



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 101981016 A

(43) 申请公布日 2011.02.23

(21) 申请号 200980110829.4

(22) 申请日 2009.03.19

(30) 优先权数据

08005632.8 2008.03.26 EP

(85) PCT申请进入国家阶段日

2010.09.26

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2009/002029 2009.03.19

(87) PCT申请的公布数据

W02009/118125 DE 2009.10.01

(71) 申请人 拜尔农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 H·科恩 A·范 阿尔姆西克

H·阿伦斯 D·福伊希特

I·海涅曼 J·迪特根

M·J·希尔斯 S·莱尔

C·H·罗辛格

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285

代理人 吴晓萍 钟守期

(51) Int. Cl.

C07D 261/08 (2006.01)

C07D 261/18 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

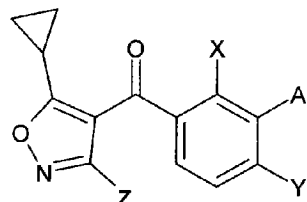
权利要求书 2 页 说明书 40 页

(54) 发明名称

有效的除草剂 4-(3-氨基苯甲酰基)-5-环丙基异噻唑

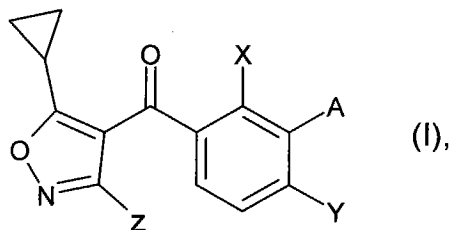
(57) 摘要

本发明涉及通式 (I) 的 4-(3-氨基苯甲酰基)-5-环丙基异噻唑除草剂。在所述式 (I) 中, A、X、Y 和 Z 为诸如氢的基团、诸如烷基的有机基团, 以及诸如卤素的其他基团。



(I)

1. 一种式 (I) 的 4-(3-氨基苯甲酰基)-5-环丙基异噁唑或其盐



其中

A 为  $\text{NR}^1\text{R}^2$  或  $\text{N} = \text{CR}^3\text{NR}^4\text{R}^5$ ,

$\text{R}^1$  和  $\text{R}^2$  彼此独立地为氢、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  烯基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  炔基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基或  $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基, 其中上述六个基团被  $m$  个卤原子取代,

$\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  和  $\text{R}^5$  彼此独立地为氢、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基或  $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基, 其中上述后三个基团被  $m$  个卤原子取代,

X 和 Y 彼此独立地为氢、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  烯基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  炔基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  卤代烷基、卤素、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷基- $\text{S}(\text{O})_n$ 、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基- $\text{S}(\text{O})_n$ 、硝基或氰基,

Z 为氢或  $\text{CO}_2\text{R}^6$ ,

$\text{R}^6$  为  $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基或  $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基,

$m$  为 0、1、2、3、4 或 5,

$n$  为 0、1 或 2。

2. 权利要求 1 的 4-(3-氨基苯甲酰基)-5-环丙基异噁唑, 其中

A 为  $\text{NR}^1\text{R}^2$  或  $\text{N} = \text{CR}^3\text{NR}^4\text{R}^5$ ,

$\text{R}^1$  和  $\text{R}^2$  彼此独立地为氢、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  烯基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基或  $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基,

$\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$  彼此独立地为氢或  $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基,

X 和 Y 彼此独立地为甲基、甲氧基、三氟甲基、氯、溴、氟或甲磺酰基,

Z 为氢或  $\text{CO}_2\text{R}^6$ ,

$\text{R}^6$  为甲基或乙基。

3. 权利要求 1 或 2 的 4-(3-氨基苯甲酰基)-5-环丙基异噁唑, 其中

A 为  $\text{NR}^1\text{R}^2$  或  $\text{N} = \text{CR}^3\text{NR}^4\text{R}^5$ ,

$\text{R}^1$  和  $\text{R}^2$  彼此独立地为氢、甲基、乙基、丙基、甲氧基乙基、乙氧基乙基或甲氧基丙基,

$\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$  彼此独立地为氢或甲基,

X 和 Y 彼此独立地为甲基、甲氧基、三氟甲基、氯、溴、氟或甲磺酰基,

Z 为氢或  $\text{CO}_2\text{R}^6$ ,

$\text{R}^6$  为甲基或乙基。

4. 一种除草组合物, 特征在于其含有至少一种权利要求 1 至 3 中任一项的式 (I) 的化合物作为除草活性成分。

5. 权利要求 4 的除草组合物, 其为与制剂助剂的混合物。

6. 一种防治不想要的植物的方法, 特征在于将有效量的至少一种权利要求 1 至 3 中任

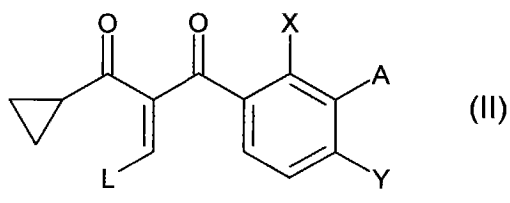
一项的式(I)的化合物或权利要求4或5的除草组合物施用于植物或施用于所述不想要的植物生长的区域。

7. 权利要求1至3中任一项的式(I)的化合物或权利要求4或5的除草组合物用于防治不想要的植物的用途。

8. 权利要求7的用途,特征在于将式(I)的化合物用于防治有用植物作物中的不想要的植物。

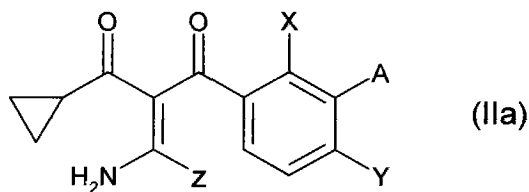
9. 权利要求8的用途,特征在于所述有用植物为转基因有用植物。

10. 式(II)的化合物



其中 A、X 和 Y 如权利要求 1 至 3 中任一项定义,且 L 为乙氧基或二甲氨基。

11. 式(IIa)的化合物



其中 A、X、Y 和 Z 如权利要求 1 至 3 中任一项定义。

## 有效的除草剂 4-(3-氨基苯甲酰基)-5-环丙基异噁唑

[0001] 本发明涉及除草剂技术领域,具体而言,涉及选择性防治有用植物作物中的阔叶杂草和禾本科杂草的除草剂。

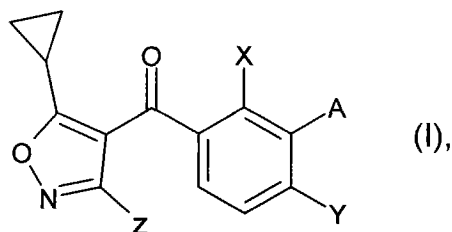
[0002] 多种出版物已公开了某些苯甲酰基异噁唑衍生物具有除草性质。例如,EP 0 418 175、EP 0 527 036 和 WO 97/30037 描述了苯环上被多种基团取代的苯甲酰基异噁唑。

[0003] 但由这些出版物中获知的化合物常常不具有足够的除草活性。因此,本发明的一个目的是提供与现有技术已知的化合物相比具有提高的除草性能的除草活性化合物。

[0004] 现已发现某些 5-位连接有环丙基且苯环的 3-位上连接有氨基或脒基的 4-苯甲酰基异噁唑尤其适于用作除草剂。

[0005] 本发明涉及式 (I) 的 4-(3-氨基苯甲酰基)-5-环丙基异噁唑或其盐

[0006]



[0007] 其中

[0008] A 为  $\text{NR}^1\text{R}^2$  或  $\text{N} = \text{CR}^3\text{NR}^4\text{R}^5$ ,

[0009]  $\text{R}^1$  和  $\text{R}^2$  彼此独立地为氢、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  烯基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  炔基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基或  $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基,其中上述六种基团被  $m$  个卤原子取代,

[0010]  $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  和  $\text{R}^5$  彼此独立地为氢、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基或  $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基,其中上述后三个基团被  $m$  个卤原子取代,

[0011] X 和 Y 彼此独立地为氢、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  烯基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$  炔基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  卤代烷基、卤素、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$  烷基-S(O)<sub>n</sub>、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基-S(O)<sub>n</sub>、硝基或氰基,

[0012] Z 为氢或  $\text{CO}_2\text{R}^6$ ,

[0013]  $\text{R}^6$  为  $(\text{C}_1\text{-C}_6)$  烷基或  $(\text{C}_3\text{-C}_6)$  环烷基,

[0014]  $m$  为 0、1、2、3、4 或 5,

[0015]  $n$  为 0、1 或 2。

[0016] 在式 (I) 和下述各式中,具有多于两个碳原子的烷基可为直链或支链。烷基有,例如甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基或 2-丁基、戊基,己基,如正己基、异己基和 1,3-二甲基丁基。卤素为氟、氯、溴或碘。

[0017] 如果一个基团被基团多取代,则应理解为意指该基团被一个或多个相同或不同的上述基团取代。

[0018] 根据取代基的性质和连接,式 (I) 的化合物可以以立体异构体的形式存在。例如,如果存在一个或多个不对称碳原子,则可存在对映异构体和非对映异构体。同样,当  $n$  为 1

时,存在立体异构体(亚砷)。立体异构体可由在制备过程中产生的混合物通过常规分离方法获得,例如通过色谱分离方法获得。同样,也可使用立体选择性反应和利用光学活性原料和/或助剂来选择性地制备立体异构体。本发明还涉及式(I)包含的所有立体异构体及其混合物,但没有具体限制。

[0019] 优选的式(I)化合物为如下的化合物:其中

[0020] A为 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 或 $\text{N} = \text{CR}^3\text{NR}^4\text{R}^5$ ,

[0021]  $\text{R}^1$ 和 $\text{R}^2$ 彼此独立地为氢、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ 烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ 烯基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ 环烷基或 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ 环烷基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基,

[0022]  $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$ 彼此独立地为氢或 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基,

[0023] X和Y彼此独立地为甲基、甲氧基、三氟甲基、氯、溴、氟或甲磺酰基,

[0024] Z为氢或 $\text{CO}_2\text{R}^6$ ,

[0025]  $\text{R}^6$ 为甲基或乙基。

[0026] 尤其优选的式(I)化合物为如下的化合物:其中

[0027] A为 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 或 $\text{N} = \text{CR}^3\text{NR}^4\text{R}^5$ ,

[0028]  $\text{R}^1$ 和 $\text{R}^2$ 彼此独立地为氢、甲基、乙基、丙基、甲氧基乙基、乙氧基乙基或甲氧基丙基,

[0029]  $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$ 彼此独立地为氢或甲基,

[0030] X和Y彼此独立地为甲基、甲氧基、三氟甲基、氯、溴、氟或甲磺酰基,

[0031] Z为氢或 $\text{CO}_2\text{R}^6$ ,

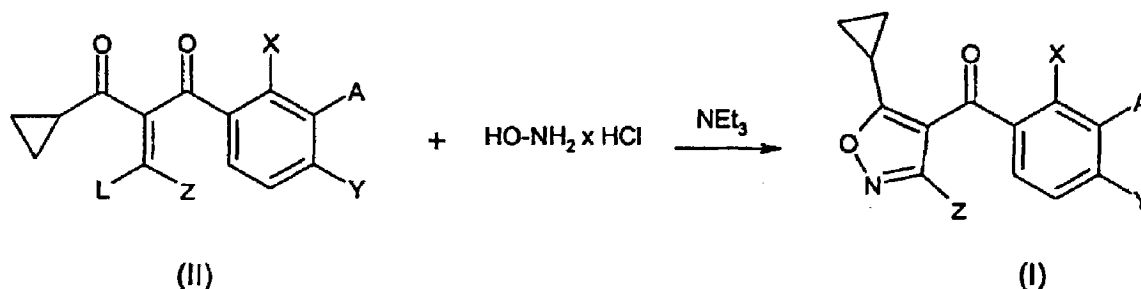
[0032]  $\text{R}^6$ 为甲基或乙基。

[0033] 除非另有定义,下文提及的所有式中的取代基和符号与式(I)中所述含义相同。

[0034] 例如,Z为氢的本发明的化合物可通过方案1所指出的已知于EP 0418 175 A1中的方法制备,所述方法通过使式(II)的化合物与一种羟胺盐如盐酸羟胺在合适的溶剂如乙醇或乙腈中、如果合适在碱如三乙胺催化的条件下于室温至最高达溶剂沸点的温度下反应而进行。在式(II)中,L为例如乙氧基或二甲氨基等基团。

[0035] 方案1

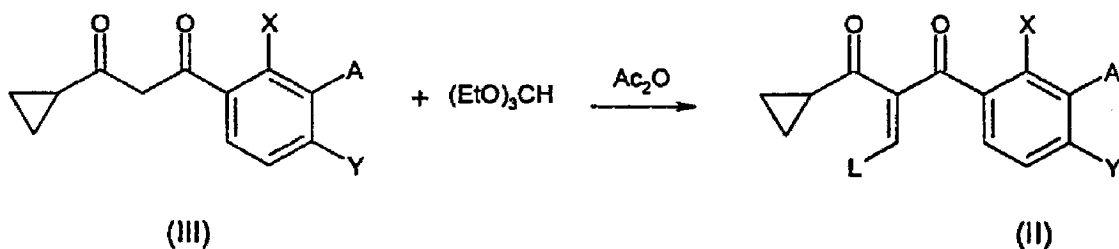
[0036]



[0037] 式(II)化合物例如可通过方案2所指出的已知于J. Heterocyclic Chem., 1976, 13, 973中的方法制备,所述方法通过使二酮(III)与例如原甲酸三乙酯借助酸催化反应而进行。

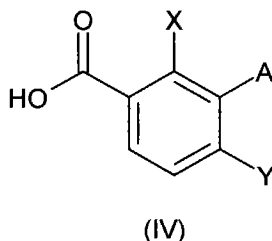
[0038] 方案2

[0039]



[0040] 式 (III) 的化合物的制备理论上是技术人员已知的,例如可使用式 (IV) 的三取代苯甲酸或其衍生物如酰氯或酯来实现。例如,所述式 (IV) 的苯甲酸可通过 WO 98/42678 中描述的方法制备。

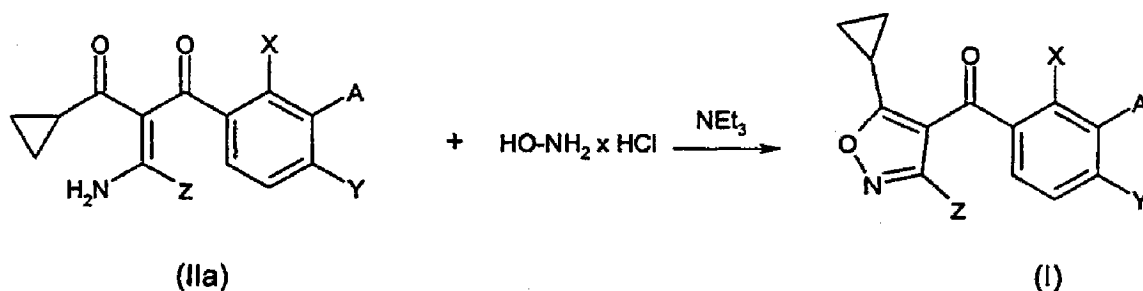
[0041]



[0042] Z 为氢或  $\text{CO}_2\text{R}^6$  的本发明的化合物可例如通过方案 3 所指出的已知于 WO 97/30037 中的方法制备,所述方法通过使式 (IIa) 化合物与羟胺或其盐在合适的溶剂如乙醇或乙腈中、如果合适在碱如三乙胺催化的条件下于室温至最高达溶剂沸点的温度下反应而进行。

[0043] 方案 3

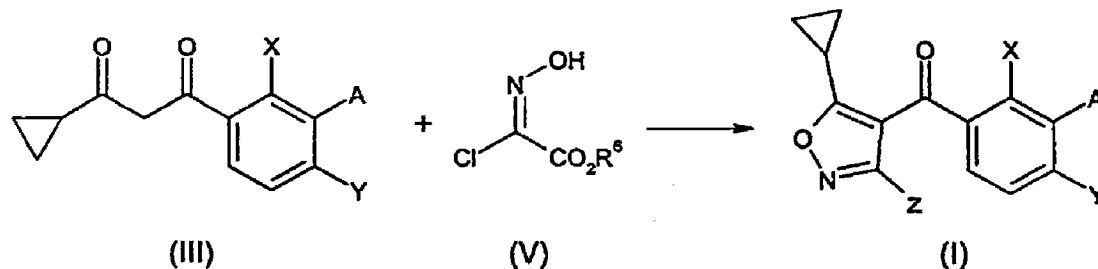
[0044]



[0045] Z 为  $\text{CO}_2\text{R}^6$  的本发明化合物还可例如通过方案 4 所指出的已知于 WO 98/5153 中的方法制备,所述方法通过使式 (III) 化合物与式 (V) 的 2-氯-2-羟亚氨基乙酸酯反应而进行。

[0046] 方案 4

[0047]



[0048] X、Y、A 和 Z 如式 (I) 定义且 L 定义如上的式 (II) 和 (IIa) 化合物是新化合物,并且也是本发明的主题。

[0049] 可根据上述反应合成的式 (I) 的化合物和 / 或其盐的集合还可以以平行方式制

备,所述方式可手动实现,或以半自动或全自动的方式实现。在这种情况下,可以例如自动地实施反应过程、后处理或者产物或中间体的纯化。总之,这应理解为例如 D. Tiebes 在 *Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening* (Editor Günther Jung), Wiley 1999, 第 1 至 34 页中所述的过程。

[0050] 所述平行反应过程和后处理可使用多种市售装置进行,例如来自 Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA 的 Calpyso 反应单元;或来自 Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 113AZ, England 的反应站;或来自 Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, USA 的 MultiPROBE Automated Workstations。可使用例如产自 ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA 等的色谱装置来对制备过程中生成的式 (I) 化合物及其盐或中间体进行平行纯化。

[0051] 所列装置使得过程模块化,其中各个模块 (pass) 自动进行,但在各模块之间必须进行手动操作。这可通过使用部分或完全集成的自动系统而避免,其中相关自动化模块通过例如自控设备操控。此类自动系统例如可由 Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA 获得。

[0052] 可通过使用聚合物负载的试剂/清除树脂辅助进行单个或多个合成步骤。专业文献描述了多种实验方案,例如在 *ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis* (Sigma-Aldrich) 中。

[0053] 除了此处描述的方法之外,式 (I) 的化合物及其盐的制备还可完全或部分地通过固相负载法进行。为此目的,将所述合成过程或一种适用于相关方法的合成过程的各个中间体或全部中间体结合至合成树脂上。固相合成法已在专业文献中有全面的描述,例如 Barry A. Bunin 的“*The Combinatorial Index*”, Academic Press, 1998 and *Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening* (Editor Günther Jung), Wiley, 1999。使用固相负载合成法可以进行文献中已知的多种方案,这些方案本身可以手动或自动地实施。例如,所述反应可借助 IRORI 技术在来自 Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA 92064, USA 的微型反应器中进行。

[0054] 可通过使用微波技术辅助进行固相上和液相中的多个合成步骤。多种实验方案描述于专业文献例如 *Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry* (Editors C. O. Kappe and A. Stadler), Wiley, 2005 中。

[0055] 根据本文所述的方法制备可以生成物质集合形式的式 (I) 的化合物及其盐,称为库 (library)。本发明还涉及含有至少两种式 (I) 化合物及其盐的库。

[0056] 本发明的式 (I) 化合物 (和/或其盐)——下文统称“本发明化合物”——对抵抗宽范围的经济上重要的单子叶和双子叶一年生有害植物具有出色的除草活性。所述活性物质还对由根茎、根状茎 (woodstocks)、或其他多年生器官发芽的难以防治的多年生有害植物有效。

[0057] 因此,本发明还涉及一种防治不想要的植物或用于调节植物生长 (优选在作物植物中) 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 (例如颖果、种子或无性繁殖体,如块茎或带芽的枝部) 或植物生长区域 (例如栽培区域)。在本文中,本发明的化合物例如可在种植前 (如果合适,还通过引入土壤中)、芽前或芽后施用。以下将提及一些可由本发明活性化合物防治的单子叶和双子叶杂草群的代表性实例,但所述列举并非意欲对特定属种进行限制。

[0058] 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*)、*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*)、蟋蟀草属 (*Eleusine*)、画眉草属 (*Eragrostis*)、野黍属 (*Eriochloa*)、羊茅属 (*Festuca*)、飘拂草属 (*Fimbristylis*)、异蕊花属 (*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*)、莞草属 (*Scirpus*)、狗尾草属 (*Setaria*)、高粱属 (*Sorghum*)。

[0059] 以下属的双子叶杂草：白麻属 (*Abutilon*)、苋属 (*Amaranthus*)、豚草属 (*Ambrosia*)、*Anoda*、春黄菊属 (*Anthemis*)、*Aphanes*、蒿属 (*Artemisia*)、滨藜属 (*Atriplex*)、雏菊属 (*Bellis*)、鬼针属 (*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*)、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*)、芙蓉属 (*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*)、山靛属 (*Mercurialis*)、*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*)、焯菜属 (*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*)、苜蓿属 (*Thlaspi*)、车轴草属 (*Trifolium*)、荨麻属 (*Urtica*)、婆婆纳属 (*Veronica*)、堇菜属 (*Viola*)、苍耳属 (*Xanthium*)。

[0060] 如果在芽前将本发明的化合物施用于土壤表面，则可以完全阻止杂草秧苗的发芽，或者使杂草生长至达到子叶期后停止生长，并最终在三至四周后彻底死亡。

[0061] 如果在芽后将所述活性化合物芽后施用于植物的绿色部位，则植物会在处理后停止生长，所述有害植物会停留在施用时间点的生长期，或在一段时间后彻底死亡，从而以此方式在极早的时间点持续地消除对作物植物有害的杂草的竞争。

[0062] 尽管本发明的化合物具有出色的抵抗单子叶和双子叶杂草的除草活性，但根据本发明各个化合物的结构及其施用率，经济上重要的作物的作物植物仅受到较小的损害，或完全不受损害，所述经济上重要的作物例如以下属的双子叶作物：落花生属 (*Arachis*)、甜菜属 (*Beta*)、芸苔属 (*Brassica*)、黄瓜属 (*Cucumis*)、南瓜属 (*Cucurbita*)、向日葵属 (*Helianthus*)、胡萝卜属 (*Daucus*)、大豆属 (*Glycine*)、棉属 (*Gossypium*)、番薯属 (*Ipomoea*)、莴苣属 (*Lactuca*)、亚麻属 (*Linum*)、番茄属 (*Lycopersicon*)、烟草属 (*Nicotiana*)、菜豆属 (*Phaseolus*)、豌豆属 (*Pisum*)、茄属 (*Solanum*)、蚕豆属 (*Vicia*)，或以下属的单子叶作物：葱属 (*Allium*)、凤梨属 (*Ananas*)、天门冬属 (*Asparagus*)、燕麦属 (*Avena*)、大麦属 (*Hordeum*)、稻属 (*Oryza*)、黍属 (*Panicum*)、甘蔗属 (*Saccharum*)、黑麦

属 (Secale)、高粱属 (Sorghum)、小黑麦属 (Triticale)、小麦属 (Triticum) 和玉蜀黍属 (Zea), 特别是玉蜀黍属和小麦属。这就是为什么本发明化合物高度适用于选择性防治作物植物如农业有用植物或观赏植物中的不想要的植物生长的原因。

[0063] 此外, 本发明的化合物 (根据其各自结构和施用率) 具有出色的作物植物生长调节性质。它们以调节方式参与植物新陈代谢, 从而可用于定向影响植物成分和促进采收, 例如通过触发脱水和矮化生长。此外, 它们还适于对不想要的营养生长进行一般防治和抑制, 而在此过程中不会损害植物。抑制营养生长在很多单子叶和双子叶作物中起到重要作用, 因为借此可例如减少或完全防止倒伏。

[0064] 由于所述活性化合物具有除草和植物生长调节性能, 其还可用于防治遗传改造的植物或已通过常规诱变改造的植物的作物中的有害植物。一般而言, 转基因植物的特征为特别有利的性质, 例如对某些农药——主要是某些除草剂——的抗性、对植物病害或植物病原体——如某些昆虫或微生物 (如真菌、细菌或病毒)——的抗性。其他特别的性质有关例如采收物的数量、质量、贮存性、组成和具体成分。例如, 具有提高的淀粉含量或改变的淀粉质量的转基因植物, 或采收物含有不同脂肪酸组成的转基因植物是已知的。

[0065] 就转基因作物而言, 优选将本发明化合物用于有用植物和观赏植物的经济上重要的转基因作物, 例如谷类 (例如小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱和黍、水稻和玉米), 或其他作物如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他蔬菜。优选将本发明的除草剂化合物用于对除草剂的植物毒性效应具有抗性、或已通过重组技术获得所述抗性的有用植物作物。

[0066] 优选将本发明化合物或其盐用于有用植物和观赏植物的经济上重要的转基因作物, 例如谷类 (例如小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱和黍、水稻、木薯和玉米), 或其他作物如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他蔬菜。优选将本发明的除草剂化合物用于对除草剂的植物毒性效应具有抗性、或已通过重组技术获得所述抗性的有用植物作物。

[0067] 制备与现有植物相比具有改造特征的新植物的常规方法有, 例如常规育种方法和产生突变体。或者, 可使用重组方法产生具有改造特征的新植物 (参见, 例如 EP-A-0221044、EP-A-0131624)。例如一些文件已描述了以下情形:

[0068] - 为使植物中合成的淀粉改性而对作物植物进行的重组改造 (例如 WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806),

[0069] - 对草胺膦 (glufosinate) 类 (参见, 例如 EP-A-0242236、EP-A-242246) 或草甘膦 (glyphosate) 类 (WO 92/00377) 或磺酰脲类 (EP-A-0257993、US-A-5013659) 的某些除草剂具有抗性的转基因作物植物,

[0070] - 能够产生使植物对某些有害物具有抗性的苏云金杆菌毒素 (Bt 毒素) 的转基因作物植物, 例如棉花 (EP-A-0142924、EP-A-0193259),

[0071] - 具有改造的脂肪酸组成的转基因作物植物 (WO 91/13972),

[0072] - 含有新成分或次生化合物——例如能提高病害抗性的新植物抗毒素——的遗传改造的作物植物 (EPA 309862、EPA0464461)

[0073] - 具有更高的产量和更高的胁迫耐受性的光呼吸作用降低的遗传改造的植物 (EPA 0305398)

[0074] - 产生制药或诊断上重要的蛋白质的转基因作物植物 (“分子制药”)

[0075] - 特征为产率更高或质量更好的转基因作物植物

[0076] - 特征为例如上述新性质的结合的转基因作物植物 (“基因堆积”)。

[0077] 可用于产生具有改造性质的新转基因植物的大量分子生物技术理论上是已知的; 参见, 例如 I. Potrykus and G. Spangenberg(eds.) Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual(1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg or Christou, “Trends in Plant Science” 1(1996) 423-431)。

[0078] 为进行此类重组操作, 可将核酸分子引入能通过 DNA 序列重组而产生诱变或序列变化的质粒中。例如, 可以借助标准方法进行碱基交换, 子序列敲除或加入天然或合成的序列。为使 DNA 片段彼此连接, 可在片段上引入加入接合单元或连接单元, 参见, 例如 Sambrook et al., 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。

[0079] 具有降低活性的基因产物的植物细胞可通过以下方式产生: 例如, 表达至少一种合适的反义 RNA 和正义 RNA 来实现共抑制效应, 或者表达至少一种能特异性切割上述基因产物的转录物的具有合适结构的核酶。为此, 首先可以使用含有基因产物的完整编码序列——包括所有可能存在的侧翼序列——的 DNA 分子, 或者也可以使用仅含有部分编码序列的 DNA 分子, 所述部分编码序列必须足够长, 以便在细胞中产生反义效果。也可以使用与基因产物的编码序列具有高度同源性但并不完全相同的 DNA 序列。

[0080] 当植物中表达核酸分子时, 合成的蛋白质可位于植物细胞的任意区室中。但为实现现在特定区室中的定位, 可以例如使编码区域与确保在特定区室中定位的 DNA 序列连接。此类序列是本领域技术人员已知的 (参见, 例如 Braun et al., EMBO J. 11(1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85(1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1(1991), 95-106)。但核酸分子还可在植物细胞的细胞器中表达。

[0081] 转基因植物细胞可通过已知技术再生以得到完整植物体。原则上, 转基因植物可以是任意植物种的植物, 即单子叶和双子叶植物。

[0082] 因此, 可通过过表达、压制或抑制同源 (= 天然) 基因或基因序列, 或表达异源 (= 外源) 基因或基因序列得到转基因植物。

[0083] 优选将本发明的化合物用于对以下物质具有抗性的转基因作物: 生长调节剂, 例如麦草畏 (dicamba); 或抑制植物必需酶的除草剂, 所述植物必需酶例如乙酰乳酸合成酶 (ALS)、EPSP 合成酶、谷氨酰胺合成酶 (GS) 或羟基苯丙酮酸双加氧酶 (HPPD); 选自磺酰脲、草甘膦、草胺膦或苯甲酰基异噁唑和类似活性物质的除草剂。

[0084] 当本发明的活性化合物用于转基因作物时, 除了可在其他作物中观察到的对有害植物的效果之外, 还常常观察到对施用于所述转基因作物而言的特异性效果, 例如改进的或特别拓宽的可防治杂草的范围、改进的可用于施用的施用率、优选地与转基因作物对其具有抗性的除草剂的良好结合能力以及对转基因作物植物的生长和产量的影响。

[0085] 因此, 本发明还涉及本发明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。

[0086] 本发明的化合物可以以可湿性粉剂、乳油、可喷雾液剂、粉剂或颗粒剂形式的常规制剂使用。因此, 本发明还涉及含有本发明化合物的除草和植物生长调节组合物。

[0087] 根据主要的生物学和 / 或化学物理参数, 可通过多种方式配制本发明的化合物。合适制剂的实例为: 可湿性粉剂 (WP)、水溶性粉剂 (SP)、水溶性浓缩剂、乳油 (EC)、乳剂 (EW) 如水包油乳剂和油包水乳剂、可喷雾液剂、胶悬剂 (SC)、油基或水基分散剂、油混溶性溶液剂、胶囊悬浮剂 (CS)、粉剂 (DP)、拌种产品、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、包衣颗粒剂和吸附颗粒剂、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 (wax)。

[0088] 各种剂型理论上是已知的, 并在下列文献中有所描述, 例如: Winnacker-Küchler, “Chemische Technologie” [Chemical technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Ed. 1986; Wade van Valkenburg, “Pesticide Formulations”, Marcel Dekker, N. Y., 1973; K. Martens, “Spray Drying” Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

[0089] 所需制剂助剂, 例如惰性物质、表面活性剂、溶剂和其他添加剂也是已知的, 并在下列文献中有所描述, 例如: Watkins, “Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”, 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N. J., H. v. Olphen, “Introduction to Clay Colloid Chemistry”; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N. Y.; C. Marsden, “Solvents Guide”; 2nd Ed., Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon’s “Detergents and Emulsifiers Annual”, MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, “Encyclopedia of Surface Active Agents”, Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964; **Schönfeldt, “Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte”** [Interface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, “Chemische Technologie” [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Ed. 1986.

[0090] 基于上述制剂, 可以制备与其他农药活性物质——例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀菌剂——以及与安全剂、肥料和 / 或生长调节剂的例如预混物或桶混物的形式的结合物。

[0091] 可湿性粉剂为可均匀分散于水中的制剂, 其除了含有活性化合物之外, 还含有稀释剂或惰性物质, 以及离子型表面活性剂和 / 或非离子型表面活性剂 (湿润剂、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、烷基磺酸盐、烷基苯磺酸盐、木素磺酸钠、2,2’-二萘基甲-6,6’-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰基甲基牛磺酸钠。为了制备可湿性粉剂, 在例如常规设备例如锤磨机、风磨机和空气气流粉碎机中精细研磨具有除草活性的化合物, 同时或随后与制剂助剂混合。

[0092] 乳油通过下述过程制备: 将活性化合物溶于有机溶剂 (例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或较高沸点的芳香化合物或烃类) 或有机溶剂混合物中, 并加入一种或多种离子型和 / 或非离子型表面活性剂 (乳化剂)。可用的乳化剂的实例有: 烷基芳基磺酸钙, 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类、烷基芳基聚乙二醇醚类、脂肪醇聚乙二醇醚类、环氧丙烷 / 环氧乙烷缩合物、烷基聚醚类、山梨糖醇酐酯类、例如山梨糖醇酐脂肪酸酯类或聚氧乙烯山梨糖醇酐酯类例如聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯类。

[0093] 粉剂可通过将活性化合物与细分散的固体物质一起研磨而制备, 所述固体物质例如滑石、天然粘土例如高岭土、膨润土和叶蜡石或硅藻土。

[0094] 悬浮剂可为水基或油基。它们可以通过例如使用市售的砂磨机湿法研磨而制备,

如果合适,加入例如上文在其他剂型中所述的表面活性剂。

[0095] 乳剂例如水包油乳剂(EW),可以借助例如搅拌器、胶体磨和/或静态混合器使用水性有机溶剂以及如果合适上文关于例如其他剂型中所述的表面活性剂。

[0096] 颗粒剂可以通过将所述活性化合物喷洒在吸收性的颗粒状惰性物质上、或通过使用粘合剂将活性化合物浓缩物涂覆在载体表面而制备,所述载体例如砂、高岭土或颗粒状惰性材料,所述粘合剂例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油。也可以将合适的活性化合物以制备肥料颗粒的常规方式制备成颗粒,如果需要,可以与肥料混合。

[0097] 水分散性颗粒剂通常可以通过常规方法制备,所述常规方法例如喷雾干燥法、流化床制粒法、盘式制粒法、使用高速搅拌器的混合法以及不使用固体惰性物质的挤出法。

[0098] 关于盘式制粒法、流体床制粒法、挤出法和喷雾法颗粒的制备,参见例如“*Spray-Drying Handbook*”3rd ed.1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “*Agglomeration*”, Chemical and Engineering 1967, pages 147 et seq.; “*Perry’s Chemical Engineer’s Handbook*”, 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, 8-57 页中的方法。

[0099] 关于作物保护产品制剂的其他细节,参见例如 G. C. Klingman, “*Weed Control as a Science*”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 81-96 页和 J. D. Freyer, S. A. Evans, “*Weed Control Handbook*”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 101-103 页。

[0100] 一般而言,所述农业化学制剂含有 0.1 至 99 重量%、特别是 0.1 至 95 重量%的本发明的化合物。在可湿性粉剂中,活性化合物的浓度为例如约 10 至 90 重量%,至 100 重量%的余量由常规制剂成分组成。在乳油中,活性化合物的浓度可为约 1 至 90 重量%、优选地为 5 至 80 重量%。粉剂形式的制剂中含有 1 至 30 重量%的活性化合物,大多数情况下优选含有 5 至 20 重量%的活性化合物;可喷雾液剂中含有约 0.05 至 80 重量%、优选地为 2 至 50 重量%的活性化合物。对于水分散性颗粒剂而言,活性化合物的含量部分地依赖于所述活性化合物为液体形式还是固体形式,以及所使用的颗粒助剂和填充剂等。例如,在水分散性颗粒剂中,活性化合物的含量通常为 1 至 95 重量%、优选地为 10 至 80 重量%。

[0101] 此外,如果合适,所述活性化合物的制剂中含有均为常规的各种助剂,如增粘剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、抗冻剂、溶剂、填充剂、载体、着色剂、消泡剂、挥发抑制剂和 pH 值调节剂和粘度调节剂。

[0102] 基于上述制剂,可以制备出与其他农药活性物质——例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀菌剂——以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的例如预混物或桶混物形式的结合物。

[0103] 可用于与本发明的化合物以混合制剂或桶混物的形式结合的活性化合物有,例如基于抑制下列酶而发挥作用的已知活性物质,所述酶例如:乙酰乳酸合成酶、乙酰辅酶 A 羧化酶、纤维素合成酶、烯醇式丙酮莽草酸-3-磷酸合成酶、谷氨酰胺合成酶、对羟基苯基丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素去饱和酶、光合体系 I、光合体系 II、原卟啉原氧化酶;所述活性化合物已知于例如:Weed Research 26(1986), 441-445 或“*The Pesticide Manual*”, 14th Edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 及其中所引用的文献中。可与本发明化合物结合的已知除草剂或植物生长

调节剂有例如以下活性化合物（所述化合物以国际标准化组织（ISO）规定的通用名或以其化学名称表示，如果合适，还附有其代码编号），且均包括其所有使用形式，例如酸、盐、酯和异构体（例如立体异构体和旋光异构体）形式。此处以实例方式提及其一种、在一些情况下为多种使用形式：

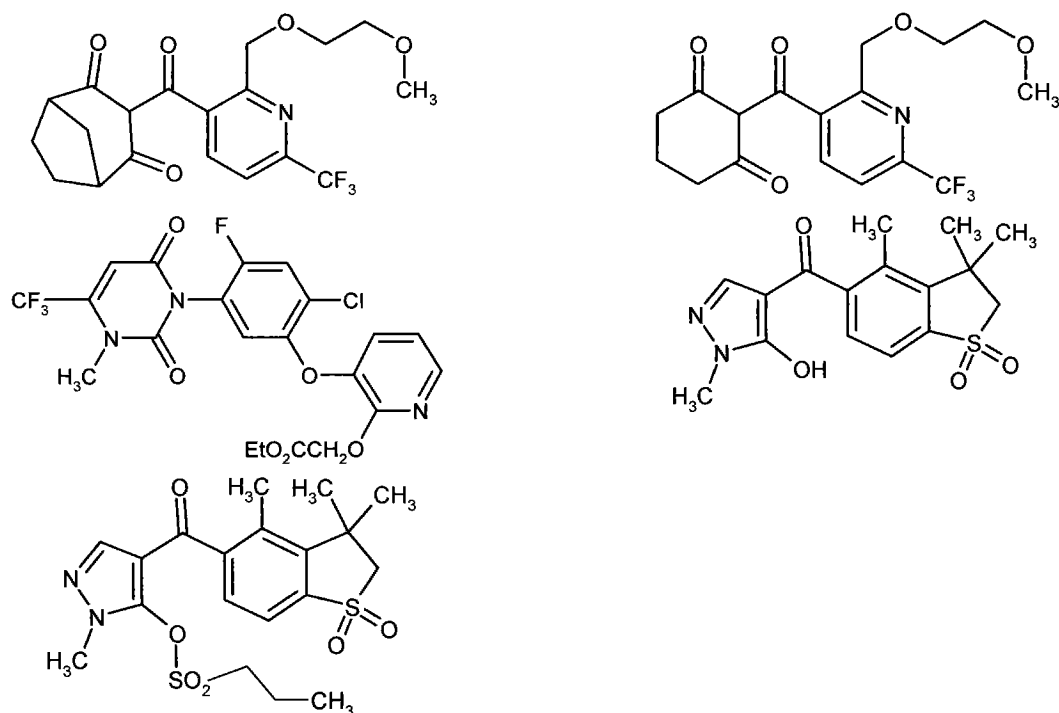
[0104] 乙草胺 (acetochlor)、活化酯 (acibenzolar)、苯并噻二唑 (acibenzolar-S-methyl)、三氟羧草醚 (acifluorfen, acifluorfen-sodium)、苯草醚 (aclonifen)、甲草胺 (alachlor)、二丙烯草胺 (allidochlor)、枯杀达 (alloxydim, alloxydim-sodium)、莠灭净 (ametryne)、氨唑草酮 (amicarbazone)、先甲草胺 (amidochlor)、酰胺磺隆 (amidosulfuron)、aminocyclopyrachlor、氯氨吡啶酸 (aminopyralid)、杀草强 (amitrol)、氨基磺酸铵、环丙嘧啶醇 (ancimidol)、莎稗磷 (anilofos)、磺草灵 (asulam)、莠去津 (atrazine)、唑啶草酮 (azafenidin)、四唑嘧磺隆 (azimsulfurone)、叠氮津 (aziprotryne)、BAH-043、BAS-140H、BAS-693H、BAS-714H、BAS-762H、BAS-776H、BAS-800H、氟丁酰草胺 (beflubutamid)、草除灵 (benazolin, benazolin-ethyl)、bencarbazone、乙丁氟灵 (benfluralin)、吡草黄 (benfuresate)、地散磷 (bensulide)、苄嘧磺隆 (bensulfuron-methyl)、灭草松 (bentazone)、双苯嘧草酮 (benzfendizone)、双环磺草酮 (benzobicyclon)、吡草酮 (benzofenap)、氟磺胺草 (benzofluor)、新燕灵 (benzoylprop)、甲羧除草醚 (bifenox)、双丙氨膦 (bialaphos, bilanafos-sodium)、双草醚 (bispyribac, bispyribac-sodium)、除草定 (bromacil)、溴丁酰草胺 (bromobutide)、溴酚肟 (bromofenoxim)、溴苯腈 (bromoxynil)、bromuron、特克草 (buminafos)、羧草酮 (busoxinone)、丁草胺 (butachlor)、氟丙嘧草酯 (butafenacil)、抑草磷 (butamifos)、丁烯草胺 (butenachlor)、仲丁灵 (butralin)、丁氧环酮 (butroxydim)、丁草敌 (butylate)、唑草胺 (cafenstrole)、双酰草胺 (carbetamide)、氟唑草酮 (carfentrazone, carfentrazone-ethyl)、甲氧除草醚 (chlomethoxyfen)、草灭畏 (chloramben)、chlorazifop、chlorazifop-butyl、氯溴隆 (chlorbromuron)、氯炔灵 (chlorbufam)、伐草克 (chlorfenac, chlorfenac-sodium)、燕麦酯 (chlorfenprop)、甲基氯苄素 (chlorflurenol, chlorflurenol-methyl)、氯草敏 (chloridazon)、氯嘧磺隆 (chlorimuron, chlorimuron-ethyl)、矮壮素 (chlormequat-chloride)、草枯醚 (chlornitrofen)、chlorophthalim、氯酞酸甲酯 (chlorthal-dimethyl)、绿麦隆 (chlorotoluron)、氯磺隆 (chlorsulfuron)、吡啶酮草酯 (cinidon, cinidon-ethyl)、环庚草醚 (cinmethylin)、醚磺隆 (cinosulfuron)、烯草酮 (clethodim)、炔草酸 (clodinafop)、炔草酯 (clodinafop-propargyl)、杀雄嗪酸 (clofencet)、异恶草松 (clomazone)、氯甲酰草胺 (clomeprop)、调果酸 (cloprop)、二氯吡啶酸 (clopymalid)、氯酯磺草酸 (cloransulam, cloransulam-methyl)、绿麦隆 (chlortoluron)、氨基氰 (cyanamide)、氰草津 (cyanazine)、环丙酰胺酸 (cyclanilide)、环草敌 (cycloate)、环丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron)、噻草酮 (cycloxydim)、环莠隆 (cycluron)、cyhalofop、氰氟草酯 (cyhalofop-butyl)、莎草快 (cyperquat)、环丙津 (cyprazine)、环唑塞胺 (cyprazole)、2, 4-D、2, 4-DB、杀草隆 (daimuron/dymron)、茅草枯 (dalapon)、丁酰肼 (daminozide)、棉隆 (dazomet)、正癸醇、甜菜安 (desmedipham)、敌草净 (desmetryn)、detosyl-pyrazolate (DTP)、燕麦敌 (di-allate)、麦草畏 (dicamba)、敌草腈

(dichlobenil)、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、精2,4-滴丙酸(dichlorprop-P)、diclofop、禾草灵(diclofop-methyl)、diclofop-P-methyl、双氯磺草胺(diclosulam)、乙酰甲草胺(diethatyl, diethatyl-ethyl)、枯莠隆(difenoxyuron)、野燕枯(difenzoquat)、吡氟酰草胺(diflufenican)、二氟吡隆(diflufenzopyr, diflufenzopyr-sodium)、噁唑隆(dimefuron)、调伏酸(dikegulac-sodium)、噁唑隆(dimefuron)、哌草丹(dimepiperate)、二甲草胺(dimethachlor)、异戊乙净(dimethametryn)、二甲吩草胺(dimethenamid)、精二甲吩草胺(dimethenamid-P)、噁节因(dimethipin)、dimetrasulfuron、氨基灵(dinitramine)、地乐酚(dinoseb)、特乐酚(dinoterb)、双苯酰草胺(diphenamid)、异丙净(dipropetryn)、敌草快(diquat)、diquat-dibromide、氟硫草定(dithiopyr)、敌草隆(diuron)、DNOC、草止津(eglinazine-ethyl)、茵多酸(endothal)、EPTC、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟灵(ethalfluralin)、胺苯磺隆(ethametsulfuron-methyl)、乙烯利(ethephon)、磺噻隆(ethidimuron)、乙嗪草酮(ethiozin)、乙氧呋草黄(ethofumesate)、氟乳醚(ethoxyfen)、氟乳醚乙酯(ethoxyfen-ethyl)、乙氧嘧磺隆(ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺(etobenzanid)、F-5331即N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧-1H-四唑-1-基]苯基]乙磺酰胺、2,4,5-涕丙酸(fenoprop)、噁唑禾草灵(fenoxaprop, fenoxaprop-ethyl)、精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P, fenoxaprop-P-ethyl)、四唑酰草胺(fentrazamide)、非草隆(fenuron)、flamprop、高效麦草氟异丙酯(flamprop-M-isopropyl)、高效麦草氟甲酯(flamprop-M-methyl)、啉嘧磺隆(flazasulfuron)、双氟磺草胺(florasulam)、吡氟禾草灵(fluzifop)、精吡氟禾草灵(fluzifop-P)、吡氟禾草灵丁酯(fluzifop-butyl)、精吡氟禾草灵丁酯(fluzifop-P-butyl)、异丙吡草酯(fluzolate)、氟酮磺隆(flucarbazone, flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氯乙氟灵(fluchloralin)、氟噻草胺(flufenacet(thiaflumide))、氟哒嗪草酯(flufenpyr, flufenpyr-ethyl)、氟节胺(flumetralin)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟烯草酸(flumiclorac, flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、炔草胺(flumipropyn)、氟草隆(flumeturon)、三氟硝草醚(fluorodifen)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen, fluoroglycofen-ethyl)、氟胺草唑(flupoxam)、fluproacil、flupropanate、氟啉嘧磺隆(flupyr-sulfuron, flupyr-sulfuron-methyl-sodium)、9-羟基笏甲酸(flurenol)、笏丁酯(flurenol-butyl)、氟啉草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氯氟吡氧乙酸(fluroxypyr, fluroxypyr-meptyl)、呋嘧醇(flurprimidol)、呋草酮(flurtamone)、嗪草酸(fluthiacet)、嗪草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、噁唑草酰胺(fluthiamide)、氟磺胺草醚(fomesafen)、甲酰氨磺隆(foramsulfuron)、氯吡脲(forchlorfenuron)、杀木膦(fosamine)、呋氧草醚(furyloxyfen)、赤霉素(gibberillic acid)、草铵膦(glufosinate)、L-草铵膦(L-glufosinate, L-glufosinate-ammonium)、草铵膦(glufosinate-ammonium)、草甘膦(glyphosate)、草甘膦异丙胺盐(glyphosate-isopropylammonium)、H-9201、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron, halosulfuron-methyl)、氟吡禾灵(haloxypyr)、精氟吡禾灵(haloxypyr-P)、氟吡禾灵乙氧基乙酯(haloxypyr-ethoxyethyl)、吡氟氯禾灵乙氧基乙酯(haloxypyr-P-ethoxyethyl)、氟吡禾灵甲酯(haloxypyr-methyl)、吡氟氯禾灵甲酯

(haloxyfop-P-methyl)、环嗪酮 (hexazinone)、HNPC-9908、HOK-201、HW-02、咪草酸 (imazamethabenz, imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟 (imazamox)、甲咪唑烟酸 (imazapic)、咪唑烟酸 (imazapyr)、咪唑喹啉酸 (imazaquin)、咪唑乙烟酸 (imazethapyr)、唑吡啶磺隆 (imazosulfuron)、抗倒胺 (inabenfide)、茚草酮 (indanofan)、吲哚乙酸 (IAA)、4-吲哚3-基丁酸 (IBA)、碘甲磺隆 (iodosulfuron, iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈 (ioxynil)、丁脘酰胺 (isocarbamid)、异丙乐灵 (isopropalin)、异丙隆 (isoproturon)、异恶隆 (isouron)、异恶酰草胺 (isoxaben)、异恶氯草酮 (isoxachlortole)、异噁唑草酮 (isoxaflutole)、异恶草醚 (isoxapyrifop)、KUH-043、KUH-071、特胺灵 (karbutilate)、ketospiradox、乳氟禾草灵 (lactofen)、环草定 (lenacil)、利谷隆 (linuron)、马来酰肼 (maleic hydrazide)、MCPA、MCPB、MCPB 甲酯、MCPB 乙酯、MCPB 钠、2-甲-4-氯丙酸 (mecoprop)、2-甲-4-氯丙酸钠、mecoprop-butotyl、mecoprop-P-butotyl、精-2-甲-4-氯丙酸二甲基铵 (mecoprop-P-dimethylammonium)、精-2-甲-4-氯丙酸-2-乙基己酯 (mecoprop-P-2-ethylhexyl)、精-2-甲-4-氯丙酸钾、苯噻酰草胺 (mefenacet)、氯磺酰草胺 (mefluidide)、甲哌啶 (mepiquat-chloride)、甲磺胺磺隆 (mesosulfuron, mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮 (mesotrione)、甲基苯噻隆 (methabenzthiazuron)、威百亩 (metam)、噁唑酰草胺 (metamifop)、苯噻草酮 (metamitron)、吡唑草胺 (metazachlor)、灭草唑 (methazole)、苯草酮 (methoxyphenone)、甲基杀草隆 (methyldymron)、1-甲基环丙烯、甲基异硫氰酸酯、吡喃隆 (metobenzuron)、溴谷隆 (metobromuron)、异丙甲草胺 (metolachlor)、精异丙甲草胺 (S-metolachlor)、磺草唑胺 (metosulam)、甲氧隆 (metoxuron)、嗪草酮 (metribuzin)、甲磺隆 (metsulfuron, metsulfuron-methyl)、禾草敌 (molinate)、庚酰草胺 (monalide)、monocarbamide、甲酰胺硫酸盐 (monocarbamide dihydrogen sulfate)、绿谷隆 (monolinuron)、单嘧磺隆 (monosulfuron)、灭草隆 (monuron)、MT 128、MT 5950 即 N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺、NGGC-011、萘丙胺 (naproanilide)、敌草胺 (napropamide)、萘草胺 (naptalam)、NC 310, 即 4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄基氧基吡唑、草不隆 (neburon)、烟嘧磺隆 (nicosulfuron)、氟氯草胺 (nipyraclufen)、甲磺乐灵 (nitralin)、除草醚 (nitrofen)、硝基苯酚钠 (异构体混合物)、硝氟草醚 (nitrofluorfen)、壬酸、氟草敏 (norflurazon)、坪草丹 (orbencarb)、噻苯胺磺隆 (orthosulfamuron)、氨磺乐灵 (oryzalin)、丙炔恶草酮 (oxadiargyl)、恶草酮 (oxadiazon)、环氧嘧磺隆 (oxasulfuron)、恶嗪草酮 (oxaziclomefone)、乙氧氟草醚 (oxyfluorfen)、多效唑 (paclobutrazole)、百草枯 (paraquat, paraquat dichloride)、壬酸 (pelargonic acid)、二甲戊灵 (pendimethalin)、pendralin、penoxsulam、甲氯酰草胺 (pentanochlor)、环戊恶草酮 (pentoxazone)、黄草伏 (perfluidone)、烯草胺 (pethoxamid)、棉胺宁 (phenisopham)、甜菜宁 (phenmedipham, phenmedipham-ethyl)、氨基吡啶酸 (picloram)、氟吡酰草胺 (picolinafen)、唑啉草酯 (pinoxaden)、哌草磷 (piperophos)、pirifenop、pirifenop-butyl、丙草胺 (pretilachlor)、氟嘧磺隆 (primisulfuron, primisulfuron-methyl)、烯丙苯噻唑 (probenazole)、氟唑草胺 (profluazol)、环丙氟津 (procyazine)、氨氟乐灵 (prodiamine)、环丙氟灵 (profluraline)、环苯草酮 (profoxydim)、调环酸 (prohexadione)、调环酸钙 (prohexadione-calcium)、茉莉酮

(prohydrojasmon)、扑灭通 (prometon)、扑草净 (prometryn)、毒草胺 (propachlor)、敌稗 (propanil)、恶草酸 (propaquizafop)、扑灭津 (propazine)、苯胺灵 (propham)、异丙草胺 (propisochlor)、丙苯磺隆 (propoxycarbazone, propoxycarbazone-sodium)、炔苯酰草胺 (propyzamide)、磺亚胺草 (prosulfalin)、苜草丹 (prosulfocarb)、氟磺隆 (prosulfuron)、丙炔草胺 (prynachlor)、双唑草腈 (pyraclonil)、吡草醚 (pyraflufen, pyraflufen-ethyl)、pyrasulfotole、吡唑特 (pyrazolynate(pyrazolate))、吡嘧磺隆 (pyrazosulfuron(-ethyl))、苜草唑 (pyrazoxyfen)、pyribambenz、异丙酯草醚 (pyribambenz-isopropyl)、嘧啶肟草醚 (pyribenzoxim)、稗草丹 (pyributicarb)、pyridafol、哒草特 (pyridate)、环酯草醚 (pyriftalid)、嘧草醚 (pyriminobac, pyriminobac-methyl)、pyrimisulfan、嘧草硫醚 (pyrithiobac, pyrithiobac-sodium)、pyroxasulfone、甲氧磺草胺 (pyroxsulam)、二氯喹啉酸 (quinchlorac)、氯甲喹啉酸 (quinmerac)、灭藻醌 (quinochloramine)、喹禾灵 (quizalofop)、喹禾灵乙酯 (quizalofop-ethyl)、精喹禾灵 (quizalofop-P)、精喹禾灵乙酯 (quizalofop-P-ethyl)、喹禾糠酯 (quizalofop-P-tefuryl)、砒嘧磺隆 (rimsulfuron)、saflufenacil、仲丁通 (sebumeton)、烯禾啶 (sethoxydim)、环草隆 (siduron)、西玛津 (simazine)、西草净 (simetryn)、SN 106279、磺草酮 (sulcotrione)、菜草畏 (sulfallate(CDEC))、甲磺草胺 (sulfentrazone)、甲嘧磺隆 (sulfometuron, sulfometuron-methyl)、草硫膦 (sulfosate(glyphosate-trimesium))、磺酰磺隆 (sulfosulfuron)、SYN-523、SYP-249、SYP-298、SYP-300、牧草胺 (tebutam)、丁噻隆 (tebuthiuron)、四氧硝基苯 (tecnazene)、tefuryltrione、tembotrione、吡喃草酮 (tepraloxymid)、特草定 (terbacil)、特草灵 (terbucarb)、特丁草胺 (terbuchlor)、特丁通 (terbumeton)、特丁津 (terbuthylazine)、特丁净 (terbutryne)、TH-547、噻吩草胺 (thenylchlor)、thiafluamide、噻氟隆 (thiazafluron)、噻唑烟酸 (thiazopyr)、噻二唑草胺 (thidiazimin)、噻苯隆 (thidiazuron)、thiencarbazone、thiencarbazone-methyl、噻吩磺隆 (thifensulfuron, thifensulfuron-methyl)、禾草丹 (thiobencarb)、仲草丹 (tiocarbazil)、topramezone、三甲苯草酮 (tralkoxydim)、野燕畏 (tri-allate)、醚苯磺隆 (triasulfuron)、三嗪氟草胺 (triaziflam)、triazofenamide、苯磺隆 (tribenuron, tribenuron-methyl)、三氯乙酸 (TCA)、三氯吡氧乙酸 (triclopyr)、灭草环 (tridiphane)、草达津 (trietazine)、三氟啶磺隆 (trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-sodium)、氟乐灵 (trifluralin)、氟胺磺隆 (triflusulfuron)、氟胺磺隆甲酯 (triflusulfuron-methyl)、三甲隆 (trimeturon)、抗倒酯 (trinexapac, trinexapac-ethyl)、三氟甲磺隆 (tritosulfuron)、tsitodef、烯效唑 (uniconazole)、精烯效唑 (uniconazole-P)、灭草敌 (vernolate)、ZJ-0166、ZJ-0270、ZJ-0543、ZJ-0862 和以下化合物

[0105]



[0106] 为了使用,如果合适,以常规方式稀释市售形式的制剂,例如在可湿性粉剂、乳油、分散剂和水分散性颗粒剂的情况下使用水稀释。粉剂、土壤颗粒剂、撒播用颗粒剂和喷雾性溶液剂形式的制剂通常无需在使用前用另外的惰性物质进一步稀释。

[0107] 式(I)的化合物需要的施用率根据外部条件变化,所述外部条件如温度、湿度、使用的除草剂的性质等。其可在较宽范围内变化,例如0.001至1.0kg/ha及以上的活性化合物,但优选在0.005和750g/ha之间。

[0108] 以下的实施例旨在示例说明本发明。

[0109] A. 化学实施例

[0110] 1. 5-环丙基-4-(3-甲基氨基-2-甲磺酰基-4-三氟甲基苯甲酰基)异噁唑(表A中的编号184)的制备

[0111] 步骤1:3-氟-2-甲磺基-4-三氟甲基苯甲酸的合成

[0112] 将25.0g(120.1mmol)3-氟-4-三氟甲基苯甲酸溶于250ml干燥四氢呋喃(THF)中,并在-40℃滴加100.9ml正丁基锂(2.5M的己烷溶液,252.3mmol)。将该混合物搅拌3h,然后滴加32.5ml(360.4mmol)二甲基二硫醚在50ml干燥THF中的溶液。将该混合物搅拌16h,在此过程中,在半小时后,将温度缓慢升至室温(RT)。小心加入2M HCl进行后处理。用乙醚萃取该混合物,随后用2M NaOH萃取有机相。将水相酸化,并用乙醚萃取。将有机相用水洗涤、干燥、并在真空下除去溶剂。将残余物与正庚烷一起搅拌,并通过过滤分离出固体。得到17.0g粗产物,将其用于接下来的合成步骤,而无需另外纯化。

[0113] 步骤2:3-氟-2-甲磺酰基-4-三氟甲基苯甲酸的合成

[0114] 将18.6g(73.2mmol)3-氟-2-甲磺基-4-三氟甲基苯甲酸加入180ml冰乙酸中。加入724mg(2.2mmol)钨(VI)酸钠二水合物,然后将该混合物加热至50-60℃。在此温度下滴加加入15.0ml(浓度为30%,146.8mmol)过氧化氢水溶液。在此温度下将该混合物搅拌4.5h。为完成该反应,随后小心滴加加入14.9ml(浓度为30%,145.9mmol)H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>水溶液,并在50-60℃下将所含物再搅拌3h。将该反应混合物冷却,并倒入水以进行后处理。使用乙

酸乙酯将该混合物萃取两次,用饱和亚硫酸氢钠水溶液洗涤合并的有机相,通过分析确定不存在过氧化物后,干燥该混合物,并在真空下除去溶剂。得到 19.8g 纯度为 95% 的产物。

[0115] 步骤 3 :3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯甲酸的合成

[0116] 用 12.1ml (168mmol ;浓度为 40%) 甲胺水溶液处理 2.40g (8.4mmol) 3- 氟 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯甲酸,并在 RT 下将该混合物搅拌 4h。为进行后处理,将所含物倒入 6N HCl 中,随后将该混合物在冰浴中冷却。通过抽滤过滤出沉淀。得到 2.50g 纯度为 95% 的产物。

[0117] 步骤 4 :3- 环丙基 -2-(3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟乙基苯甲酰基)-3- 氧代丙酸叔丁酯的合成

[0118] 将 2.50g (8.4mmol) 3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯甲酸加入 50ml  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  中,并用 1.1ml (12.6mmol) 草酰氯和两滴 DMF 处理。将该混合物加热回流直至气体的释放停止。为完成反应,再加入 0.8ml (9.2mmol) 草酰氯和另外两滴 DMF。气体的释放停止后,再将所含物加热回流 15 分钟。之后,用旋转蒸发仪浓缩该混合物。为除去残余草酰氯,将残余物与甲苯共同蒸发。将残余物溶于 50ml 甲苯。加入 4.01g (16.8mmol) (3- 叔丁氧基 -1- 环丙基 -3- 氧代丙 -1- 烯 -1- 醇化物) 甲醇镁 (合成例如描述于 EP 0918056 中),并在 RT 下将该混合物搅拌 16h。浓缩所含物,并将残余物溶于乙酸乙酯。用稀 HCl 洗涤该溶液,干燥有机相,并在真空下除去溶剂。得到 5.3g 纯度约 70% 的粗产物,将其用于接下来的合成步骤,而无需另外纯化。

[0119] 步骤 5 :1- 环丙基 -3-(3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯基) 丙 -1,3- 二酮的合成

[0120] 在 55-60°C 下加热 5.0ml 三氟乙酸。滴加加入 5.3g (8.0mmol ;纯度为 70%) 叔丁基 -3- 环丙基 -2-(3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯甲酰基)-3- 氧代丙酸酯的 10ml  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  溶液,然后将该混合物加热回流 15 分钟。在真空下除去溶剂,并通过硅胶柱层析纯化残余物。得到 1.22g 纯度为 95% 的产物。

[0121] 步骤 6 :1- 环丙基 -2-( 二甲基氨基亚甲基)-3-(3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯基) 丙 -1,3- 二酮的合成

[0122] 用 3.0ml (22.7mmol) N, N- 二甲基甲酰胺二甲基乙缩醛处理 1.22g (3.4mmol) 1- 环丙基 -3-(3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯基) 丙 -1,3- 二酮,并在 RT 下将该混合物搅拌 16h。然后加入少量正庚烷,并在 RT 下将所含物再搅拌 10 分钟。通过抽滤过滤出沉淀。得到 1.29g 纯度为 95% 的产物。

[0123] 步骤 7 :5- 环丙基 -4-(3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯甲酰基) 异噁唑的合成

[0124] 将 1.29g (3.1mmol) 1- 环丙基 -2-( 二甲基氨基亚甲基)-3-(3- 甲基氨基 -2- 甲磺酰基 -4- 三氟甲基苯基) 丙 -1,3- 二酮加入 50ml 乙醇中。加入 0.30g (4.3mmol) 羟基氯化铵,并在 RT 下将该混合物搅拌 30 分钟。之后,加入 0.33g (4.0mmol) 乙酸钠,并在 RT 下将所含物搅拌 16h。接着加入另外 0.15g (2.2mmol) 羟基氯化铵,并再在 RT 下将该混合物搅拌 16h。之后,再加入 0.15g (2.2mmol) 羟基氯化铵,并在 RT 下将该混合物搅拌 3d。在真空下除去溶剂,并将残余物溶于乙酸乙酯。用 1N HCl 洗涤该溶液,干燥有机相,并在真空下除去溶剂。通过硅胶柱层析纯化残余物。得到 1.00g 纯度为 95% 的产物。

[0125] 2,5-环丙基-4-(3-甲基氨基-2-甲基-4-甲磺酰基苯甲酰基)异噁唑(表A中的编号2)的制备

[0126] 步骤1:1-环丙基-2-(二甲基氨基亚甲基)-3-(3-甲基氨基-2-甲基-4-甲磺酰基苯基)丙-1,3-二酮的合成

[0127] 在RT下将1.58g(5.1mmol)1-环丙基-3-(3-甲基氨基-2-甲基-4-甲磺酰基苯基)丙-1,3-二酮和2.0ml(15.3mmol)N,N-二甲基甲酰胺二甲基乙缩醛的溶液搅拌3h。将该混合物用10ml  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  处理,在50°C的油浴温度下搅拌2h,静置过夜,在50°C的油浴温度下搅拌1d,并在真空下除去溶剂。通过硅胶柱层析纯化残余物。得到0.85g纯度为93%的产物。

[0128] 步骤2:5-环丙基-4-(3-甲基氨基-2-甲基-4-甲磺酰基苯甲酰基)异噁唑的合成

[0129] 将0.19g(2.8mmol)羟基氯化铵加入0.85g(2.3mmol)1-环丙基-2-(二甲基氨基亚甲基)-3-(3-甲基氨基-2-甲基-4-甲磺酰基苯基)丙-1,3-二酮在100ml乙醇中的溶液中。在RT下将该混合物搅拌3h,并在真空下除去溶剂。将残余物溶于 $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ ,用浓度为10%的 $\text{H}_2\text{SO}_4$ 洗涤,并用 $\text{MgSO}_4$ 干燥。在真空中除去溶剂,并通过硅胶柱层析纯化残余物。得到0.50g纯度为95%的产物。

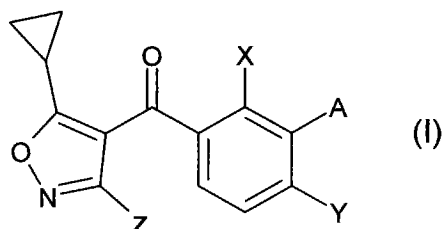
[0130] 下表中列出的实施例根据类似于以上提及的方法制备,或可通过类似于以上提及的方法获得。这些化合物为极特别优选的。

[0131] 使用的缩写为:

[0132] All = 烯丙基 Et = 乙基 Me = 甲基 Pr = 丙基

[0133] 表A:本发明的式(I)的化合物

[0134]



[0135]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
1	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	H	8.18 (s,1H), 7.76 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.32 (br, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.62-2.71 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.34-1.40 (m, 2H), 1.22-1.29 (m, 2H)
2	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	H	8.21 (s,1H), 7.82 (d, 1H), 6.96 (d, 1H), 5.62 (br, 1H), 3.09 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.56-2.64 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.33-1.40 (m, 2H), 1.21-1.27 (m, 2H)
3	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	H	8.21 (s,1H), 7.82 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.55 (br, 1H), 3.27 (q, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.57-2.65 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.33-1.39 (m, 2H), 1.31 (t, 3H), 1.22-1.28 (m, 2H)
4	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	H	8.21 (s,1H), 7.82 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 5.68 (br, 1H), 3.18 (dd, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.56-2.63 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.66-1.76 (m, 2H), 1.34-1.39 (m, 2H), 1.21-1.28 (m, 2H), 1.03 (t, 3H)
5	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHAlI	H	8.19 (s,1H), 7.84 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.93.6.05 (m, 1H), 5.68 (br, 1H), 5.32-5.39 (m, 1H), 5.20-5.25 (m, 1H), 3.82-3.88 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.58-2.66 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.33-1.39 (m, 2H), 1.21-1.28 (m, 2H)
6	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	8.21 (s,1H), 7.84 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.81 (br, 1H), 3.62 (dd, 2H), 3.42 (br, 2H), 3.41 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 2.54-2.62 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.33-1.39 (m, 2H), 1.21-1.28 (m, 2H)
7	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Et	H	8.22 (s,1H), 7.84 (d, 1H), 6.97 (d, 1H),

[0136]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
					5.84 (br, 1H), 3.66 (dd, 2H), 3.57 (q, 2H), 3.42 (dd, 2H), 3.21 (s, 3H), 2.53-2.63 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.32-1.40 (m, 2H), 1.24 (t, 3H), 1.19-1.29 (m, 2H)
8	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-Me	H	8.21 (s,1H), 7.83 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.64 (br, 1H), 3.55 (t, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.32 (t, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.55-2.63 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.90-1.99 (m, 2H), 1.34-1.39 (m, 2H), 1.21-1.28 (m, 2H)
9	Me	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
10	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
11	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
12	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
13	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
14	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
15	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
16	Me	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
17	Me	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
18	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
19	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
20	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
21	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
22	Me	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
23	Me	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
24	Me	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	H	8.18 (s,1H), 8.04 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 3.29 (s, 3H), 2.93 (s, 6H), 2.58-2.66 (m, 1H), 2.37 (s, 3H), 1.34-1.40 (m, 2H), 1.22-1.29 (m, 2H)
25	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	H	
26	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	H	
27	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	H	
28	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
29	Me	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	

[0137]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: $\delta$ [CDCl <sub>3</sub> ]
30	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
31	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
32	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
33	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
34	Me	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
35	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
36	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
37	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
38	Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
39	Me	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	
40	Me	CF <sub>3</sub>	NHMe	H	
41	Me	CF <sub>3</sub>	NHEt	H	
42	Me	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	H	
43	Me	CF <sub>3</sub>	NHAll	H	
44	Me	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
45	Me	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
46	Me	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
47	Me	CF <sub>3</sub>	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
48	Me	CF <sub>3</sub>	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
49	Me	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
50	Me	CF <sub>3</sub>	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
51	Me	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
52	Me	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
53	Me	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
54	Me	CF <sub>3</sub>	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
55	Me	CF <sub>3</sub>	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
56	Me	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
57	Me	CF <sub>3</sub>	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
58	Me	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
59	Me	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
60	Me	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	
61	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	H	
62	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	H	

[0138]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
63	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	H	
64	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
65	Me	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
66	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
67	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
68	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
69	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
70	Me	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
71	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
72	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
73	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
74	Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
75	Me	Cl	NH <sub>2</sub>	H	
76	Me	Cl	NHMe	H	
77	Me	Cl	NHEt	H	
78	Me	Cl	NH-n-Pr	H	
79	Me	Cl	NHAll	H	
80	Me	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
81	Me	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
82	Me	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
83	Me	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
84	Me	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
85	Me	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
86	Me	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
87	Me	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
88	Me	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
89	Me	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
90	Me	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
91	Me	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
92	Me	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
93	Me	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
94	Me	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
95	Me	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	

[0139]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: $\delta$ [CDCl <sub>3</sub> ]
96	Me	Cl	NMe <sub>2</sub>	H	
97	Me	Cl	N(Me)Et	H	
98	Me	Cl	N(Me)-n-Pr	H	
99	Me	Cl	N(Me)All	H	
100	Me	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
101	Me	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
102	Me	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
103	Me	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
104	Me	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
105	Me	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
106	Me	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
107	Me	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
108	Me	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
109	Me	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
110	Me	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
111	Me	OMe	NH <sub>2</sub>	H	
112	Me	OMe	NHMe	H	
113	Me	OMe	NHEt	H	
114	Me	OMe	NH-n-Pr	H	
115	Me	OMe	NHAll	H	
116	Me	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
117	Me	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
118	Me	OMe	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
119	Me	OMe	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
120	Me	OMe	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
121	Me	OMe	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
122	Me	OMe	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
123	Me	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
124	Me	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
125	Me	OMe	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
126	Me	OMe	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
127	Me	OMe	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
128	Me	OMe	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	

[0140]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
129	Me	OMe	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
130	Me	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
131	Me	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
132	Me	OMe	NMe <sub>2</sub>	H	
133	Me	OMe	N(Me)Et	H	
134	Me	OMe	N(Me)-n-Pr	H	
135	Me	OMe	N(Me)All	H	
136	Me	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
137	Me	OMe	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
138	Me	OMe	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
139	Me	OMe	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
140	Me	OMe	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
141	Me	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
142	Me	OMe	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
143	Me	OMe	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
144	Me	OMe	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
145	Me	OMe	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
146	Me	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
147	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	H	
148	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	H	
149	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	H	
150	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	H	
151	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	H	
152	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
153	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
154	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
155	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
156	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
157	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
158	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
159	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
160	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
161	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
162	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
163	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	

[0141]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
164	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
165	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
166	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
167	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
168	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	H	
169	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	H	
170	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	H	
171	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	H	
172	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
173	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
174	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
175	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
176	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
177	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
178	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
179	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
180	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
181	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
182	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
183	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	8.21 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.12 (br. s, 2H), 3.25 (s, 3H), 2.57 (m, 1H), 1.38 - 1.32 (m, 2H), 1.25 - 1.22 (m, 2H)
184	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHMe	H	8.19 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 6.97 (q, 1H), 6.68 (d, 1H), 3.23 (s, 3H), 3.12 (m, 3H), 2.57 (m, 1H), 1.37 - 1.32 (m, 2H), 1.26 - 1.20 (m, 2H)
185	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHEt	H	8.21 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 6.71 (d, 1H), 6.63 (t, 1H), 3.42 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 1.38 - 1.32 (m, 2H), 1.25 - 1.20 (m, 2H)
186	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	H	
187	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHAll	H	
188	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
189	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
190	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	

[0142]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: $\delta$ [CDCl <sub>3</sub> ]
191	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
192	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
193	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
194	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
195	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
196	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
197	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	7.68 (d, 1H), 6.66 (d, 1H), 6.08 (br. s, 2H), 4.18 (q, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.48 (m, 1H), 1.37 - 1.32 (m, 2H), 1.28 - 1.20 (t + m, 5H)
198	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
199	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
200	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
201	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
202	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
203	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
204	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	8.12 (s, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 3.32 (s, 3H), 2.92 (s, 6H), 2.67 (m, 1H), 1.38 - 1.33 (m, 2H), 1.27 - 1.22 (m, 2H)
205	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	H	
206	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	H	
207	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	H	
208	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
209	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
210	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
211	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
212	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
213	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
214	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
215	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
216	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
217	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
218	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
219	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH <sub>2</sub>	H	

[0143]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
220	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHMe	H	
221	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHEt	H	
222	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH-n-Pr	H	
223	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHAll	H	
224	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
225	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
226	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
227	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
228	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
229	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
230	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
231	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
232	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
233	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
234	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
235	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
236	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
237	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
238	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
239	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
240	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NMe <sub>2</sub>	H	
241	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)Et	H	
242	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)-n-Pr	H	
243	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)All	H	
244	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
245	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
246	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
247	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
248	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
249	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
250	SO <sub>2</sub> Me	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
251	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
252	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	

[0144]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
253	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
254	SO <sub>2</sub> Me	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
255	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH <sub>2</sub>	H	
256	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHMe	H	
257	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHEt	H	
258	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH-n-Pr	H	
259	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHAll	H	
260	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
261	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
262	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
263	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
264	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
265	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
266	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
267	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
268	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
269	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
270	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
271	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
272	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
273	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
274	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
275	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
276	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NMe <sub>2</sub>	H	
277	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)Et	H	
278	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)-n-Pr	H	
279	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)All	H	
280	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
281	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
282	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
283	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
284	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
285	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	

[0145]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
286	SO <sub>2</sub> Me	OMe	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
287	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
288	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
289	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
290	SO <sub>2</sub> Me	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
291	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	H	
292	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	H	
293	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	H	
294	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	H	
295	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	H	
296	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
297	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
298	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
299	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
300	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
301	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
302	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
303	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
304	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
305	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
306	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
307	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
308	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
309	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
310	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
311	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
312	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	H	
313	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	H	
314	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	H	
315	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	H	
316	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
317	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
318	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	

[0146]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
319	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
320	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
321	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
322	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
323	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
324	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
325	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
326	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
327	CF <sub>3</sub>	Cl	NH <sub>2</sub>	H	
328	CF <sub>3</sub>	Cl	NHMe	H	
329	CF <sub>3</sub>	Cl	NHEt	H	
330	CF <sub>3</sub>	Cl	NH-n-Pr	H	
331	CF <sub>3</sub>	Cl	NHAll	H	
332	CF <sub>3</sub>	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
333	CF <sub>3</sub>	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
334	CF <sub>3</sub>	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
335	CF <sub>3</sub>	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
336	CF <sub>3</sub>	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
337	CF <sub>3</sub>	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
338	CF <sub>3</sub>	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
339	CF <sub>3</sub>	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
340	CF <sub>3</sub>	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
341	CF <sub>3</sub>	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
342	CF <sub>3</sub>	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
343	CF <sub>3</sub>	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
344	CF <sub>3</sub>	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
345	CF <sub>3</sub>	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
346	CF <sub>3</sub>	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
347	CF <sub>3</sub>	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
348	CF <sub>3</sub>	Cl	NMe <sub>2</sub>	H	
349	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)Et	H	
350	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)-n-Pr	H	
351	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)All	H	

[0147]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: $\delta$ [CDCl <sub>3</sub> ]
352	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
353	CF <sub>3</sub>	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
354	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
355	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
356	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
357	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
358	CF <sub>3</sub>	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
359	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
360	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
361	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
362	CF <sub>3</sub>	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
363	CF <sub>3</sub>	OMe	NH <sub>2</sub>	H	
364	CF <sub>3</sub>	OMe	NHMe	H	
365	CF <sub>3</sub>	OMe	NHEt	H	
366	CF <sub>3</sub>	OMe	NH-n-Pr	H	
367	CF <sub>3</sub>	OMe	NHAll	H	
368	CF <sub>3</sub>	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
369	CF <sub>3</sub>	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
370	CF <sub>3</sub>	OMe	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
371	CF <sub>3</sub>	OMe	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
372	CF <sub>3</sub>	OMe	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
373	CF <sub>3</sub>	OMe	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
374	CF <sub>3</sub>	OMe	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
375	CF <sub>3</sub>	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
376	CF <sub>3</sub>	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
377	CF <sub>3</sub>	OMe	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
378	CF <sub>3</sub>	OMe	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
379	CF <sub>3</sub>	OMe	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
380	CF <sub>3</sub>	OMe	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
381	CF <sub>3</sub>	OMe	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
382	CF <sub>3</sub>	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
383	CF <sub>3</sub>	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
384	CF <sub>3</sub>	OMe	NMe <sub>2</sub>	H	

[0148]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
385	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)Et	H	
386	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)-n-Pr	H	
387	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)All	H	
388	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
389	CF <sub>3</sub>	OMe	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
390	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
391	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
392	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
393	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
394	CF <sub>3</sub>	OMe	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
395	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
396	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
397	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
398	CF <sub>3</sub>	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
399	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	H	8.18 (s,1H), 7.81 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 5.77 (br, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.66-2.75 (m, 1H), 1.36-1.41 (m, 2H), 1.24-1.31 (m, 2H)
400	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	H	
401	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	H	
402	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	H	8.18 (s,1H), 7.89 (d, 1H), 6.93 (d, 1H), 3.51 (t, 2H), 3.14 (s, 3H), 2.61-2.72 (m, 1H), 1.64-1.78 (m, 2H), 1.34-1.42 (m, 2H), 1.22-1.33 (m, 2H), 1.03 (t, 3H)
403	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	H	
404	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
405	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	8.16 (s,1H), 8.03 (d, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.09 (d, 1H), 3.32 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.09 (s, 3H), 2.69-2.82 (m, 1H), 1.35-1.44 (m, 2H), 1.23-1.34 (m, 2H)
406	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
407	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
408	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
409	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	

[0149]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: $\delta$ [CDCl <sub>3</sub> ]
410	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
411	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
412	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
413	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
414	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
415	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
416	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
417	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
418	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
419	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
420	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	H	
421	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	H	
422	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	H	
423	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	H	
424	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
425	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
426	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
427	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
428	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
429	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
430	Cl	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
431	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
432	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
433	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
434	Cl	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
435	Cl	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	
436	Cl	CF <sub>3</sub>	NHMe	H	
437	Cl	CF <sub>3</sub>	NHEt	H	
438	Cl	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	H	
439	Cl	CF <sub>3</sub>	NHAll	H	
440	Cl	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
441	Cl	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
442	Cl	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	

[0150]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: $\delta$ [CDCl <sub>3</sub> ]
443	Cl	CF <sub>3</sub>	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
444	Cl	CF <sub>3</sub>	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
445	Cl	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
446	Cl	CF <sub>3</sub>	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
447	Cl	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
448	Cl	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
449	Cl	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
450	Cl	CF <sub>3</sub>	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
451	Cl	CF <sub>3</sub>	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
452	Cl	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
453	Cl	CF <sub>3</sub>	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
454	Cl	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
455	Cl	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
456	Cl	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	
457	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	H	
458	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	H	
459	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	H	
460	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
461	Cl	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
462	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
463	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
464	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
465	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
466	Cl	CF <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
467	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
468	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
469	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
470	Cl	CF <sub>3</sub>	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
471	Cl	Cl	NH <sub>2</sub>	H	
472	Cl	Cl	NHMe	H	
473	Cl	Cl	NHEt	H	
474	Cl	Cl	NH-n-Pr	H	
475	Cl	Cl	NHAll	H	

[0151]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
476	Cl	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
477	Cl	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
478	Cl	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
479	Cl	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
480	Cl	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
481	Cl	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
482	Cl	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
483	Cl	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
484	Cl	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
485	Cl	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
486	Cl	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
487	Cl	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
488	Cl	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
489	Cl	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
490	Cl	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
491	Cl	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
492	Cl	Cl	NMe <sub>2</sub>	H	
493	Cl	Cl	N(Me)Et	H	
494	Cl	Cl	N(Me)-n-Pr	H	
495	Cl	Cl	N(Me)All	H	
496	Cl	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
497	Cl	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
498	Cl	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
499	Cl	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
500	Cl	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
501	Cl	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
502	Cl	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
503	Cl	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
504	Cl	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
505	Cl	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
506	Cl	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
507	Cl	OMe	NH <sub>2</sub>	H	
508	Cl	OMe	NHMe	H	

[0152]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
509	Cl	OMe	NHEt	H	
510	Cl	OMe	NH-n-Pr	H	
511	Cl	OMe	NHAll	H	
512	Cl	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
513	Cl	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
514	Cl	OMe	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
515	Cl	OMe	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
516	Cl	OMe	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
517	Cl	OMe	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
518	Cl	OMe	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
519	Cl	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
520	Cl	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
521	Cl	OMe	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
522	Cl	OMe	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
523	Cl	OMe	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
524	Cl	OMe	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
525	Cl	OMe	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
526	Cl	OMe	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
527	Cl	OMe	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
528	Cl	OMe	NMe <sub>2</sub>	H	
529	Cl	OMe	N(Me)Et	H	
530	Cl	OMe	N(Me)-n-Pr	H	
531	Cl	OMe	N(Me)All	H	
532	Cl	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
533	Cl	OMe	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
534	Cl	OMe	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
535	Cl	OMe	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
536	Cl	OMe	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
537	Cl	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
538	Cl	OMe	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
539	Cl	OMe	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
540	Cl	OMe	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
541	Cl	OMe	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	

[0153]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
542	Cl	OMe	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
543	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	H	8.24 (s,1H), 7.60 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.48 (br, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 2.75-2.85 (m, 1H), 1.35-1.40 (m, 2H), 1.22-1.35 (m, 2H)
544	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	H	8.25 (s,1H), 7.66 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.95 (br, 1H), 3.68 (s, 3H), 3.15 (d, 3H), 3.08 (s, 3H), 2.78-2.85 (m, 1H), 1.35-1.40 (m, 2H), 1.25-1.30 (m, 2H)
545	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	H	
546	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	H	
547	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	H	
548	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
549	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	7.80 (s,1H), 7.65 (s, 1H), 7.35 (d, 1H), 6.40 (s, 1H), 3.65 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.08 (s, 3H), 3.05 (s, 3H), 1.75-1.85 (s, 1H), 1.20-1.25 (m, 2H), 0.98-1.05 (m, 2H)
550	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
551	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
552	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
553	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
554	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
555	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
556	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
557	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
558	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
559	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
560	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
561	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
562	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
563	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
564	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	H	8.20 (s,1H), 7.90 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.35 (d, 3H), 3.90 (s, 6H),

[0154]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
					2.78-2.85 (m, 1H), 1.38-1.42 (m, 2H), 1.25-1.32 (m, 2H)
565	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	H	
566	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	H	
567	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	H	
568	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
569	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
570	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
571	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
572	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
573	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
574	OMe	SO <sub>2</sub> Me	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
575	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
576	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
577	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
578	OMe	SO <sub>2</sub> Me	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
579	OMe	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	
580	OMe	CF <sub>3</sub>	NHMe	H	
581	OMe	CF <sub>3</sub>	NHEt	H	
582	OMe	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	H	
583	OMe	CF <sub>3</sub>	NHAll	H	
584	OMe	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
585	OMe	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	H	
586	OMe	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
587	OMe	CF <sub>3</sub>	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
588	OMe	CF <sub>3</sub>	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
589	OMe	CF <sub>3</sub>	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
590	OMe	CF <sub>3</sub>	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
591	OMe	CF <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
592	OMe	CF <sub>3</sub>	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
593	OMe	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
594	OMe	CF <sub>3</sub>	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
595	OMe	CF <sub>3</sub>	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	

[0155]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2H)
622	OMe	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
623	OMe	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
624	OMe	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
625	OMe	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
626	OMe	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
627	OMe	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
628	OMe	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
629	OMe	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
630	OMe	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
631	OMe	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
632	OMe	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
633	OMe	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
634	OMe	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
635	OMe	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
636	OMe	Cl	NMe <sub>2</sub>	H	8.22 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 3.68 (s, 3H), 2.92 (s, 6H), 2.75-2.80 (m, 1H), 1.30-1.38 (m, 2H), 1.20-1.30 (m, 2H)
637	OMe	Cl	N(Me)Et	H	
638	OMe	Cl	N(Me)-n-Pr	H	
639	OMe	Cl	N(Me)All	H	
640	OMe	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
641	OMe	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
642	OMe	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
643	OMe	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
644	OMe	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
645	OMe	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
646	OMe	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
647	OMe	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
648	OMe	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
649	OMe	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
650	OMe	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	

[0156]

编号	X	Y	A	Z	物理数据: <sup>1</sup> H NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ]
					2H)
622	OMe	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
623	OMe	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Me	
624	OMe	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Me	
625	OMe	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
626	OMe	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Me	
627	OMe	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
628	OMe	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
629	OMe	Cl	NH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
630	OMe	Cl	NHMe	CO <sub>2</sub> Et	
631	OMe	Cl	NHEt	CO <sub>2</sub> Et	
632	OMe	Cl	NH-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
633	OMe	Cl	NHAll	CO <sub>2</sub> Et	
634	OMe	Cl	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	
635	OMe	Cl	N=CH-NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
636	OMe	Cl	NMe <sub>2</sub>	H	8.22 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 3.68 (s, 3H), 2.92 (s, 6H), 2.75-2.80 (m, 1H), 1.30-1.38 (m, 2H), 1.20-1.30 (m, 2H)
637	OMe	Cl	N(Me)Et	H	
638	OMe	Cl	N(Me)-n-Pr	H	
639	OMe	Cl	N(Me)All	H	
640	OMe	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	H	
641	OMe	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Me	
642	OMe	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Me	
643	OMe	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Me	
644	OMe	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Me	
645	OMe	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Me	
646	OMe	Cl	NMe <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	
647	OMe	Cl	N(Me)Et	CO <sub>2</sub> Et	
648	OMe	Cl	N(Me)-n-Pr	CO <sub>2</sub> Et	
649	OMe	Cl	N(Me)All	CO <sub>2</sub> Et	
650	OMe	Cl	N(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Me	CO <sub>2</sub> Et	

[0157] B. 制剂实施例

[0158] a) 将 10 重量份的一种式 (I) 化合物和 / 或其盐和 90 重量份作为惰性物质的滑石

混合,并将混合物在锤磨机中粉碎,得到粉剂。

[0159] b) 将 25 重量份的一种式 (I) 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,将混合物在销盘式研磨机 (pinned-disk mill) 中研磨,得到易分散于水中的可湿性粉剂。

[0160] c) 将 20 重量份的一种式 (I) 化合物和 / 或其盐、6 重量份的烷基苯酚聚乙二醇醚 (® Triton X 207)、3 重量份的异十三烷醇聚乙二醇醚 (8E0) 和 71 重量份的石蜡矿物油 (沸程为例如约 255 至高于 277°C) 相混合,并将混合物在球磨中研磨至细度达到 5 微米以下,得到易分散于水中的分散浓缩剂。

[0161] d) 将 15 重量份的一种式 (I) 化合物和 / 或其盐、75 重量份作为溶剂的环己酮和 10 重量份作为乳化剂的乙氧基化的壬基苯酚混合,得到乳油。

[0162] e) 将下述组分混合:

[0163] 75 重量份的一种式 (I) 化合物和 / 或其盐、

[0164] 10 重量份的木素磺酸钙、

[0165] 5 重量份的十二烷基硫酸钠、

[0166] 3 重量份的聚乙烯醇、和

[0167] 7 重量份的高岭土,

[0168] 将混合物在销盘式研磨机中研磨,并在流化床中向作为制粒液体的水上喷雾而粒化该粉末,得到水分散性颗粒剂。

[0169] f) 在胶体磨中均化并预粉碎下述组分:

[0170] 25 重量份的一种式 (I) 化合物和 / 或其盐、

[0171] 5 重量份的 2,2'-二萘基甲-6,6'-二磺酸钠、

[0172] 2 重量份的油酰基甲基牛磺酸钠、

[0173] 1 重量份的聚乙烯醇、

[0174] 17 重量份的碳酸钙、和

[0175] 50 重量份的水,

[0176] 随后再在砂磨机中研磨该混合物,并将所得悬浮液在喷雾塔中通过单料喷嘴雾化并干燥,得到水分散性颗粒剂。

[0177] C. 生物实施例

[0178] 1. 对有害植物的芽前除草作用

[0179] 将单子叶和双子叶杂草或作物植物的种子置于木质纤维盆中的沙质壤土中,并用土壤覆盖。然后将配制为可湿性粉剂 (WP) 或乳油 (EC) 形式的本发明的化合物以水性悬浮液或乳液的形式以 600 至 800 升水 / 公顷 (经换算) 的施用率施用至土壤盖层的表面,并添加 0.2% 的润湿剂。在处理,将盆置于温室中,并使之保持处于对于供试植物而言良好的生长条件下。在 3 周的试验期后,通过与未处理的对照组比较,对供试植物的受损程度进行目测评价 (以百分比 (%) 计的除草活性:100% 活性 = 植物死亡,0% 活性 = 类似于对照植物)。在本文中,例如编号 543、564、616 和 621 的化合物各自在 320 克 / 公顷的施用率下对苘麻 (*Abutilon theophrasti*)、反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) 和稗 (*Echinochloa crus galli*) 具有至少 90% 的活性。编号 4 和 564 的化合物各自在 320 克 / 公顷的施用率

下对狗尾草 (*Setaria viridis*) 和繁缕 (*Stellaria media*) 具有至少 90% 的活性。

[0180] 2. 对有害植物的芽后除草作用

[0181] 将单子叶和双子叶杂草或作物植物的种子置于木质纤维盆中的沙质壤土中, 用土壤覆盖, 并使之于温室中在良好生长条件下生长。播种 2 至 3 周后, 在单叶期处理所述供试植物。然后, 将配置为可湿性粉剂 (WP) 或乳油 (EC) 形式的本发明的化合物以水悬液或乳液的形式以 600-800 升水 / 公顷的施用率 (经换算) 喷雾到绿色植物部位, 并添加 0.2% 的润湿剂。所述供试植物于温室中在最佳生长条件下保持约 3 周后, 通过与未处理对照组进行比较而对所述制剂的活性进行目测评价 (以百分比 (%) 计的除草活性: 100% 活性 = 植物死亡, 0% 活性 = 类似于对照植物)。在本文中, 例如编号 4 和 564 的化合物各自在 80 克 / 公顷的施用率下对狗尾草、繁缕和三色堇 (*Viola tricolor*) 具有至少 80% 的活性。编号 616 和 621 的化合物各自在 80 克 / 公顷的施用率下对苘麻、反枝苋和稗具有至少 90% 的活性。