0.6); 7.4516 (0.8); 7.4492 (0.8); 7.4446 (1.1); 7.4402 (0.7); 7.4342 (0.8); 7.4295 (1.0); 7.4276 (1.2); 7.4238 (1.6); 7.4200 (0.8); 7.4076 (0.7); 7.4035 (0.7); 7.3176 (0.5); 7.3134 (0.5); 7.3014 (0.6); 7.2973 (1.2); 7.2932 (0.7); 7.2813 (0.8); 7.2771 (0.7); 7.2618 (8.0); 7.1716 (0.8); 7.1679 (0.8); 7.1514 (1.2); 7.1476 (1.2); 7.1311 (0.5); 7.1273 (0.5); 5.9024 (5.4); 4.3450 (0.8); 4.3272 (2.6); 4.3093 (2.7); 4.2915 (1.0); 3.6869 (16.0); 1.5612 (3.8); 1.3439 (3.8); 1.3260 (7.8); 1.3082 (3.7); -0.0002 (8.9)

[0676]

I-119: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃): δ = 8.4885 (1.5); 8.4817 (1.5); 8.2908 (0.9); 8.2874 (1.5); 8.2840 (1.0); 7.4699 (0.6); 7.4654 (0.7); 7.4630 (0.7); 7.4586 (0.6); 7.4477 (0.9); 7.4432 (1.2); 7.4367 (0.7); 7.4304 (0.6); 7.4264 (1.2); 7.4224 (0.8); 7.4101 (0.6); 7.4059 (0.7); 7.3557 (0.5); 7.3515 (0.5); 7.3395 (0.6); 7.3354 (1.2); 7.3313 (0.7); 7.3193 (0.7); 7.3151 (0.6); 7.2621 (9.6); 7.1823 (0.7); 7.1784 (0.7); 7.1620 (1.2); 7.1581 (1.2); 7.1417 (0.5); 7.1379 (0.5); 5.8870 (5.7); 4.5318 (1.9); 4.5157 (4.3); 4.4996 (2.0); 3.6777 (16.0); 3.6620 (14.6); 2.7321 (1.8); 2.7160 (3.7); 2.6999 (1.7); -0.0002 (10.8)
I-120: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃): δ = 8.0869 (0.8); 8.0806 (0.9); 7.3971 (0.6); 7.3936 (0.8); 7.3930 (0.8); 7.3745 (0.8); 7.2615 (8.2); 7.2086 (0.6); 7.2069 (0.7); 7.2052 (0.7); 7.0360 (0.8); 6.9406 (0.6); 6.9390 (0.6); 6.9331 (0.6); 6.9315 (0.6); 6.9194 (0.6); 6.9178 (0.6); 6.9119 (0.6); 6.9103 (0.6); 6.8528 (0.8); 6.7177 (1.5); 6.5827 (0.9); 5.9841 (4.8); 5.2999 (1.5); 3.8538 (14.7); 3.6788 (16.0); 1.5521 (2.4); -0.0002 (9.2)
I-121: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃): δ = 8.0989 (1.0); 8.0927 (1.0); 7.7797 (0.5); 7.4320 (0.7); 7.4278 (0.8); 7.4133 (0.5); 7.4089 (0.6); 7.2612 (12.8); 7.2314 (0.5); 7.2297 (0.5); 7.2102 (0.8); 7.0554 (0.5); 7.0523 (0.5); 7.0309 (0.9); 7.0273 (0.5); 6.9390 (0.7); 6.9375 (0.7); 6.9316 (0.7); 6.9301 (0.7); 6.9178 (0.7); 6.9163 (0.7); 6.9103 (0.7); 6.9089 (0.6); 6.8381 (0.8); 6.7030 (1.6); 6.5680 (0.9); 5.9327 (5.5); 4.5268 (1.8); 4.5107 (4.2); 4.4947 (1.9); 3.6696 (16.0); 3.6593 (14.1); 2.7281 (1.7); 2.7121 (3.5); 2.6960 (1.6); 1.5511 (2.5); -0.0002 (18.1); -0.0085 (0.5)
I-122: ¹H NMR(400.6 MHz, CDCl₃): δ = 8.1720 (0.6); 8.1700 (0.6); 8.1673 (0.7); 8.1652 (0.6); 8.1598 (0.6); 8.1578 (0.7); 8.1551 (0.7); 8.1531 (0.6); 7.7473 (0.6); 7.7425 (0.6); 7.7287 (0.7); 7.7268 (0.8); 7.7240 (0.7); 7.7220 (0.8); 7.7082 (0.8); 7.7035 (0.7); 7.4899 (0.8); 7.4876 (1.4); 7.4854 (0.8); 7.4694 (0.7); 7.4672 (1.2); 7.4649 (0.7); 7.3274 (1.3); 7.3219 (0.5); 7.3141 (1.4); 7.3106 (0.6); 7.3088 (0.6); 7.3052 (1.7); 7.2975 (0.6); 7.2919 (1.6); 7.2608 (10.3); 7.1435 (0.7); 7.1409 (0.7); 7.1313 (0.7); 7.1288 (0.7); 7.1249 (0.7); 7.1224 (0.7); 7.1128 (0.7); 7.1103 (0.6); 7.0896 (1.7); 7.0678 (2.7); 7.0626 (0.5); 7.0459 (1.4); 6.0276 (5.0); 3.8665 (15.0); 3.8136 (0.5); 3.6954 (16.0); 1.5531 (3.5); -0.0002 (12.0)

[0677] B. 制剂实施例

[0678] a) 撒粉产品通过以下方式获得:将10重量份的式(I)的化合物和/或其盐与90重量份的作为惰性物质的滑石混合,并将混合物在冲击式磨机中粉碎。

[0679] b) 易分散于水中的可湿性粉剂通过以下方式获得:将25重量份的式(I)的化合物和/或其盐、64重量份的作为惰性物质的含高岭土的石英、10重量份的木质素磺酸钾和1重量份的作为润湿剂和分散剂的油酰基甲基牛磺酸钠混合,并在销盘式研磨机中研磨。

[0680] c) 易分散于水中的分散浓缩剂通过以下方式获得:将20重量份的式(I)的化合物和/或其盐与6重量份的烷基酚聚乙二醇醚(**®Triton X 207**)、3重量份的异十三烷醇聚乙二醇醚(8E0)和71重量份的链烷烃系矿物油(沸程为例如约255℃至大于277℃)混合,并在球磨机中研磨至低于5微米的细度。

[0681] d) 可乳化浓缩剂由15重量份的式(I)的化合物和/或其盐、75重量份的作为溶剂的环己酮和10重量份的作为乳化剂的乙氧基化壬基苯酚获得。

[0682] e) 水分散性颗粒剂通过以下方式获得:

[0683] 将75重量份的式(I)的化合物和/或其盐、

[0684] 10重量份的木质素磺酸钙、

[0685] 5重量份的十二烷基硫酸钠、

[0686] 3重量份的聚乙烯醇和

[0687] 7重量份的高岭土混合,

[0688] 将混合物在销盘式研磨机中研磨,并在流化床中通过喷洒施用作为造粒液体的水而对粉末进行造粒。

[0689] f) 水分散性颗粒剂还通过以下方式获得:

[0690] 将25重量份的式(I)的化合物和/或其盐、

[0691] 5重量份的2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、

[0692] 2重量份的油酰基甲基牛磺酸钠、

[0693] 1重量份的聚乙烯醇、

[0694] 17重量份的碳酸钙和

[0695] 50重量份的水在胶体磨中进行均质化并预粉碎,

[0696] 然后将该混合物在珠磨机中研磨,并在喷雾塔中通过单相喷嘴雾化并干燥所得的悬浮液。

[0697] C. 生物实施例

[0698] 1. 苗前除草作用和作物植物相容性

[0699] 将单子叶和双子叶杂草植物和作物植物的种子置于塑料或有机花盆中,并用土壤覆盖。然后,将配制成可湿性粉剂(WP)或乳液浓缩剂(EC)形式的本发明化合物作为水性悬浮液或乳液施用至覆盖的土壤的表面,水施用率为600L/ha且添加了0.5%添加剂。在处理后将盆置于温室中并保持在对于试验植物而言良好的生长条件下。在约3周后,通过与未处理的对照组比较,目测评估制剂的效果(以百分比计)。例如100%活性=植物已经死亡,0%活性=与对照植物类似。

[0700] 下表1a至19c示出了所选的通式(I)的化合物在施用率为20至320g/ha时对各种有害植物的效果/作物相容性,其通过上述试验方法获得。

[0701] 植物:

[0702]	ALOMY: 大穗看麦娘 (<i>Alopecurus myosuroides</i>)	SETVI: 狗尾草 (<i>Setaria viridis</i>)
	AVEFA: 野燕麦 (<i>Avena fatua</i>)	POLCO: 卷茎蓼 (<i>Fallopia convolvulus</i>)
	AMARE: 反枝苋 (<i>Amaranthus retroflexus</i>)	ECHCG: 稗 (<i>Echinochloa crus-galli</i>)
	LOLRI: 硬直黑麦草 (<i>Lolium rigidum</i>)	STEME: 繁缕 (<i>Stellaria media</i>)
	VERPE: 阿拉伯婆婆纳 (<i>Veronica persica</i>)	MATIN: 新疆三肋果 (<i>Tripleurospermum inodorum</i>)
	DIGSA: 马唐 (<i>Digitaria sanguinalis</i>)	ABUTH: 苘麻 (<i>Abutilon theophrasti</i>)
	TRZAS: 小麦 (<i>Triticum aestivum</i>)	VIOTR: 三色堇 (<i>Viola tricolor</i>)
	BRSNW: 欧洲油菜 (<i>Brassica napus</i>)	ZEAMX: 玉蜀黍 (<i>Zea mays</i>)
	PHBPU: 圆叶牵牛 (<i>Ipomoea purpurea</i>)	GLXMA: 大豆 (<i>Glycine max</i>)
	ORYSA: 稻 (<i>Oryza sativa</i>)	HORMU: 鼠大麦 (<i>Hordeum murinum</i>)

[0703] 1. 苗前功效

[0704] 如表1a至19c的结果所示,本发明的化合物对广谱的禾本科杂草和阔叶杂草具有良好的作物植物相容性和良好的除草苗前功效。

[0705] 表1a:在20g/ha下对ZEAMX的苗前作用,以%计

[0706]	实施例编号	剂量[g/ha]	ZEAMX
	I-49	20	0
	I-76	20	20

[0707] 表1b:在80g/ha下对ZEAMX的苗前作用,以%计

[0708]

实施例编号	剂量[g/ha]	ZEAMX
I-01	80	0
I-03	80	20
I-04	80	0
I-05	80	20
I-07	80	10
I-08	80	0
I-11	80	0
I-49	80	0

[0709] 表1c:在320g/ha下对ZEAMX的苗前作用,以%计

[0710]

实施例编号	剂量[g/ha]	ZEAMX
I-03	320	20
I-08	320	10
I-09	320	10

[0711] 表2a:在80g/ha下对TRZAS的苗前作用,以%计

[0712]

实施例编号	剂量[g/ha]	TRZAS
I-06	80	10
I-07	80	20
I-08	80	0
I-09	80	0
I-11	80	0

[0713] 表2b:在320g/ha下对TRZAS的苗前作用,以%计

[0714]

实施例编号	剂量[g/ha]	TRZAS
I-03	320	0
I-08	320	0
I-09	320	20
I-11	320	0

[0715] 表3a:在80g/ha下对ORYSA的苗前作用,以%计

[0716]

实施例编号	剂量[g/ha]	ORYSA
I-02	80	0
I-03	80	0
I-08	80	0

[0717] 表3b:在320g/ha下对ORYSA的苗前作用,以%计

[0718]	实施例编号	剂量[g/ha]	ORYSA
	I-02	320	0
	I-08	320	0

[0719] 表4a:在80g/ha下对GLXMA的苗前作用,以%计

[0720]	实施例编号	剂量[g/ha]	GLXMA
	I-01	80	0
	I-02	80	0
	I-03	80	20
	I-05	80	10
	I-06	80	10
	I-07	80	10
	I-08	80	0
	I-09	80	10
	I-11	80	0

[0721] 表4b:在320g/ha下对GLXMA的苗前作用,以%计

[0722]	实施例编号	剂量[g/ha]	GLXMA
	I-02	320	0
	I-09	320	10
	I-11	320	0

[0724] 表5a:在80g/ha下对BRSNW的苗前作用,以%计

[0725]	实施例编号	剂量[g/ha]	BRSNW
	I-02	80	0
	I-03	80	20
	I-09	80	0

[0726] 表5b:在320g/ha下对BRSNW的苗前作用,以%计

[0727]	实施例编号	剂量[g/ha]	BRSNW
	I-02	320	0
	I-09	320	0

[0728] 表6a:在80g/ha下对ABUTH的苗前作用,以%计

[0729]

实施例编号	剂量[g/ha]	ABUTH
I-76	80	90

[0730] 表6b:在320g/ha下对ABUTH的苗前作用,以%计

[0731]

实施例编号	剂量[g/ha]	ABUTH
I-04	320	80
I-31	320	80
I-34	320	90
I-76	320	90

[0732] 表7a:在80g/ha下对ALOMY的苗前作用,以%计

[0733]

实施例编号	剂量[g/ha]	ALOMY
I-04	80	80
I-34	80	90
I-76	80	90

[0734] 表7b:在320g/ha下对ALOMY的苗前作用,以%计

[0735]

实施例编号	剂量[g/ha]	ALOMY
I-01	320	90
I-04	320	90
I-05	320	90
I-06	320	90
I-31	320	100
I-34	320	100
I-49	320	90
I-76	320	90

[0736] 表8a:在20g/ha下对AMARE的苗前作用,以%计

[0737]

实施例编号	剂量[g/ha]	AMARE
I-31	20	80
I-76	20	80

[0738] 表8b:在80g/ha下对AMARE的苗前作用,以%计

[0739]

实施例编号	剂量[g/ha]	AMARE
I-01	80	80
I-04	80	80
I-06	80	90
I-07	80	80
I-31	80	100
I-34	80	100
I-49	80	90
I-76	80	100

[0740] 表8c:在320g/ha下对AMARE的苗前作用,以%计

[0741]

实施例编号	剂量[g/ha]	AMARE
I-01	320	100
I-03	320	80
I-04	320	100
I-05	320	90
I-06	320	100
I-07	320	90

[0742]

I-31	320	100
I-34	320	100
I-49	320	100
I-76	320	100

[0743] 表9a:在20g/ha下对AVEFA的苗前作用,以%计

[0744]

实施例编号	剂量[g/ha]	AVEFA
I-34	20	80

[0745] 表9b:在80g/ha下对AVEFA的苗前作用,以%计

[0746]

实施例编号	剂量[g/ha]	AVEFA
I-31	80	90
I-34	80	90
I-76	80	90

[0747] 表9c:在320g/ha下对AVEFA的苗前作用,以%计

[0748]

实施例编号	剂量[g/ha]	AVEFA
I-04	320	80
I-05	320	90
I-07	320	80
I-31	320	90
I-34	320	100
I-49	320	90
I-76	320	100

[0749] 表10a:在80g/ha下对DIGSA的苗前作用,以%计

[0750]

实施例编号	剂量[g/ha]	DIGSA
I-76	80	80

[0751] 表10b:在320g/ha下对DIGSA的苗前作用,以%计

[0752]

实施例编号	剂量[g/ha]	DIGSA
I-05	320	90

[0753]

I-07	320	90
I-31	320	90
I-34	320	80
I-49	320	100
I-76	320	90

[0754] 表11a:在80g/ha下对ECHCG的苗前作用,以%计

[0755]

实施例编号	剂量[g/ha]	ECHCG
I-04	80	80
I-31	80	90
I-34	80	90
I-76	80	90

[0756] 表11b:在320g/ha下对ECHCG的苗前作用,以%计

[0757]

实施例编号	剂量[g/ha]	ECHCG
I-01	320	100
I-04	320	100
I-05	320	90
I-06	320	100
I-07	320	90
I-31	320	100
I-34	320	100
I-49	320	90
I-76	320	100

[0758] 表12a:在80g/ha下对LOLRI的苗前作用,以%计

[0759]

实施例编号	剂量[g/ha]	LOLRI
I-01	80	90
I-34	80	90
I-76	80	90

[0760] 表12b:在320g/ha下对LOLRI的苗前作用,以%计

[0761]

实施例编号	剂量[g/ha]	LOLRI
I-01	320	100
I-04	320	100

[0762]

I-05	320	100
I-07	320	90
I-31	320	100
I-34	320	100
I-49	320	90
I-76	320	100

[0763] 表13a:在80g/ha下对MATIN的苗前作用,以%计

[0764]

实施例编号	剂量[g/ha]	MATIN
I-01	80	90
I-06	80	80
I-31	80	90
I-34	80	90

[0765] 表13b:在320g/ha下对MATIN的苗前作用,以%计

[0766]

实施例编号	剂量[g/ha]	MATIN
I-01	320	90
I-04	320	90
I-05	320	90
I-06	320	90
I-07	320	90
I-31	320	100
I-34	320	90
I-49	320	90
I-76	320	90

[0767] 表14a:在80g/ha下对PHBPU的苗前作用,以%计

[0768]

实施例编号	剂量[g/ha]	PHBPU
I-04	80	80
I-31	80	90
I-34	80	90

[0769] 表14b:在320g/ha下对PHBPU的苗前作用,以%计

[0770]

实施例编号	剂量[g/ha]	PHBPU
I-04	320	90

[0771]

I-05	320	80
I-06	320	90
I-07	320	90
I-31	320	90
I-34	320	90
I-76	320	90

[0772] 表15a:在20g/ha下对POLCO的苗前作用,以%计

[0773]

实施例编号	剂量[g/ha]	POLCO
I-31	20	80
I-34	20	90

[0774] 表15b:在80g/ha下对POLCO的苗前作用,以%计

[0775]

实施例编号	剂量[g/ha]	POLCO
I-01	80	80
I-04	80	80
I-31	80	100
I-34	80	90
I-76	80	90

[0776] 表15c:在320g/ha下对POLCO的苗前作用,以%计

[0777]

实施例编号	剂量[g/ha]	POLCO
I-01	320	90
I-04	320	90
I-05	320	90
I-06	320	80
I-07	320	80
I-31	320	100
I-34	320	90
I-49	320	80
I-76	320	90

[0778] 表16a:在80g/ha下对SETVI的苗前作用,以%计

[0779]

实施例编号	剂量[g/ha]	SETVI
I-04	80	80

[0780]

I-76	80	90
------	----	----

[0781] 表16b:在320g/ha下对SETVI的苗前作用,以%计

[0782]

实施例编号	剂量[g/ha]	SETVI
I-01	320	100
I-02	320	80
I-04	320	100
I-05	320	100
I-07	320	100
I-31	320	90
I-34	320	90
I-49	320	100
I-76	320	100

[0783] 表17:在320g/ha下对VERPE的苗前作用,以%计

	实施例编号	剂量[g/ha]	VERPE
[0784]	I-01	320	80
	I-04	320	90
	I-31	320	90
	I-34	320	80

[0785] 表18a:在20g/ha下对VIOTR的苗前作用,以%计

	实施例编号	剂量[g/ha]	VIOTR
[0786]	I-34	20	80

[0787] 表18b:在80g/ha下对VIOTR的苗前作用,以%计

	实施例编号	剂量[g/ha]	VIOTR
[0788]	I-04	80	80
	I-31	80	100
	I-34	80	100
	I-76	80	100

[0789] 表18c:在320g/ha下对VIOTR的苗前作用,以%计

	实施例编号	剂量[g/ha]	VIOTR
[0790]	I-04	320	100
	I-05	320	100
	I-31	320	100
	I-34	320	100
	I-49	320	90
	I-76	320	100

[0791] 表19a:在20g/ha下对KCHSC的苗前作用,以%计

	实施例编号	剂量[g/ha]	KCHSC
[0792]	I-76	20	90

[0793] 表19b:在80g/ha下对KCHSC的苗前作用,以%计

	实施例编号	剂量[g/ha]	KCHSC
[0794]	I-76	80	90

[0795] 表19c:在320g/ha下对KCHSC的苗前作用,以%计

[0796]

实施例编号	剂量[g/ha]	KCHSC
I-49	320	100
I-76	320	100

[0797] 如结果所示,本发明通式(I)的化合物,在苗前处理中,在施用率为每公顷0.020至0.320kg活性物质时,对有害植物(如苘麻、大穗看麦娘、反枝苋、野燕麦、马唐、稗、硬直黑麦草、狗尾草、繁缕、新疆三肋果、阿拉伯婆婆纳和卷茎蓼)具有良好的除草功效,并且在施用率为每公顷0.32kg或更少时,与生物(如玉蜀黍、稻、欧洲油菜、大豆和小麦)具有良好的作物植物相容性。

[0798] 因此,本发明的化合物适用于通过苗前法防治不想要的植物生长。

[0799] 2. 苗后除草作用和作物植物相容性

[0800] 将单子叶和双子叶杂草和作物植物的种子置于塑料或有机花盆中的沙壤土中,用土壤覆盖并在温室中于受控生长条件下栽培。在播种后2至3周,在一叶期时对试验植物进行处理。将配制为可湿性粉剂(WP)或乳液浓缩剂(EC)形式的本发明的化合物作为水性悬浮剂或乳液喷洒到植物的绿色部位上,水施用率为600L/ha(经换算)且添加了0.5%添加剂。在试验植物已在温室中于最佳生长条件下保持约3周后,与未处理的对照组比较,目测评估所述制剂的活性。例如,100%活性=植物已经死亡,0%活性=与对照植物类似。

[0801] 下表20a至38c示出了所选的通式(I)的化合物在施用率为20至320g/ha时对各种有害植物的效果/作物相容性,其通过上述试验方法获得。

[0802] 表20a:在20g/ha下对ZEAMX的苗后作用,以%计

[0803]

实施例编号	剂量[g/ha]	ZEAMX
I-13	20	10
I-12	20	0
I-10	20	20
I-15	20	0
I-20	20	0
I-24	20	0
I-25	20	20
I-22	20	20
I-26	20	20
I-32	20	10
I-35	20	20
I-38	20	0
I-39	20	20
I-40	20	0
I-41	20	0
I-14	20	0
I-48	20	0
I-47	20	0
I-46	20	0
I-45	20	0
I-44	20	0
I-43	20	0
I-42	20	0
I-54	20	0
I-51	20	0

[0804]

I-52	20	0
I-53	20	0
I-59	20	20
I-55	20	0
I-58	20	0
I-56	20	0
I-57	20	0
I-69	20	0
I-60	20	0
I-71	20	10
I-64	20	20
I-61	20	0
I-62	20	0
I-65	20	0
I-68	20	0
I-82	20	20
I-75	20	0
I-74	20	0
I-77	20	0
I-80	20	20
I-81	20	0
I-86	20	0
I-85	20	0
I-88	20	0
I-89	20	0
I-90	20	0
I-107	20	0
I-108	20	0
I-92	20	20
I-93	20	10

[0805] 表20b:在80g/ha下对ZEAMX的苗后作用,以%计

[0806]

实施例编号	剂量[g/ha]	ZEAMX
I-02	80	10
I-03	80	20
I-05	80	20
I-09	80	0
I-11	80	0
I-13	80	20
I-12	80	20
I-15	80	10
I-20	80	20
I-24	80	10

[0807]

I-22	80	20
I-40	80	0
I-41	80	0
I-47	80	0
I-46	80	20
I-45	80	0
I-44	80	0
I-43	80	0
I-42	80	0
I-51	80	0
I-52	80	0
I-55	80	0
I-58	80	10
I-56	80	0
I-57	80	0
I-69	80	0
I-60	80	0
I-65	80	0
I-75	80	0
I-77	80	0
I-81	80	0
I-86	80	0
I-85	80	20
I-88	80	0
I-89	80	0
I-90	80	0
I-107	80	0
I-108	80	0

[0808] 表20c:在320g/ha下对ZEAMX的苗后作用,以%计

[0809]

实施例编号	剂量[g/ha]	ZEAMX
I-09	320	0
I-11	320	0
I-15	320	20
I-24	320	20
I-40	320	0
I-45	320	0
I-44	320	0
I-42	320	20
I-51	320	0
I-52	320	0
I-56	320	20
I-57	320	0

[0810]

I-65	320	0
I-88	320	0
I-90	320	0
I-108	320	0

[0811] 表21a:在20g/ha下对TRZAS的苗后作用,以%计

[0812]

实施例编号	剂量[g/ha]	TRZAS
I-12	20	0
I-15	20	0
I-16	20	10
I-17	20	10
I-19	20	20
I-24	20	0
I-25	20	10
I-22	20	20
I-28	20	20
I-33	20	20
I-32	20	10
I-36	20	20
I-35	20	20
I-38	20	0
I-39	20	0
I-47	20	0
I-46	20	0
I-45	20	0
I-44	20	0
I-43	20	0
I-42	20	0
I-54	20	0
I-51	20	0
I-52	20	0
I-53	20	0
I-59	20	0
I-55	20	20
I-56	20	0
I-57	20	0
I-69	20	0
I-60	20	0
I-71	20	20
I-64	20	10
I-65	20	0
I-78	20	0
I-81	20	0

[0813]

I-85	20	0
I-88	20	20
I-89	20	0
I-107	20	20
I-114	20	0
I-115	20	0
I-92	20	0
I-93	20	0
I-94	20	0
I-95	20	0

[0814] 表21b:在80g/ha下对TRZAS的苗后作用,以%计

[0815]

实施例编号	剂量[g/ha]	TRZAS
I-02	80	10
I-09	80	0
I-11	80	0
I-12	80	10
I-15	80	10
I-24	80	0
I-45	80	0
I-44	80	0
I-43	80	0
I-42	80	0
I-51	80	0
I-52	80	0
I-57	80	20
I-69	80	10
I-60	80	0
I-65	80	0
I-114	80	20
I-115	80	10
I-92	80	10
I-93	80	10
I-94	80	10
I-95	80	0

[0816] 表21c:在320g/ha下对TRZAS的苗后作用,以%计

[0817]

实施例编号	剂量[g/ha]	TRZAS
I-02	320	10
I-09	320	0

[0818]

I-11	320	0
I-12	320	20
I-15	320	20
I-24	320	0
I-45	320	0
I-44	320	0
I-43	320	0
I-51	320	0
I-52	320	0
I-65	320	0
I-115	320	20
I-92	320	20
I-93	320	20
I-94	320	20
I-95	320	0

[0819] 表22a:在20g/ha下对ORYSA的苗后作用,以%计

[0820]

实施例编号	剂量[g/ha]	ORYSA
I-13	20	10
I-12	20	20
I-10	20	10
I-15	20	0
I-16	20	0
I-17	20	0
I-19	20	0
I-20	20	0
I-24	20	0
I-25	20	10
I-22	20	10
I-23	20	20
I-26	20	20
I-28	20	0
I-29	20	0
I-30	20	10
I-33	20	0
I-32	20	10
I-36	20	0
I-35	20	0
I-37	20	0
I-38	20	0
I-39	20	0

[0821] 表22b:在80g/ha下对ORYSA的苗后作用,以%计

[0822]

实施例编号	剂量[g/ha]	ORYSA
I-02	80	0
I-03	80	0
I-08	80	10
I-09	80	10
I-11	80	0
I-12	80	20
I-15	80	10
I-16	80	10
I-17	80	20
I-19	80	0
I-24	80	0
I-25	80	10
I-28	80	10
I-29	80	0
I-33	80	20
I-32	80	20
I-36	80	10
I-35	80	0
I-37	80	0
I-39	80	20

[0823] 表22c:在320g/ha下对ORYSA的苗后作用,以%计

[0824]

实施例编号	剂量[g/ha]	ORYSA
I-02	320	10
I-03	320	10
I-12	320	20
I-15	320	10
I-19	320	20
I-24	320	10
I-28	320	20
I-36	320	20
I-35	320	10

[0825] 表23a:在20g/ha下对GLXMA的苗后作用,以%计

[0826]

实施例编号	剂量[g/ha]	GLXMA
I-12	20	0

[0827]

I-15	20	20
I-24	20	10
I-36	20	10
I-35	20	20
I-45	20	0
I-44	20	0
I-43	20	0
I-51	20	0
I-52	20	0
I-60	20	10
I-65	20	0
I-92	20	10
I-93	20	20

[0828] 表23b:在80g/ha下对GLXMA的苗后作用,以%计

[0829]

实施例编号	剂量[g/ha]	GLXMA
I-02	80	20
I-09	80	10
I-11	80	20
I-12	80	20
I-24	80	10
I-45	80	0
I-44	80	0
I-51	80	0
I-52	80	0
I-65	80	0

[0830] 表23c:在320g/ha下对GLXMA的苗后作用,以%计

[0831]

实施例编号	剂量[g/ha]	GLXMA
I-02	320	20
I-09	320	20
I-44	320	0
I-51	320	0
I-52	320	0
I-65	320	0

[0832] 表24a:在20g/ha下对BRSNW的苗后作用,以%计

[0833]

实施例编号	剂量[g/ha]	BRSNW
I-12	20	0
I-24	20	10
I-25	20	20
I-45	20	0
I-44	20	0
I-43	20	0
I-51	20	0
I-52	20	0
I-65	20	0

[0834] 表24b:在80g/ha下对BRSNW的苗后作用,以%计

[0835]

实施例编号	剂量[g/ha]	BRSNW
I-02	80	20
I-12	80	20
I-24	80	10
I-45	80	0
I-44	80	0
I-51	80	0
I-52	80	0
I-65	80	0

[0836] 表24c:在320g/ha下对BRSNW的苗后作用,以%计

[0837]

实施例编号	剂量[g/ha]	BRSNW
I-45	320	0
I-51	320	0
I-65	320	0

[0838] 表25a:在20g/ha下对ABUTH的苗后作用,以%计

[0839]

实施例编号	剂量[g/ha]	ABUTH
I-10	20	80
I-17	20	80
I-37	20	80
I-73	20	80
I-82	20	80

[0840]

I-75	20	80
I-74	20	80
I-78	20	80
I-79	20	80
I-87	20	90
I-83	20	80
I-109	20	80
I-110	20	80
I-112	20	80
I-113	20	90

[0841] 表25b:在80g/ha下对ABUTH的苗后作用,以%计

[0842]

实施例编号	剂量[g/ha]	ABUTH
I-01	80	80
I-10	80	90
I-16	80	90
I-17	80	90
I-19	80	90
I-20	80	80
I-28	80	90
I-29	80	80
I-30	80	80
I-33	80	90
I-32	80	80
I-37	80	90
I-40	80	90
I-41	80	90
I-14	80	90
I-48	80	80
I-47	80	80
I-50	80	80
I-59	80	90
I-55	80	80
I-58	80	80
I-70	80	80
I-71	80	90
I-63	80	90
I-61	80	80
I-62	80	80
I-66	80	80
I-73	80	80
I-68	80	80
I-72	80	80

[0843]

I-82	80	90
I-75	80	80
I-74	80	80
I-77	80	80
I-78	80	80
I-79	80	80
I-80	80	80
I-86	80	80
I-87	80	90
I-83	80	90
I-84	80	80
I-85	80	80
I-108	80	80
I-109	80	80
I-110	80	90
I-111	80	80
I-112	80	80
I-91	80	80
I-113	80	90
I-114	80	80
I-93	80	80
I-94	80	80
I-95	80	80

[0844] 表25c:在320g/ha下对ABUTH的苗后作用,以%计

[0845]

实施例编号	剂量[g/ha]	ABUTH
I-01	320	90
I-04	320	80
I-13	320	80
I-10	320	90
I-16	320	90
I-17	320	90
I-19	320	90
I-20	320	90
I-25	320	80
I-26	320	90
I-28	320	100
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-35	320	80
I-37	320	90

[0846]

I-38	320	80
I-39	320	90
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-47	320	90
I-46	320	80
I-42	320	80
I-54	320	80
I-50	320	90
I-53	320	80
I-59	320	90
I-55	320	90
I-58	320	80
I-56	320	80
I-69	320	90
I-70	320	90
I-71	320	90
I-63	320	90
I-64	320	80
I-61	320	80
I-62	320	90
I-66	320	90
I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	90
I-74	320	90
I-77	320	80
I-78	320	80
I-79	320	90
I-80	320	80
I-81	320	90
I-86	320	80
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	80
I-85	320	90
I-88	320	80
I-90	320	90
I-107	320	80
I-108	320	90
I-109	320	90
I-110	320	90

[0847]

I-111	320	90
I-112	320	80
I-91	320	80
I-113	320	90
I-114	320	90
I-115	320	80
I-93	320	90
I-94	320	90
I-95	320	90

[0848] 表26a:在20g/ha下对ALOMY的苗后作用,以%计

[0849]

实施例编号	剂量[g/ha]	ALOMY
I-112	20	80

[0850] 表26b:在80g/ha下对ALOMY的苗后作用,以%计

[0851]

实施例编号	剂量[g/ha]	ALOMY
I-01	80	90
I-04	80	90
I-05	80	90
I-06	80	90
I-07	80	90
I-13	80	80
I-23	80	90
I-26	80	90
I-37	80	100
I-70	80	80
I-73	80	80
I-68	80	90
I-79	80	80
I-86	80	90
I-87	80	90
I-83	80	90
I-88	80	90
I-108	80	90
I-110	80	80
I-111	80	80
I-112	80	90
I-113	80	100

[0852] 表26c:在320g/ha下对ALOMY的苗后作用,以%计

[0853]

实施例编号	剂量[g/ha]	ALOMY
I-01	320	100
I-04	320	90
I-05	320	90
I-06	320	90
I-07	320	90
I-08	320	90
I-13	320	90
I-10	320	90
I-16	320	90
I-17	320	90
I-19	320	80
I-20	320	80
I-22	320	90
I-23	320	90
I-26	320	90
I-28	320	90
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-35	320	90
I-37	320	100
I-38	320	100
I-39	320	100
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-46	320	90
I-42	320	90
I-54	320	100
I-50	320	80
I-53	320	100
I-59	320	90
I-55	320	90
I-58	320	90
I-70	320	90
I-71	320	90
I-63	320	90
I-64	320	90
I-61	320	90
I-62	320	90
I-66	320	90

[0854]

I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	80
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-80	320	90
I-81	320	90
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-89	320	90
I-90	320	90
I-107	320	100
I-108	320	100
I-109	320	90
I-110	320	100
I-111	320	90
I-112	320	90
I-91	320	80
I-113	320	100

[0855] 表27a:在20g/ha下对AMARE的苗后作用,以%计

[0856]

实施例编号	剂量[g/ha]	AMARE
I-10	20	80
I-17	20	80
I-26	20	80
I-73	20	80
I-72	20	80
I-74	20	80
I-79	20	80
I-83	20	90
I-113	20	80
I-114	20	80

[0857] 表27b:在80g/ha下对AMARE的苗后作用,以%计

[0858]

实施例编号	剂量[g/ha]	AMARE
I-01	80	80
I-10	80	80
I-16	80	80
I-17	80	80
I-19	80	80
I-20	80	80
I-25	80	80
I-23	80	80
I-26	80	80
I-29	80	90
I-30	80	80
I-37	80	90
I-38	80	90
I-46	80	80
I-70	80	80
I-66	80	80
I-73	80	90
I-72	80	80
I-82	80	90
I-74	80	80
I-78	80	90
I-79	80	80
I-86	80	80
I-87	80	80
I-83	80	90
I-84	80	80
I-111	80	80
I-113	80	80
I-114	80	80
I-94	80	80
I-95	80	80

[0859] 表27c:在320g/ha下对AMARE的苗后作用,以%计

[0860]

实施例编号	剂量[g/ha]	AMARE
I-01	320	90
I-04	320	90
I-05	320	80
I-13	320	80
I-10	320	100
I-16	320	80

[0861]

I-17	320	80
I-19	320	80
I-20	320	90
I-25	320	90
I-22	320	90
I-23	320	90
I-26	320	80
I-28	320	80
I-29	320	90
I-30	320	80
I-32	320	80
I-36	320	80
I-35	320	80
I-37	320	90
I-38	320	90
I-39	320	80
I-40	320	80
I-41	320	90
I-14	320	80
I-48	320	80
I-47	320	80
I-46	320	80
I-42	320	80
I-54	320	80
I-50	320	80
I-53	320	80
I-70	320	80
I-71	320	80
I-66	320	80
I-73	320	90
I-68	320	80
I-72	320	80
I-82	320	90
I-75	320	90
I-74	320	80
I-78	320	90
I-79	320	80
I-80	320	80
I-81	320	80
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	80
I-85	320	80
I-88	320	80
I-90	320	80

[0862]

I-107	320	80
I-110	320	80
I-111	320	80
I-113	320	80
I-114	320	90
I-93	320	90
I-94	320	90
I-95	320	90

[0863] 表28a:在20g/ha下对AVEFA的苗后作用,以%计

[0864]

实施例编号	剂量[g/ha]	AVEFA
I-58	20	80
I-86	20	80
I-112	20	90
I-113	20	80

[0865] 表28b:在80g/ha下对AVEFA的苗后作用,以%计

[0866]

实施例编号	剂量[g/ha]	AVEFA
I-04	80	80
I-05	80	80
I-23	80	80
I-26	80	80
I-28	80	80
I-29	80	90
I-30	80	90
I-37	80	80
I-40	80	80
I-41	80	80
I-14	80	90
I-48	80	90
I-55	80	90
I-58	80	80
I-70	80	90
I-63	80	80
I-61	80	80
I-62	80	90
I-73	80	90
I-68	80	90
I-72	80	90
I-82	80	90

[0867]

I-74	80	90
I-77	80	90
I-78	80	90
I-79	80	90
I-86	80	90
I-87	80	90
I-83	80	90
I-84	80	90
I-85	80	90
I-88	80	90
I-108	80	90
I-109	80	80
I-110	80	90
I-111	80	90
I-112	80	90
I-91	80	90
I-113	80	100

[0868] 表28c:在320g/ha下对AVEFA的苗后作用,以%计

[0869]

实施例编号	剂量[g/ha]	AVEFA
I-01	320	90
I-04	320	90
I-05	320	80
I-06	320	80
I-13	320	80
I-10	320	80
I-16	320	90
I-17	320	90
I-19	320	80
I-20	320	90
I-22	320	80
I-23	320	80
I-26	320	90
I-28	320	90
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-35	320	80
I-37	320	90
I-38	320	90
I-39	320	100
I-40	320	90

[0870]

I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-47	320	80
I-54	320	90
I-50	320	90
I-53	320	90
I-59	320	80
I-55	320	90
I-58	320	90
I-56	320	80
I-57	320	80
I-60	320	80
I-70	320	90
I-71	320	90
I-63	320	90
I-64	320	90
I-61	320	90
I-62	320	90
I-66	320	80
I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	90
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-80	320	90
I-81	320	90
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-89	320	80
I-90	320	90
I-107	320	90
I-108	320	90
I-109	320	90
I-110	320	90
I-111	320	90
I-112	320	90
I-91	320	90

[0871]	I-113	320	100
	I-114	320	80
	I-115	320	80
	I-94	320	80

[0872] 表29a:在80g/ha下对DIGSA的苗后作用,以%计

[0873]	实施例编号	剂量[g/ha]	DIGSA
	I-05	80	90
	I-07	80	80
	I-13	80	90
	I-16	80	80
	I-17	80	80
	I-23	80	90
	I-26	80	80
	I-30	80	90
	I-41	80	80
	I-14	80	80
	I-48	80	80
	I-59	80	80
	I-55	80	90
	I-70	80	80
	I-63	80	90
	I-61	80	80
	I-62	80	90
	I-72	80	90
	I-82	80	90
	I-75	80	80
	I-74	80	80
	I-80	80	80
	I-87	80	80
	I-84	80	80

[0874] 表29b:在320g/ha下对DIGSA的苗后作用,以%计

[0875]	实施例编号	剂量[g/ha]	DIGSA
	I-05	320	90
	I-07	320	90
	I-13	320	90
	I-10	320	90
	I-16	320	90
	I-17	320	90
	I-19	320	90

[0876]

I-20	320	90
I-25	320	90
I-22	320	80
I-23	320	90
I-26	320	90
I-28	320	80
I-29	320	80
I-30	320	90
I-33	320	80
I-32	320	90
I-35	320	80
I-37	320	90
I-38	320	90
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-47	320	80
I-46	320	80
I-42	320	90
I-54	320	90
I-50	320	90
I-53	320	90
I-59	320	90
I-55	320	90
I-58	320	80
I-56	320	80
I-70	320	90
I-71	320	90
I-63	320	90
I-64	320	80
I-61	320	90
I-62	320	90
I-66	320	90
I-73	320	80
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	80
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	80
I-79	320	80
I-80	320	90
I-81	320	80
I-86	320	80

[0877]

I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	80
I-90	320	80
I-107	320	80
I-108	320	90
I-111	320	80
I-112	320	80
I-91	320	90
I-113	320	90
I-114	320	80
I-94	320	80

[0878] 表30a:在20g/ha下对ECHCG的苗后作用,以%计

[0879]

实施例编号	剂量[g/ha]	ECHCG
I-13	20	80
I-10	20	80
I-23	20	80
I-30	20	80
I-54	20	80
I-50	20	90
I-71	20	90
I-63	20	90
I-73	20	90
I-68	20	80
I-72	20	90
I-82	20	80
I-74	20	90
I-78	20	90
I-79	20	80
I-80	20	90
I-86	20	80
I-87	20	90
I-83	20	90
I-84	20	90
I-85	20	90
I-88	20	80
I-109	20	80
I-110	20	90
I-111	20	80
I-112	20	90

[0880]	I-91	20	80
	I-113	20	90
	I-114	20	80
	I-94	20	80
	I-95	20	80

[0881] 表30b:在80g/ha下对ECHCG的苗后作用,以%计

[0882]	实施例编号	剂量[g/ha]	ECHCG
	I-01	80	90
	I-04	80	80
	I-06	80	80
	I-07	80	80
	I-13	80	90
	I-10	80	90
	I-16	80	90
	I-17	80	80
	I-19	80	80
	I-20	80	80
	I-23	80	80
	I-26	80	80
	I-28	80	90
	I-29	80	80
	I-30	80	90
	I-33	80	80
	I-32	80	90
	I-35	80	80
	I-37	80	100
	I-40	80	90
	I-14	80	90
	I-48	80	90
	I-47	80	90
	I-46	80	80
	I-54	80	90
	I-50	80	90
	I-53	80	90
	I-59	80	90
	I-55	80	90
	I-58	80	90
	I-56	80	80
	I-70	80	90
	I-71	80	90
	I-63	80	90
	I-64	80	80

[0883]

I-61	80	90
I-62	80	90
I-66	80	90
I-73	80	90
I-68	80	90
I-72	80	90
I-82	80	90
I-75	80	90
I-74	80	90
I-77	80	90
I-78	80	90
I-79	80	90
I-80	80	90
I-86	80	90
I-87	80	90
I-83	80	90
I-84	80	90
I-85	80	90
I-88	80	90
I-90	80	90
I-108	80	90
I-109	80	90
I-110	80	90
I-111	80	90
I-112	80	90
I-91	80	80
I-113	80	90
I-114	80	90
I-92	80	80
I-94	80	100
I-95	80	90

[0884] 表30c:在320g/ha下对ECHCG的苗后作用,以%计

[0885]

实施例编号	剂量[g/ha]	ECHCG
I-01	320	90
I-03	320	80
I-04	320	80
I-05	320	80
I-06	320	80
I-07	320	80
I-08	320	80
I-13	320	90
I-10	320	100

[0886]

I-16	320	90
I-17	320	90
I-19	320	90
I-20	320	90
I-25	320	80
I-22	320	90
I-23	320	90
I-26	320	90
I-28	320	90
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-36	320	90
I-35	320	90
I-37	320	100
I-38	320	100
I-39	320	90
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-47	320	90
I-46	320	90
I-42	320	90
I-54	320	90
I-50	320	90
I-53	320	90
I-59	320	90
I-55	320	90
I-58	320	90
I-56	320	90
I-57	320	90
I-69	320	90
I-70	320	90
I-71	320	90
I-63	320	90
I-64	320	90
I-61	320	90
I-62	320	90
I-66	320	90
I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	90

[0887]

I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-80	320	90
I-81	320	90
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-90	320	90
I-107	320	90
I-108	320	90
I-109	320	90
I-110	320	90
I-111	320	90
I-112	320	90
I-91	320	90
I-113	320	90
I-114	320	100
I-115	320	90
I-92	320	90
I-94	320	100
I-95	320	100

[0888] 表31a:在20g/ha下对LOLRI的苗后作用,以%计

[0889]

实施例编号	剂量[g/ha]	LOLRI
I-86	20	80

[0890] 表31b:在80g/ha下对LOLRI的苗后作用,以%计

[0891]

实施例编号	剂量[g/ha]	LOLRI
I-04	80	80
I-05	80	80
I-07	80	80
I-26	80	90
I-37	80	90
I-40	80	90
I-14	80	90
I-48	80	90

[0892]

I-58	80	90
I-73	80	90
I-75	80	80
I-77	80	90
I-78	80	90
I-79	80	90
I-86	80	90
I-87	80	90
I-84	80	90
I-85	80	80
I-88	80	90
I-109	80	90
I-111	80	90
I-112	80	90
I-91	80	90
I-113	80	90

[0893] 表31c:在320g/ha下对LOLRI的苗后作用,以%计

[0894]

实施例编号	剂量[g/ha]	LOLRI
I-01	320	90
I-04	320	80
I-05	320	90
I-07	320	80
I-13	320	80
I-10	320	90
I-17	320	80
I-25	320	90
I-23	320	90
I-26	320	90
I-28	320	90
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-36	320	80
I-35	320	80
I-37	320	100
I-38	320	100
I-39	320	100
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90

[0895]

I-47	320	90
I-46	320	90
I-42	320	90
I-50	320	90
I-53	320	90
I-55	320	90
I-58	320	90
I-70	320	90
I-71	320	90
I-66	320	90
I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	90
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-89	320	90
I-90	320	90
I-107	320	90
I-108	320	90
I-109	320	90
I-110	320	90
I-111	320	90
I-112	320	90
I-91	320	90
I-113	320	100
I-114	320	80

[0896] 表32a:在20g/ha下对MATIN的苗后作用,以%计

[0897]

实施例编号	剂量[g/ha]	MATIN
I-10	20	80
I-17	20	80
I-23	20	80
I-26	20	80

[0898]

I-28	20	80
I-29	20	80
I-37	20	80
I-54	20	80
I-78	20	80
I-83	20	80
I-111	20	80
I-112	20	80

[0899] 表32b:在80g/ha下对MATIN的苗后作用,以%计

[0900]

实施例编号	剂量[g/ha]	MATIN
I-01	80	80
I-04	80	80
I-06	80	80
I-13	80	80
I-10	80	80
I-16	80	80
I-17	80	80
I-20	80	80
I-23	80	80
I-26	80	80
I-28	80	90
I-29	80	90
I-30	80	80
I-33	80	80
I-32	80	90
I-37	80	90
I-48	80	80
I-54	80	90
I-70	80	80
I-71	80	80
I-63	80	80
I-61	80	80
I-62	80	80
I-66	80	80
I-73	80	90
I-68	80	80
I-82	80	80
I-75	80	80
I-74	80	80
I-77	80	80
I-78	80	90
I-79	80	80

[0901]

I-87	80	80
I-83	80	90
I-84	80	80
I-110	80	80
I-111	80	80
I-112	80	80
I-91	80	80
I-113	80	80
I-114	80	80
I-94	80	80
I-95	80	80

[0902] 表32c:在320g/ha下对MATIN的苗后作用,以%计

[0903]

实施例编号	剂量[g/ha]	MATIN
I-01	320	90
I-04	320	80
I-05	320	80
I-06	320	80
I-07	320	80
I-08	320	80
I-13	320	80
I-10	320	90
I-16	320	90
I-17	320	80
I-19	320	80
I-20	320	90
I-25	320	80
I-22	320	90
I-23	320	90
I-26	320	80
I-28	320	90
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-37	320	90
I-40	320	80
I-41	320	80
I-14	320	90
I-48	320	90
I-54	320	90
I-50	320	80
I-53	320	80

[0904]

I-59	320	80
I-69	320	80
I-70	320	80
I-71	320	80
I-63	320	80
I-64	320	80
I-61	320	80
I-62	320	80
I-66	320	90
I-73	320	90
I-68	320	90
I-82	320	90
I-75	320	80
I-74	320	80
I-77	320	80
I-78	320	90
I-79	320	80
I-86	320	90
I-87	320	80
I-83	320	90
I-84	320	80
I-109	320	80
I-110	320	80
I-111	320	80
I-112	320	80
I-91	320	80
I-113	320	80
I-114	320	90
I-94	320	90
I-95	320	80

[0905] 表33a:在20g/ha下对PHBPU的苗后作用,以%计

[0906]

实施例编号	剂量[g/ha]	PHBPU
I-16	20	80
I-17	20	90
I-19	20	80
I-26	20	80
I-28	20	80
I-29	20	80
I-33	20	80
I-37	20	90
I-55	20	80
I-71	20	80

[0907]

I-63	20	80
I-62	20	90
I-66	20	80
I-73	20	80
I-72	20	80
I-74	20	80
I-78	20	80
I-79	20	90
I-86	20	80
I-87	20	90
I-83	20	90
I-84	20	80
I-85	20	80
I-110	20	90
I-111	20	80
I-112	20	90
I-91	20	80
I-113	20	90
I-94	20	80

[0908] 表33b:在80g/ha下对PHBPU的苗后作用,以%计

[0909]

实施例编号	剂量[g/ha]	PHBPU
I-01	80	90
I-04	80	80
I-06	80	80
I-10	80	80
I-16	80	90
I-17	80	90
I-19	80	90
I-20	80	80
I-23	80	80
I-26	80	80
I-28	80	90
I-29	80	80
I-30	80	80
I-33	80	90
I-37	80	90
I-38	80	90
I-39	80	90
I-40	80	90
I-41	80	90
I-14	80	80
I-48	80	90

[0910]

I-47	80	80
I-54	80	90
I-50	80	90
I-53	80	90
I-59	80	90
I-55	80	80
I-58	80	80
I-70	80	90
I-71	80	90
I-63	80	90
I-64	80	80
I-61	80	90
I-62	80	90
I-66	80	80
I-73	80	90
I-68	80	90
I-72	80	90
I-82	80	80
I-75	80	80
I-74	80	90
I-77	80	90
I-78	80	90
I-79	80	90
I-80	80	90
I-86	80	90
I-87	80	90
I-83	80	90
I-84	80	90
I-85	80	90
I-107	80	80
I-108	80	80
I-109	80	90
I-110	80	90
I-111	80	90
I-112	80	90
I-91	80	80
I-113	80	90
I-114	80	80
I-94	80	90
I-95	80	90

[0911] 表33c:在320g/ha下对PHBPU的苗后作用,以%计

[0912]

实施例编号	剂量[g/ha]	PHBPU
-------	----------	-------

[0913]

I-01	320	90
I-04	320	80
I-05	320	90
I-06	320	80
I-07	320	80
I-13	320	90
I-10	320	90
I-15	320	80
I-16	320	90
I-17	320	90
I-19	320	90
I-20	320	90
I-25	320	90
I-22	320	90
I-23	320	90
I-26	320	90
I-28	320	90
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-36	320	80
I-37	320	90
I-38	320	90
I-39	320	90
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-47	320	90
I-46	320	90
I-42	320	80
I-54	320	90
I-50	320	90
I-53	320	90
I-59	320	90
I-55	320	90
I-58	320	90
I-56	320	80
I-57	320	80
I-69	320	80
I-60	320	90
I-70	320	90
I-71	320	90
I-63	320	90
I-64	320	90

[0914]

I-61	320	90
I-62	320	90
I-66	320	90
I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	90
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-80	320	90
I-81	320	80
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-90	320	90
I-107	320	80
I-108	320	90
I-109	320	90
I-110	320	90
I-111	320	90
I-112	320	90
I-91	320	80
I-113	320	100
I-114	320	90
I-115	320	80
I-92	320	80
I-93	320	80
I-94	320	90
I-95	320	90

[0915] 表34a:在20g/ha下对POLCO的苗后作用,以%计

[0916]

实施例编号	剂量[g/ha]	POLCO
I-10	20	80
I-48	20	80
I-70	20	80
I-73	20	80
I-72	20	80

[0917]

I-82	20	80
I-86	20	80
I-87	20	80
I-85	20	80
I-88	20	80
I-110	20	80

[0918] 表34b:在80g/ha下对POLCO的苗后作用,以%计

[0919]

实施例编号	剂量[g/ha]	POLCO
I-01	80	80
I-07	80	80
I-13	80	80
I-10	80	80
I-17	80	80
I-19	80	80
I-30	80	80
I-37	80	90
I-38	80	90
I-39	80	90
I-40	80	90
I-41	80	90
I-14	80	80
I-48	80	80
I-47	80	80
I-54	80	80
I-53	80	80
I-55	80	80
I-58	80	80
I-69	80	80
I-70	80	80
I-71	80	80
I-63	80	80
I-61	80	80
I-62	80	80
I-73	80	80
I-68	80	80
I-72	80	80
I-82	80	80
I-77	80	90
I-78	80	90
I-79	80	90
I-86	80	80
I-87	80	90

[0920]

I-83	80	80
I-84	80	90
I-85	80	90
I-88	80	90
I-107	80	90
I-109	80	80
I-110	80	80
I-111	80	80
I-112	80	80
I-113	80	80

[0921]

表34c:在320g/ha下对POLCO的苗后作用,以%计

[0922]

实施例编号	剂量[g/ha]	POLCO
I-01	320	80
I-05	320	80
I-07	320	90
I-13	320	80
I-10	320	80
I-16	320	80
I-17	320	80
I-19	320	80
I-20	320	80
I-23	320	80
I-28	320	80
I-29	320	80
I-30	320	80
I-33	320	80
I-32	320	80
I-36	320	80
I-37	320	90
I-38	320	90
I-39	320	90
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	80
I-48	320	80
I-47	320	80
I-46	320	80
I-42	320	80
I-54	320	80
I-50	320	80
I-53	320	80
I-55	320	90

[0923]

I-58	320	80
I-56	320	80
I-57	320	80
I-69	320	80
I-60	320	90
I-70	320	80
I-71	320	80
I-63	320	90
I-61	320	80
I-62	320	80
I-66	320	80
I-73	320	90
I-68	320	80
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	80
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-80	320	90
I-81	320	90
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-89	320	90
I-90	320	80
I-107	320	90
I-108	320	80
I-109	320	90
I-110	320	90
I-111	320	80
I-112	320	80
I-91	320	80
I-113	320	80

[0924] 表35a: 在20g/ha下对SETVI的苗后作用, 以%计

[0925]

实施例编号	剂量[g/ha]	SETVI
I-30	20	80
I-73	20	80

[0926]

I-72	20	90
I-82	20	90
I-79	20	90
I-87	20	90
I-83	20	90
I-84	20	80
I-111	20	80
I-91	20	80
I-113	20	90

[0927] 表35b:在80g/ha下对SETVI的苗后作用,以%计

[0928]

实施例编号	剂量[g/ha]	SETVI
I-01	80	90
I-04	80	80
I-05	80	80
I-06	80	80
I-13	80	80
I-10	80	80
I-16	80	80
I-17	80	80
I-20	80	80
I-23	80	80
I-28	80	80
I-29	80	90
I-30	80	90
I-33	80	90
I-37	80	90
I-48	80	90
I-54	80	80
I-50	80	90
I-59	80	80
I-70	80	80
I-71	80	80
I-63	80	90
I-61	80	90
I-62	80	90
I-73	80	90
I-68	80	90
I-72	80	90
I-82	80	90
I-75	80	80
I-74	80	90
I-78	80	90

[0929]

I-79	80	90
I-80	80	90
I-86	80	90
I-87	80	90
I-83	80	90
I-84	80	90
I-85	80	90
I-110	80	80
I-111	80	80
I-112	80	80
I-91	80	80
I-113	80	90

[0930] 表35c:在320g/ha下对SETVI的苗后作用,以%计

[0931]

实施例编号	剂量[g/ha]	SETVI
I-01	320	90
I-03	320	80
I-04	320	80
I-05	320	80
I-06	320	80
I-07	320	80
I-08	320	80
I-13	320	90
I-10	320	90
I-16	320	80
I-17	320	90
I-19	320	80
I-20	320	80
I-25	320	90
I-22	320	90
I-23	320	90
I-26	320	90
I-28	320	90
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-36	320	80
I-35	320	80
I-37	320	90
I-38	320	90
I-39	320	90
I-40	320	90

[0932]

I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-46	320	90
I-42	320	80
I-54	320	90
I-50	320	90
I-53	320	90
I-59	320	90
I-55	320	80
I-58	320	90
I-56	320	80
I-70	320	80
I-71	320	90
I-63	320	90
I-64	320	90
I-61	320	90
I-62	320	90
I-66	320	90
I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	90
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-80	320	90
I-81	320	90
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-90	320	90
I-107	320	90
I-108	320	90
I-109	320	80
I-110	320	80
I-111	320	80
I-112	320	80
I-91	320	80
I-113	320	90
I-114	320	90

[0933]

I-115	320	90
I-92	320	80
I-94	320	90
I-95	320	90

[0934] 表36a:在20g/ha下对VERPE的苗后作用,以%计

[0935]

实施例编号	剂量[g/ha]	VERPE
I-17	20	80
I-23	20	80
I-30	20	80
I-37	20	90
I-38	20	80
I-54	20	80
I-78	20	80
I-79	20	90
I-87	20	80
I-83	20	90
I-109	20	80
I-110	20	80
I-111	20	80
I-112	20	80
I-113	20	80
I-114	20	80

[0936] 表36b:在80g/ha下对VERPE的苗后作用,以%计

[0937]

实施例编号	剂量[g/ha]	VERPE
I-01	80	80
I-04	80	90
I-07	80	80
I-13	80	80
I-10	80	90
I-17	80	80
I-19	80	80
I-20	80	80
I-25	80	80
I-22	80	90
I-23	80	90
I-26	80	90
I-29	80	90
I-30	80	80

[0938]

I-33	80	80
I-32	80	90
I-37	80	100
I-38	80	80
I-48	80	80
I-47	80	80
I-54	80	80
I-50	80	90
I-53	80	80
I-59	80	80
I-70	80	90
I-71	80	90
I-63	80	80
I-64	80	80
I-61	80	80
I-62	80	80
I-66	80	80
I-73	80	90
I-68	80	90
I-82	80	90
I-75	80	80
I-74	80	90
I-78	80	90
I-79	80	90
I-80	80	80
I-86	80	80
I-87	80	90
I-83	80	90
I-84	80	90
I-108	80	80
I-109	80	80
I-110	80	80
I-111	80	80
I-112	80	80
I-91	80	80
I-113	80	90
I-114	80	80
I-94	80	80
I-95	80	80

[0939] 表36c:在320g/ha下对VERPE的苗后作用,以%计

[0940]

实施例编号	剂量[g/ha]	VERPE
I-01	320	90

[0941]

I-03	320	90
I-04	320	90
I-05	320	80
I-07	320	80
I-08	320	80
I-13	320	80
I-10	320	90
I-16	320	80
I-17	320	90
I-19	320	80
I-20	320	90
I-25	320	90
I-22	320	90
I-23	320	90
I-26	320	90
I-28	320	80
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-37	320	100
I-38	320	100
I-39	320	90
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-47	320	90
I-46	320	90
I-42	320	80
I-54	320	90
I-50	320	90
I-53	320	90
I-59	320	80
I-55	320	90
I-58	320	80
I-56	320	80
I-69	320	80
I-60	320	80
I-70	320	90
I-71	320	90
I-63	320	80
I-64	320	80
I-61	320	80
I-62	320	80
I-66	320	90

[0942]

I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	90
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-80	320	90
I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-90	320	80
I-107	320	80
I-108	320	80
I-109	320	80
I-110	320	90
I-111	320	80
I-112	320	80
I-91	320	80
I-113	320	90
I-114	320	90
I-115	320	80
I-94	320	90
I-95	320	90

[0943] 表37a:在20g/ha下对VIOTR的苗后作用,以%计

[0944]

实施例编号	剂量[g/ha]	VIOTR
I-16	20	80
I-17	20	90
I-23	20	80
I-28	20	80
I-29	20	80
I-30	20	80
I-33	20	80
I-37	20	80
I-48	20	80
I-71	20	90
I-61	20	80

[0945]

I-73	20	90
I-72	20	90
I-82	20	80
I-74	20	80
I-78	20	80
I-79	20	90
I-87	20	90
I-83	20	90
I-110	20	80
I-112	20	80
I-91	20	80
I-113	20	90

[0946] 表37b:在80g/ha下对VIOTR的苗后作用,以%计

[0947]

实施例编号	剂量[g/ha]	VIOTR
I-01	80	80
I-04	80	80
I-10	80	80
I-16	80	80
I-17	80	90
I-19	80	80
I-20	80	80
I-23	80	80
I-26	80	80
I-28	80	90
I-29	80	90
I-30	80	90
I-33	80	80
I-32	80	90
I-37	80	90
I-38	80	80
I-39	80	80
I-40	80	90
I-41	80	80
I-14	80	90
I-48	80	90
I-47	80	80
I-46	80	90
I-54	80	80
I-50	80	80
I-53	80	80
I-59	80	90
I-55	80	80

[0948]

I-58	80	80
I-70	80	90
I-71	80	90
I-63	80	80
I-61	80	90
I-62	80	90
I-73	80	90
I-68	80	90
I-72	80	90
I-82	80	90
I-75	80	80
I-74	80	90
I-77	80	90
I-78	80	90
I-79	80	90
I-80	80	80
I-86	80	90
I-87	80	90
I-83	80	90
I-84	80	90
I-85	80	80
I-88	80	80
I-108	80	90
I-109	80	90
I-110	80	80
I-111	80	80
I-112	80	80
I-91	80	80
I-113	80	90
I-94	80	80
I-95	80	80

[0949] 表37c:在320g/ha下对VIOTR的苗后作用,以%计

[0950]

实施例编号	剂量[g/ha]	VIOTR
I-01	320	90
I-04	320	80
I-05	320	80
I-06	320	80
I-13	320	80
I-10	320	90
I-15	320	80
I-16	320	90
I-17	320	90

[0951]

I-19	320	80
I-20	320	90
I-25	320	80
I-22	320	80
I-23	320	80
I-26	320	80
I-28	320	90
I-29	320	90
I-30	320	90
I-33	320	90
I-32	320	90
I-37	320	90
I-38	320	90
I-39	320	90
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-47	320	90
I-46	320	90
I-42	320	90
I-54	320	80
I-50	320	90
I-51	320	80
I-53	320	80
I-59	320	90
I-55	320	90
I-58	320	80
I-56	320	90
I-57	320	80
I-69	320	90
I-70	320	90
I-71	320	90
I-63	320	90
I-61	320	90
I-62	320	90
I-73	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-82	320	90
I-75	320	90
I-74	320	90
I-77	320	90
I-78	320	90
I-79	320	90
I-80	320	90

[0952]

I-86	320	90
I-87	320	90
I-83	320	90
I-84	320	90
I-85	320	90
I-88	320	90
I-90	320	90
I-107	320	90
I-108	320	90
I-109	320	90
I-110	320	80
I-111	320	80
I-112	320	80
I-91	320	80
I-113	320	90
I-114	320	90
I-94	320	90
I-95	320	90

[0953] 表38a:在20g/ha下对KCHSC的苗后作用,以%计

[0954]

实施例编号	剂量[g/ha]	KCHSC
I-70	20	80
I-62	20	80
I-73	20	80
I-68	20	90
I-72	20	90
I-82	20	90
I-77	20	80
I-80	20	90
I-87	20	90
I-84	20	90
I-90	20	80
I-91	20	80
I-113	20	90

[0955] 表38b:在80g/ha下对KCHSC的苗后作用,以%计

[0956]

实施例编号	剂量[g/ha]	KCHSC
I-40	80	90
I-41	80	80
I-14	80	90

[0957]

I-48	80	80
I-47	80	90
I-46	80	80
I-55	80	90
I-58	80	90
I-70	80	90
I-71	80	80
I-61	80	80
I-62	80	90
I-66	80	80
I-73	80	90
I-68	80	90
I-72	80	90
I-82	80	90
I-77	80	90
I-80	80	90
I-86	80	90
I-87	80	90
I-84	80	90
I-85	80	90
I-88	80	80
I-90	80	90
I-108	80	90
I-91	80	80
I-113	80	90

[0958] 表38c:在320g/ha下对KCHSC的苗后作用,以%计

[0959]

实施例编号	剂量[g/ha]	KCHSC
I-40	320	90
I-41	320	90
I-14	320	90
I-48	320	90
I-47	320	90
I-46	320	90
I-42	320	90
I-54	320	80
I-50	320	80
I-53	320	80
I-59	320	80
I-55	320	90
I-58	320	90
I-56	320	90
I-57	320	90

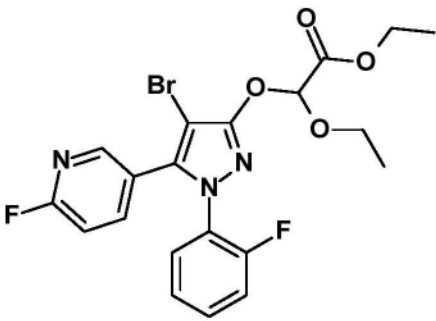
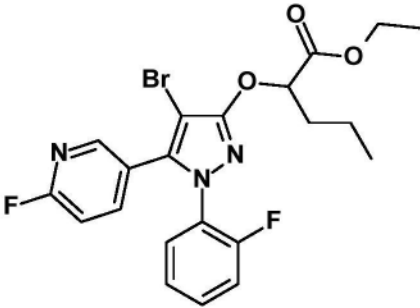
[0960]	I-69	320	80
	I-70	320	90
	I-71	320	90
	I-63	320	90
	I-64	320	90
	I-61	320	90
	I-62	320	90
	I-66	320	90
	I-73	320	90
	I-68	320	90
	I-72	320	90
	I-82	320	90
	I-75	320	90
	I-74	320	90
	I-77	320	90
	I-79	320	80
	I-80	320	90
	I-81	320	90
	I-86	320	90
	I-87	320	90
	I-83	320	80
	I-84	320	90
	I-85	320	90
	I-88	320	80
	I-89	320	90
	I-90	320	90
	I-107	320	90
	I-108	320	90
	I-109	320	80
	I-110	320	80
	I-112	320	80
	I-91	320	90
	I-113	320	90

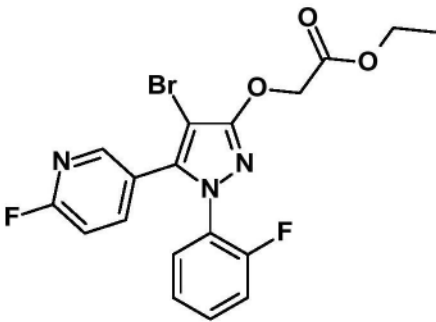
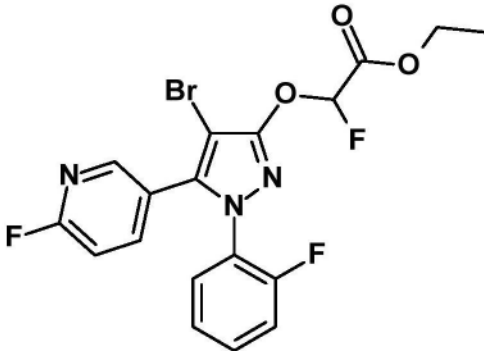
[0961] 如结果所示,本发明通式(I)的化合物,在苗后处理中,在施用率为每公顷0.020至0.320kg活性物质时,对有害植物(如苘麻、大穗看麦娘、反枝苋、野燕麦、马唐、稗、硬直黑麦草、狗尾草、繁缕、新疆三肋果、阿拉伯婆婆纳和卷茎蓼)具有良好的除草功效,并且在施用率为每公顷0.32kg或更少时,与生物(如玉蜀黍、稻、欧洲油菜、大豆和小麦)具有良好的作物植物相容性。

[0962] 因此,本发明的化合物适用于通过苗后法防治不想要的植物生长。

[0963] 3.比较本发明的化合物(I-01)与W02020/245044中的结构相似的化合物的除草作用

[0964] 表39:对比实验中测试的物质

物质	结构式
I-01 (本发明)	
对比物质	
A	
B	

	
[0966]	C 

[0967] 下表40a至40b示出了本发明的化合物(I-01)与结构相似的化合物(来自W02020/245044)在施用率为320g/ha或更少时对各种有害植物的效果,其通过下述试验方法获得。此处本发明的化合物(I-01)与结构相似的化合物的显著结构特征的差异在于R²基团。

[0968] 苗前除草作用和作物植物相容性(PE)

[0969] 将单子叶和双子叶杂草植物和作物植物的种子置于塑料或有机花盆中,并用土壤覆盖。然后,将配制成可湿性粉剂(WP)或乳液浓缩剂(EC)形式的本发明化合物作为水性悬浮液或乳液施用至覆盖的土壤的表面,水施用率为600L/ha且添加了0.5%添加剂。在处理后将盆置于温室中并保持在对于试验植物而言良好的生长条件下。在约3周后,与未处理的对照组相比,目测评估所述制剂的效果(以百分比计)。例如100%活性=植物已经死亡,0%活性=与对照植物类似。

[0970] 所选化合物(表39)在施用率为80至320g/ha时对各种有害植物的效果/作物相容性(通过上述试验方法获得)如下表40a和40b所示。

[0971] 表40a:在320g/ha下对各种不想要的植物的苗前作用

[0972]		试验对象	ALOMY	LOLRI	MATIN	SETVI	ECHCG
	(对比) 物质	浓度	测量结果				
	I-01 (本发明)	320	效果%	90	100	90	100
	A	320	效果%	60	30	30	70
	C	320	效果%	80	90	80	70

[0973] 表40b:在80g/ha下对各种不想要的植物的苗前作用

[0974]		试验对象	LOLRI	MATIN	ECHCG	POLCO
	(对比) 物质	浓度	测量结果			
	I-01 (本发明)	80	效果%	90	90	70
	A	80	效果%	20	0	20
	C	80	效果%	10	70	50

[0975] 如表40a和40b中显示的结果所示,与结构相似的化合物相比,本发明的化合物I-01在施用率为每公顷320g或更少时,对不同有害植物具有显著提高的除草功效。下表41a至41b示出了本发明的化合物(I-01)与结构相似的化合物(W02020/245044)在施用率为320g/ha或更少时对各种有害植物的效果,其通过下述试验方法获得。此处本发明的化合物(I-01)与结构相似的化合物的显著结构特征的差异在于R²基团。

[0976] 苗后除草作用和作物植物相容性(P0)

[0977] 将单子叶和双子叶杂草和作物植物的种子置于塑料或有机花盆中的沙壤土中,用土壤覆盖并在温室中于受控生长条件下栽培。在播种后2至3周,在一叶期时对试验植物进行处理。将配制为可湿性粉剂(WP)或乳液浓缩剂(EC)形式的本发明的化合物作为水性悬浮剂或乳液喷洒到植物的绿色部位上,水施用率为600L/ha(经换算)且添加了0.5%添加剂。在试验植物已在温室中于最佳生长条件下保持约3周后,与未处理的对照组相比,目测评估所述制剂的活性。例如,100%活性=植物已经死亡,0%活性=与对照植物类似。

[0978] 所选化合物(见表39)在施用率为80至320g/ha时对各种有害植物的效果/作物相容性(通过上述试验方法获得)如下表41a和41b所示。

[0979] 表41a:在320g/ha下对各种不想要的植物的苗后作用

[0980]

		试验对象	ALOMY	LOLRI	AVEFA	SETVI	ECHCG
(对比) 物质	浓度	测量结果					
I-01 (本发明)	320	效果%	100	90	90	90	90
A	320	效果%	50	20	40	70	80

[0981] 表41b:在80g/ha下对各种不想要的植物的苗后作用

[0982]

		试验对象	ALOMY	LOLRI	AVEFA	SETVI	ECHCG
(对比) 物质	浓度	测量结果					
I-01 (本发明)	80	效果%	90	70	90	90	90
A	80	效果%	0	0	30	20	50
B	80	效果%	70	30	80	70	50
C	80	效果%	50	10	60	70	80

[0983] 如表41a和41b中显示的结果所示,与结构相似的化合物相比,本发明的化合物I-01在施用率为每公顷320g或更少时,对不同有害植物具有显著提高的除草功效。