(19)国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 118974024 A
(43)申请公布日 2024.11.15

(21)申请号 202380031242.4
(22)申请日 2023.03.23
(30)优先权数据
22164820.7 2022.03.28 EP
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2024.09.27
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2023/057451 2023.03.23
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2023/186691 DE 2023.10.05
(71)申请人 拜耳公司
地址 德国勒沃库森
(72)发明人 R·布劳恩 I·海涅曼
M·帕德玛纳班 M·P·巴达特
B·博伦巴克-沃尔 D·施姆茨勒
A·M·莱因格鲁伯
(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285
专利代理师 杨月 侯婧
(51)Int.Cl.
C07D 239/30(2006.01)
C07D 401/10(2006.01)
C07D 401/12(2006.01)
C07D 403/10(2006.01)
C07D 403/12(2006.01)
C07D 413/10(2006.01)
A01N 43/80(2006.01)
A01N 43/40(2006.01)

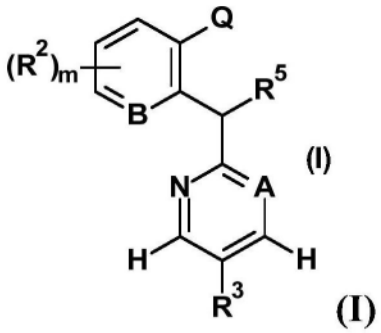
权利要求书3页 说明书103页

(54)发明名称

取代的2-C-吖嗪及其盐以及作为除草活性物质的用途

(57)摘要

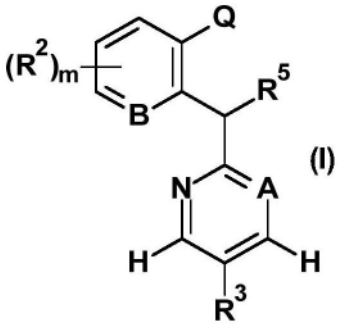
本发明涉及通式(I)的取代的2-C-吖嗪及其作为除草剂,特别是用于防治有用植物作物中的杂草和/或禾本科杂草,和/或作为植物生长调节剂用于影响有用植物作物的生长的用途。本发明还涉及包含一种或多种通式(I)的化合物的除草和/或植物生长调节剂。



(I)

CN 118974024 A

1.通式(I)的取代的2-C-吖嗪或其盐：



其中

A为氮或CR^1，

R^1为氢、CN或卤素，

B为CH、CR^2或N，

Q为Y-(C_2-C_6)-卤代烷基，其中Y表示直接键、氧、$S(O)_n$、CO或OSO_2，或

Q为Z-芳基或Z-杂芳基，其中芳基被1至5个独立地选自R^4的取代基取代，其中杂芳基被最高达2个独立地选自R^4的取代基取代，并且其中Z表示直接键、O、$S(O)_n$或CH_2，

R^2独立地为卤素、氰基、硝基、氨基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、环丙基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基或(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-，

m为0、1、2或3，

n为0、1或2，

R^3为氢、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_2)-卤代烷氧基或(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-，

条件是，当A为CR^1时，R^3一定不为氢，

R^4为卤素、氰基、硝基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_8)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_2)-卤代烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基甲基或(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-，

和

R^5为氢或CN。

2.根据权利要求1所述的通式(I)的化合物或其盐，其中A为氮或CR^1，

R^1为氢、CN或卤素，

B为CH、CR^2或N，

Q为Y-(C_3-C_5)-卤代烷基，其中Y表示直接键、氧、$S(O)_n$、CO或OSO_2，或

Q为Z-芳基或Z-杂芳基，其中芳基被1至3个独立地选自R^4的取代基取代，其中杂芳基被最高达2个独立地选自R^4的取代基取代，并且其中Z表示直接键、O、$S(O)_n$或CH_2，

R^2独立地为卤素、氰基、硝基、氨基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、环丙基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基或(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-，

m为0、1、2或3，

n为0、1或2，

R^3为氢、卤素、氰基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基或(C_1-C_2)-卤代烷氧基，

条件是，当A为CR^1时，R^3一定不为氢，

R^4为卤素、氰基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_8)-卤代烷基或(C_1-C_4)-烷氧基甲基，

和

R^5为氢或CN。

3.根据权利要求1所述的通式(I)的化合物或其盐，其中A为氮或CR^1，

R^1为氢、氰基、氟或氯，

B为CH、CR^2或N，

Q为Y-(C_3-C_5)-卤代烷基，其中Y表示直接键、氧、S、CO或OSO_2，或

Q为Z-芳基或Z-杂芳基，其中芳基被1个或2个独立地选自R^4的取代基取代，其中杂芳基被最高达2个独立地选自R^4的取代基取代，并且其中Z表示直接键、O、S或CH_2，

R^2独立地为氟、氯、溴、氰基、甲基、CF_3或甲氧基，

m为0、1或2，

R^3为氢、氯、溴、氟、氰基、甲基、CF_3、甲氧基或CHF_2O，条件是，当A为CR^1时，R^3一定不为氢，

R^4为氟、氯、甲基、CHF_2、CF_3、甲氧基甲基，

和

R^5为氢或CN。

4.根据权利要求1所述的通式(I)的化合物或其盐，其中A为氮或CR^1，

R^1为氢、氰基、氟或氯，

B为CH、CR^2或N，

Q为Y-(C_3-C_5)-卤代烷基，其中Y表示直接键、氧、S、CO或OSO_2，或

Q为Z-芳基或Z-杂芳基，其中芳基被1个或2个独立地选自R^4的取代基取代，其中杂芳基被最高达2个独立地选自R^4的取代基取代，并且其中Z表示直接键、O、S或CH_2，

R^2独立地为氟、氯、溴、氰基、甲基、CF_3或甲氧基，

m为0、1或2，

R^3为氢、氯、溴、氟、氰基、甲基、CF_3、甲氧基或CHF_2O，条件是，当A为CR^1时，R^3一定不为氢，

R^4为氟、氯、甲基、CHF_2、CF_3或甲氧基甲基，

和

R^5为氢或CN。

5.根据权利要求1所述的通式(I)的化合物或其盐，其中A为氮、CH、CCN或CF，

B为CH，

Q为$(CH_2)_3CF_3$、$(CH_2)_4CF_3$、$S(CH_2)_3CF_3$、$S(CH_2)_3Cl$、$SO(CH_2)_3Cl$、$SO(CH_2)_2CF_3$、$SO(CH_2)_3CF_3$、$SO_2(CH_2)_3CF_3$、$O(CH_2)_3CF_3$、C(O)$(CH_2)_3CF_3$、$OSO_2(CH_2)_3CF_3$、$OSO_2(CH_2)_2CF_3$、$OSO_2(CH_2)_3Cl$、4-氟苄基、4-氯苯基、3,4-二氟苯基、4-氟苯氧基、4-氟苯基硫烷基、2,4-Cl_2-苯基磺酰基、2,4-Cl_2-苯基硫烷基、2,4-Cl_2-苯基亚磺酰基、4-(CF_3)-吡唑-1-基、5-Cl-嘧啶-2-氧基、5-F-嘧啶-2-氧基、5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基、3-(CHF_2)-异噁唑-5-基、5-(CHF_2)-异噁唑-3-基、1,2,4-噁二唑-3-基、5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基、5-(CHF_2)-1,2,4-噁二唑-3-基、5-(CF_3)-1,2,4-噁二唑-3-基、5-F-嘧啶-2-基硫烷基、5-Cl-嘧啶-2-基硫烷基、5-Cl-嘧啶-2-基亚磺酰基、5-Cl-嘧啶-2-基磺酰基、4-Cl-吡唑-1-基甲基、4-Br-吡唑-1-基甲基或4-(CF_3)-吡唑-1-基甲基，R^2独立地为氟、氯、溴、氰基、甲基、CF_3或甲氧基，

m为0、1或2，

R^3为氯、溴或氟，

和

R^5为氢或CN。

6.除草组合物，其特征在于除草活性量的至少一种根据权利要求1至5中任一项所述的通式(I)的化合物。

7.根据权利要求6所述的除草组合物，其为含有制剂助剂的混合物。

8.根据权利要求6或7所述的除草组合物，其包含至少一种选自杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂、安全剂和生长调节剂的其他农药活性物质。

9.根据权利要求8所述的除草组合物，其包含安全剂。

10.根据权利要求9所述的除草组合物，其包含环丙磺酰胺、解草酯、吡唑解草酯或双苯噁唑酸。

11.根据权利要求6至10中任一项所述的除草组合物，其包含其他除草剂。

12.防治不想要的植物的方法，其特征在于将有效量的至少一种根据权利要求1至5中任一项所述的通式(I)的化合物或根据权利要求6至10中任一项所述的除草组合物施用于植物或不想要的植被的位置。

13.根据权利要求1至5中任一项所述的通式(I)的化合物或根据权利要求6至10中任一项所述的除草组合物用于防治不想要的植物的用途。

14.根据权利要求13所述的用途，其特征在于将通式(I)的化合物用于防治有用植物作物中的不想要的植物。

15.根据权利要求14所述的用途，其特征在于所述有用植物为转基因有用植物。

取代的2-C-吖嗪及其盐以及作为除草活性物质的用途

[0001] 本发明涉及作物保护产品的技术领域,特别是用于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的技术领域。

[0002] 具体而言,本发明涉及取代的2-C-吖嗪及其盐、其制备方法及其作为除草剂的用途。

[0003] 迄今已知的用于选择性防治有用植物作物中的有害植物的作物保护产品或用于防治不想要的植物的活性成分在它们的应用中有时具有缺点,无论是(a)它们具有不足的除草活性(如果有的话)来抵抗特定的有害植物,(b)可用活性成分防治的有害植物谱不够宽,(c)它们对有用植物作物的选择性太低和/或(d)它们具有毒理学上不利的性能。此外,一些可用作许多有用植物的植物生长调节剂的活性成分在其他有用植物中引起不希望的采收产量降低,或仅在窄的施用率范围内与作物植物相容(如果有的话)。由于前体和试剂难以获得,一些已知的活性成分不能以工业规模经济地制备,或它们仅具有不足的化学稳定性。在其他活性成分的情况下,活性过高地依赖于环境条件,如天气和土壤条件。

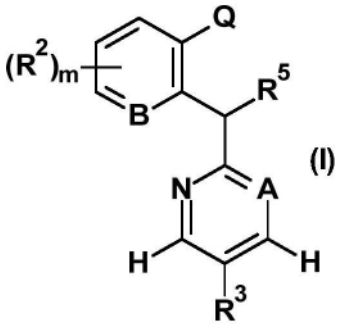
[0004] 这些已知化合物的除草作用,尤其在低施用率下的除草作用,和/或其与作物植物的相容性仍然需要改进。

[0005] AU535637、EP8192、EP61913、JP61236766、WO2016/196606、WO2021/204706、GB2594931和WO2016/010731是记载了具有除草作用的杂芳基氧基苯的文献。WO2020/002089和WO2022/002838记载了具有除草作用的杂芳基氧基吡啶。WO2020/193474记载了具有除草作用的2-杂芳基氨基苯。

[0006] 相比之下,取代的2-C-吖嗪或其盐尚未被描述为活性除草成分。

[0007] 出人意料地,现已发现,特定的取代的2-C-吖嗪或其盐特别适合作为活性除草成分。

[0008] 因此,本发明提供通式(I)的取代的2-C-吖嗪或其盐:

[0009] 

[0010] 其中

[0011] A为氮或CR^1,

[0012] R^1为氢、CN或卤素,

[0013] B为CH、CR^2或N,

[0014] Q为Y-(C_2-C_6)-卤代烷基,其中Y表示直接键、氧、$S(O)_n$、CO或OSO_2,或

[0015] Q为Z-芳基或Z-杂芳基,其中芳基被1至5个独立地选自R^4的取代基取代,其中杂芳基被最高达2个独立地选自R^4的取代基取代,并且其中Z表示直接键、O、$S(O)_n$或CH_2,

[0016] R^2独立地为卤素、氰基、硝基、氨基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、环丙基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基或(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-,

[0017] m为0、1、2或3,

[0018] n为0、1或2,

[0019] R^3为氢、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_2)-卤代烷氧基或(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-,

[0020] 条件是,当A为CR^1时,R^3一定不为氢,

[0021] R^4为卤素、氰基、硝基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_8)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_2)-卤代烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基甲基、(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-,

[0022] 和

[0023] R^5为氢或CN。

[0024] 通式(I)的化合物可通过将合适的无机或有机酸添加至碱性基团上而形成盐,所述无机或有机酸为例如无机酸,例如HCl、HBr、H_2SO_4、H_3PO_4或HNO_3;或有机酸,例如羧酸(如甲酸、乙酸、丙酸、草酸、乳酸或水杨酸)或磺酸(例如对甲苯磺酸),所述碱性基团为例如氨基、烷基氨基、二烷基氨基、哌啶基、吗啉基或吡啶基。因此,这些盐含有作为阴离子的所述酸的共轭碱。去质子化形式的合适的取代基,例如磺酸(特别是磺酰胺)或羧酸,能够与本身可质子化的基团(如氨基基团)形成内盐。还可以通过将碱作用于通式(I)的化合物而形成盐。合适的碱为例如有机胺,如三烷基胺、吗啉、哌啶和吡啶;以及铵、碱金属或碱土金属的氢氧化物、碳酸盐和碳酸氢盐,尤其是氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠和碳酸氢钾。这些盐为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,尤其是碱金属盐或碱土金属盐,特别是钠盐和钾盐;或铵盐、与有机胺的盐或季铵盐,例如具有式$[NR^aR^bR^cR^d]^+$的阳离子的盐,其中R^a至R^d各自独立地为有机基团,尤其是烷基、芳基、芳基烷基或烷基芳基。还可使用烷基锍盐和烷基氧化锍盐,如(C_1-C_4)-三烷基锍盐和(C_1-C_4)-三烷基氧化锍盐。

[0025] 本发明的通式(I)的取代的2-C-吖嗪,根据外部条件如pH、溶剂和温度,可能以各种互变异构体结构存在,所有这些结构均为通式(I)所涵盖。

[0026] 根据本发明使用的式(I)的化合物及其盐在下文中称为“通式(I)的化合物”。

[0027] 本发明更优选提供通式(I)的化合物,其中

[0028] A为氮或CR^1,

[0029] R^1为氢、CN或卤素,

[0030] B为CH、CR^2或N,

[0031] Q为Y-(C_3-C_5)-卤代烷基,其中Y表示直接键、氧、$S(O)_n$、CO或OSO_2,或

[0032] Q为Z-芳基或Z-杂芳基,其中芳基被1至3个独立地选自R^4的取代基取代,其中杂芳基被最高达2个独立地选自R^4的取代基取代,并且其中Z表示直接键、O、$S(O)_n$或CH_2,

[0033] R^2独立地为卤素、氰基、硝基、氨基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、环丙基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-卤代烷氧基或(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-,

[0034] m为0、1、2或3,

[0035] n为0、1或2,

[0036] R^3为氢、卤素、氰基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基或(C_1-C_2)-

卤代烷氧基，

[0037] 条件是，当A为CR^1时，R^3一定不为氢，

[0038] R^4为卤素、氰基、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_8)-卤代烷基、(C_1-C_4)-烷氧基甲基，

[0039] 和

[0040] R^5为氢或CN。

[0041] 本发明非常特别优选提供通式(I)的化合物，其中

[0042] A为氮或CR^1，

[0043] R^1为氢、氰基、氟或氯，

[0044] B为CH、CR^2或N，

[0045] Q为Y-(C_3-C_5)-卤代烷基，其中Y表示直接键、氧、S、CO或OSO_2，或

[0046] Q为Z-芳基或Z-杂芳基，其中芳基被1个或2个独立地选自R^4的取代基取代，其中杂芳基被最高达2个独立地选自R^4的取代基取代，并且其中Z表示直接键、O、S或CH_2，

[0047] R^2独立地为氟、氯、溴、氰基、甲基、CF_3或甲氧基，

[0048] m为0、1或2，

[0049] R^3为氢、氯、溴、氟、氰基、甲基、CF_3、甲氧基或CHF_2O，条件是，当A为CR^1时，R^3一定不为氢，

[0050] R^4为氟、氯、甲基、CHF_2、CF_3或甲氧基甲基，

[0051] 和

[0052] R^5为氢或CN。

[0053] 本发明同样还优选提供通式(I)的化合物，其中

[0054] A为氮或CR^1，

[0055] R^1为氢、氰基、氟或氯，

[0056] B为CH、CR^2或N，

[0057] Q为Y-(C_3-C_5)-卤代烷基，其中Y表示直接键、氧、S、CO或OSO_2，或

[0058] Q为Z-芳基或Z-杂芳基，其中芳基被1个或2个独立地选自R^4的取代基取代，其中杂芳基被最高达2个独立地选自R^4的取代基取代，并且其中Z表示直接键、O、S或CH_2，

[0059] R^2独立地为氟、氯、溴、氰基、甲基、CF_3或甲氧基，

[0060] m为0、1或2，

[0061] R^3为氢、氯、溴、氟、氰基、甲基、CF_3、甲氧基或CHF_2O，条件是，当A为CR^1时，R^3一定不为氢，

[0062] R^4为氟、氯、甲基、CHF_2、CF_3或甲氧基甲基，

[0063] 和

[0064] R^5为氢或CN。

[0065] 本发明同样还优选提供通式(I)的化合物，其中

[0066] A为氮、CH、CCN或CF，

[0067] B为CH，

[0068] Q为$(CH_2)_3CF_3$、$(CH_2)_4CF_3$、$S(CH_2)_3CF_3$、$S(CH_2)_3Cl$、$SO(CH_2)_3Cl$、$SO(CH_2)_2CF_3$、$SO(CH_2)_3CF_3$、$SO_2(CH_2)_3CF_3$、$O(CH_2)_3CF_3$、$C(O)(CH_2)_3CF_3$、$OSO_2(CH_2)_2CF_3$、$OSO_2(CH_2)_3CF_3$、$OSO_2(CH_2)_3Cl$、4-氟苄基、4-氯苯基、3,4-二氟苯基、4-氟苯氧基、5-Cl-嘧啶-2-氧基、5-F-嘧啶-2-氧基、5-

Cl-3-F-吡啶-2-氧基、4-氟苯基硫烷基、2,4-Cl_2-苯基磺酰基、2,4-Cl_2-苯基硫烷基、2,4-Cl_2-苯基亚磺酰基、3-(CHF_2)-异噁唑-5-基、5-(CHF_2)-异噁唑-3-基、1,2,4-噁二唑-3-基、5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基、5-(CHF_2)-1,2,4-噁二唑-3-基、5-(CF_3)-1,2,4-噁二唑-3-基、5-Cl-嘧啶-2-基硫烷基、5-Cl-嘧啶-2-基亚磺酰基、5-Cl-嘧啶-2-基磺酰基、5-F-嘧啶-2-基硫烷基、4-(CF_3)-吡唑-1-基、4-Cl-吡唑-1-基甲基、4-Br-吡唑-1-基甲基或4-(CF_3)-吡唑-1-基甲基，

[0069] R^2独立地为氟、氯、溴、氰基、甲基、CF_3或甲氧基，

[0070] m为0、1或2，

[0071] R^3为氯、溴或氟，

[0072] 和

[0073] R^5为氢或CN。

[0074] 本发明更优选提供通式(I)的化合物，其中

[0075] A为氮、CH或CF，

[0076] B为CH，

[0077] Q为$(CH_2)_3CF_3$、$S(CH_2)_3CF_3$、$SO(CH_2)_3CF_3$、$O(CH_2)_3CF_3$、$OSO_2(CH_2)_3CF_3$、$OSO_2(CH_2)_3Cl$、4-氟苄基、3,4-二氟苯基、4-氟苯氧基、4-氟苯基硫烷基、2,4-Cl_2-苯基硫烷基、4-(CF_3)-吡唑-1-基、5-Cl-嘧啶-2-氧基、5-F-嘧啶-2-氧基、5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基、3-(CHF_2)-异噁唑-5-基或5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基，

[0078] R^2独立地为氟、氯、溴、氰基、甲基、CF_3或甲氧基，

[0079] m为0、1或2，

[0080] R^3为氯、溴或氟，

[0081] 和

[0082] R^5为氢或CN。

[0083] 上文以一般术语或在优选范围内列出的基团的定义既适用于通式(I)的终产物，又相应地适用于在每种情况下制备所需的起始材料或中间体。这些基团定义可以根据需要彼此组合，即包括给出的优选范围之间的组合。

[0084] 主要是由于更高的除草活性、更好的选择性和/或更好的可制备性，给出的本发明的通式(I)的化合物或其盐或本发明的其用途备受关注，其中各基团具有一种已指定的或下文指定的优选含义，或特别是具有其中一种或多种已指定的或下文指定的优选含义组合产生的含义。

[0085] 关于本发明的化合物，将阐明上文使用的和下文进一步使用的术语。这些术语是本领域技术人员所熟知的，并且尤其具有下文中阐述的定义：

[0086] 除非另有不同定义，通常应这样理解化学基团的名称，使得与分子的骨架或其余部分的连接是通过最后提及的相关化学基团的结构元素，即例如在(C_1-C_4)-烷氧基的情况下是通过氧原子，在(C_1-C_4)-烷基-$S(O)_n$-的情况下是通过硫原子，以及在(C_1-C_4)-烷氧基甲基的情况下是通过甲基的碳原子。

[0087] 术语“卤素”表示例如氟、氯、溴或碘。如果将该术语用于基团，则“卤素”表示例如氟、氯、溴或碘原子。

[0088] 本文以实例的方式提及的表述“(C_1-C_4)-烷基”是根据所述碳原子范围对具有1至4

个碳原子的直链或支链烷基的简要记法,即包括甲基、乙基、1-丙基、2-丙基、1-丁基、2-丁基、2-甲基丙基或叔丁基基团。具有更大的指定的碳原子范围的一般烷基基团,例如“(C_2-C_6)-烷基”,相应地还包括具有更大数量的碳原子的直链或支链烷基基团,即根据所述实例,还包括具有5个和6个碳原子的烷基基团。

[0089] “卤代烷基”表示被相同或不同的卤素原子部分或完全取代的烷基,例如单卤代烷基,例如CH_2CH_2Cl、CH_2CH_2Br、$CHClCH_3$、CH_2Cl、CH_2F、$CH_2CH_2CF_3$;全卤代烷基,例如CCl_3、$CClF_2$、$CFCl_2$、CF_2CClF_2、$CF_2CClFCF_3$;多卤代烷基,例如CH_2CHFCl、CF_2CClFH、CF_2CBrFH、CH_2CF_3;术语全卤代烷基还包括术语全氟烷基。

[0090] “烷氧基”表示通过氧原子键合的烷基基团,例如(但不限于)(C_1-C_4)-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-甲基丙氧基和1,1-二甲基乙氧基。

[0091] 卤代烷氧基为例如OCF_3、$OCHF_2$、OCH_2F、OCF_2CF_3、OCH_2CF_3和OCH_2CH_2Cl。

[0092] 术语“芳基”表示具有优选6至14个、特别是6至10个环碳原子的任选取代的单环、双环或多环芳族体系,例如苯基、萘基、蒽基、菲基等,优选苯基。

[0093] 当基础结构被选自基团(=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。

[0094] 根据本发明,表述“杂芳基”代表杂芳族化合物,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、氮杂环庚烯基、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、氧杂环庚烯基、硫杂环庚烯基、1,2,4-三唑酮基和1,2,4-二氮杂环庚烯基、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。本发明的杂芳基还可被一个或多个相同或不同的基团取代。如果两个相邻的碳原子为另一芳族环的一部分,则该体系为稠合的杂芳族体系,如苯并稠合的或多重稠合的(polyannelated)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元苯并稠

合环:1H-吲哚-1-基、1H-吲哚-2-基、1H-吲哚-3-基、1H-吲哚-4-基、1H-吲哚-5-基、1H-吲哚-6-基、1H-吲哚-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-吲唑-1-基、1H-吲唑-3-基、1H-吲唑-4-基、1H-吲唑-5-基、1H-吲唑-6-基、1H-吲唑-7-基、2H-吲唑-2-基、2H-吲唑-3-基、2H-吲唑-4-基、2H-吲唑-5-基、2H-吲唑-6-基、2H-吲唑-7-基、2H-异吲哚-2-基、2H-异吲哚-1-基、2H-异吲哚-3-基、2H-异吲哚-4-基、2H-异吲哚-5-基、2H-异吲哚-6-基、2H-异吲哚-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。

[0095] 如果化合物可通过氢移位形成其结构形式上未被通式(I)涵盖的互变异构体,则这些互变异构体仍为本发明的通式(I)的化合物的定义所涵盖,除非考虑的是特定的互变异构体。例如,许多羰基化合物可以酮形式和以烯醇形式存在,两种形式均为通式(I)的化合物的定义所涵盖。

[0096] 根据取代基的性质和连接其的方式,通式(I)的化合物可以立体异构体形式存在。由立体异构体的特定三维形式定义的可能的立体异构体,如对映异构体、非对映异构体、Z和E异构体,均为通式(I)所涵盖。例如,如果存在一个或多个烯基,则可产生非对映异构体(Z和E异构体)。例如,如果存在一个或多个非对称碳原子,则可产生对映异构体和非对映异构体。立体异构体可通过常规的分离方法从制备中获得的混合物中获得。可进行分析级的色谱分离以发现对映体过量或非对映体过量,或进行制备级的色谱分离以制备用于生物试验的试验样品。同样,可通过使用光学活性起始材料和/或助剂,利用立体选择性反应来选择性地制备立体异构体。因此,本发明还涉及为通式(I)所包含但未以其特定的立体异构形式示出的所有立体异构体及其混合物。

[0097] 如果化合物以固体形式获得,则纯化也可通过重结晶或浸提(digestion)进行。如果个别的通式(I)的化合物无法通过下述途径以令人满意的方式获得,则它们可通过其他通式(I)的化合物的衍生化来制备。

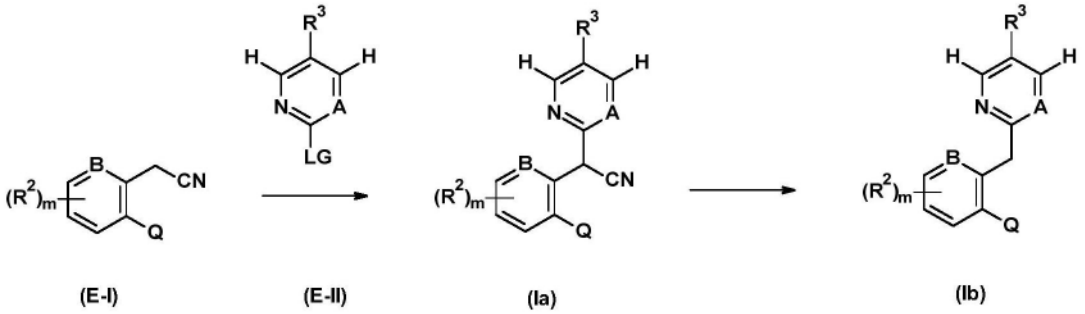
[0098] 合适的分离方法、纯化方法和用于分离通式(I)的化合物的立体异构体的方法为本领域技术人员从类似情况中通常已知的方法,例如通过物理方法,如结晶、色谱方法(特别是柱色谱法和HPLC(高压液相色谱))、蒸馏(任选地在减压下)、萃取和其他方法,任何残留的混合物通常可通过色谱分离(例如在手性固相上)进行分离。适用于制备量或工业规模的是例如结晶的方法,例如非对映异构体盐的结晶,所述非对映异构体盐可使用光学活性酸,以及如果合适,使用光学活性碱(条件是存在酸性基团),从非对映异构体混合物中获得。

[0099] 本发明还要求保护制备本发明的通式(I)的化合物的方法。

[0100] 本发明的通式(I)的化合物可尤其使用已知方法制备。所使用和经检查的合成路

线从市售可得的或易于制备的结构单元(building block)开始进行。在以下方案中,通式(I)的部分A、B、Q、R^2、R^3和m具有上文定义的含义,除非给出示例性而非限制性的定义。

[0101] 本发明的化合物可例如通过以下方案1中指定的方法制备。

[0102] 

[0103] 方案1

[0104] 通式(Ia)的吡啶(嘧啶)可通过将相应的乙腈(E-I)与吡啶(嘧啶)(EII)偶联来制备,其中LG为离去基团,例如在碱的存在下。为此目的所需的碱可例如为碱金属(例如钠或钾)的碳酸盐或碱金属(例如钠)的氢化物。反应通常在有机溶剂(例如二噁烷、二甲基亚砜或二甲基甲酰胺)中在0℃至溶剂的沸点之间的温度下进行。

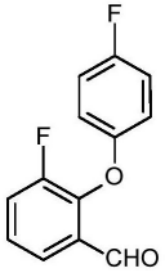
[0105] 通式(Ib)的吡啶(嘧啶)可例如通过相应乙腈(Ia)的脱羧水解来制备。相应的条件为例如加热至沸点的含水酸(例如盐酸)。

[0106] 通式(E-I)的乙腈是文献中已知的,并且可例如通过Helvetica Chimica Acta(2003),86(2),343-360,in Angewandte Chemie,国际版本(2011),50(19),4470-4474中所述的方法及类似方法制备。

[0107] 下文列举了本发明的通式(I)的化合物的选定的详细合成实施例。在以下部分中记载的化学实施例中所记录的^{1}H NMR、^{13}C NMR和^{19}FNMR光谱数据(^{1}H NMR为400MHz,^{13}C NMR为150MHz,^{19}F NMR为375MHz,溶剂$CDCl_3$、CD_3OD或d_6-DMSO,内标物:四甲基硅烷δ=0.00ppm)在Bruker仪器上获得,并且列出的信号具有下文给出的含义:b=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中每种的显著信号,或记录了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=CH_3,Et=CH_2CH_3,t-Hex=$C(CH_3)_2CH(CH_3)_2$,t-Bu=$C(CH_3)_3$,n-Bu=无支链的丁基,n-Pr=无支链的丙基,i-Pr=有支链的丙基,c-Pr=环丙基,c-Hex=环已基。

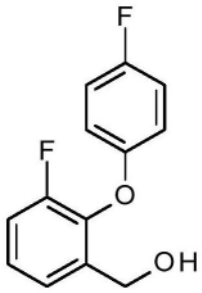
[0108] 合成实施例:

[0109] 表格实施例编号1-34:(5-氯嘧啶-2-基)[3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯基]乙腈合成阶段1:3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯甲醛

[0110] 

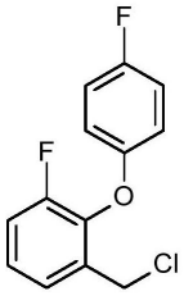
[0111] 将2.0g 2,3-二氟苯甲醛(14.1mmol,1.0当量)、2.37g 2-氟苯酚(21.1mmol,1.5当量)和3.89g碳酸钾(28.1mmol,2.0当量)于30ml DMF中的溶液在100℃下搅拌3小时。然后用50ml乙醚稀释,用2N氢氧化钠溶液(30ml×2)和饱和氯化钠溶液洗涤,经硫酸钠干燥并在减压下浓缩。将残余物通过柱色谱法纯化。收率为2.82g(85%)。^{1}H-NMR(400.0MHz,$CDCl_3$):10.35(s,1H);7.75(m,1H);7.43(m,1H);7.32(m,1H);7.01(m,2H);6.91(m,2H)。

[0112] 合成阶段2:3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯甲醇

[0113] 

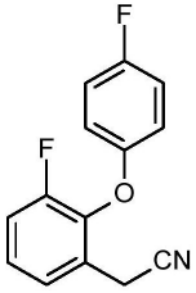
[0114] 将0.91g硼氢化钠(24mmol,2.0当量)加入2.8g 3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯甲醛(12mmol,1.0当量)于44ml THF和22ml MeOH的混合物中的溶液中,并将混合物在室温下搅拌3小时。然后向溶液中加入水,并用乙酸乙酯萃取。将有机相在减压下浓缩,并将残余物用二氯甲烷溶解,经硫酸钠干燥并在减压下浓缩。所得产物无需进一步纯化即可使用。收率为2.77g(98%粗品)。^{1}H-NMR(400.0MHz,$CDCl_3$):7.30(m,1H);7.23(m,1H);7.13(m,1H);6.97(m,2H);6.84(m,2H);4.69(s,2H);1.79(bs,1H)。

[0115] 合成阶段3:3-氟-2-(4-氟苯氧基)苄基氯

[0116] 

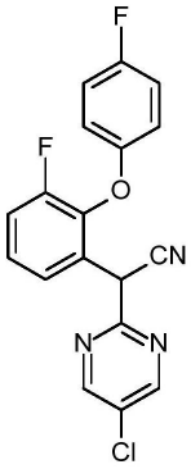
[0117] 将1.0ml亚硫酰氯加入2.70g 3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯甲醇(11.4mmol,1.0当量)于18ml甲苯中的溶液中,并将混合物在室温下搅拌5小时。然后加入水,并用二氯甲烷萃取。将有机相用硫酸钠干燥,并在减压下浓缩。所得产物无需进一步纯化即可使用。收率为3.29g(100%粗品)。^{1}H-NMR(400.0MHz,$CDCl_3$):7.31-7.12(m,3H);6.98(m,2H);6.87(m,2H);4.60(s,2H)。

[0118] 合成阶段4:(3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯基)乙腈

[0119] 

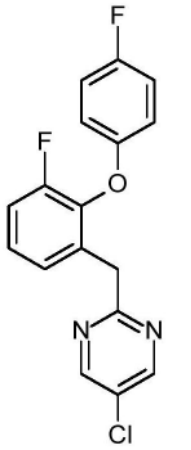
[0120] 将3.2g 3-氟-2-(4-氟苯氧基)苄基氯(12.6mmol,1.0当量)和982mg氰化钾(15.1mmol,1.2当量)在5ml水和25ml乙醇的混合物中回流加热6小时。然后浓缩并将残余物用二氯甲烷溶解。将有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩,并将残余物通过柱色谱法纯化。收率为1.46g(47%)。^{1}H-NMR(400.0MHz,$CDCl_3$):7.33(m,1H);7.26(m,1H);7.18(m,1H);6.99(m,2H);6.83(m,2H);3.72(s,2H)。

[0121] 合成阶段5:(5-氯嘧啶-2-基)[3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯基]乙腈

[0122] 

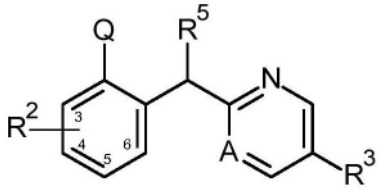
[0123] 将179mg氢化钠(60%)(4.49 mmol,2.2当量)加入500 mg(3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯基)乙腈(2.0 mmol,1.0当量)于15 ml THF中的溶液中,并将混合物在室温下搅拌30分钟。随后,加入365 mg 2,5-二氯嘧啶(2.45 mmol,1.2 eq),并将混合物在室温下搅拌过夜。然后,将混合物与2N盐酸混合,并用二氯甲烷萃取。将有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩,并将残余物通过柱色谱法纯化。收率为631 mg(87%)。

[0124] 表格实施例编号1-35:5-氯-2-[3-氟-2-(4-氟苯氧基)苄基]嘧啶

[0125] 

[0126] 将530mg(5-氯嘧啶-2-基)[3-氟-2-(4-氟苯氧基)苯基]乙腈(1.48mmol)于6 ml冰乙酸和2 ml浓盐酸的混合物中的溶液在100℃下搅拌8小时。随后,将混合物浓缩,并将残余物通过柱色谱法纯化。收率为200mg(41%)。

[0127] 类似于上文引用的并在适当的位置列举的制备实施例,获得下文指定的并在表1中示出的以下通式的化合物。

[0128] 

[0129] 表1

[0130]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
1-1	H	Cl	H	N	$(CH_2)_3CF_3$
1-2	H	Cl	H	N	CH_2CF_4
1-3	H	F	H	N	$(CH_2)_3CF_3$
1-4	H	Cl	H	N	$S(CH_2)_3CF_3$
1-5	H	Cl	H	N	$SO(CH_2)_3CF_3$
1-6	H	Cl	H	N	$SO_2(CH_2)_3CF_3$
1-7	H	F	H	N	$S(CH_2)_3CF_3$
1-8	H	Cl	H	N	$O(CH_2)_3CF_3$
1-9	H	Cl	H	N	$C(O)(CH_2)_3CF_3$
1-10	H	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
1-11	H	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
1-12	H	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_2CF_3$
1-13	H	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_2CF_3$
1-14	3-F	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
1-15	3-F	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
1-16	3-F	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_2CF_3$
1-17	3-F	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_2CF_3$
1-18	3-Cl	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
1-19	3-Cl	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
1-20	3-Cl	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_2CF_3$
1-21	3-Cl	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_2CF_3$
1-22	3-F	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3C_2F_5$
1-23	H	Cl	H	N	4-氟苄基
1-24	H	Cl	H	N	4-氟苯基
1-25	H	Cl	H	N	4-氯苯基

[0131]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
1-26	H	Cl	H	N	3,4-二氟苯基
1-27	H	F	H	N	3,4-二氟苯基
1-28	H	Cl	CN	N	4-氟苯氧基
1-29	H	Cl	H	N	4-氟苯氧基
1-30	3-Me	Cl	CN	N	4-氟苯氧基
1-31	3-Me	Cl	H	N	4-氟苯氧基
1-32	3-MeO	Cl	CN	N	4-氟苯氧基
1-33	3-MeO	Cl	H	N	4-氟苯氧基
1-34	3-F	Cl	CN	N	4-氟苯氧基
1-35	3-F	Cl	H	N	4-氟苯氧基
1-36	3-Br	Cl	CN	N	4-氟苯氧基
1-37	3-Br	Cl	H	N	4-氟苯氧基
1-38	3-CN	Cl	H	N	4-氟苯氧基
1-39	3-CF_3	Cl	CN	N	4-氟苯氧基
1-40	3-CF_3	Cl	H	N	4-氟苯氧基
1-41	H	Cl	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-42	H	Cl	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-43	3-Br	Cl	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-44	3-Br	Cl	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-45	3-CN	Cl	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-46	3-F	Cl	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-47	3-F	Cl	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-48	3-Me	Cl	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-49	3-Me	Cl	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-50	H	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-51	6-F	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-52	6-F	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-53	6-Br	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-54	6-Br	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-55	6-Br	Cl	H	N	5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基

[0132]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
1-56	6-Cl	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-57	6-Cl	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-58	6-Cl	Cl	H	N	5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基
1-59	6-CN	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-60	6-F	Cl	H	N	$O(CH_2)_3CF_3$
1-61	6-CN	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-62	6-CN	F	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-63	6-CN	F	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-64	6-Me	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-65	6-Me	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-66	6-Me	Cl	H	N	5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基
1-67	H	F	H	N	4-氟苯氧基
1-68	H	Cl	CN	N	$(CH_2)_3CF_3$
1-69	H	Cl	CN	N	4-氟苄基
1-70	H	F	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-71	3-CN	Cl	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-72	H	F	CN	N	$(CH_2)_3CF_3$
1-73	H	Cl	CN	CH	$(CH_2)_3CF_3$
1-74	H	Cl	H	CH	4-氟苯氧基
1-75	H	H	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-76	H	H	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-77	H	H	H	N	5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基
1-78	H	Cl	CN	N	3,4-二氟苯基
1-79	H	F	CN	N	3,4-二氟苯基
1-80	H	Cl	CN	CH	3,4-二氟苯基
1-81	H	F	CN	N	4-氟苄基
1-82	H	Cl	CN	CH	4-氟苄基
1-83	H	Br	CN	N	4-氟苯氧基
1-84	H	Cl	CN	CH	4-氟苯氧基
1-85	H	Cl	CN	CCN	4-氟苯氧基

[0133]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
1-86	H	Cl	CN	N	4-氟苯基硫烷基
1-87	H	Br	H	N	4-氟苯氧基
1-88	H	F	CN	N	4-氟苯基硫烷基
1-89	H	F	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-90	H	F	H	N	5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基
1-91	H	Cl	H	CH	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-92	H	F	H	CH	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-93	H	F	H	CH	5-F-嘧啶-2-氧基
1-94	H	Cl	H	CH	$(CH_2)_3CF_3$
1-95	H	F	H	N	4-氟苄基
1-96	H	Cl	H	CH	4-氟苄基
1-97	H	Cl	H	CH	3,4-二氟苯基
1-98	H	H	H	N	4-氟苯氧基
1-99	H	Cl	H	N	4-氟苯基硫烷基
1-100	H	Cl	H	CH	5-F-嘧啶-2-氧基
1-101	H	Cl	H	CH	5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基
1-102	H	Cl	CN	CH	4-氟苯基硫烷基
1-103	H	F	H	CH	5-Cl-3-F-吡啶-2-氧基
1-104	H	F	H	N	4-氟苯基硫烷基
1-105	H	Cl	H	CH	4-氟苯基硫烷基
1-106	H	Cl	H	CF	4-氟苯基硫烷基
1-107	H	Cl	CN	N	$S(CH_2)_2CF_3$
1-108	H	F	CN	N	$S(CH_2)_2CF_3$
1-109	H	Cl	CN	CH	$S(CH_2)_2CF_3$
1-110	H	Cl	H	CF	$S(CH_2)_2CF_3$
1-111	H	F	H	N	$S(CH_2)_2CF_3$
1-112	H	Cl	H	N	$S(CH_2)_2CF_3$
1-113	H	Cl	CN	CF	$S(CH_2)_2CF_3$
1-114	H	Cl	CN	N	$S(CH_2)_3CF_3$
1-115	H	F	CN	N	$S(CH_2)_3CF_3$

[0134]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
1-116	H	Cl	CN	CF	$S(CH_2)_3CF_3$
1-117	H	Cl	CN	CH	$S(CH_2)_3CF_3$
1-118	H	Cl	CN	N	CH_2CF_2
1-119	H	Cl	H	N	CH_2CF_2
1-120	H	F	CN	N	CH_2CF_2
1-121	H	F	H	N	CH_2CF_2
1-122	H	Cl	CN	CH	CH_2CF_2
1-123	H	Cl	H	CH	CH_2CF_2
1-124	H	F	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-125	H	Cl	CN	CCN	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-126	H	Cl	CN	CF	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-127	H	Cl	H	CF	3,4-二氟苯基
1-128	3-CN	F	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-129	H	F	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-130	H	Cl	H	CF	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-131	3-CN	F	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-132	H	Cl	CN	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
1-133	H	Cl	H	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
1-134	H	F	CN	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
1-135	H	F	H	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
1-136	H	Cl	CN	N	2,4-Cl_2-苯基硫烷基
1-137	H	Cl	H	N	2,4-Cl_2-苯基硫烷基
1-138	3-Br	Cl	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-139	H	Cl	CN	N	5-(CHF_2)-异噁唑-3-基
1-140	3-Cl	Cl	H	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
1-141	H	Cl	H	N	4-氟苯基亚磺酰基
1-142	H	Cl	H	N	4-氟苯基磺酰基
1-143	H	F	H	N	4-氟苯基亚磺酰基
1-144	H	F	H	N	4-氟苯基磺酰基
1-145	H	Cl	H	N	2,4-Cl_2-苯基亚磺酰基

[0135]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
1-146	H	F	CN	N	2,4-Cl_2-苯基硫烷基
1-147	H	F	H	N	2,4-Cl_2-苯基硫烷基
1-148	H	F	H	N	2,4-Cl_2-苯基亚磺酰基
1-149	H	F	H	N	$SO(CH_2)_2CF_3$
1-150	H	F	H	N	$SO_2(CH_2)_2CF_3$
1-151	3-F	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-152	3-F	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-153	3-F	F	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-154	3-F	F	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-155	3-Cl	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-156	3-Cl	F	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-157	3-Cl	F	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-158	H	Cl	H	N	1,2,4-噁二唑-3-基
1-159	H	Cl	H	N	5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基
1-160	H	Cl	H	N	5-(CHF_2)-1,2,4-噁二唑-3-基
1-161	H	Cl	H	N	5-(CF_3)-1,2,4-噁二唑-3-基
1-162	3-Me	F	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-163	H	F	H	N	2,4-Cl_2-苯基磺酰基
1-164	H	Cl	H	N	2,4-Cl_2-苯基磺酰基
1-165	3-Me	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-166	3-Me	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-167	H	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-基硫烷基
1-168	H	Cl	H	N	$S(CH_2)_3CF_3$
1-169	H	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-基硫烷基
1-170	H	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-基磺酰基
1-171	H	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
1-172	H	F	CN	N	4-Cl-吡唑-1-基甲基
1-173	H	F	H	N	4-Cl-吡唑-1-基甲基
1-174	H	Cl	CN	N	4-Cl-吡唑-1-基甲基
1-175	H	Cl	H	N	4-Cl-吡唑-1-基甲基

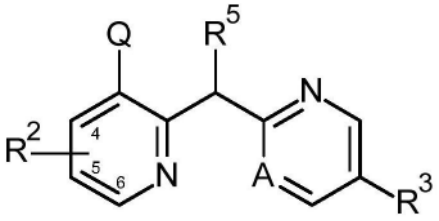
[0136]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
1-176	H	F	CN	N	4-Br-吡唑-1-基甲基
1-177	H	F	H	N	4-Br-吡唑-1-基甲基
1-178	H	Cl	CN	N	4-Br-吡唑-1-基甲基
1-179	H	Cl	H	N	4-Br-吡唑-1-基甲基
1-180	H	F	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基甲基
1-181	H	F	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基甲基
1-182	H	Cl	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基甲基
1-183	H	Cl	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基甲基
1-184	3-Me	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3Cl$
1-185	3-F	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_3Cl$
1-186	3-F	Br	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
1-187	3-F	Br	H	N	$OSO_2(CH_2)_2CF_3$
1-188	3-Me	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
1-189	3-Me	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_2CF_3$
1-190	3-Cl	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3Cl$
1-191	3-Cl	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_3Cl$
1-192	3-F	Br	H	N	$OSO_2(CH_2)_3Cl$
1-193	3-F	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3Cl$
1-194	6-F	F	H	CH	5-Cl-嘧啶-2-氧基
1-195	3-F	Cl	H	N	$O(CH_2)_3CF_3$
1-196	H	Cl	H	N	$SO(CH_2)_3CF_3$
1-197	H	Cl	H	N	$SO_2(CH_2)_3CF_3$
1-198	H	Cl	H	N	$S(CH_2)_3Cl$
1-199	H	Cl	H	N	$SO(CH_2)_3Cl$
1-200	H	Cl	H	N	$SO_2(CH_2)_3Cl$
1-201	H	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-基-硫烷基
1-202	H	F	H	N	5-F-嘧啶-2-基-硫烷基
1-203	H	F	H	N	$SO(CH_2)_3CF_3$
1-204	H	F	H	N	$SO_2(CH_2)_3CF_3$
1-205	H	F	H	N	$SO(CH_2)_3Cl$

[0137]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
1-206	H	F	H	N	$SO_2(CH_2)_3Cl$
1-207	3-Br	F	CN	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-208	3-Br	Cl	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
1-209	3-Br	F	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基

[0138] 类似于上文引用的并在适当的位置列举的制备实施例,获得下文指定的并在表2中示出的以下通式的化合物。

[0139] 

[0140] 表2

[0141]

实施例编号	R^2	R^3	R^5	A	Q
2-1	4,6-Me_2	F	H	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
2-2	4,6-Me_2	Cl	H	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
2-3	6-Me	F	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
2-4	6-Me	Cl	H	N	4-(CF_3)-吡唑-1-基
2-5	4,6-Me_2	F	CN	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
2-6	4,6-Me_2	Cl	CN	N	3-(CHF_2)-异噁唑-5-基
2-7	6-Me	F	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
2-8	6-Me	F	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
2-9	6-Me	F	H	N	$O(CH_2)_3CF_3$
2-10	6-Me	F	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
2-11	6-Me	Cl	H	N	$OSO_2(CH_2)_3CF_3$
2-12	6-Me	Cl	H	N	5-F-嘧啶-2-氧基
2-13	6-Me	Cl	H	N	5-Cl-嘧啶-2-氧基
2-14	6-Me	Cl	H	N	$O(CH_2)_3CF_3$

[0142] 所公开实施例的NMR数据以常规形式(δ值、氢原子数、多重分裂峰)列出,或以所谓的NMR峰列表的形式列出。在NMR峰列表方法中,选定的实施例的NMR数据以NMR峰列表的形式记录,其中对于每个信号峰,首先列出以ppm计的δ值,然后通过空格隔开,列出信号强度。不同信号峰的δ值/信号强度数对通过分号彼此间隔列出。

[0143] 因此,一个实施例的峰列表具有以下形式:

[0144] δ_1(强度$_1$);δ_2(强度$_2$);……;δ_i(强度$_i$);……;δ_n(强度$_n$)。

[0145] 尖峰信号的强度与NMR谱的打印实例中以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,可以显示几个峰或信号的中间峰及其与谱图中的最强信号相比的相对强度。

[0146] ^{1}H NMR谱图的化学位移的校准使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移来完成,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是必须出现在NMR峰列表中。

[0147] ^{1}H NMR峰列表与常规的^{1}H NMR打印件相似,因此通常包含在常规NMR说明中列出的所有峰。

[0148] 此外,如同常规的^{1}H NMR打印件,其可显示出溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其同样由本发明提供)的信号和/或杂质的峰。

[0149] 在溶剂和/或水的δ范围内记录化合物信号时,本文的^{1}H NMR峰列表显示出标准溶剂峰,例如在d_6-DMSO中的DMSO的峰和水的峰,其通常具有平均较高的强度。

[0150] 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,在这种情况下,通过参考“副产物指纹(by-product fingerprints)”,它们的峰可有助于识别本文的制备方法的再现性。

[0151] 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另外的强度滤波器来分离目标化合物的峰。这种分离类似于常规^{1}H NMR说明中相关的峰拾取。

[0152] 可在研究公开数据库(Research Disclosure Database)第564025号中找到^{1}H NMR峰列表的其他详细信息。

[0153]

1-8: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$):
δ= 8.5935 (16.0); 7.2666 (2.8); 7.2593 (13.1); 7.2472 (3.2); 7.2422 (1.2); 7.2274 (1.2); 7.2231 (0.9); 6.9818 (1.2); 6.9791 (1.3); 6.9631 (1.9); 6.9606 (2.2); 6.9446 (1.0); 6.9419 (1.0); 6.8306 (1.9); 6.8107 (1.8); 4.2924 (10.2); 3.9605 (2.0); 3.9460 (3.8); 3.9315 (2.1); 2.1705 (1.0); 2.1561 (0.8); 2.1511 (1.0); 2.1433 (1.4); 2.1303 (1.4); 2.1240 (1.0); 2.1161 (0.9); 2.1033 (1.3); 1.9217 (0.8); 1.9075 (1.9); 1.9014 (0.8); 1.8935 (1.4); 1.8819 (1.4); 1.8672 (1.2); 1.8531 (0.5); 1.5572 (5.5); 0.0079 (0.5); -0.0002 (19.7); -0.0085 (0.6)

[0154]

1-30: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.7038 (0.6); 8.5508 (16.0); 7.5383 (0.9); 7.5336 (1.0); 7.5197 (1.1); 7.5150 (1.1); 7.2971 (0.6); 7.2814 (1.6); 7.2781 (1.3); 7.2638 (2.6); 7.2599 (15.8); 7.2451 (2.6); 7.2262 (0.9); 6.9087 (2.3); 6.9028 (0.7); 6.8916 (0.9); 6.8886 (2.5); 6.8857 (3.0); 6.8830 (0.8); 6.8717 (0.7); 6.8657 (2.7); 6.6096 (2.8); 6.6036 (0.8); 6.5989 (2.8); 6.5928 (1.3); 6.5866 (2.3); 6.5819 (0.8); 6.5760 (2.3); 5.6286 (5.7); 2.0636 (12.7); 1.5742 (2.8); 0.0080 (0.6); -0.0002 (22.1); -0.0085 (0.6)**
1-31: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.4912 (16.0); 7.2597 (13.4); 7.2084 (0.7); 7.2026 (0.8); 7.1905 (1.3); 7.1857 (2.5); 7.1747 (2.6); 7.1692 (1.0); 7.1612 (4.2); 7.1443 (1.7); 7.1252 (0.7); 6.8735 (2.9); 6.8675 (0.9); 6.8563 (1.1); 6.8531 (3.3); 6.8504 (3.6); 6.8473 (1.0); 6.8361 (1.0); 6.8301 (3.4); 6.5935 (3.5); 6.5875 (1.0); 6.5827 (3.6); 6.5766 (1.8); 6.5705 (2.8); 6.5656 (1.0); 6.5597 (2.8); 4.1887 (10.7); 2.0819 (15.9); 1.5606 (3.2); 0.0080 (0.6); -0.0002 (21.5); -0.0085 (0.6)**
1-32: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.5384 (11.9); 7.2942 (2.4); 7.2855 (2.1); 7.2778 (6.4); 7.2658 (0.5); 7.2602 (5.9); 7.0347 (1.2); 7.0267 (1.1); 7.0185 (0.9); 7.0104 (1.0); 6.8871 (1.8); 6.8811 (0.6); 6.8700 (0.7); 6.8669 (2.0); 6.8640 (2.4); 6.8610 (0.7); 6.8499 (0.6); 6.8438 (2.2); 6.6412 (2.2); 6.6351 (0.7); 6.6304 (2.3); 6.6242 (1.1); 6.6181 (1.8); 6.6134 (0.6); 6.6074 (1.7); 5.6813 (5.0); 3.7180 (16.0); 1.5507 (1.9); -0.0002 (9.1)**
1-33: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.5451 (0.5); 8.5400 (0.5); 8.5311 (1.1); 8.5256 (1.1); 8.4703 (9.9); 7.8904 (0.6); 7.8854 (0.7); 7.7775 (1.2); 7.7721 (1.2); 7.2599 (6.7); 7.2387 (0.6); 7.2255 (0.6); 7.2165 (1.8); 7.2032 (0.8); 7.1967 (2.0); 7.1767 (1.6); 7.0271 (0.9); 7.0057 (1.4); 6.9834 (0.7); 6.9717 (1.0); 6.9681 (1.3); 6.9523 (1.0); 6.9487 (1.0); 6.9417 (1.3); 6.9383 (1.0); 6.9212 (1.1); 6.9177 (0.9); 6.8561 (1.7); 6.8501 (0.6); 6.8389 (0.7); 6.8356 (2.0); 6.8330 (2.3); 6.8298 (0.6); 6.8187 (0.6); 6.8127 (2.1); 6.6308 (2.2); 6.6247 (0.7); 6.6199 (2.3); 6.6138 (1.1); 6.6077 (1.7); 6.6028 (0.6); 6.5969 (1.7); 5.8979 (1.4); 5.4981 (1.4); 4.2343 (6.6); 3.7303 (16.0); 1.2555 (0.5); -0.0002 (10.4)**
1-34: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.5742 (16.0); 7.4893 (0.8); 7.4860 (1.4); 7.4826 (0.8); 7.4697 (1.0); 7.4664 (1.7); 7.4631 (1.0); 7.3097 (0.8); 7.2970 (0.8); 7.2890 (1.4); 7.2765 (1.4); 7.2694 (1.2); 7.2602 (8.8); 7.2567 (1.2); 7.2316 (1.2); 7.2275 (1.2); 7.2107 (0.8); 7.2064 (1.8); 7.2023 (1.2); 7.1855 (0.8); 7.1815 (0.7); 6.9401 (2.4); 6.9340 (0.8); 6.9229 (1.1); 6.9200 (2.7); 6.9170 (3.4); 6.9142 (0.9); 6.9031 (0.9); 6.8970 (3.1); 6.7468 (1.9); 6.7456 (2.0); 6.7409 (0.6); 6.7363 (1.9); 6.7349 (1.9); 6.7301 (1.0); 6.7285 (1.0); 6.7238 (1.6); 6.7194 (0.6); 6.7177 (0.6); 6.7132 (1.6); 5.7416 (5.8); 2.0451 (0.5); 1.5480 (4.3); 1.2645 (0.6); 1.2593 (0.7); 0.8818 (1.2); -0.0002 (13.2)**
1-35: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.4948 (16.0); 7.2591 (3.2); 7.1849 (1.7); 7.1729 (1.5); 7.1656 (2.1); 7.1550 (3.6); 7.1505 (3.2); 7.1362 (0.7); 7.1179 (1.3); 7.1126 (1.0); 7.0986 (0.7); 7.0928 (1.7); 7.0859 (1.1); 7.0746 (0.7); 7.0680 (0.7); 6.9020 (2.8); 6.8959 (1.0); 6.8849 (1.2); 6.8818 (3.2); 6.8788 (4.0); 6.8758 (1.1); 6.8648 (1.1); 6.8586 (3.7); 6.7225 (2.4); 6.7177 (0.8); 6.7160 (0.8); 6.7129 (2.3); 6.7117 (2.3); 6.7068 (1.2); 6.7053 (1.1); 6.7006 (1.8); 6.6960 (0.7); 6.6944 (0.7); 6.6898 (1.9); 4.2929 (11.6); -0.0002 (5.0)**
1-36: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.5542 (16.0); 7.7121 (1.4); 7.7083 (1.9); 7.6917 (2.0); 7.6896 (3.4); 7.6862 (1.9); 7.6698 (2.6); 7.6660 (1.8); 7.2660 (2.2); 7.2601 (8.7); 7.2462 (3.5); 7.2264 (1.8); 6.9304 (2.5); 6.9244 (0.8); 6.9132 (1.1); 6.9104 (2.9); 6.9073 (3.2); 6.9046 (0.9); 6.8934 (0.8); 6.8873 (2.9); 6.6307 (3.1); 6.6246 (0.9); 6.6201 (3.1); 6.6138 (1.5); 6.6076 (2.4); 6.6030 (0.9); 6.5971 (2.4); 5.6483 (5.7); 1.5471 (3.9); -0.0002 (13.1)**
1-37: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.4932 (16.0); 7.5783 (2.2); 7.5747 (2.3); 7.5583 (2.5); 7.5547 (2.5); 7.3411 (2.0); 7.3388 (2.0); 7.3373 (2.0); 7.3220 (2.5); 7.3203 (2.4); 7.3183 (2.4); 7.2605 (8.0); 7.1500 (2.4); 7.1305 (3.8); 7.1109 (1.9); 6.8987 (3.0); 6.8928 (1.2); 6.8884 (0.7); 6.8784 (4.6); 6.8758 (4.6); 6.8658 (0.8); 6.8614 (1.3); 6.8555 (3.5); 6.6290 (3.8); 6.6229 (1.9); 6.6183 (3.9); 6.6122 (2.3); 6.6060 (3.2); 6.6013 (1.6); 6.5954 (3.0); 4.2303 (12.8); 1.5673 (10.3); 1.5618 (3.0); 0.0078 (0.6); -0.0002 (12.5)**

[0155]

1-38: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.5194 (16.0); 7.6424 (1.3); 7.6383 (2.1); 7.6292 (2.4); 7.6248 (2.2); 7.6191 (2.5); 7.6097 (2.9); 7.6055 (1.5); 7.3387 (2.5); 7.3193 (4.2); 7.3000 (1.9); 7.2606 (19.8); 6.9387 (3.0); 6.9327 (1.0); 6.9215 (1.3); 6.9186 (3.4); 6.9156 (4.1); 6.9128 (1.2); 6.9017 (1.1); 6.8957 (3.8); 6.7203 (3.9); 6.7143 (1.2); 6.7098 (4.0); 6.7035 (2.0); 6.6973 (3.1); 6.6927 (1.1); 6.6867 (3.0); 4.2657 (11.5); 1.5936 (0.9); 1.2555 (0.6); 0.0080 (0.8); -0.0002 (31.4); -0.0085 (0.9)**
1-39: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.5849 (9.8); 8.0022 (0.7); 7.9984 (0.7); 7.9823 (0.8); 7.9787 (0.8); 7.7902 (0.8); 7.7733 (0.8); 7.7705 (0.8); 7.5115 (0.6); 7.4919 (1.0); 7.4721 (0.5); 7.2601 (30.9); 6.9373 (1.5); 6.9174 (1.6); 6.9142 (1.9); 6.8944 (1.8); 6.6568 (1.7); 6.6464 (1.7); 6.6401 (0.8); 6.6338 (1.4); 6.6234 (1.4); 5.5496 (3.6); 3.5556 (0.6); 1.5372 (16.0); 1.2646 (0.8); 0.8820 (1.6); 0.8643 (0.6); 0.0080 (1.2); -0.0002 (47.4); -0.0085 (1.4)**
1-40: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.5846 (2.7); 8.5170 (16.0); 7.6642 (1.7); 7.6447 (1.9); 7.5634 (1.6); 7.5454 (2.0); 7.3682 (1.4); 7.3489 (2.3); 7.3296 (1.0); 7.2602 (9.7); 6.9172 (0.6); 6.9141 (0.6); 6.8945 (0.7); 6.8851 (2.9); 6.8792 (1.0); 6.8649 (3.8); 6.8622 (4.2); 6.8522 (0.5); 6.8479 (1.1); 6.8419 (3.4); 6.6572 (0.6); 6.6465 (0.7); 6.6355 (3.8); 6.6294 (1.6); 6.6248 (3.8); 6.6187 (1.9); 6.6127 (2.8); 6.6079 (1.2); 6.6021 (2.8); 5.5507 (1.1); 4.1416 (12.1); 1.5578 (5.1); -0.0002 (14.4); -0.0084 (0.6)**
1-51: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.6534 (0.6); 8.4811 (11.9); 8.4030 (16.0); 7.3662 (0.6); 7.3503 (0.6); 7.3455 (1.3); 7.3297 (1.3); 7.3248 (0.8); 7.3090 (0.8); 7.2604 (18.0); 7.0931 (0.8); 7.0904 (0.8); 7.0703 (1.3); 7.0497 (0.7); 7.0471 (0.7); 6.9855 (0.9); 6.9828 (1.6); 6.9650 (0.8); 6.9623 (1.4); 4.3211 (4.7); 4.3191 (4.8); 0.0080 (0.8); -0.0002 (26.2); -0.0085 (0.8)**
1-52: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.4874 (15.2); 8.3362 (16.0); 7.3623 (1.1); 7.3423 (2.8); 7.3217 (2.8); 7.3054 (1.3); 7.2602 (22.3); 7.0809 (2.0); 7.0607 (3.8); 7.0388 (1.8); 6.9812 (3.8); 6.9607 (3.4); 4.3277 (14.9); 2.0456 (0.6); 1.5511 (7.9); 1.2578 (0.6); -0.0002 (32.1)**
1-53: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.6539 (1.6); 8.4959 (9.4); 8.4161 (12.0); 7.5732 (1.3); 7.5703 (1.2); 7.5532 (1.5); 7.5503 (1.4); 7.2692 (1.2); 7.2603 (26.8); 7.2490 (2.6); 7.2288 (1.5); 7.1483 (1.6); 7.1455 (1.5); 7.1279 (1.1); 7.1251 (1.0); 4.5010 (6.9); 1.5457 (16.0); 0.0079 (0.9); -0.0002 (29.6); -0.0085 (1.1)**
1-54: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.5010 (14.4); 8.3471 (16.0); 7.5655 (2.2); 7.5629 (2.1); 7.5456 (2.5); 7.5429 (2.4); 7.2670 (2.1); 7.2603 (25.0); 7.2471 (4.1); 7.2269 (2.3); 7.1496 (2.7); 7.1472 (2.6); 7.1293 (1.9); 4.5088 (12.2); 1.5484 (12.3); 0.0078 (1.1); -0.0002 (27.2); -0.0083 (1.4)**
1-55: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.6053 (1.4); 8.5087 (13.2); 7.7817 (3.6); 7.7762 (3.8); 7.5513 (1.8); 7.5485 (1.8); 7.5313 (2.2); 7.5285 (2.0); 7.4680 (2.3); 7.4626 (2.0); 7.4456 (2.1); 7.4401 (2.0); 7.2600 (32.2); 7.2446 (1.9); 7.2243 (3.5); 7.2171 (0.6); 7.2072 (1.1); 7.2041 (2.0); 7.1113 (2.2); 7.1085 (2.1); 7.0909 (1.7); 7.0882 (1.5); 6.0097 (0.5); 4.5072 (10.1); 1.5440 (16.0); 1.3053 (0.6); 1.2881 (0.6); 0.0079 (1.2); -0.0002 (35.1); -0.0085 (1.4)**
1-56: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.6665 (0.8); 8.6526 (2.5); 8.4919 (13.3); 8.4166 (16.0); 7.3932 (1.2); 7.3901 (1.4); 7.3730 (2.4); 7.3699 (2.4); 7.3329 (2.2); 7.3127 (3.4); 7.2926 (1.5); 7.2607 (10.4); 7.1088 (1.9); 7.1057 (2.0); 7.0887 (1.7); 7.0855 (1.7); 4.5396 (0.6); 4.4688 (10.2); 1.5691 (3.7); -0.0002 (11.4)**
1-57: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.4974 (14.3); 8.3480 (16.0); 7.3860 (1.3); 7.3829 (1.5); 7.3658 (2.8); 7.3627 (2.8); 7.3309 (2.4); 7.3108 (3.7); 7.2906 (1.6); 7.2610 (8.9); 7.1102 (2.2); 7.1071 (2.3); 7.0901 (1.9); 7.0871 (1.9); 4.4769 (12.0); 1.5731 (3.1); -0.0002 (9.8); -0.0083 (0.6)**
1-58: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.6051 (2.7); 8.5054 (14.6); 8.2917 (0.7); 8.2864 (0.7); 7.7789 (4.1); 7.7734 (4.4); 7.4725 (2.5); 7.4670 (2.4); 7.4500 (2.4); 7.4445 (2.4); 7.3723 (1.4); 7.3692 (1.5); 7.3522 (2.7); 7.3490 (2.5); 7.3085 (2.3); 7.2883 (3.8); 7.2820 (0.6); 7.2681 (1.8); 7.2602 (26.2); 7.1743 (0.8); 7.1719 (0.6); 7.1534 (0.5); 7.0712 (2.1); 7.0680 (2.1); 7.0510 (1.8); 7.0479 (1.8); 6.0263 (0.8); 5.2995**

(1.8); 4.4743 (10.8); 1.5494 (16.0); 0.0079 (0.8); -0.0002 (28.6); -0.0085 (1.1)
1-59: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.5012 (2.7); 8.4897 (13.4); 8.3474 (3.2); 8.3217 (16.0); 7.6656 (1.7); 7.6624 (1.8); 7.6466 (2.2); 7.6434 (2.1); 7.4907 (1.5); 7.4703 (2.8); 7.4510 (2.1); 7.4048 (2.4); 7.4015 (2.3); 7.3842 (1.5); 7.3810 (1.3); 7.2610 (22.6); 7.2474 (0.9); 7.1502 (0.5); 7.1474 (0.5); 5.3000 (5.4); 4.5370 (10.3); 4.5091 (2.2); 1.5564 (7.2); 0.0079 (0.8); -0.0002 (24.7); -0.0068 (0.9); -0.0084 (1.2)
1-60: ^{1}H-NMR (400.6 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.5813 (16.0); 7.2598 (17.3); 7.2388 (0.8); 7.2220 (0.9); 7.2179 (1.8); 7.2012 (1.8); 7.1971 (1.1); 7.1804 (1.0); 6.7924 (1.0); 6.7902 (1.1); 6.7692 (1.9); 6.7491 (1.0); 6.7468 (1.0); 6.6467 (1.9); 6.6259 (1.8); 4.3464 (6.4); 4.3441 (6.6); 3.9739 (1.9); 3.9593 (3.6); 3.9447 (2.0); 2.1342 (0.9); 2.1191 (0.8); 2.1149 (0.9); 2.1072 (1.3); 2.0941 (1.3); 2.0882 (0.9); 2.0800 (0.9); 2.0672 (1.2); 1.9222 (0.8); 1.9080 (1.9); 1.9019 (0.7); 1.8941 (1.4); 1.8886 (1.0); 1.8831 (1.3); 1.8678 (1.1); 0.0080 (0.7); -0.0002 (26.1); -0.0085 (0.7)

[0156]

[0157] 终产物的NMR数据(常规形式):

[0158] 针对在以下部分中记载的化学实施例给出的^{1}H NMR光谱数据(^{1}HNMR为400MHz,溶剂$CDCl_3$或d_6-DMSO,内标物:四甲基硅烷δ=0.00ppm)在Bruker仪器上获得,并且列出的信号具有下文给出的含义:b=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中每种的显著信号,或记录了主要的非对映异构体的特征信号。

1-1: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.60 (s,2H); 7.29 (dd,1H); 7.22-7.15 (m,3H); 4.30 (s,2H); 2.78 (m,2H); 2.10 (m,2H); 1.79 (m,2H)
1-3: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.51 (s,2H); 7.29 (dd,1H); 7.22-7.15 (m,3H); 4.32 (s,2H); 2.78 (m,2H); 2.10 (m,2H); 1.79 (m,2H)
1-10: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.60 (s,2H); 7.42-7.27 (m,4H); 4.37 (s,2H); 3.46 (t,2H); 2.40-2.26 (m,4H)
1-14: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.62 (s,2H); 7.27-7.21 (m,1H); 7.14-7.12 (m,2H); 4.46 (s,2H); 3.56-3.48 (m,2H); 2.41-2.17 (m,4H)
1-15: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.53 (s,2H); 7.25-7.21 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.48 (s,2H); 3.56-3.52 (m,2H); 2.41-2.27 (m,4H)
1-16: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.62 (s,2H); 7.28-7.23 (m,1H); 7.16-7.11 (m,2H); 4.45 (s,2H); 3.71-3.67 (m,2H); 2.93-2.84 (m,2H)
1-17: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.53 (s,2H); 7.26-7.23 (m,1H); 7.16-7.11 (m,2H); 4.47 (s,2H); 3.71-3.67 (m, 2H); 2.90-2.84 (m,2H)
1-18: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.62 (s,2H); 7.39-7.37 (m,1H); 7.24-7.18 (m,2H); 4.51 (s,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.45-2.30 (m,4H)

[0159]

[0160]

1-19: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.53 (s,2H); 7.39-7.37 (m,1H); 7.24-7.18 (m,2H); 4.52 (s,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.43-2.29 (m,4H)**
1-20: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.62 (s,2H); 7.40-7.38 (m,1H); 7.27-7.20 (m,2H); 4.49 (s,2H); 3.82-3.78 (m,2H); 2.96-2.84 (m,2H)**
1-21: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.53 (s,2H); 7.40-7.38 (m,1H); 7.27-7.20 (m,2H); 4.50 (s,2H); 3.82-3.78 (m,2H); 2.96-2.84 (m,2H)**
1-23: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.53 (s,2H); 7.31-7.22 (m,3H); 7.11 (m,1H); 6.99 (m,2H); 6.90 (m,2H); 4.25 (s,2H); 4.05 (s,2H)**
1-26: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.57 (s,2H); 7.34-7.18 (m,5H); 7.13 (m,1H); 7.07 (m,1H); 4.25 (s,2H)**
1-27: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.48 (s,2H); 7.34-7.18 (m,5H); 7.13 (m,1H); 7.06 (m,1H); 4.27 (s,2H)**
1-29: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.55 (s,2H); 7.33 (dd,1H); 7.23 (ddd,1H); 7.11 (dd,1H); 6.94 (m,2H); 6.85-6.79 (m,3H); 4.35 (s,2H)**
1-41: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.61 (s,2H); 7.91 (s,2H); 7.82 (dd,1H); 7.59-7.51 (m,2H); 7.38 (dd,1H); 6.04 (s,1H)**
1-42: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.54 (s,2H); 8.00 (m,1H); 7.84 (s,1H); 7.46-7.36 (m,4H); 4.29 (s,2H)**
1-45: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.54 (s,2H); 7.98 (m,1H); 7.95 (s,1H); 7.75 (dd,1H); 7.73 (dd,1H); 7.59 (dd,1H); 4.20 (s,2H)**
1-50: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.48 (s,2H); 8.40 (s,2H); 7.43 (dd,1H); 7.35 (ddd,1H); 7.28 (dd,1H); 7.13 (d,1H); 4.26 (s,2H)**
1-64: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.45 (s,2H); 8.39 (s,2H); 7.26 (dd,1H); 7.16 (d,1H); 6.99 (dd,1H); 4.32 (s,2H); 2.40 (s,3H)**
1-65: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.46 (s,2H); 8.32 (s,2H); 7.29-7.24 (m,1H); 7.14 (dd,1H); 6.99 (d,1H); 4.33 (s,2H); 2.39 (s,3H)**
1-66: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.47 (s,2H); 7.72 (d,1H); 7.44 (dd,1H); 7.24 (dd,1H); 7.14 (d,1H); 6.95 (d,1H); 4.30 (s,2H); 2.41 (s,3H)**
1-67: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.47 (s,2H); 7.33 (dd,1H); 7.22 (ddd,1H); 7.11 (ddd,1H); 6.94 (m,2H); 6.85-6.79 (m,3H); 4.37 (s,2H)**
1-68: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.68 (s,2H); 7.60 (dd,1H); 7.34-7.28 (m,2H); 7.22 (dd,1H); 5.61 (s,1H); 2.87 (m,2H); 2.17 (m,2H); 1.87 (m,2H)**
1-69: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.60 (s,2H); 7.65 (m,1H); 7.37-7.31 (m,2H); 7.15 (m,1H); 7.01-6.92 (m,4H); 5.56 (s,1H); 4.25 (d,1H); 4.07 (d,1H)**
1-70: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.41 (s,2H); 8.40 (s,2H); 7.43 (dd,1H); 7.35 (ddd,1H); 7.28 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 4.28 (s,2H)**
1-71: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.60 (s,2H); 8.14 (dd,1H); 8.00 (s,1H); 7.94 (s,1H); 7.87 (dd,1H); 7.74 (dd,1H); 5.73 (s,1H)**
1-72: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.59 (s,2H); 7.61 (dd,1H); 7.36-7.28 (m,2H); 7.22 (dd,1H); 5.64 (s,1H); 2.86 (m,2H); 2.17 (m,2H); 1.86 (m,2H)**
1-73: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.54 (dd,1H); 7.67 (dd,1H); 7.48 (dd,1H); 7.40-7.21 (m,4H); 5.47 (s,1H); 2.73 (m,2H); 2.11**

[0161]

(m,2H); 1.78 (m,2H)
1-74: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.46 (s,1H); 7.50 (d,1H); 7.31 (d,1H); 7.20 (dd,1H); 7.08 (m,2H); 6.97 (m,2H); 6.68-6.83 (m,3H); 4.16 (s,2H)
1-75: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.55 (d,2H); 8.31 (d,2H); 7.44 (dd,1H); 7.34 (ddd,1H); 7.27 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 7.04 (t,1H); 4.29 (s,2H)
1-76: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.53 (d,2H); 8.38 (s,2H); 7.45 (dd,1H); 7.34 (ddd,1H); 7.28 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 7.05 (t,1H); 4.28 (s,2H)
1-77: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.55 (d,2H); 7.73 (d,1H); 7.46-7.43 (m,2H); 7.32 (ddd,1H); 7.26 (ddd,1H); 7.10 (dd,1H); 7.05 (t,1H); 4.27 (s,2H)
1-78: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.68 (s,2H); 7.62 (m,1H); 7.44-7.38 (m,2H); 7.31-7.22 (m,3H); 7.16 (m,1H); 5.53 (s,1H)
1-79: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.58 (s,2H); 7.63 (m,1H); 7.44-7.38 (m,2H); 7.32-7.22 (m,3H); 7.15 (m,1H); 5.56 (s,1H)
1-80: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.50 (dd,1H); 7.64 (dd,1H); 7.52 (dd,1H); 7.46-7.38 (m,2H); 7.28-7.14 (m,4H); 7.06 (m,1H); 5.36 (s,1H)
1-81: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.52 (s,2H); 7.66 (m,1H); 7.37-7.29 (m,2H); 7.15 (m,1H); 7.03-6.93 (m,4H); 5.59 (s,1H); 4.25 (d,1H); 4.07 (d,1H)
1-82: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.51 (dd,1H); 7.58-7.52 (m,2H); 7.36-7.30 (m,2H); 7.18 (m,1H); 7.05-6.92 (m,5H); 5.41 (s,1H); 4.06 (d,1H); 4.00 (d,1H)
1-83: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.75 (s,2H); 7.58 (d,1H); 7.32 (dd,1H); 7.16 (dd,1H); 7.03 (m,2H); 6.98 (m,2H); 6.80 (m,1H); 5.86 (s,1H)
1-84: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.54 (s,1H); 7.63 (d,1H); 7.57 (d,1H); 7.35 (d,1H); 7.28 (dd,1H); 7.15 (dd,1H); 7.02 (m,2H); 6.88 (m,2H); 6.76 (d,1H); 5.68 (s,1H)
1-85: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.75 (d,1H); 7.90 (d,1H); 7.68 (dd,1H); 7.30 (m,1H); 7.16 (ddd,1H); 7.02 (m,2H); 6.88 (m,2H); 6.75 (dd,1H); 6.13 (s,1H)
1-86: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.63 (s,2H); 7.71 (m,1H); 7.42-7.38 (m,2H); 7.33 (m,1H); 7.18 (m,2H); 6.97 (m,2H); 6.22 (s,1H)
1-87: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.64 (s,2H); 7.33 (dd,1H); 7.23 (ddd,1H); 7.13 (ddd,1H); 6.94 (m,2H); 6.85-6.79 (m,3H); 4.33 (s,2H)
1-88: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.55 (s,2H); 7.71 (m,1H); 7.41-7.30 (m,3H); 7.19 (m,2H); 6.97 (m,2H); 6.24 (s,1H)
1-89: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.41 (s,2H); 8.34 (s,2H); 7.42 (dd,1H); 7.35 (ddd,1H); 7.27 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 4.29 (s,2H)
1-90: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.41 (s,2H); 7.75 (d,1H); 7.46 (dd,1H); 7.43 (dd,1H); 7.33 (ddd,1H); 7.26 (ddd,1H); 7.10 (dd,1H); 4.27 (s,2H)
1-91: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.41 (s,2H); 8.38 (m,1H); 7.45 (dd,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 7.26 (ddd,1H); 7.12 (dd,1H); 7.03 (d,1H); 4.08 (s,2H)
1-92: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.41 (s,2H); 8.29 (d,1H); 7.37-7.31 (m,2H); 7.28-7.19 (m,3H); 7.12 (dd,1H); 7.07 (dd,1H);

[0162]

4.09 (s,2H)
1-93: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.34 (s,2H); 8.28 (d,1H); 7.37-7.31 (m,2H); 7.27-7.19 (m,3H); 7.12 (dd,1H); 7.07 (dd,1H); 4.10 (s,2H)
1-94: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.49 (d,1H); 7.53 (dd,1H); 7.23-7.17 (m,4H); 6.93 (d,1H); 4.16 (s,2H); 2.66 (m,2H); 2.05 (m,2H); 1.72 (m,2H)
1-95: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.45 (s,2H); 7.29-7.21 (m,3H); 7.11 (m,1H); 7.00 (m,2H); 6.90 (m,2H); 4.27 (s,2H); 4.06 (s,2H)
1-96: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.46 (dd,1H); 7.44 (dd,1H); 7.25-7.12 (m,4H); 6.98 (m,2H); 6.90 (m,2H); 6.78 (dd,1H); 4.10 (s,2H); 3.93 (s,2H)
1-97: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.44 (dd,1H); 7.48 (dd,1H); 7.36-7.21 (m,4H); 7.17-7.05 (m,2H); 6.95 (m,1H); 6.80 (dd,1H); 4.08 (s,2H)
1-98: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.62 (d,2H); 7.35 (ddd,1H); 7.22 (ddd,1H); 7.11 (ddd,1H); 7.06 (t,1H); 6.92 (m,2H); 6.85-6.79 (m,3H); 4.38 (s,2H)
1-99: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.56 (s,2H); 7.35-7.20 (m,4H); 7.15 (m,2H); 6.93 (m,2H); 4.50 (s,2H)
1-100: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.39 (m,1H); 8.34 (s,2H); 7.46 (dd,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 7.25 (ddd,1H); 7.12 (dd,1H); 7.05 (d,1H); 4.10 (s,2H)
1-101: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.39 (m,1H); 7.78 (d,1H); 7.48 (dd,1H); 7.47 (d,1H); 7.36-7.30 (m,2H); 7.23 (ddd,1H); 7.10 (dd,1H); 7.03 (d,1H); 4.10 (s,2H)
1-102: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.53 (dd,1H); 7.67 (dd,1H); 7.60 (dd,1H); 7.41-7.29 (m,3H); 7.22-7.14 (m,3H); 6.99 (m,2H); 6.00 (s,1H)
1-103: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.30 (d,1H); 7.78 (d,1H); 7.46 (dd,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 7.25-7.20 (m,2H); 7.09 (dd,1H); 7.05 (dd,1H); 4.10 (s,2H)
1-104: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.48 (s,2H); 7.34-7.21 (m,4H); 7.18 (m,2H); 6.94 (m,2H); 4.52 (s,2H)
1-105: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.48 (d,1H); 7.50 (dd,1H); 7.30-7.15 (m,6H); 7.00-6.94 (m,3H); 4.32 (s,2H)
1-106: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.28 (d,1H); 7.35 (dd,1H); 7.30-7.18 (m,4H); 7.16 (m,2H); 6.94 (m,2H); 4.32 (s,2H)
1-107: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.69 (s,2H); 7.64 (m,1H); 7.56 (m,1H); 7.40-7.36 (m,2H); 6.30 (s,1H); 3.15 (m,1H); 3.05 (m,1H); 2.38 (m,2H)
1-108: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.60 (s,2H); 7.65 (m,1H); 7.56 (m,1H); 7.40-7.36 (m,2H); 6.32 (s,1H); 3.14 (m,1H); 3.04 (m,1H); 2.38 (m,2H)
1-109: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.54 (s,1H); 7.68 (dd,1H); 7.57 (m,1H); 7.51 (m,1H); 7.40-7.34 (m,3H); 6.05 (s,1H); 3.09 (m,1H); 3.02 (m,1H); 2.36 (m,2H)
1-110: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.31 (d,1H); 7.43-7.41 (m,2H); 7.27-7.17 (m,3H); 4.36 (s,2H); 3.02 (m,2H); 2.33 (m,2H)
1-111: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.52 (s,2H); 7.44 (m,1H); 7.33-7.24 (m,3H); 4.54 (s,2H); 3.02 (m,2H); 2.33 (m,2H)
1-112: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.61 (s,2H); 7.44 (m,1H); 7.33-7.25 (m,3H); 4.52 (s,2H); 3.03 (m,2H); 2.33 (m,2H)

[0163]

1-113: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.43 (dd,1H); 7.65 (m,1H); 7.53-7.34 (m,4H); 6.26 (d,1H); 3.04 (m,2H); 2.34 (m,2H)**
1-114: ^{1}H-NMR (600.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.69 (s,2H); 7.66 (dd,1H); 7.52 (dd,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 6.30 (s,1H); 2.98 (m,2H); 2.24 (m,2H); 1.87 (m,2H)**
1-115: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.60 (s,2H); 7.62 (m,1H); 7.52 (m,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 6.32 (d,1H); 2.98 (m,2H); 2.24 (m,2H); 1.87 (m,2H)**
1-116: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.43 (dd,1H); 7.63 (m,1H); 7.51-7.32 (m,4H); 6.28 (d,1H); 2.95 (m,2H); 2.19 (m,2H); 1.86 (m,2H)**
1-117: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.55 (d,1H); 7.67 (dd,1H); 7.56 (m,1H); 7.48 (m,1H); 7.38-7.29 (m,3H); 6.05 (s,1H); 2.94 (m,2H); 2.19 (m,2H); 1.85 (m,2H)**
1-118: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.70 (s,2H); 7.61 (m,1H); 7.33-7.30 (m,2H); 7.23 (m,1H); 5.60 (s,1H); 3.07 (m,2H); 2.49 (m,1H); 2.38 (m,1H)**
1-119: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.61 (s,2H); 7.28 (m,1H); 7.23-7.17 (m,3H); 4.31 (s,2H); 2.99 (m,2H); 2.36 (m,2H)**
1-120: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.61 (s,2H); 7.62 (m,1H); 7.35-7.29 (m,2H); 7.23 (m,1H); 5.63 (s,1H); 3.07 (m,2H); 2.49 (m,1H); 2.38 (m,1H)**
1-121: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.52 (s,2H); 7.29 (m,1H); 7.25-7.17 (m,3H); 4.33 (s,2H); 2.99 (m,2H); 2.35 (m,2H)**
1-122: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.54 (dd,1H); 7.70 (dd,1H); 7.48 (dd,1H); 7.37-7.30 (m,3H); 7.24 (dd,1H); 5.47 (s,1H); 2.95 (m,2H); 2.34 (m,2H)**
1-123: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.50 (d,1H); 7.54 (dd,1H); 7.25-7.17 (m,4H); 6.97 (d,1H); 4.17 (s,2H); 2.87 (m,2H); 2.26 (m,2H)**
1-124: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.52 (s,2H); 7.91 (s,1H); 7.90 (m,1H); 7.83 (dd,1H); 7.57 (ddd,1H); 7.53 (ddd,1H); 7.38 (dd,1H); 6.06 (s,1H)**
1-125: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.65 (d,1H); 7.94 (s,1H); 7.90-7.88 (m,2H); 7.79 (m,1H); 7.62-7.54 (m,2H); 7.36 (dd,1H); 6.26 (s,1H)**
1-126: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.40 (dd,1H); 7.94-7.90 (m,2H); 7.69 (m,1H); 7.63-7.50 (m,2H); 7.39 (m,1H); 7.32 (dd,1H); 6.13 (s,1H)**
1-127: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.30 (dd,1H); 7.34-7.27 (m,3H); 7.22-7.12 (m,4H); 7.02 (m,1H); 4.10 (d,2H)**
1-128: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.52 (s,2H); 8.15 (dd,1H); 8.00 (s,1H); 7.93 (m,1H); 7.88 (dd,1H); 7.75 (dd,1H); 5.76 (s,1H)**
1-129: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.45 (s,2H); 7.99 (m,1H); 7.84 (s,1H); 7.46-7.36 (m,4H); 4.31 (d,2H)**
1-130: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.24 (dd,1H); 7.87 (m,1H); 7.86 (s,1H); 7.46-7.32 (m,5H); 4.15 (d,2H)**
1-131: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.46 (s,2H); 7.97 (m,1H); 7.95 (s,1H); 7.75 (dd,1H); 7.73 (dd,1H); 7.59 (dd,1H); 4.22 (s,2H)**
1-132: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.68 (s,2H); 7.84 (dd,1H); 7.67 (dd,1H); 7.59 (dt,1H); 7.52 (ddd,1H); 6.95 (s,1H); 6.83 (t,1H); 5.95 (s,1H)**
1-133: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.60 (s,2H); 7.70 (dd,1H); 7.48-7.39 (m,3H); 6.87 (s,1H); 6.79 (t,1H); 4.50 (s,2H)**

[0164]

1-134: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.59 (s,2H); 7.84 (dd,1H); 7.67 (dd,1H); 7.59 (dt,1H); 7.52 (ddd,1H); 6.94 (s,1H); 6.83 (t,1H); 5.97 (s,1H)**
1-135: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.51 (s,2H); 7.70 (d,1H); 7.48-7.38 (m,3H); 6.87 (s,1H); 6.79 (t,1H); 4.52 (s,2H)**
1-136: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.57 (s,2H); 7.82 (dd,1H); 7.55-7.51 (m,2H); 7.43 (m,1H); 7.37 (m,1H); 6.99 (m,1H); 6.55 (d,1H); 6.21 (s,1H)**
1-137: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.49 (s,2H); 7.49 (d,1H); 7.44-7.42 (m,2H); 7.35-7.31 (m,2H); 6.94 (dd,1H); 6.53 (d,1H); 4.48 (s,2H)**
1-138: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.60 (s,2H); 7.95 (s,1H); 7.82 (d,1H); 7.78 (dd,1H); 7.70 (s,1H); 7.49 (dd,1H); 5.42 (s,1H)**
1-139: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 10.50 (bs,1H); 8.75 (s,2H); 7.90 (d,1H); 7.81 (dd,1H); 7.68 (m,1H); 7.62 (m,1H); 6.25 (m,1H); 5.91 (t,1H)**
1-140: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.55 (s,2H); 7.45 (dd,1H); 7.42 (dd,1H); 7.34 (dd,3H); 6.81 (t,1H); 6.57 (s,1H); 4.22 (s,2H)**
1-141: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.55 (s,2H); 7.92 (d,1H); 7.62-7.59 (m,2H); 7.51-7.44 (m,2H); 7.31 (d,1H); 7.11-7.07 (m,2H); 4.53 (d,1H); 4.46 (d,1H)**
1-142: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.46 (s,2H); 8.26 (dd,1H); 7.83-7.80 (m,2H); 7.59 (m,1H); 7.51 (m,1H); 7.27 (d,1H); 7.09-7.05 (m,2H); 4.66 (s,2H)**
1-143: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.47 (s,2H); 7.92 (dd,1H); 7.63-7.59 (m,2H); 7.51-7.43 (m,2H); 7.31 (m,1H); 7.11-7.06 (m,2H); 4.53 (d,1H); 4.48 (d,1H)**
1-144: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.38 (s,2H); 8.26 (dd,1H); 7.85-7.81 (m,2H); 7.58 (m,1H); 7.50 (m,1H); 7.28 (d,1H); 7.10-7.05 (m,2H); 4.67 (s,2H)**
1-145: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.60 (s,2H); 7.92 (d,1H); 7.56 (dd,1H); 7.44-7.33 (m,5H); 4.88 (d,1H); 4.50 (d,1H)**
1-146: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.50 (s,2H); 7.81 (dd,1H); 7.54-7.50 (m,2H); 7.42 (m,1H); 7.38 (m,1H); 7.00 (dd,1H); 6.60 (d,1H); 6.24 (s,1H)**
1-147: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.42 (d,2H); 7.48 (dd,1H); 7.43-7.40 (m,2H); 7.34-7.30 (m,2H); 6.95 (dd,1H); 6.57 (d,1H); 4.50 (s,2H)**
1-148: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.51 (s,2H); 7.94 (d,1H); 7.55-7.47 (m,2H); 7.49 (m,5H); 4.91 (d,1H); 4.53 (d,1H)**
1-149: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.50 (s,2H); 7.97 (dd,1H); 7.33-7.24 (m,2H); 7.41 (d,1H); 4.47 (d,1H); 4.38 (d,1H); 3.36 (m,1H); 3.13 (m,1H); 2.71 (m,1H); 2.40 (m,1H)**
1-150: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.49 (s,2H); 8.06 (d,1H); 7.60 (dd,1H); 7.53 (d,1H); 7.47 (dd,1H); 4.89 (s,2H); 3.79 (m,2H); 2.55 (m,2H)**
1-151: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.48 (s,2H); 8.42 (s,2H); 7.24-7.20 (m,2H); 7.11 (m,1H); 4.32 (s,2H)**
1-152: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.48 (s,2H); 8.35 (s,2H); 7.24-7.19 (m,2H); 7.11 (m,1H); 4.34 (s,2H)**
1-153: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.40 (s,2H); 8.35 (s,2H); 7.24-7.20 (m,2H); 7.11 (m,1H); 4.32 (s,2H)**
1-154: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.43 (d,2H); 8.39 (s,2H); 7.24-7.19 (m,2H); 7.11 (m,1H); 4.33 (s,2H)**

[0165]

1-155: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.49 (s,2H); 8.33 (s,2H); 7.40 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 7.23 (dd,1H); 4.28 (s,2H)**
1-156: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.41 (s,2H); 8.34 (s,2H); 7.40 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 7.22 (dd,1H); 4.29 (s,2H)**
1-157: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.41 (s,2H); 8.40 (s,2H); 7.40 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 7.23 (dd,1H); 4.29 (s,2H)**
1-158: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.70 (s,1H); 8.56 (s,2H); 8.09 (dd,1H); 7.50 (m,1H); 7.45 (m,1H); 7.38 (m,1H); 4.80 (s,2H)**
1-159: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.57 (s,2H); 8.03 (dd,1H); 7.47 (m,1H); 7.41 (m,1H); 7.34 (m,1H); 4.78 (s,2H); 2.61 (s,3H)**
1-160: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.55 (s,2H); 8.09 (dd,1H); 7.52 (m,1H); 7.45 (m,1H); 7.39 (m,1H); 6.83 (t,1H); 4.78 (s,2H)**
1-161: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.58 (s,2H); 8.11 (dd,1H); 7.54 (m,1H); 7.47 (m,1H); 7.40 (m,1H); 4.78 (s,2H)**
1-162: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.39 (s,2H); 8.32 (s,2H); 7.26 (d,1H); 7.20-7.19 (m,2H); 4.22 (s,2H); 2.10 (s,3H)**
1-163: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.35 (dd,1H); 8.33 (s,2H); 8.21 (d,1H); 7.61 (ddd,1H); 7.52 (ddd,1H); 7.33-7.27 (m,3H); 4.56 (s,2H)**
1-164: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.41 (s,2H); 8.36 (dd,1H); 8.19 (d,1H); 7.62 (ddd,1H); 7.52 (ddd,1H); 7.32-7.28 (m,3H); 4.55 (s,2H)**
1-165: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.48 (s,2H); 8.32 (s,2H); 7.27 (m,1H); 7.20-7.19 (m,2H); 4.21 (s,2H); 2.10 (s,3H)**
1-166: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.47 (s,2H); 8.39 (s,2H); 7.27 (m,1H); 7.21-7.20 (m,2H); 4.20 (s,2H); 2.10 (s,3H)**
1-167: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.53 (s,2H); 8.36 (s,2H); 7.66 (dd,1H); 7.47-7.45 (m,2H); 7.36 (ddd,1H); 4.50 (s,2H)**
1-168: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.61 (s,2H); 7.41 (ddd,1H); 7.34-7.19 (m,3H); 4.50 (s,2H); 2.93 (t,2H); 2.20 (m,2H); 1.84 (m,2H)**
1-169: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.69 (s,2H); 8.61 (s,2H); 8.02 (dd,1H); 7.43-7.40 (m,2H); 7.30 (dd,1H); 5.02 (d,1H); 4.53 (d,1H)**
1-170: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.76 (s,2H); 8.42 (s,2H); 8.37 (dd,1H); 7.62 (ddd,1H); 7.53 (m,1H); 7.38 (dd,1H); 4.77 (s,2H)**
1-171: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.49 (s,2H); 8.34 (s,2H); 7.43 (dd,1H); 7.35 (ddd,1H); 7.27 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 4.27 (s,2H)**
1-180: ^{1}H-NMR (300.0 MHz, d_6-DMSO): **δ= 8.93 (d,2H); 8.44 (s,1H); 7.90 (s,1H); 7.52-7.33 (m,3H); 7.13 (m,1H); 6.53 (s,1H); 5.70 (d, H); 5.59 (d,1H)**
1-182: ^{1}H-NMR (300.0 MHz, d_6-DMSO): **δ= 8.95 (s,2H); 8.44 (s,1H); 7.88 (s,1H); 7.52-7.33 (m,3H); 7.14 (m,1H); 6.52 (s,1H); 5.69 (d, H); 5.58 (d,1H)**
1-184: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.61 (s,2H); 7.19-7.16 (m,3H); 4.43 (s,2H); 3.76-3.74 (t,2H); 3.70-3.66 (t,2H); 2.52-2.40 (m,2H); 2.31 (s,3H)**
1-185: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.53 (s,2H); 7.25-7.20 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.48 (s,2H); 3.75-3.72 (t,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.53-2.46 (m,2H)**
1-186: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.71 (s,2H); 7.25-7.21 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.44 (s,2H); 3.56-3.52 (m,2H); 2.41-2.27**

[0166]

(m,4H)
1-187: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.71 (s,2H); 7.32-7.24 (m,1H); 7.22-7.17 (m,2H); 4.42 (s,2H); 3.71-3.61 (m,2H); 2.89-2.57 (m,2H)
1-188: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.60 (s,2H); 7.20-7.16 (m,3H); 4.42 (s,2H); 3.56 (t,2H); 2.43-2.26 (m,7H)
1-189: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.61 (s,2H); 7.24-7.21 (m,1H); 7.19-7.08 (m,2H); 4.39 (s,2H); 3.80-3.71 (m,2H); 2.93-2.83 (m,2H); 2.39 (S,3H)
1-190: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.62 (s,2H); 7.39-7.37 (m,1H); 7.25-7.20 (m,2H); 4.51 (s,2H); 3.77-3.73 (m,4H); 2.55-2.49 (m,2H)
1-191: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.53 (s,2H); 7.39-7.36 (m,1H); 7.25-7.17 (m,2H); 4.53 (s,2H); 3.77-3.73 (m,4H); 2.56-2.49 (m,2H)
1-192: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.71 (s,2H); 7.24-7.20 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.44 (s,2H); 3.75-3.72 (t,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.53-2.46 (m,2H)
1-193: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.62 (s,2H); 7.25-7.20 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.47 (s,2H); 3.75-3.72 (t,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.53-2.46 (m,2H)
1-194: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.38 (s,2H); 8.19 (s,1H); 7.35-7.29 (m,1H); 7.21-7.17 (m,1H); 7.10-7.04 (m,2H); 6.96-6.95 (m,1H), 4.15 (s,2H)
1-195: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.61 (s,2H); 7.05-6.95 (m,3H); 4.31 (s,2H); 4.08 (t,2H); 2.29 (m,2H); 1.92 (m,2H)
1-196: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.60 (s,2H); 7.98 (dd,1H); 7.51 (ddd,1H); 7.45 (ddd,1H); 7.38 (dd,1H); 4.46 (d,1H); 4.35 (d,1H); 3.12 (m,1H); 2.91 (m,1H); 2.31-1.97 (m,4H)
1-197: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.60 (s,2H); 8.07 (ddd,1H); 7.58 (ddd;1H); 7.48-7.44 (m,2H); 4.85 (s,2H); 3.51 (t,2H); 2.27 (m,2H); 2.03 (m,2H)
1-198: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.62 (s,2H); 7.42 (dd,1H); 7.28-7.18 (m,3H); 4.50 (s,2H); 3.61 (t,2H); 3.03 (t,2H); 2.03 (quint,2H)
1-199: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.61 (s,2H); 7.99 (dd,1H); 7.51 (ddd,1H); 7.45 (ddd,1H); 7.37 (dd,1H); 4.49 (d,1H); 4.37 (d,1H); 3.72 (m,1H); 3.62 (m,1H); 3.27 (m,1H); 2.93 (m,1H); 2.36 (m,1H); 2.22 (m,1H)
1-200: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.61 (s,2H); 8.07 (ddd,1H); 7.58 (ddd;1H); 7.48-7.44 (m,2H); 4.86 (s,2H); 3.65-3.57 (m,4H); 2.23 (m,2H)
1-201: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.53 (s,2H); 8.32 (d,2H); 7.67 (dd,1H); 7.48-7.43 (m,2H); 7.35 (ddd,1H); 4.51 (s,2H)
1-202: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.46 (s,2H); 8.32 (d,2H); 7.67 (dd,1H); 7.48-7.41 (m,2H); 7.35 (ddd,1H); 4.52 (s,2H)
1-203: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.50 (s,2H); 7.98 (dd,1H); 7.51 (ddd,1H); 7.45 (ddd,1H); 7.38 (dd,1H); 4.48 (d,1H); 4.38 (d,1H); 3.12 (m,1H); 2.89 (m,1H); 2.31-1.97 (m,4H)
1-204: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.51 (s,2H); 8.07 (ddd,1H); 7.58 (ddd;1H); 7.48-7.44 (m,2H); 4.86 (s,2H); 3.51 (t,2H); 2.27 (m,2H); 2.03 (m,2H)
1-205: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): δ= 8.52 (s,2H); 7.99 (dd,1H); 7.51 (ddd,1H); 7.45 (ddd,1H); 7.37 (dd,1H); 4.50 (dd,1H); 4.39 (d,1H); 3.72 (m,1H); 3.62 (m,1H); 3.27 (m,1H); 2.93 (m,1H); 2.36 (m,1H); 2.22 (m,1H)

[0167]

1-206: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.52 (s,2H); 8.07 (dd,1H); 7.58 (ddd;1H); 7.48-7.43 (m,2H); 4.88 (s,2H); 3.65-3.57 (m,4H); 2.23 (m,2H)**
1-207: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.51 (s,2H); 7.95 (s,1H); 7.83 (dd,1H); 7.78 (dd,1H); 7.68 (s,1H); 7.49 (dd,1H); 5.45 (s,1H)**
1-208: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.53 (s,2H); 7.89 (s,1H); 7.67 (m,1H); 7.65 (dd,1H); 7.41 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 4.12 (s,2H)**
1-209: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.44 (s,2H); 7.89 (s,1H); 7.65 (s,1H); 7.64 (dd,1H); 7.41 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 4.13 (s,2H)**
2-1: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.46 (s,2H); 7.06 (s,1H); 6.77 (t,1H); 6.46 (s,1H); 4.44 (s,2H); 2.56 (s,3H); 2.20 (s,3H)**
2-2: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.56 (s,2H); 7.06 (s,1H); 6.78 (t,1H); 6.49 (s,1H); 4.42 (s,2H); 2.55 (s,3H); 2.20 (s,3H)**
2-5: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.56 (s,2H); 7.15 (s,1H); 6.82 (t,1H); 6.71 (s,1H); 6.60 (s,1H); 2.56 (s,3H); 2.22 (s,3H)**
2-6: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.65 (s,2H); 7.17 (s,1H); 6.84 (t,1H); 6.73 (s,1H); 6.59 (s,1H); 2.56 (s,3H); 2.23 (s,3H)**
2-7: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.42 (s,2H); 8.41 (s,2H); 7.38 (d,1H); 7.16 (d,1H); 4.50 (s,2H); 2.58 (s,3H)**
2-8: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.41 (s,2H); 8.35 (s,2H); 7.38 (d,1H); 7.15 (d,1H); 4.50 (s,2H); 2.57 (s,3H)**
2-9: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.50 (s,2H); 7.02 (s,2H); 4.53 (d,2H); 3.91 (t,2H); 2.49 (s,3H); 2.05 (m,2H); 1.87 (m,2H)**
2-10: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.51 (s,2H); 7.58 (d,1H); 7.12 (d,1H); 4.58 (d,2H); 3.43 (t,2H); 2.55 (s,3H); 2.37-2.22 (m,4H)**
2-11: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.60 (s,2H); 7.58 (d,1H); 7.12 (d,1H); 4.56 (d,2H); 3.43 (t,2H); 2.55 (s,3H); 2.37-2.22 (m,4H)**
2-12: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.49 (s,2H); 8.34 (s,2H); 7.39 (d,1H); 7.16 (d,1H); 4.49 (s,2H); 2.57 (s,3H)**
2-13: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.48 (s,2H); 8.45 (s,2H); 7.94 (d,1H); 7.52 (d,1H); 4.76 (s,2H); 2.85 (s,3H)**
2-14: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, $CDCl_3$): **δ= 8.56 (s,2H); 7.61 (d,1H); 7.46 (d,1H); 4.81 (s,2H); 4.08 (t,2H); 2.78 (s,3H); 2.04 (m,2H); 1.96 (m,2H)**

[0168] 本发明还提供一种或多种如上文所定义的、优选在一个认定为优选或特别优选的实施方案中的通式(I)的化合物和/或其盐,特别是一种或多种在每种情况下如上文所定义的式(1-1)至(1-209)、(2-1)至(2-14)的化合物和/或其盐,作为除草剂和/或植物生长调节剂的用途,优选在有用植物和/或观赏植物的作物中。

[0169] 本发明还提供一种用于防治有害植物和/或调节植物生长的方法,其特征在于,将有效量的

[0170] -一种或多种如上文所定义的、优选在一个认定为优选或特别优选的实施方案中的通式(I)的化合物和/或其盐,特别是一种或多种在每种情况下如上文所定义的式(1-1)至(1-209)或(2-1)至(2-14)的化合物和/或其盐,或

[0171] -如下文所定义的本发明的组合物,

[0172] 施用于(有害)植物、(有害)植物的种子、(有害)植物在其中或其上生长的土壤或栽培区域。

[0173] 本发明还提供一种用于防治不想要的植物的方法,优选在有用植物作物中,其特征在于,将有效量的

[0174] -一种或多种如上文所定义的、优选在一个认定为优选或特别优选的实施方案中的通式(I)的化合物和/或其盐,特别是一种或多种在每种情况下如上文所定义的式(1-1)至(1-209)或(2-1)至(2-14)的化合物和/或其盐,或

[0175] -如下文所定义的本发明的组合物,

[0176] 施用于不想要的植物(例如有害植物,如单子叶杂草或双子叶杂草或不想要的作物植物)、不想要的植物的种子(即植物种子,例如谷粒、种子或营养繁殖器官(如块茎)或带芽的嫩枝部位)、不想要的植物在其中或其上生长的土壤(例如作物种植地或非作物种植地的土壤)或栽培区域(即不想要的植物在其上生长的区域)。

[0177] 本发明还进一步提供用于防治有害植物或用于调节植物(优选有用植物)生长的方法,其特征在于,将有效量的

[0178] -一种或多种如上文所定义的、优选在一个认定为优选或特别优选的实施方案中的通式(I)的化合物和/或其盐,特别是一种或多种在每种情况下如上文所定义的式(1-1)至(1-209)或(2-1)至(2-14)的化合物和/或其盐,或

[0179] -如下文所定义的本发明的组合物,

[0180] 施用于植物、植物的种子(即植物种子,例如谷粒、种子或营养繁殖器官(如块茎)或带芽的嫩枝部位)、植物在其中或其上生长的土壤(例如耕地或非耕地的土壤)或栽培区域(即植物在其上生长的区域)。

[0181] 在本上下文中,本发明的化合物或本发明的组合物可例如通过预播种(如果合适,还通过掺入土壤中)、苗前法和/或苗后法施用。可通过本发明的化合物防治的单子叶和双子叶杂草植物群的一些代表性的具体实例如下,尽管无意限于所列举的特定物种。

[0182] 在本发明的用于防治有害植物或用于调节植物生长的方法中,优选使用一种或多种通式(I)的化合物和/或其盐来防治有害植物或调节有用植物或观赏植物的作物的生长,其中在优选构型中,所述有用植物或观赏植物为转基因植物。

[0183] 本发明的通式(I)的化合物和/或其盐适于防治以下属的单子叶和双子叶有害植物:

[0184] 单子叶有害植物属: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)、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)、鹬草属(Phalaris)、梯牧草属(Phleum)、早熟禾属(Poa)、筒轴茅属(Rottboellia)、慈姑属(Sagittaria)、蔗草属(Scirpus)、狗尾草属(Setaria)、高粱属(Sorghum)。

[0185] 双子叶有害植物属:苘麻属(Abutilon)、苋属(Amaranthus)、豚草属(Ambrosia)、蔓锦葵属(Anoda)、春黄菊属(Anthemis)、蔷薇属(Aphanes)、蒿属(Artemisia)、滨藜属(Atriplex)、雏菊属(Bellis)、鬼针草属(Bidens)、荠属(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)、猪殃殃属(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)、山靛属(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)、菥蓂属(Thlaspi)、三叶草属(Trifolium)、荨麻属(Urtica)、婆婆纳属(Veronica)、堇菜属(Viola)、苍耳属(Xanthium)。

[0186] 当将本发明的通式(I)的化合物在有害植物(禾本科杂草和/或阔叶杂草)萌芽前施用至土壤表面(苗前法)时,可完全阻止禾本科杂草或阔叶杂草的幼苗出土,或其生长直至其到达子叶期,但随后停止生长并最终在三至四周后完全死亡。

[0187] 如果在出苗后将通式(I)的活性成分施用至植物的绿色部位,则生长在处理后停止,且所述有害植物停留在施用时的生长阶段,或其在一定时间后完全死亡,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。

[0188] 尽管本发明的通式(I)的化合物对单子叶和双子叶杂草显示出优良的除草活性,但仅轻微损害或一点也不损害经济上重要的作物的作物植物,这取决于本发明相应化合物的结构及其施用率,所述作物植物为例如双子叶作物属: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)、棉花属(Gossypium)、番薯属(Ipomoea)、莴苣属(Lactuca)、亚麻属(Linum)、番茄属(Lycopersicon)、芒属(Miscanthus)、烟草属(Nicotiana)、菜豆属(Phaseolus)、豌豆属(Pisum)、茄属(Solanum)、蚕豆属(Vicia),或单子叶作物属:葱属(Allium)、凤梨属(Ananas)、天门冬属(Asparagus)、燕麦属、大麦属(Hordeum)、稻属(Oryza)、黍属、甘蔗属(Saccharum)、黑麦属(Secale)、高粱属、黑小麦属(Triticale)、小麦属(Triticum)、玉蜀黍属(Zea)。由于这些原因,本发明化合物非常适于在植物作物(如农业上有用的植物或观赏植物)中选择性防治不想要的植物的生长。

[0189] 此外,本发明的通式(I)的化合物(根据其特殊结构和使用的施用率)在作物植物中具有优良的生长调节性能。它们通过调节作用干预植物自身的新陈代谢,并因此可例如通过引发脱水和矮化生长用于受控影响植物成分和促进采收。此外,它们还适于一般性防治和抑制不想要的营养生长,而在此过程中不会杀死植物。营养生长的抑制对许多单子叶和双子叶作物起重要作用,因为例如其可减少或完全防止倒伏。

[0190] 通式(I)的活性化合物凭借其除草和植物生长调节性能,也可被用于防治基因修饰植物作物或通过常规诱变而改性的植物作物中的有害植物。通常,转基因植物的特征在于特别有利的性能,例如对某些农药(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有关采收材料的数量、品质、贮存性、组成和具体成分。例如,存在已知的淀粉含量增加或淀粉

品质改变的转基因植物,或采收材料中具有不同脂肪酸组成的那些转基因植物。

[0191] 就转基因作物而言,优选将本发明的通式(I)的化合物和/或其盐用于经济上重要的有用植物和观赏植物的转基因作物中,例如谷类如小麦、大麦、黑麦、燕麦、黍、稻和玉米,或作物如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他植物。

[0192] 优选还将本发明的通式(I)的化合物在对除草剂的植物毒性作用具有抗性或已通过重组方法使其具有抗性的有用植物的作物中用作除草剂。

[0193] 本发明的通式(I)的化合物凭借其除草和植物生长调节性能,还可用于防治已知的或有待开发的基因修饰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性能,例如对某些农药(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有关采收材料的数量、品质、贮存性、组成和具体成分。例如,存在已知的淀粉含量增加或淀粉品质改变的转基因植物,或采收材料中具有不同脂肪酸组成的那些转基因植物。其他特定性能可为对非生物胁迫因素(例如热、冷、干旱、盐度和紫外线辐射)的耐受性或抗性。

[0194] 优选本发明的通式(I)的化合物或其盐在经济上重要的有用植物和观赏植物的转基因作物中的用途,所述转基因作物为例如谷类,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、黑小麦、黍、稻、木薯和玉米,或作物如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他植物。

[0195] 优选将通式(I)的化合物在对除草剂的植物毒性作用具有抗性或已通过重组方法使其具有抗性的有用植物的作物中用作除草剂。

[0196] 产生与现有植物相比具有改进的性能的新植物的常规方法包括例如传统培育方法和产生突变体。或者,具有改变的性能的新植物可借助于重组方法产生。

[0197] 大量的通过其可产生具有改进性能的新的转基因植物的分子生物技术是本领域技术人员已知的。对于这种遗传操作,可将允许通过DNA序列重组进行突变或序列改变的核酸分子引入到质粒中。借助于标准方法,例如可以进行碱基交换、移除部分序列或添加天然或合成序列。为将DNA片段彼此连接,可向片段中加入衔接子(adapter)或接头(linker)。

[0198] 例如,通过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,或通过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,可实现产生具有降低的基因产物活性的植物细胞。

[0199] 为此,首先可以使用包含基因产物的整个编码序列的DNA分子,所述基因产物包括可存在的任何侧翼序列,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需要足够长以在细胞中具有反义作用。还可以使用与基因产物的编码序列具有高度的同源性但不完全相同的DNA序列。

[0200] 当在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何所需区室中。然而,为实现在特定区室内的定位,例如可以将编码区连接到确保定位于特定区室中的DNA序列。此类序列是本领域技术人员已知的(参见,例如,Braun等人,EMBO J.11(1992),3219-3227)。核酸分子也可在植物细胞的细胞器中表达。

[0201] 可通过已知技术再生转基因植物细胞以产生整个植物。原则上,转基因植物可为任何所需植物种类的植物,即不仅有单子叶植物,还有双子叶植物。

[0202] 以这种方式可获得具有通过超表达、抑制(suppression)或抑制(inhibition)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的特性的转基因

植物。

[0203] 优选将本发明的通式(I)的化合物用于转基因作物中,所述转基因作物对生长调节剂(例如麦草畏(dicamba))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(glyphosate)、草铵膦(glufosinate)或苯甲酰基异噁唑类及类似的活性成分的除草剂具有抗性。

[0204] 当将本发明的通式(I)的化合物用于转基因作物中时,不仅发生在其他作物中观察到的对有害植物的功效,而且通常还发生对在特定的转基因作物中施用的特定功效,例如改变的或特别拓宽的可防治的杂草谱、可用于施用的改变的施用率、优选与转基因作物对其具有抗性的除草剂的良好的相容性,以及影响转基因作物植物的生长和产量。

[0205] 因此,本发明还涉及本发明的通式(I)的化合物和/或其盐作为除草剂任选地在转基因作物植物中用于防治有用植物或观赏植物的作物中的有害植物的用途。

[0206] 优选通过苗前法或苗后法在谷类中使用通式(I)的化合物,本文中所述谷类优选玉米、小麦、大麦、黑麦、燕麦、黍或稻。

[0207] 还优选通过苗前法或苗后法在大豆中使用通式(I)的化合物。

[0208] 本发明的通式(I)的化合物用于防治有害植物或用于植物的生长调节的用途还包括这样的情况,其中通式(I)的化合物或其盐直至在施用于植物上、植物中或土壤中之后才由前体物质(“前药”)形成。

[0209] 本发明还提供一种或多种通式(I)的化合物或其盐或本发明的组合物(如下文所定义)(在某种方法中)用于防治有害植物或用于调节植物生长的用途,其包括将有效量的一种或多种通式(I)的化合物或其盐施用于植物(有害植物,如果合适,与有用植物一起)、植物种子、植物在其中或其上生长的土壤或栽培区域。

[0210] 本发明还提供除草组合物和/或植物生长调节组合物,其特征在于,所述组合物包含

[0211] (a)一种或多种如上文所定义的、优选在一个认定为优选或特别优选的实施方案中的通式(I)的化合物和/或其盐,特别是一种或多种在每种情况下如上文所定义的式(1-1)至(1-209)或(2-1)至(2-14)的化合物和/或其盐,

[0212] 和

[0213] (b)一种或多种选自组(i)和/或(ii)的其他物质:

[0214] (i)一种或多种其他农业化学活性物质,优选选自杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、其他除草剂(即不符合上文所定义的通式(I)的那些)、杀真菌剂、安全剂、肥料和/或其他生长调节剂,

[0215] (ii)一种或多种常用于作物保护中的制剂助剂。

[0216] 本发明的组合物的组分(i)的其他农业化学活性物质优选选自"The Pesticide Manual",第16版,The British Crop Protection Council and the Royal Soc.of Chemistry,2012中提及的物质。

[0217] 本发明的除草组合物或植物生长调节组合物优选包含一种、两种、三种或更多种常用于作物保护中的制剂助剂(ii),所述制剂助剂选自表面活性剂、乳化剂、分散剂、成膜剂、增稠剂、无机盐、撒粉剂、在25℃和1013mbar下为固体的载体(优选吸附性颗粒状惰性材

料)、润湿剂、抗氧化剂、稳定剂、缓冲物质、消泡剂、水、有机溶剂(优选在25℃和1013mbar下与水以任意比例混溶的有机溶剂)。

[0218] 本发明的通式(I)的化合物可以常规制剂中的可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、可喷雾溶液剂、撒粉产品或颗粒剂的形式使用。因此,本发明还提供包含通式(I)的化合物和/或其盐的除草组合物和植物生长调节组合物。

[0219] 根据指定的生物学和/或物理化学参数,可以多种方式配制本发明的通式(I)的化合物和/或其盐。可能的制剂包括,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)、可喷洒颗粒剂、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。

[0220] 这些单个的制剂类型和制剂助剂(如惰性材料、表面活性剂、溶剂和其他添加剂)是本领域技术人员已知的,并且记载于例如以下文献中:Watkins,"Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers",第2版,Darland Books,Caldwell N.J.;H.v.Olphen,"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 and Wood,"Encyclopedia of Surface Active Agents",Chem.Publ.Co.Inc.,N.Y.1964;**Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte"**[Interface-active Ethylene Oxide Adducts],Wiss.Verlagsgesellschaft,Stuttgart 1976;Winnacker-Küchler,"Chemische Technologie",第7卷,C.Hanser Verlag Munich,第4版1986。

[0221] 可湿性粉剂为可在水中均匀分散的制剂,其除活性成分之外,还包含除稀释剂或惰性物质之外的离子型和/或非离子型的表面活性剂(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、烷基磺酸盐、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。为制备所述可湿性粉剂,在例如常规设备如锤式磨机、鼓风式磨机和喷气式磨机中细磨所述活性除草成分,并同时或随后与制剂助剂混合。

[0222] 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,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)。

[0223] 撒粉产品通过将活性成分与细分散的固体一起研磨而获得,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。

[0224] 悬浮浓缩剂可为水基或油基的。它们可借助标准的市售珠磨机并任选添加例如已在上文针对其他类型制剂列出的表面活性剂通过例如湿式研磨法制备。

[0225] 乳剂,例如水包油乳剂(EW),可使用含水有机溶剂和任选地例如已在上文针对其他制剂类型列出的表面活性剂,借助例如搅拌器、胶体磨机和/或静态混合器制备。

[0226] 颗粒剂可通过将活性成分喷洒到能够吸附的颗粒状惰性材料上而制备或借助胶黏剂(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(如砂、高岭土或颗粒状惰性材料)的表面上而制备。还可将合适的活性成分以常规用于制备肥料颗粒的方式——如果需要与肥料相混合——造粒。

[0227] 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。

[0228] 对于盘式颗粒、流化床颗粒、挤出颗粒和喷雾颗粒的制备,参见例如在"Spray-Drying Handbook"第3版1979,G.Goodwin 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。

[0229] 关于作物保护剂的制剂的其他详细信息,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。

[0230] 本发明的农业化学制剂、优选除草组合物或植物生长调节组合物优选包含总量为0.1至99重量%、优选0.5至95重量%、更优选1至90重量%、特别优选2至80重量%的通式(I)的活性成分及其盐。

[0231] 在可湿性粉剂中,所述活性成分的浓度为例如约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,所述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%。撒粉剂形式的制剂包含1重量%至30重量%的活性成分,优选地通常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,所述活性成分的含量部分取决于活性成分是液体形式还是固体形式,以及所使用的造粒助剂、填料等。在水分散性颗粒剂中,活性成分的含量为例如1重量%至95重量%,优选10重量%至80重量%。

[0232] 此外,所提及的活性成分制剂任选地包含各种常规的粘着剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂和溶剂、填料、载体和染料、消泡剂、蒸发抑制剂和影响pH和粘度的试剂。制剂助剂的实例尤其记载于"Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations",编辑D.A.Knowles,Kluwer Academic Publishers(1998)中。

[0233] 本发明的通式(I)的化合物或其盐可以其本身或以其与其他农药活性物质(例如杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、除草剂、杀真菌剂、安全剂、肥料和/或生长调节剂)结合的制剂(配方)形式使用,例如以成品制剂或桶混物的形式。考虑到要结合的活性成分的物理性质和稳定性,所述组合制剂可在上述制剂的基础上制备。

[0234] 在混合制剂或桶混物中,可用于本发明的通式(I)的化合物的组合配对物为,例如基于抑制以下酶的已知活性成分:例如乙酰乳酸合酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合酶、烯醇式丙酮莽草酸-3-磷酸合酶(enolpyruvylshikimate-3-phosphate synthase)、谷氨酰胺合酶、对羟基苯丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素脱氢酶(phytoene desaturase)、光系统I

(photosystem I)、光系统II、原卟啉原氧化酶(protoporphyrinogen oxidase),如在例如Weed Research 26(1986)441-445或“The Pesticide Manual”,第16版,The British Crop Protection Council and the Royal Soc.of Chemistry,2012以及其中引用的文献中所记载。

[0235] 备受关注的是选择性防治有用植物和观赏植物的作物中的有害植物。尽管本发明的通式(I)的化合物已经在大量的作物中表现出非常良好的至足够的选择性,但原则上,在一些作物中以及特别是还在与其他选择性较差的除草剂的混合物的情况下,可能发生对作物植物的植物毒性。在这点上,备受关注的本发明的通式(I)的化合物的结合物包含通式(I)的化合物或其与其他除草剂或农药和安全剂的结合物。以解毒有效量使用的安全剂降低了施用的除草剂/农药在例如以下作物中的植物毒性副作用:经济上重要的作物,如谷类(小麦、大麦、黑麦、玉米、稻、黍)、甜菜、甘蔗、油菜、棉花和大豆,优选谷类。

[0236] 除草剂(混合物)与安全剂的重量比通常取决于除草剂的施用率和所述安全剂的功效,且可在宽范围内变化,例如在200:1至1:200、优选100:1至1:100、特别是20:1至1:20的范围内。类似于通式(I)的化合物或其混合物,安全剂可与其他除草剂/农药一起配制,并可作为含除草剂的成品制剂或桶混物提供和使用。

[0237] 为进行施用,如果合适,以常规方式稀释市售形式的除草剂制剂或除草剂-安全剂制剂,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。撒粉剂形式的制剂、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通常在施用前不用其他惰性物质进一步稀释。

[0238] 通式(I)的化合物和/或其盐的施用率在一定程度上受外部条件如温度、湿度等的影响。所述施用率可在宽范围内变化。对于作为用于防治有害植物的除草剂的施用,通式(I)的化合物及其盐的总量优选为0.001至10.0kg/ha,优选0.005至5kg/ha,更优选0.01至1.5kg/ha,特别优选0.05至1kg/ha。这既适用于苗前施用,又适用于苗后施用。

[0239] 当将本发明的通式(I)的化合物和/或其盐用作植物生长调节剂,例如用作如上文所提及的那些作物植物(优选谷类植物,如小麦、大麦、黑麦、黑小麦、黍、稻或玉米)的茎秆稳定剂时,总施用率优选为0.001至2kg/ha,优选0.005至1kg/ha,特别是10至500g/ha,非常特别优选20至250g/ha。这既适用于苗前施用,又适用于苗后施用。

[0240] 作为茎秆稳定剂的施用可在植物生长的各个阶段进行。优选在例如分蘖期之后、纵向生长开始时施用。

[0241] 作为替代方案,作为植物生长调节剂的施用也可以通过处理种子(其包括用于拌种和包衣种子的各种技术)进行。所述施用率取决于特定的技术,并且可在初步试验中确定。

[0242] 在本发明的组合物中(例如在混合制剂或桶混物中),可用于本发明的通式(I)的化合物的组合配对物为,例如基于抑制以下酶的已知活性成分:例如乙酰乳酸合酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合酶、烯醇式丙酮莽草酸-3-磷酸合酶、谷氨酰胺合酶、对羟基苯丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素脱氢酶、光系统I、光系统II或原卟啉原氧化酶,如在例如Weed Research 26(1986)441-445或“The Pesticide Manual”,第16版,The British Crop Protection Council and the Royal Soc.of Chemistry,2012以及其中引用的文献中所记载。可与本发明的化合物结合的已知除草剂或植物生长调节剂为例如以下活性成分,其

中所述活性成分由其根据国际标准化组织(ISO)的“通用名称”或化学名称或代码编号指代。它们总是包括所有的使用形式,例如酸、盐、酯以及所有的异构形式,如立体异构体和光学异构体,即使它们未被明确提及。

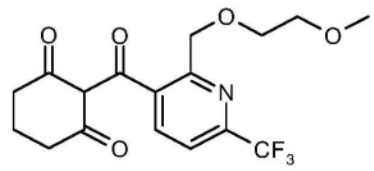
[0243] 这种除草混合配对物的实例为:

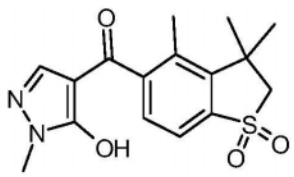
[0244] 乙草胺(acetochlor)、三氟羧草醚(acifluorfen、acifluorfen-sodium)、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、二丙烯草胺(allidochlor)、枯杀达(alloxydim、alloxydim-sodium)、莠灭净(ametryn)、氨唑草酮(amicarbazone)、先甲草胺(amidochlor)、酰嘧磺隆(amidosulfuron)、4-氨基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲基苯基)-5-氟吡啶-2-甲酸、环丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、环丙嘧啶酸钾(aminocyclopyrachlor-potassium)、环丙嘧啶酸甲酯(aminocyclopyrachlor-methyl)、氯氨吡啶酸(aminopyralid)、杀草强(amitrole)、氨基磺酸铵(ammoniumsulfamate)、莎稗磷(anilofos)、磺草灵(asulam)、莠去津(atrazine)、唑啶草酮(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、氟丁酰草胺(beflubutamid)、草除灵(benazolin、benazolin-ethyl)、乙丁氟灵(benfluralin)、呋草黄(benfuresate)、苄嘧磺隆(bensulfuron、bensulfuron-methyl)、地散磷(bensulide)、灭草松(bentazone)、双环磺草酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟吡草酮(bicyclopyron)、甲羧除草醚(bifenox)、双丙氨膦(bilanafos、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)、丁酰溴苯腈(bromoxynil-butyrate)、溴苯腈钾(bromoxynil-potassium)、庚酰溴苯腈(bromoxynil-heptanoate)和辛酰溴苯腈(bromoxynil-octanoate)、羟草酮(busoxinone)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、抑草磷(butamifos)、丁烯草胺(butenachlor)、仲丁灵(butralin)、丁苯草酮(butroxydim)、丁草敌(butylate)、唑草胺(cafenstrole)、双酰草胺(carbetamide)、唑酮草酯(carfentrazone、carfentrazone-ethyl)、草灭畏(chloramben)、氯溴隆(chlorbromuron)、伐草克(chlorfenac、chlorfenac-sodium)、燕麦酯(chlorfenprop)、甲基氯芴素(chlorflurenol、chlorflurenol-methyl)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron、chlorimuron-ethyl)、氯酞酰亚胺(chlorophthalim)、绿麦隆(chlorotoluron)、氯酞酸二甲酯(chlorthal-dimethyl)、氯磺隆(chlorsulfuron)、吲哚酮草酯(cinidon、cinidon-ethyl)、环庚草醚(cinmethylin)、醚磺隆(cinosulfuron)、氯酰草膦(clacyfos)、烯草酮(clethodim)、炔草酸(clodinafop)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、异噁草松(clomazone)、氯甲酰草胺(clomeprop)、二氯吡啶酸(clopyralid)、氯酯磺草胺(cloransulam、cloransulam-methyl)、苄草隆(cumyluron)、氨基氰(cyanamide)、氰草津(cyanazine)、环草敌(cycloate)、环哒嗪草酯(cyclopyrimorate)、环丙嘧磺隆(cyclosulfamuron)、噻草酮(cycloxydim)、氰氟草酯(cyhalofop、cyhalofop-butyl)、环草津(cyprazine)、2,4-D、2,4-D-丁氧基乙酯(2,4-D-butotyl)、2,4-D-丁酯(2,4-D-butyl)、2,4-D-二甲基铵(2,4-D-dimethylammonium)、2,4-D-二乙醇胺(2,4-D-diolamine)、2,4-D-乙酯(2,4-D-ethyl)、2,4-D-2-乙基己酯、2,4-D-异丁酯、2,4-D-异辛酯、2,4-D-异丙基铵、2,4-D-钾、2,4-D-三异丙醇铵和2,4-D-三乙醇胺、2,4-DB、2,4-DB-丁酯、2,4-DB-二甲基铵、2,4-DB-异辛酯、2,4-DB-钾和2,4-DB-钠、杀草隆(daimuron、dymron)、茅草枯(dalapon)、棉隆(dazomet)、正癸醇、甜菜安(desmedipham)、

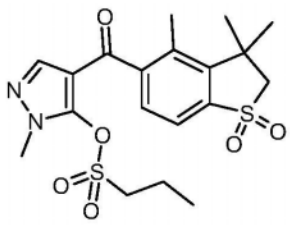
detosyl-pyrazolate(DTP)、麦草畏、敌草腈(dichlobenil)、2-(2,4-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、2-(2,5-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、精2,4-滴丙酸(dichlorprop-P)、禾草灵(diclofop、diclofop-methyl)、精禾草灵(diclofop-P-methyl)、双氯磺草胺(diclosulam)、野燕枯(difenzoquat)、吡氟酰草胺(diflufenican)、二氟吡隆(diflufenzopyr、diflufenzopyr-sodium)、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)、dimetrasulfuron、氨氟灵(dinitramine)、特乐酚(dinoterb)、双苯酰草胺(diphenamid)、敌草快(diquat、diquat-dibromid)、氟硫草定(dithiopyr)、敌草隆(diuron)、DNOC、茵多酸(endothal)、EPTC、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟灵(ethalfluralin)、胺苯磺隆(ethametsulfuron、ethametsulfuron-methyl)、乙嗪草酮(ethiozin)、乙氧呋草黄(ethofumesate)、氟乳醚(ethoxyfen、ethoxyfen-ethyl)、乙氧嘧磺隆(ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺(etobenzanid)、F-9600、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(fenoxaprop)、精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P)、噁唑禾草灵(fenoxaprop-ethyl)、精噁唑禾草灵(fenoxaprop-P-ethyl)、苯磺噁唑草(fenoxasulfone)、fenquinotrione、四唑酰草胺(fentrazamide)、麦草伏(flamprop)、高效麦草氟异丙酯(flamprop-M-isopropyl)、高效麦草氟甲酯(flamprop-M-methyl)、啶嘧磺隆(flazasulfuron)、双氟磺草胺(florasulam)、吡氟禾草灵(fluazifop)、精吡氟禾草灵(fluazifop-P)、吡氟禾草灵丁酯(fluazifop-butyl)、精吡氟禾草灵丁酯(fluazifop-P-butyl)、氟酮磺隆(flucarbazone、flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氯乙氟灵(fluchloralin)、氟噻草胺(flufenacet)、氟哒嗪草酯(flufenpyr、flufenpyr-ethyl)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟烯草酸(flumiclorac、flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、氟草隆(fluometuron)、抑草丁(flurenol)、芴醇丁酯(flurenol-butyl)、芴醇二甲铵(flurenol-dimethylammonium)和芴醇甲酯(flurenol-methyl)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen、fluoroglycofen-ethyl)、四氟丙酸(flupropanate)、氟啶嘧磺隆(flupyrsulfuron、flupyrsulfuron-methyl-sodium)、氟啶草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氯氟吡氧乙酸(fluroxypyr、fluroxypyr-meptyl)、呋草酮(flurtamone)、嗪草酸(fluthiacet)、嗪草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、氟磺胺草醚(fomesafen)、氟磺胺草醚钠(fomesafen-sodium)、甲酰氨磺隆(foramsulfuron)、杀木膦(fosamine)、草铵膦、草铵膦铵、精草铵膦钠(glufosinate-P-sodium)、精草铵膦铵、精草铵膦钠、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、草甘膦钠和草硫膦(glyphosate-trimesium)、H-9201(即O-(2,4-二甲基-6-硝基苯基)O-乙基异丙基硫代磷酰胺酯(O-(2,4-dimethyl-6-nitrophenyl)O-ethyl isopropylphosphoramidothioate))、氟氯吡啶酯(halauxifen、halauxifen-methyl)、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron、halosulfuron-methyl)、氟吡禾灵(haloxyfop)、精氟吡禾灵(haloxyfop-P)、氟吡禾灵乙氧基乙酯、精氟吡禾灵乙氧基乙酯、氟吡甲禾灵(haloxyfop-methyl)、精氟吡甲禾灵(haloxyfop-P-methyl)、环嗪酮(hexazinone)、HW-02(即(2,4-二氯苯氧基)乙酸1-(二甲氧

基磷酰基)乙酯)、咪草酯(imazamethabenz、imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟(imazamox)、甲氧咪草烟铵、甲咪唑烟酸(imazapic)、甲咪唑烟酸铵、咪唑烟酸(imazapyr)、咪唑烟酸异丙基铵、咪唑喹啉酸(imazaquin)、咪唑喹啉酸铵、咪唑乙烟酸(imazethapyr)、咪唑乙烟酸亚铵(imazethapyr-immonium)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、茚草酮(indanofan)、三嗪茚草胺(indaziflam)、碘甲磺隆(iodosulfuron、iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(ioxynil)、辛酰碘苯腈(ioxynil-octanoate)、碘苯腈钾和碘苯腈钠、三唑酰草胺(ipfencarbazone)、异丙隆(isoproturon)、异噁隆(isouron)、异噁酰草胺(isoxaben)、异噁唑草酮(isoxaflutole)、特胺灵(karbutilate)、KUH-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)、ketospiradox、乳氟禾草灵(lactofen)、环草定(lenacil)、利谷隆(linuron)、MCPA、MCPA-丁氧基乙酯、MCPA-二甲基铵、MCPA-2-乙基己酯、MCPA-异丙基铵、MCPA-钾和MCPA-钠、MCPB、MCPB-甲酯、MCPB-乙酯和MCPB-钠、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、2-甲-4-氯丙酸钠和2-甲-4-氯丙酸丁氧基乙酯、精2-甲-4-氯丙酸(mecoprop-P)、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(mefenacet)、氟磺酰草胺(mefluidide)、甲基二磺隆(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)、苯嗪草酮(metamitron)、吡唑草胺(metazachlor)、嗪吡嘧磺隆(metazosulfuron)、甲基苯噻隆、甲硫嘧磺隆(methiopyrsulfuron)、甲硫唑草啉(methiozolin)、异硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、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(molinat)、绿谷隆(monolinuron)、单嘧磺隆(monosulfuron)、单嘧磺酯(monosulfuron-ester)、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(napropamide)、NC-310(即4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄氧基吡唑)、草不隆(neburon)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、壬酸(pelargonic acid)、氟草敏(norflurazon)、油酸(脂肪酸)、坪草丹(orbencarb)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、氨磺乐灵(oryzalin)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、噁草酮(oxadiazon)、环氧嘧磺隆(oxasulfuron)、噁嗪草酮(oxaziclomefon)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、百草枯(paraquat、paraquat dichloride)、克草猛(pebulate)、二甲戊灵(pendimethalin)、五氟磺草胺(penoxsulam)、五氯苯酚(pentachlorphenol)、环戊噁草酮(pentoxazone)、烯草胺(pethoxamid)、矿物油(petroleum oils)、甜菜宁(phenmedipham)、氨氯吡啶酸(picloram)、氟吡酰草胺(picolinafen)、唑啉草酯(pinoxaden)、哌草磷(piperophos)、丙草胺(pretilachlor)、氟嘧磺隆(primisulfuron、primisulfuron-methyl)、氨氟乐灵(prodiamine)、环苯草酮(profoxydim)、扑灭通(prometon)、扑草净(prometryn)、毒草胺(propachlor)、敌稗(propanil)、噁草酸(propaquizafop)、扑灭津(propazine)、苯胺灵(propham)、异丙草胺(propisochlor)、丙苯磺隆(propoxycarbazone、propoxycarbazone-sodium)、丙嗪嘧磺隆(propyrisulfuron)、炔苯酰草胺(propyzamide)、苄草丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、双唑草腈(pyraclonil)、吡草醚(pyraflufen、pyraflufen-ethyl)、磺酰草吡唑(pyrasulfotole)、吡唑特(pyrazolynate、pyrazolate)、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron、

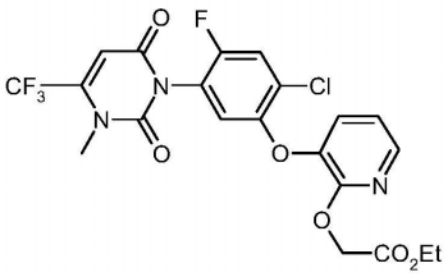
pyrazosulfuron-ethyl)、苄草唑(pyrazoxyfen)、pyribambenz、异丙酯草醚(pyribambenz-isopropyl)、丙酯草醚(pyribambenz-propyl)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、达草止(pyridafol)、哒草特(pyridate)、环酯草醚(pyriftalid)、嘧草醚(pyriminobac、pyriminobac-methyl)、嘧氟磺草胺(pyrimisulfan)、嘧草硫醚(pyrithiobac、pyrithiobac-sodium)、砜吡草唑(pyroxasulfone)、甲氧磺草胺(pyroxsulam)、二氯喹啉酸(quinclorac)、氯甲喹啉酸(quinmerac)、灭藻醌(quinoclamine)、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)、砜嘧磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、烯禾啶(sethoxydim)、环草隆(siduron)、西玛津(simazine)、西草净(simetryn)、SL-261、磺草酮(sulcotrion)、甲磺草胺(sulfentrazone)、甲嘧磺隆(sulfometuron、sulfometuron-methyl)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、SYN-523、SYP-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(三氟乙酸)、TCA-钠、丁噻隆(tebuthiuron)、呋喃磺草酮(tefuryltrione)、环磺酮(tembotrione)、吡喃草酮(tepraloxydim)、特草定(terbacil)、特草灵(terbucarb)、特丁通(terbumeton)、特丁津(terbuthylazin)、特丁净(terbutryn)、噻吩草胺(thenylchlor)、噻唑烟酸(thiazopyr)、噻酮磺隆(thiencarbazone、thiencarbazone-methyl)、噻吩磺隆(thifensulfuron、thifensulfuron-methyl)、禾草丹(thiobencarb)、氟嘧硫草酯(tiafenacil)、tolpyralate、苯吡唑草酮(topramezone)、三甲苯草酮(tralkoxydim)、氟酮磺草胺(triafamone)、野麦畏(tri-allate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、三唑氟草胺(triaziflam)、苯磺隆(tribenuron、tribenuron-methyl)、三氯吡氧乙酸(triclopyr)、草达津(trietazine)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron、trifloxysulfuron-sodium)、三氟草嗪(trifludimoxazin)、氟乐灵(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron、triflusulfuron-methyl)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、硫酸脲、灭草敌(vernolate)、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),以及以下化合物:







[0245]



[0246] 作为可能的混合配对物的植物生长调节剂的实例为:

[0247] 活化酯(acibenzolar)、苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、5-氨基乙酰丙酸、嘧啶醇(ancymidol)、6-苄基氨基嘌呤、芸苔素内酯(brassinolide)、邻苯二酚(catechol)、矮壮素(chlormequat chloride)、调果酸(cloprop)、环丙酸酰胺(cyclanilide)、3-(环丙-1-烯基)丙酸、丁酰肼(daminozide)、棉隆、正癸醇、调呋酸(dikegulac)、调呋酸钠(dikegulac-sodium)、茵多酸(endothal)、茵多酸二钾(endothal-dipotassium)、茵多酸二钠(endothal-disodium)和茵多酸单(N,N-二甲基烷基铵)、乙烯利(ethephon)、氟节胺(flumetralin)、抑草丁、芴醇丁酯、呋嘧醇(flurprimidol)、氯吡脲(forchlorfenuron)、赤霉酸(gibberellic acid)、抗倒胺(inabenfide)、吲哚-3-乙酸(IAA)、4-吲哚-3-基丁酸、稻瘟灵(isoprothiolane)、烯丙苯噻唑(probenazole)、茉莉酸(jasmonic acid)、茉莉酸甲酯、马来酰肼、助壮素(mepiquat chloride)、1-甲基环丙烯、2-(1-萘基)乙酰胺、1-萘基乙酸、2-萘氧基乙酸、硝基苯酚盐混合物(nitrophenolate mixture)、4-氧代-4[(2-苯基乙基)氨基]丁酸、多效唑(paclobutrazole)、N-苯基邻苯二甲酸、调环酸(prohexadione)、调环酸钙(prohexadione-calcium)、茉莉酮(prohydrojasmone)、水杨酸、独角金内酯(strigolactone)、四氧硝基苯(tecnazene)、噻苯隆(thidiazuron)、三十烷醇(triacontanol)、抗倒酯(trinexapac、trinexapac-ethyl)、tsitodef、烯效唑(uniconazole)、精烯效唑(uniconazole-P)。

[0248] 本发明的通式(I)的化合物的有用的组合配对物还包括例如以下安全剂:

[0249] S1)选自杂环羧酸衍生物类的化合物:

[0250] $S1^a$)二氯苯基吡唑啉-3-羧酸类化合物($S1^a$),优选化合物例如

[0251] 1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-羧酸、

[0252] 1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-羧酸乙酯(S1-1)(“吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)”)及相关化合物,如WO-A-91/07874中所记载;

[0253] $S1^b$)二氯苯基吡唑羧酸的衍生物($S1^b$),优选化合物例如1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基吡唑-3-羧酸乙酯(S1-2)、1-(2,4-二氯苯基)-5-异丙基吡唑-3-羧酸乙酯(S1-3)、1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)吡唑-3-羧酸乙酯(S1-4)及相关化合物,如EP-A-333131和EP-A-269806中所记载;

[0254] $S1^c$)1,5-二苯基吡唑-3-羧酸的衍生物($S1^c$),优选化合物例如1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基吡唑-3-羧酸乙酯(S1-5)、1-(2-氯苯基)-5-苯基吡唑-3-羧酸甲酯(S1-6)及相关化合物,如例如EP-A-268554中所记载;

[0255] $S1^d$)三唑羧酸类化合物($S1^d$),优选化合物例如解草唑(fenchlorazole)

[0256] (乙酯),即1-(2,4-二氯苯基)-5-三氯甲基-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯(S1-7),以及相关化合物,如EP-A-174562和EP-A-346620中所记载;

[0257] $S1^e$)5-苄基-2-异噁唑啉-3-羧酸类或5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸类或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸类化合物($S1^e$),优选化合物例如5-(2,4-二氯苄基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-8)或5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-9)及相关化合物,如WO-A-91/08202中所记载;或5,5-二苯基-2-异噁唑啉羧酸(S1-10)或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-11)(“双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)”)或5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸正丙酯(S1-12)或5-(4-氟苯基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯(S1-13),如专利申请WO-A-95/07897中所记载。

[0258] S2)选自8-喹啉氧基衍生物类的化合物(S2)：

[0259] $S2^a$)8-喹啉氧基乙酸类化合物($S2^a$)，优选(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸1-甲基己酯(“解草酯(cloquintocet-mexyl)”)(S2-1)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸1,3-二甲基丁-1-基酯(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-亚丙基亚氨基氧基)-1-乙基酯(S2-8)、(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸2-氧代丙-1-基酯(S2-9)及相关化合物，如EP-A-86750、EP-A-94349和EP-A-191736或EP-A-0 492 366中所记载；以及(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸(S2-10)及其水合物和盐，例如其锂盐、钠盐、钾盐、钙盐、镁盐、铝盐、铁盐、铵盐、季铵盐、锍盐或鏻盐，

[0260] 如WO-A-2002/34048中所记载；

[0261] $S2^b$)(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸类化合物($S2^b$)，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)丙二酸甲基乙基酯及相关化合物，如EP-A-0 582 198中所记载。

[0262] S3)二氯乙酰胺类活性成分(S3)，其通常用作出苗前安全剂(作用于土壤的安全剂)，例如

[0263] “二氯丙烯胺(dichlormid)”(N,N-二烯丙基-2,2-二氯乙酰胺)(S3-1)，

[0264] 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)，

[0265] 购自Stauffer的“R-28725”(3-二氯乙酰基-2,2,-二甲基-1,3-噁唑烷)(S3-3)，

[0266] “解草嗪(benoxacor)”(4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪)(S3-4)，

[0267] 购自PPG Industries的“PPG-1292”(N-烯丙基-N-[(1,3-二氧杂环戊烷-2-基)甲基]二氯乙酰胺)(S3-5)，

[0268] 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)，

[0269] 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)，

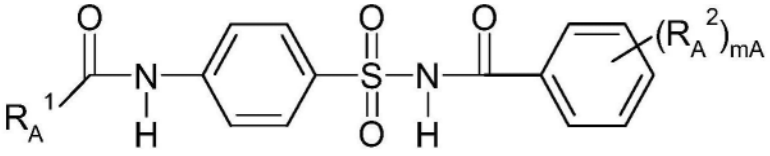
[0270] 购自TRI-Chemical RT的“TI-35”(1-二氯乙酰基氮杂环庚烷)(S3-8)，

[0271] 购自BASF的“diclonon”(dicyclonon)或“BAS145138”或“LAB145138”(S3-9)((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)，

[0272] “解草噁唑(furilazole)”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)及其(R)异构体(S3-11)。

[0273] S4)酰基磺酰胺类的化合物(S4)：

[0274] $S4^a$)式($S4^a$)的N-酰基磺酰胺及其盐，如WO-A-97/45016中所记载，

[0275] 

($S4^a$)

[0276] 其中

[0277] R_A^1为(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基,其中后2个基团被v_A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,还可被(C_1-C_4)-烷基和(C_1-C_4)-卤代烷基取代;

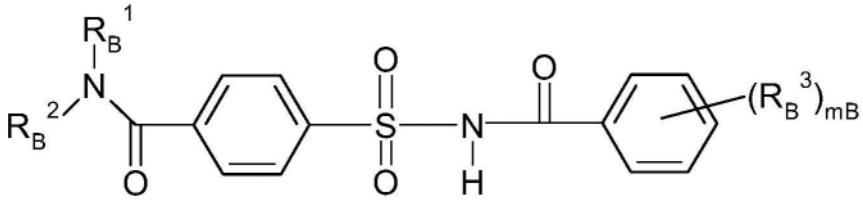
[0278] R_A^2为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、CF_3;

[0279] m_A为1或2;

[0280] v_A为0、1、2或3;

[0281] $S4^b$)式($S4^b$)的4-(苯甲酰基氨磺酰基)苯甲酰胺类的化合物及其盐,

[0282] 如WO-A-99/16744中所记载,

[0283] 
(S4b)

[0284] 其中

[0285] R_B^1、R_B^2独立地为氢、(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基、(C_3-C_6)-烯基、

[0286] (C_3-C_6)-炔基,

[0287] R_B^3为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-卤代烷基或(C_1-C_4)-烷氧基,并且

[0288] m_B为1或2,

[0289] 例如以下的化合物,其中

[0290] R_B^1=环丙基,R_B^2=氢,且(R_B^3)=2-OMe(“环丙磺酰胺(cyprosulfamide)”,S4-1),

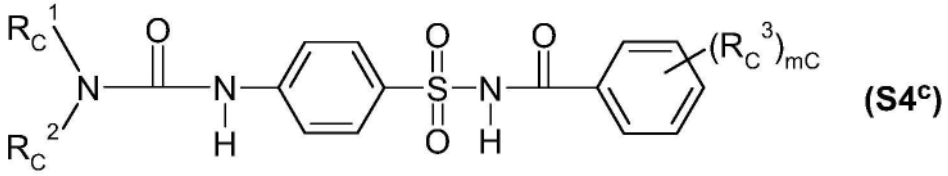
[0291] R_B^1=环丙基,R_B^2=氢,且(R_B^3)=5-Cl-2-OMe(S4-2),

[0292] R_B^1=乙基,R_B^2=氢,且(R_B^3)=2-OMe(S4-3),

[0293] R_B^1=异丙基,R_B^2=氢,且(R_B^3)=5-Cl-2-OMe(S4-4),和

[0294] R_B^1=异丙基,R_B^2=氢,且(R_B^3)=2-OMe(S4-5);

[0295] $S4^c$)式($S4^c$)的苯甲酰基氨磺酰基苯基脲类的化合物,如EP-A-365484中所记载,

[0296] 
(S4c)

[0297] 其中

[0298] R_C^1、R_C^2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,

[0299] R_C^3为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、CF_3,并且

[0300] m_C为1或2;

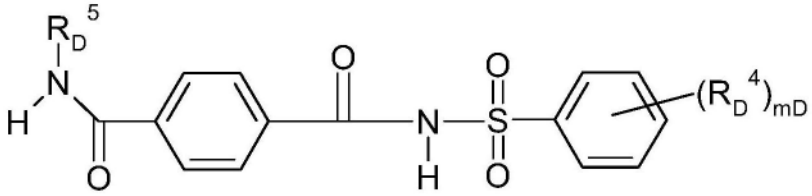
[0301] 例如

[0302] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲,

[0303] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲,

[0304] 1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨磺酰基)苯基]-3-甲基脲;

[0305] $S4^d$)式($S4^d$)的N-苯基磺酰基对苯二甲酰胺类的化合物及其盐,其例如由CN 101838227已知,

[0306] 

(S4d)

[0307] 其中

[0308] R_D^4为卤素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、CF_3；

[0309] M_D为1或2；

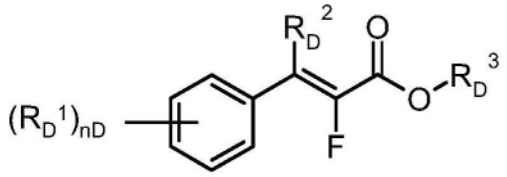
[0310] R_D^5为氢、(C_1-C_6)-烷基、(C_3-C_6)-环烷基、(C_2-C_6)-烯基、(C_2-C_6)-炔基、(C_5-C_6)-环烯基。

[0311] S5)羟基芳族化合物类和芳族-脂族羧酸衍生物类的活性成分(S5)，例如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WO-A-2004/084631、WO-A-2005/015994、WO-A-2005/016001中所记载。

[0312] S6)1,2-二氢喹喔啉-2-酮类的活性成分(S6)，例如1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹喔啉-2-酮、1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹喔啉-2-硫酮、1-(2-氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹喔啉-2-酮盐酸盐、1-(2-甲基磺酰基氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹喔啉-2-酮，如WO-A-2005/112630中所记载。

[0313] S7)二苯基甲氧基乙酸衍生物类的化合物(S7)，例如二苯基甲氧基乙酸甲酯(CAS登记号41858-19-9)(S7-1)、二苯基甲氧基乙酸乙酯或二苯基甲氧基乙酸，如WO-A-98/38856中所记载。

[0314] S8)式(S8)的化合物或其盐，如WO-A-98/27049中所记载，

[0315] 

(S8)

[0316] 其中各符号和角标定义如下：

[0317] R_D^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，

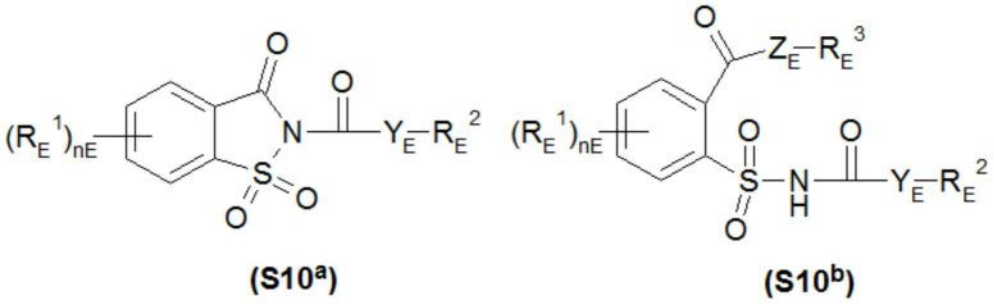
[0318] R_D^2为氢或(C_1-C_4)-烷基，

[0319] R_D^3为氢、(C_1-C_8)-烷基、(C_2-C_4)-烯基、(C_2-C_4)-炔基或芳基，其中上述含碳基团中的每一个均为未取代的或被一个或多个、优选最高达3个相同或不同的选自卤素和烷氧基的基团取代；

[0320] n_D为0至2的整数。

[0321] S9)3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮类的活性成分(S9)，例如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WO-A-1999/000020中所记载。

[0322] S10)式$(S10^a)$或$(S10^b)$的化合物，如WO-A-2007/023719和WO-A-2007/023764中所记载，

[0323] 

(S10a) (S10b)

[0324] 其中

[0325] R_E^1为卤素、(C_1-C_4)-烷基、甲氧基、硝基、氰基、CF_3、OCF_3，

[0326] Y_E、Z_E独立地为O或S，

[0327] n_E为0至4的整数，

[0328] R_E^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，

[0329] R_E^3为氢或(C_1-C_6)-烷基。

[0330] S11)氧基亚氨基化合物类的活性成分(S11)，其已知为拌种剂，例如

[0331] “解草腈(oxabetrinil)”((Z)-1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲氧基亚氨基(苯基)乙腈)(S11-1)，其已知为拌种安全剂用于黍/高粱来抵抗异丙甲草胺的损害，

[0332] “氟草肟(fluxofenim)”(1-(4-氯苯基)-2,2,2-三氟-1-乙酮O-(1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基)肟)(S11-2)，其已知为拌种安全剂用于黍/高粱来抵抗异丙甲草胺的损害，以及

[0333] “解草胺腈(cyometrinil)”或“CGA-43089”((Z)-氰基甲氧基亚氨基(苯基)乙腈)(S11-3)，其已知为拌种安全剂用于黍/高粱来抵抗异丙甲草胺的损害。

[0334] S12)异硫代苯并二氢吡喃酮类(isothiochromanones)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WO-A-1998/13361中的相关化合物。

[0335] S13)组(S13)的一种或多种化合物：

[0336] “萘二甲酸酐”(1,8-萘二甲酸酐)(S13-1)，其已知为拌种安全剂用于玉米来抵抗硫代氨基甲酸酯除草剂的损害，

[0337] “解草啶(fenclorim)”(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，

[0338] “解草胺(flurazole)”(2-氯-4-三氟甲基-1,3-噻唑-5-甲酸苄酯)(S13-3)，其已知为拌种安全剂用于黍/高粱来抵抗甲草胺和异丙甲草胺的损害，

[0339] 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)，其已知为安全剂用于玉米来抵抗咪唑啉酮的损害，

[0340] 购自Nitrokemia的“MG 191”(CAS登记号96420-72-3)(2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧杂环戊烷)(S13-5)，其已知为用于玉米的安全剂，

[0341] 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)，

[0342] “乙拌磷(disulfoton)”(S-2-乙硫基乙基二硫代磷酸O,O-二乙基酯)(S13-7)，

[0343] “增效磷(dietholate)”(O-苯基硫代磷酸O,O-二乙基酯)(S13-8)，

[0344] “mephenate”(甲基氨基甲酸4-氯苯基酯)(S13-9)。

[0345] S14)除了对有害植物具有除草作用以外,还对作物植物如稻具有安全剂作用的活性成分,例如

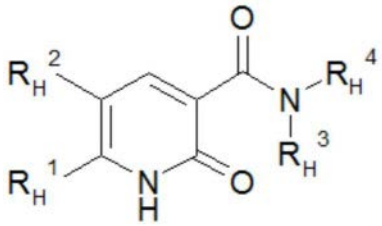
[0346] “哌草丹”或“MY-93”(1-苯基乙基哌啶-1-硫代甲酸S-1-甲基酯),其已知为安全剂用于稻来抵抗除草剂禾草敌的损害,“杀草隆”或“SK 23”(1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-对甲苯基脲),其已知为安全剂用于稻来抵抗除草剂唑吡嘧磺隆的损害,

[0347] “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-60087270),其已知为安全剂用于稻来抵抗一些除草剂的损害,

[0348] “苯草酮(methoxyphenone)”或“NK 049”(3,3’-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮),其已知为安全剂用于稻来抵抗一些除草剂的损害,

[0349] 购自Kumiai的“CSB”(1-溴-4-(氯甲基磺酰基)苯)(CAS登记号54091-06-4),其已知为安全剂用于在稻中抵抗一些除草剂的损害。

[0350] S15)式(S15)的化合物或其互变异构体

[0351]  (S15)

[0352] 如WO-A-2008/131861和WO-A-2008/131860中所记载

[0353] 其中

[0354] R_H^1为(C_1-C_6)-卤代烷基,并且

[0355] R_H^2为氢或卤素,并且

[0356] 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,

[0357] 其中,后3个基团中的每一个均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、未取代或取代的(C_3-C_6)-环烷基、未取代或取代的苯基以及未取代或取代的杂环基,

[0358] 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,

[0359] 其中,后4个基团中的每一个均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、未取代或取代的(C_3-C_6)-环烷基、未取代或取代的苯基以及未取代或取代的杂环基,

[0360] 或

[0361] 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,并且

[0362] R_H^4为氢或(C_1-C_4)-烷基,或

[0363] 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,所述杂环除氮原子以外,还可含有其他环杂原子,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。

[0364] 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成分,例如

[0365] (2,4-二氯苯氧基)乙酸(2,4-D),

[0366] (4-氯苯氧基)乙酸,

[0367] (R,S)-2-(4-氯-邻甲苯氧基)丙酸(2-甲-4-氯丙酸),

[0368] 4-(2,4-二氯苯氧基)丁酸(2,4-DB),

[0369] (4-氯-邻甲苯氧基)乙酸(MCPA),

[0370] 4-(4-氯-邻甲苯氧基)丁酸,

[0371] 4-(4-氯苯氧基)丁酸,

[0372] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸(麦草畏),

[0373] 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸1-(乙氧基羰基)乙酯(lactidichloro-ethyl)。

[0374] 与本发明的通式(I)的化合物和/或其盐、特别是与式(1-1)至(1-209)或(2-1)至(2-14)的化合物和/或其盐结合的优选的安全剂为:解草酯、环丙磺酰胺、解草唑乙酯、双苯噁唑酸、吡唑解草酯、解草啶、苄草隆、S4-1和S4-5,且特别优选的安全剂为:解草酯、环丙磺酰胺、双苯噁唑酸和吡唑解草酯。

[0375] 生物实施例

[0376] 在下文的实施例和表格中,使用以下缩写:

[0377] 不想要的植物/杂草

[0378] ABUTH:苘麻(Abutilon theophrasti)

[0379] ALOMY:大穗看麦娘(Alopecurus myosuroides)

[0380] AMARE:反枝苋(Amaranthus retroflexus)

[0381] DIGSA:马唐(Digitaria sanguinalis)

[0382] ECHCG:稗草(Echinochloa crus-galli)

[0383] KCHSC:地肤(Kochia scoparia)

[0384] LOLRI:硬直黑麦草(Lolium rigidum)

[0385] MATIN:淡甘菊(Matricaria inodora)

[0386] POAAN:早熟禾(Poa annua)

[0387] SETVI:狗尾草(Setaria viridis)

[0388] STEME:繁缕(Stellaria media)

[0389] VERPE:阿拉伯婆婆纳(Veronica persica)

[0390] VIOTR:三色堇(Viola tricolor)

[0391] A.在1280g/ha下的苗后除草功效

[0392] 将单子叶和双子叶杂草植物的种子置于塑料盆中的沙壤土中(在每种情况下每盆播种一种单子叶或双子叶杂草植物,播种两次),用土壤覆盖并在受控生长条件下在温室中栽培。在播种后2至3周,在一叶期时对试验植物进行处理。在相当于每公顷600升的水施用率并加入0.5%添加剂的情况下,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剂施用至植物的绿色部位。在试验植物已在最佳生长条件下在温室中保持约3周后,与未处理的对照组相比,目测评估所述制剂的活性。

[0393] 例如,100%活性=植物已经死亡,0%活性=与对照植物类似。

[0394] 下表A1至A12示出了选定的表1的通式(I)的化合物对各种有害植物的效果且相应的施用率为1280g/ha,所述效果通过上文指定的试验方法获得。

[0395] 表A1:在1280g/ha下对ABUTH的以%计的苗后功效

[0396]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-1	1280	90
1-3	1280	90
1-23	1280	100
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-31	1280	100
1-35	1280	100

[0397]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-41	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-81	1280	90
1-87	1280	100
1-89	1280	90
1-90	1280	90
1-91	1280	100
1-92	1280	90
1-93	1280	90
1-95	1280	100
1-96	1280	100
1-97	1280	100
1-99	1280	90
1-100	1280	90
1-101	1280	90
1-103	1280	100

[0398]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	90
1-110	1280	90
1-111	1280	90
1-112	1280	100
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

[0399] 表A2:在1280g/ha下对ALOMY的以%计的苗后功效

[0400]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ALOMY
1-35	1280	90
1-40	1280	100
1-54	1280	90
1-55	1280	90
1-66	1280	90
1-130	1280	90
1-133	1280	90

[0401] 表A3:在1280g/ha下对AMARE的以%计的苗后功效

[0402]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-1	1280	100
1-3	1280	90

[0403]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-23	1280	100
1-26	1280	100
1-27	1280	100
1-29	1280	90
1-31	1280	90
1-32	1280	90
1-34	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-41	1280	90
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-68	1280	100
1-69	1280	90
1-70	1280	90
1-71	1280	100

[0404]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-73	1280	90
1-74	1280	90
1-75	1280	90
1-76	1280	90
1-77	1280	90
1-78	1280	90
1-80	1280	100
1-81	1280	90
1-82	1280	100
1-87	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-94	1280	90
1-95	1280	100
1-96	1280	100
1-97	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	100
1-110	1280	100
1-111	1280	100

[0405]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-112	1280	100
1-119	1280	100
1-123	1280	100
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	100

[0406] 表A4:在1280g/ha下对DIGSA的以%计的苗后功效

[0407]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-1	1280	90
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-35	1280	90
1-37	1280	90
1-38	1280	90
1-40	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	90
1-54	1280	90
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90

[0408]

1-59	1280	100
1-66	1280	100
1-90	1280	90
1-91	1280	90
1-92	1280	90
1-99	1280	90
1-104	1280	100
1-112	1280	90
1-131	1280	90
1-133	1280	100

[0409] 表A5:在1280g/ha下对ECHCG的以%计的苗后功效

[0410]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-31	1280	100
1-35	1280	100
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	90
1-65	1280	90
1-66	1280	100

[0411]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-81	1280	90
1-87	1280	90
1-96	1280	90
1-99	1280	100
1-101	1280	90
1-104	1280	100
1-106	1280	90
1-112	1280	90
1-130	1280	90
1-131	1280	100
1-133	1280	100

[0412] 表A6:在1280g/ha下对KCHSC的以%计的苗后功效

[0413]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-1	1280	90
1-3	1280	90
1-23	1280	90
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-39	1280	90
1-40	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	90
1-52	1280	90

[0414]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-69	1280	90
1-71	1280	100
1-82	1280	90
1-87	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100
1-96	1280	90
1-97	1280	100
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	90
1-110	1280	90

[0415]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

[0416] 表A7:在1280g/ha下对LOLRI的以%计的苗后功效

[0417]

实施例编号	剂量 [g/ha]	LOLRI
1-35	1280	90
1-40	1280	100
1-56	1280	90
1-66	1280	90
1-110	1280	90
1-133	1280	100

[0418] 表A8:在1280g/ha下对MATIN的以%计的苗后功效

[0419]

实施例编号	剂量 [g/ha]	MATIN
1-55	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-70	1280	90
1-131	1280	90

[0420] 表A9:在1280g/ha下对POAAN的以%计的苗后功效

[0421]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POAAN
1-1	1280	90
1-3	1280	100
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-31	1280	90
1-33	1280	90
1-35	1280	90
1-37	1280	100
1-38	1280	90
1-40	1280	90
1-41	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-74	1280	90
1-77	1280	90
1-87	1280	100
1-90	1280	100

[0422]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POAAN
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-94	1280	90
1-95	1280	100
1-96	1280	90
1-97	1280	100
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	100
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-123	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

[0423] 表A10:在1280g/ha下对SETVI的以%计的苗后功效

[0424]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI

[0425]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-23	1280	90
1-26	1280	90
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-31	1280	90
1-35	1280	90
1-38	1280	90
1-40	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-59	1280	90
1-65	1280	90
1-66	1280	100
1-74	1280	90
1-87	1280	90
1-91	1280	90
1-92	1280	100
1-95	1280	90
1-99	1280	90
1-100	1280	90
1-103	1280	90
1-104	1280	90
1-112	1280	90
1-127	1280	90
1-130	1280	90

[0426]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-131	1280	90
1-133	1280	100

[0427] 表A11:在1280g/ha下对STEME的以％计的苗后功效

[0428]

实施例编号	剂量 [g/ha]	STEME
1-1	1280	100
1-3	1280	90
1-8	1280	90
1-23	1280	90
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-31	1280	90
1-32	1280	90
1-33	1280	90
1-34	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	90
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100

[0429]

实施例编号	剂量 [g/ha]	STEME
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-69	1280	90
1-70	1280	90
1-71	1280	90
1-77	1280	90
1-80	1280	90
1-87	1280	90
1-90	1280	90
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-95	1280	100
1-96	1280	90
1-97	1280	90
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	90
1-101	1280	90
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	100
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	100
1-123	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	100

[0430]

实施例编号	剂量 [g/ha]	STEME
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

[0431] 表A12:在1280g/ha下对VERPE的以%计的苗后功效

[0432]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-1	1280	100
1-3	1280	90
1-8	1280	100
1-23	1280	100
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-29	1280	100
1-30	1280	90
1-31	1280	90
1-32	1280	90
1-33	1280	90
1-34	1280	100
1-35	1280	100
1-36	1280	90
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-39	1280	100
1-40	1280	100
1-41	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	100

[0433]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-51	1280	100
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-60	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-69	1280	100
1-70	1280	90
1-71	1280	90
1-73	1280	90
1-75	1280	90
1-76	1280	90
1-77	1280	90
1-80	1280	90
1-81	1280	90
1-82	1280	90
1-87	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-94	1280	100

[0434]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-95	1280	90
1-96	1280	100
1-97	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	90
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	100
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	90
1-123	1280	100
1-127	1280	100
1-129	1280	90
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

[0435] 试验结果表明,本发明的通式(I)的化合物,在苗后处理中,在相应的施用率为每公顷1280g活性物质时,对选定的有害植物(例如苘麻、大穗看麦娘、反枝苋、马唐、稗草、地肤、硬直黑麦草、淡甘菊、早熟禾、狗尾草、繁缕和阿拉伯婆婆纳)显示出良好的除草功效。

[0436] B.在80g/ha下的苗后除草功效

[0437] 将单子叶和双子叶杂草和作物植物的种子置于塑料盆或有机种植盆中的沙壤土中,用土壤覆盖并在受控生长条件下在温室中栽培。在播种后2至3周,在一叶期时对试验植物进行处理。然后在600l/ha(换算值)的水施用率并加入0.5%添加剂的情况下,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剂喷洒到植物的绿色部位上。在试验植物已在最佳生长条件下在温室中保持约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。

[0438] 下表B1至B10示出了选定的表1的通式(I)的化合物对各种有害植物的效果且相应的施用率为80g/ha,所述效果通过上述实验方法获得。

[0439] 表B1:在80g/ha下对ABUTH的以%计的苗后功效

[0440]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-133	80	80
1-140	80	100

[0441] 表B2:在80g/ha下对ALOMY的以%计的苗后功效

[0442]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ALOMY
1-140	80	80

[0443] 表B3:在80g/ha下对AMARE的以%计的苗后功效

[0444]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-14	80	95
1-15	80	90
1-16	80	100
1-17	80	90
1-18	80	90
1-20	80	90
1-21	80	90

[0445]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-40	80	90
1-51	80	100
1-52	80	80
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-67	80	100
1-131	80	100
1-133	80	100
1-135	80	100
1-140	80	100
1-142	80	80
1-150	80	80
1-151	80	80
1-152	80	90
1-153	80	90
1-154	80	90
1-156	80	80
1-157	80	80
1-159	80	80
1-160	80	100
1-186	80	90
1-187	80	90
1-193	80	90
1-194	80	98

[0446] 表B4:在80g/ha下对DIGSA的以%计的苗后功效

[0447]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-140	80	90

[0448] 表B5:在80g/ha下对ECHCG的以%计的苗后功效

[0449]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-140	80	90

[0450] 表B6:在80g/ha下对KCHSC的以%计的苗后功效

[0451]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-40	80	90
1-56	80	80
1-59	80	90
1-133	80	100

[0452] 表B7:在80g/ha下对POLCO的以%计的苗后功效

[0453]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POLCO
1-16	80	80
1-54	80	80
1-56	80	80
1-133	80	100
1-140	80	100

[0454] 表B8:在80g/ha下对SETVI的以%计的苗后功效

[0455]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-140	80	80

[0456] 表B9:在80g/ha下对VERPE的以%计的苗后功效

[0457]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-14	80	95
1-16	80	90
1-40	80	90
1-51	80	100
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	90
1-65	80	90
1-67	80	80
1-133	80	100
1-140	80	100
1-186	80	90
1-187	80	90
1-189	80	90
1-192	80	80
1-193	80	90

[0458] 表B10:在80g/ha下对VIOTR的以%计的苗后功效

[0459]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VIOTR
1-40	80	100
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	100
1-67	80	100
1-131	80	90
1-133	80	100

[0460] 试验结果表明,本发明的通式(I)的化合物,在苗后处理中,在相应的施用率为每

公顷80g活性物质时,对选定的有害植物(例如苘麻、大穗看麦娘、反枝苋、马唐、稗草、地肤、卷茎蓼(Polygonum convolvulus)、狗尾草、阿拉伯婆婆纳和三色堇)显示出良好的除草功效。

[0461] C.在1280g/ha下的苗前除草功效

[0462] 将单子叶和双子叶杂草植物的种子置于塑料盆中的沙壤土中(每盆分别播种一种单子叶或双子叶杂草植物,播种两次),并用土壤覆盖。然后在每公顷600升(换算值)的水施用率并加入0.5%添加剂的情况下,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剂施用至覆盖土壤的表面。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。约3周后,与未处理的对照组相比,对所述制剂的功效目测评分,以百分比计。

[0463] 例如,100%活性=植物已经死亡,0%活性=与对照植物类似。

[0464] 下表C1至C12示出了选定的表1的通式(I)的化合物对各种有害植物的效果且相应的施用率为1280g/ha,所述效果通过上文指定的试验方法获得。

[0465] 表C1:在1280g/ha下对ABUTH的以%计的苗前功效

[0466]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-35	1280	90
1-39	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100

[0467]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-69	1280	100
1-70	1280	90
1-75	1280	90
1-76	1280	90
1-77	1280	90
1-80	1280	90
1-82	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100
1-96	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	90
1-100	1280	100
1-101	1280	90
1-103	1280	100

[0468]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-104	1280	100
1-110	1280	90
1-112	1280	90
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
2-6	1280	100

[0469] 表C2:在1280g/ha下对ALOMY的以%计的苗前功效

[0470]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ALOMY
1-40	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	90
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	90
1-66	1280	90
1-133	1280	100

[0471] 表C3:在1280g/ha下对AMARE的以%计的苗前功效

[0472]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-1	1280	100
1-8	1280	100
1-23	1280	100
1-26	1280	100

[0473]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-31	1280	90
1-32	1280	90
1-33	1280	100
1-34	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-71	1280	100
1-73	1280	90
1-74	1280	100
1-75	1280	100
1-76	1280	100

[0474]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-77	1280	100
1-80	1280	100
1-82	1280	100
1-87	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100
1-96	1280	100
1-97	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	100
1-106	1280	90
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	90
1-123	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100

[0475]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-133	1280	100
1-137	1280	100
2-6	1280	90

[0476] 表C4:在1280g/ha下对DIGSA的以%计的苗前功效

[0477]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-1	1280	100
1-8	1280	100
1-23	1280	100
1-26	1280	100
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-31	1280	100
1-35	1280	90
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100

[0478]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-74	1280	100
1-77	1280	90
1-87	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	90
1-96	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100
1-111	1280	90
1-112	1280	100
1-127	1280	90
1-129	1280	90
1-131	1280	100
1-133	1280	100
2-6	1280	90

[0479] 表C5:在1280g/ha下对ECHCG的以%计的苗前功效

[0480]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-1	1280	90
1-8	1280	90
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	90
1-29	1280	100
1-31	1280	100
1-35	1280	90
1-37	1280	90
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	90
1-45	1280	100
1-51	1280	90
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	90
1-87	1280	90
1-90	1280	100
1-91	1280	90
1-92	1280	100

[0481]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-93	1280	100
1-95	1280	90
1-96	1280	90
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-112	1280	100
1-129	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100

[0482] 表C6:在1280g/ha下对KCHSC的以%计的苗前功效

[0483]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-1	1280	90
1-23	1280	90
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-35	1280	100
1-40	1280	90
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100

[0484]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-74	1280	90
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	90
1-100	1280	100
1-112	1280	100
1-127	1280	90
1-129	1280	90
1-131	1280	100
1-133	1280	100

[0485] 表C7:在1280g/ha下对LOLRI的以%计的苗前功效

[0486]

实施例编号	剂量 [g/ha]	LOLRI
1-29	1280	100
1-40	1280	100
1-45	1280	90
1-53	1280	100

[0487]

实施例编号	剂量 [g/ha]	LOLRI
1-54	1280	100
1-55	1280	90
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-133	1280	90

[0488] 表C8:在1280g/ha下对MATIN的以%计的苗前功效

[0489]

实施例编号	剂量 [g/ha]	MATIN
1-29	1280	90
1-35	1280	90
1-40	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-70	1280	100
1-75	1280	90
1-76	1280	90

[0490]

1-89	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-100	1280	100
1-104	1280	100
1-129	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100

[0491] 表C9:在1280g/ha下对POAAN的以%计的苗前功效

实施例编号	剂量 [g/ha]	POAAN
1-1	1280	90
1-23	1280	90
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-29	1280	100
1-31	1280	100
1-33	1280	100
1-35	1280	90
1-37	1280	90
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-41	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-51	1280	90
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100

[0492]

[0493]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POAAN
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-60	1280	90
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	90
1-72	1280	90
1-74	1280	100
1-77	1280	90
1-78	1280	90
1-79	1280	90
1-80	1280	90
1-81	1280	100
1-82	1280	90
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	90
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100

[0494]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POAAN
1-105	1280	100
1-110	1280	90
1-112	1280	90
1-119	1280	90
1-127	1280	90
1-129	1280	90
1-130	1280	90
1-131	1280	90
1-133	1280	100
1-137	1280	90

[0495] 表C10:在1280g/ha下对SETVI的以%计的苗前功效

[0496]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-1	1280	90
1-8	1280	90
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-31	1280	100
1-33	1280	100
1-35	1280	90
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100

[0497]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-74	1280	100
1-87	1280	100
1-89	1280	90
1-90	1280	90
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-96	1280	90
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-112	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	90
1-130	1280	90

[0498]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	100

[0499] 表C11:在1280g/ha下对STEME的以%计的苗前功效

[0500]

实施例编号	剂量 [g/ha]	STEME
1-8	1280	90
1-23	1280	100
1-29	1280	90
1-33	1280	90
1-34	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	90
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100

[0501]

实施例编号	剂量 [g/ha]	STEME
1-70	1280	100
1-71	1280	90
1-76	1280	90
1-77	1280	90
1-80	1280	100
1-82	1280	100
1-89	1280	90
1-90	1280	90
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-110	1280	100
1-112	1280	90
1-127	1280	90
1-129	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	100
2-6	1280	100

[0502] 表C12:在1280g/ha下对VERPE的以％计的苗前功效

[0503]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-23	1280	100
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-33	1280	100
1-35	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	90
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-60	1280	90
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	90
1-76	1280	90
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100

[0504]

1-98	1280	90
1-100	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100
1-105	1280	100
1-112	1280	100
1-127	1280	90
1-129	1280	90
1-130	1280	90
1-131	1280	100
1-133	1280	100

[0505] 试验结果表明,本发明的通式(I)的化合物,在苗前处理中,在相应的施用率为每公顷1280g活性物质时,对选定的有害植物(例如苘麻、大穗看麦娘、反枝苋、马唐、稗草、地肤、硬直黑麦草、淡甘菊、早熟禾、狗尾草、繁缕和阿拉伯婆婆纳)显示出良好的除草功效。

[0506] D.在80g/ha下的苗前除草功效

[0507] 将单子叶和双子叶杂草植物和作物植物的种子置于塑料盆或有机种植盆中,并用土壤覆盖。然后在相当于600l/ha的水施用率并加入0.5%添加剂的情况下,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剂施用至覆盖土壤的表面。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。约3周后,与未处理的对照组相比,对所述制剂的功效目测评分,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。

[0508] 下表D1至D12示出了选定的表1的通式(I)的化合物对各种有害植物的效果且相应的施用率为80g/ha,所述效果通过上述实验方法获得。

[0509] 表D1:在80g/ha下对ABUTH的以%计的苗前功效

[0510]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ABUTH
1-52	80	90

[0511]

1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	90
1-67	80	100
1-133	80	100
1-135	80	95
1-156	80	90
1-152	80	80
1-140	80	100

[0512] 表D2:在80g/ha下对ALOMY的以%计的苗前功效

[0513]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ALOMY
1-54	80	80
1-59	80	80
1-140	80	90

[0514] 表D3:在80g/ha下对AMARE的以%计的苗前功效

[0515]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-14	80	90
1-16	80	100
1-17	80	80
1-21	80	90
1-45	80	100
1-50	80	90
1-51	80	90
1-52	80	100
1-54	80	100
1-56	80	100

[0516]

实施例编号	剂量 [g/ha]	AMARE
1-59	80	100
1-65	80	100
1-67	80	90
1-131	80	100
1-133	80	100
1-135	80	100
1-140	80	100
1-151	80	80
1-152	80	100
1-153	80	100
1-154	80	100
1-156	80	100
1-157	80	100
1-159	80	90
1-160	80	100
1-162	80	90
1-166	80	95
1-187	80	100
1-189	80	80
1-194	80	100

[0517] 表D4:在80g/ha下对DIGSA的以%计的苗前功效

[0518]

实施例编号	剂量 [g/ha]	DIGSA
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	90
1-133	80	100

[0519]

1-140	80	100
1-152	80	90
1-156	80	90
1-157	80	80
1-165	80	80
1-166	80	100
1-194	80	90

[0520] 表D5:在80g/ha下对ECHCG的以%计的苗前功效

[0521]

实施例编号	剂量 [g/ha]	ECHCG
1-54	80	100
1-56	80	80
1-59	80	100
1-133	80	80
1-140	80	100

[0522] 表D6:在80g/ha下对KCHSC的以%计的苗前功效

[0523]

实施例编号	剂量 [g/ha]	KCHSC
1-50	80	90
1-54	80	100
1-56	80	90
1-59	80	100
1-65	80	100
1-133	80	100

[0524] 表D7:在80g/ha下对LOLRI的以%计的苗前功效

[0525]

实施例编号	剂量 [g/ha]	LOLRI
1-140	80	90

[0526] 表D8:在80g/ha下对MATIN的以%计的苗前功效

[0527]

实施例编号	剂量 [g/ha]	MATIN
1-54	80	90
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	100
1-133	80	80
1-140	80	80
1-156	80	80

[0528] 表D9:在80g/ha下对POLCO的以%计的苗前功效

[0529]

实施例编号	剂量 [g/ha]	POLCO
1-54	80	80
1-56	80	90
1-59	80	90
1-131	80	80
1-133	80	80
1-135	80	90
1-140	80	90
1-152	80	90
1-154	80	80
1-156	80	80
1-162	80	80
1-165	80	80
1-166	80	90
1-194	80	90

[0530] 表D10:在80g/ha下对SETVI的以%计的苗前功效

[0531]

实施例编号	剂量 [g/ha]	SETVI
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	90
1-133	80	100
1-140	80	100
1-152	80	80
1-166	80	80
1-194	80	100

[0532] 表D11:在80g/ha下对VERPE的以%计的苗前功效

[0533]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VERPE
1-16	80	90
1-51	80	80
1-54	80	90
1-56	80	90
1-59	80	90
1-65	80	100
1-133	80	90
1-135	80	95
1-140	80	100
1-194	80	90

[0534] 表D12:在80g/ha下对VIOTR的以%计的苗前功效

[0535]

实施例编号	剂量 [g/ha]	VIOTR
1-40	80	100
1-54	80	100

[0536]

1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	100
1-131	80	90
1-133	80	80

[0537] 试验结果表明,本发明的通式(I)的化合物,在苗前处理中,在相应的施用率为每公顷80g活性物质时,对选定的有害植物(例如苘麻、大穗看麦娘、反枝苋、马唐、稗草、地肤、硬直黑麦草、淡甘菊、卷茎蓼、狗尾草、阿拉伯婆婆纳和三色堇)显示出良好的除草功效。