(19)国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 118922400 A
(43)申请公布日 2024.11.08

(21)申请号 202380029155.5
(22)申请日 2023.03.20
(30)优先权数据
291575 2022.03.21 IL
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2024.09.20
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/IL2023/050289 2023.03.20
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2023/181030 EN 2023.09.28
(71)申请人 艾格普莱纳斯有限公司
地址 以色列雷霍沃特
(72)发明人 B·英泊 E·维塞尔布拉特
Y·弗洛伊德 W·洛萨
(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 孙美焕 王媛
(51)Int.Cl.
C07C 229/30(2006.01)
C07C 229/46(2006.01)
C07C 311/51(2006.01)
A01N 37/18(2006.01)
A01N 1/00(2006.01)

权利要求书13页 说明书64页

(54)发明名称

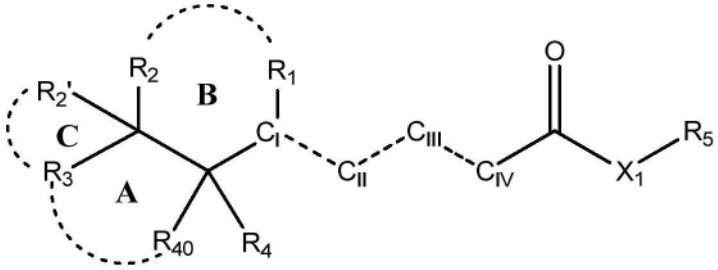
杀虫和除草化合物及其使用方法

(57)摘要

本发明涉及一种新型杀虫和/或除草活性化合物、其农用化学组合物、其制备方法及其用于防治例如作物田中的不期望的植物(例如,杂草)的生长的用途。

CN 118922400 A

1.一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式I的结构表示:



I

其中

C_I、C_{II}、C_{III}和C_{IV}各自独立地是sp、sp^2或sp^3碳原子,这取决于它们分别是否是三键、双键或单键的一部分;且对于sp、sp^2或sp^3碳原子,它们各自独立地是C、CH或C(R_{20});或CH_2、CH(R_{20})或C(R_{20})$_2$。

其中R_{20}是卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,

甲基);

C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}、C_{III}---C_{IV}各自独立地为单键或双键,其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个为双键;或C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}各自独立地为单键或三键,其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个为三键;

R_1是H、F、Cl、Br、I、C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基);

其中如果C_I---C_{II}是三键则R_1不存在;

R_2是F、Cl、Br、I、C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环环B(例如,环己基、环己烯基、环戊基);

R_2'是H、F、Cl、Br、I、C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、N(R)$_2$;

或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,环丙基);

R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、N(R)$_2$;

R_{40}是H、C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环己基);

R_5是H,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、

$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)-CH(CH_3)_2$，R_8-芳基(例如，CH_2-Ph)，C(=CH_2)-R_{10}(例如，C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN)，取代或未取代的烷基砜(例如，SO_2-CH_2-环丙基)，取代或未取代的芳基(例如，苯基)，取代或未取代的杂芳基(例如，吡啶(2、3和4-吡啶))；

X_1是O、NH或N-R_{50}；

R_8是$[CH_2]_p$

其中p是1至10；

R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如，甲基、乙基)、C(O)R(例如，C(O)(OCH_3))或S(O)$_2$R；

R_{50}是H，C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如，甲基、乙基、丁基、异丙基)；

R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基，或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环；

A环不存在，或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如，环丙基、环丁基、环戊基、环己基)；

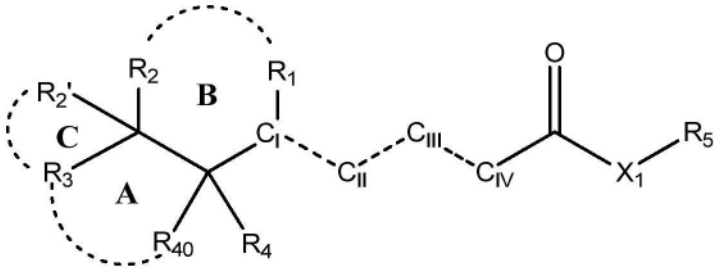
B环不存在，或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如，环己基、环己烯基、环戊基)；

C环不存在，或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如，环丙基)；

其中至少一个A、B和C环中至少有一个存在；

其中R_3和R_4中至少一个是NH_2。

2.一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如，氘代类似物)或其任何组合，所述化合物由式I的结构表示：



I

其中

C_I、C_{II}、C_{III}和C_{IV}各自独立地是sp、sp^2或sp^3碳原子，这取决于它们分别是否是三键、双键或单键的一部分；对于sp、sp^2或sp^3碳原子，它们各自独立地是C、CH或C(R_{20})；或CH_2、CH(R_{20})或C(R_{20})$_2$。

其中R_{20}是卤素(例如，F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如，

甲基)；

C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}、C_{III}---C_{IV}各自独立地为单键或双键，其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个为双键；或C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}各自独立地为单键或三键，其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个为三键；

R_1是H，F，Cl，Br，I，C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如，甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基)；

其中如果C_I---C_{II}是三键则R_1不存在;

R_2是F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环环B(例如,环已基、环已烯基、环戊基);

R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,环丙基);

R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

R_{40}是H、C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基);

R_5是H,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶));

X_1是O、NH或N-R_{50};

R_8是$[CH_2]_p$

其中p是1至10;

R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))或$S(O)_2R$;

R_{50}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丁基、异丙基);

R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基,或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环;

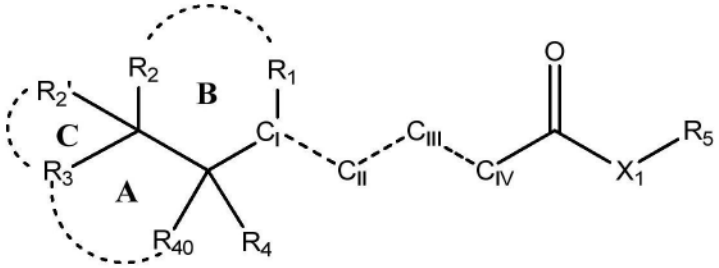
A环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基);

B环不存在,或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如,环已基、环已烯基、环戊基);

C环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基);

其中R_3和R_4中的一个是NH_2,另一个是OH。

3.一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式I的结构表示:



I

其中

C_I、C_{II}、C_{III}和C_{IV}各自独立地是sp、sp^2或sp^3碳原子,这取决于它们分别是否是三键、双键或单键的一部分;对于sp、sp^2或sp^3碳原子,它们各自独立地是C、CH或$C(R_{20})$;或CH_2、$CH(R_{20})$或$C(R_{20})_2$。

其中R_{20}是卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,

甲基);

C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}、C_{III}---C_{IV}各自独立地为单键或双键,其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个为双键;或C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}各自独立地为单键或三键,其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个为三键;

R_1是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基);

其中如果C_I---C_{II}是三键则R_1不存在;

R_2是F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环环B(例如,环己基、环己烯基、环戊基);

R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,环丙基);

R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

R_{40}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环己基);

R_5是H,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),$C(=CH_2)$-R_{10}(例如,$C(=CH_2)$-C(O)-OCH_3、$C(=CH_2)$-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶));

X_1是O、NH或N-R_{50}；

R_8是$[CH_2]_p$

其中p是1至10；

R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))或S(O)$_2$R；

R_{50}是H、C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丁基、异丙基)；

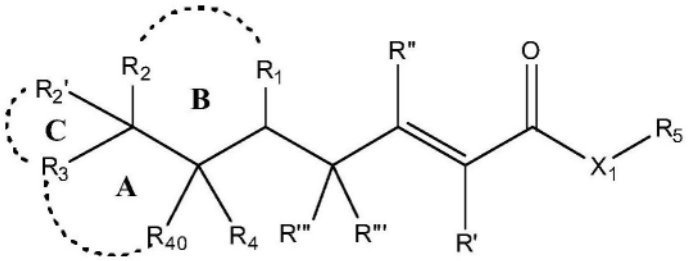
R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基,或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环；

A环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环己基)；

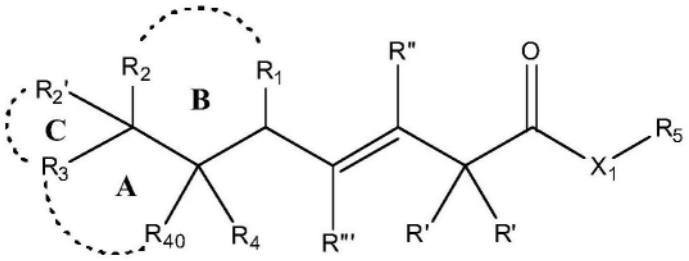
B环不存在,或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如,环己基、环己烯基、环戊基)；

C环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基)；其中R_3和R_4中至少一个是NH_2。

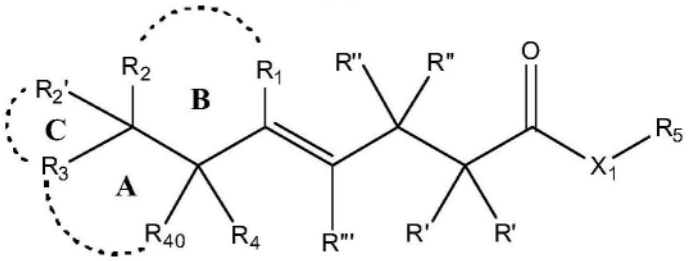
4.根据权利要求1至3中任一项所述的化合物,其由式II(a)-II(d)或III(a)-III(c)的结构表示：



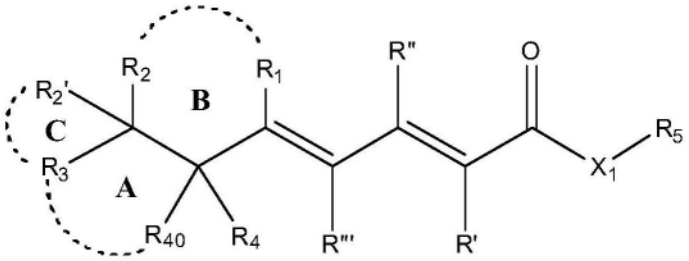
II(a);



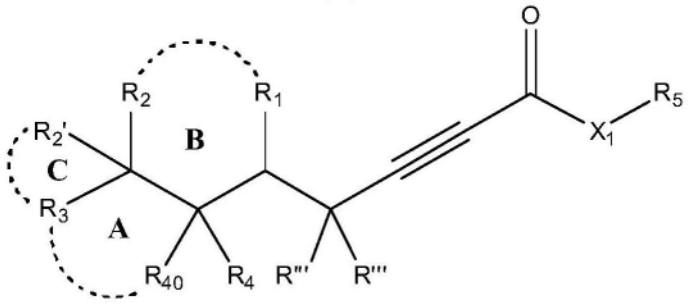
II(b);



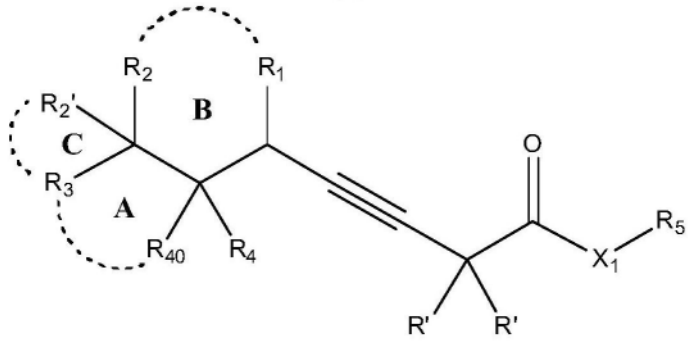
II(c);



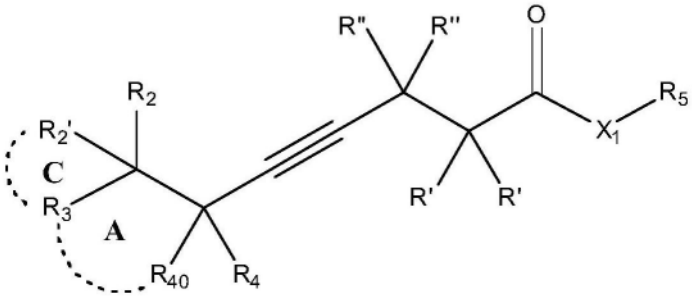
II(d);



III(a);



III(b); 或



III(c);

其中

R'、R"和R"'各自独立地选自卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基)。

5.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中R_{20}是F或甲基。

6.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中R_1是H,R_2是CH_3或CH_2CH_3,或R_1和R_2连接形成环已基。

7.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中R_2'是H或CH_3,R_3是H、OH或NH_2,或R_3和R_2'连接形成环丙基。

8.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中R_4是H或NH_2。

9.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中R_{40}是H,R_3是H、OH或NH_2,或R_3和R_{40}连接形成3-8元环烷基环。

10.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中X_1是O。

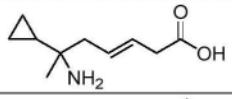
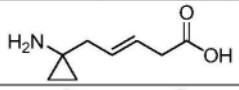
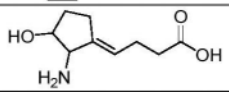
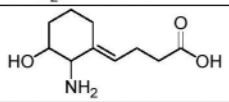
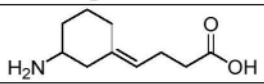
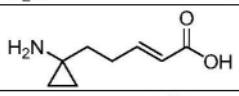
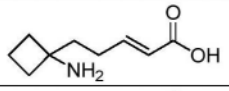
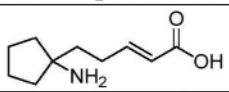
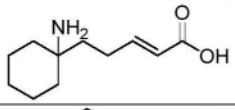
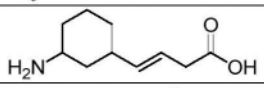
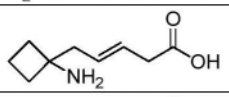
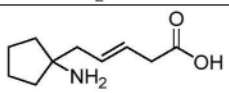
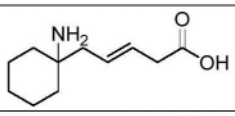
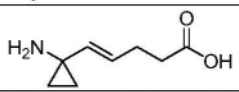
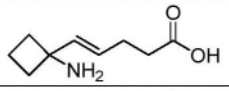
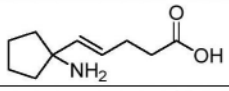
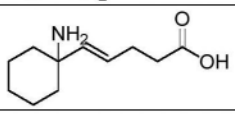
11.根据权利要求1所述的化合物,其中R_5是H。

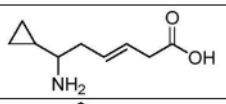
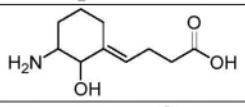
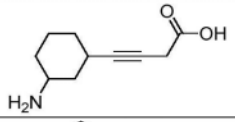
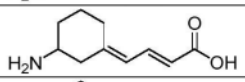
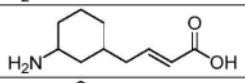
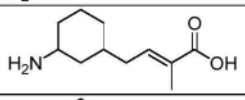
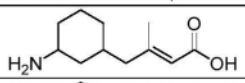
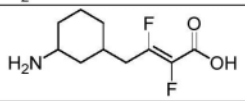
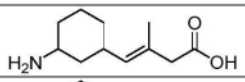
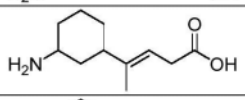
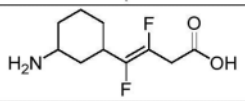
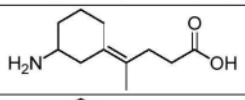
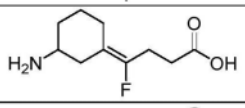
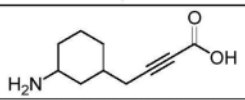
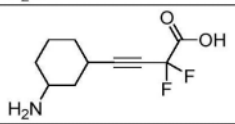
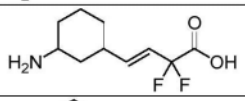
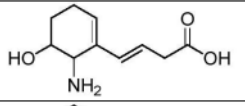
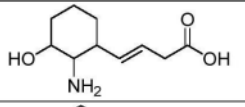
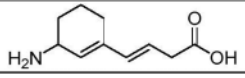
12.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中所述化合物是基本上纯的单一立体异构体。

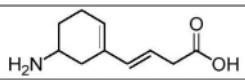
13.根据权利要求12所述的化合物,其中所述化合物是基本上纯的SR立体异构体、RS立体异构体、RR立体异构体或SS非对映异构体。

14.根据权利要求13所述的化合物,其中基本上纯的立体异构体的纯度高于90%,优选地高于95%,更优选地高于98%。

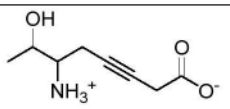
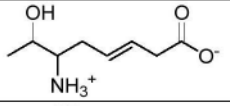
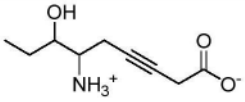
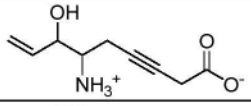
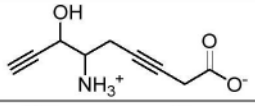
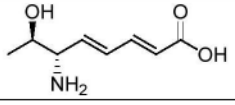
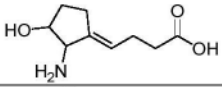
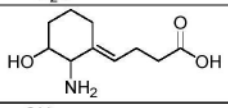
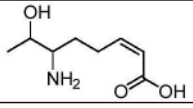
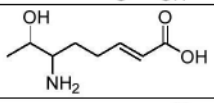
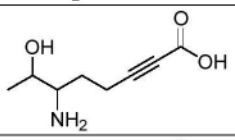
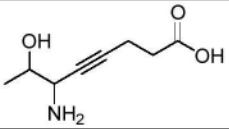
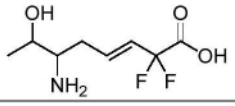
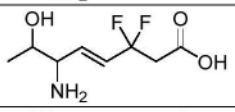
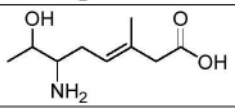
15.根据权利要求1-14中任一项所述的化合物,其由以下任何一种结构表示:

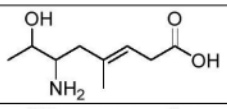
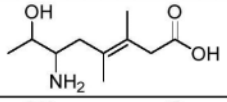
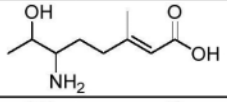
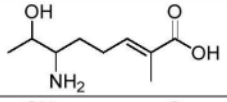
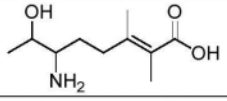
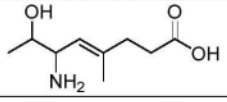
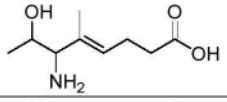
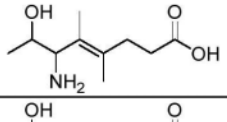
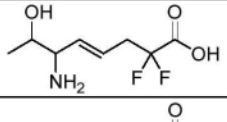
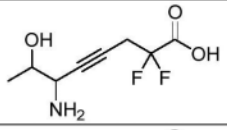
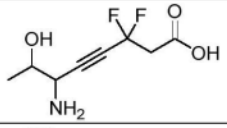
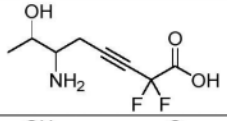
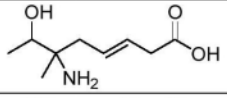
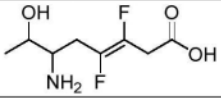
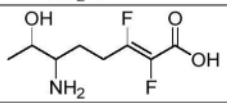
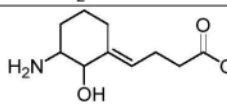
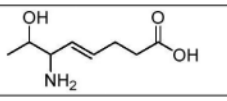
化合物编号	结构
111	
112	
115	
116	
119	
120	
121	
122	
123	
124	
125	
126	
127	
128	
129	
130	
131	

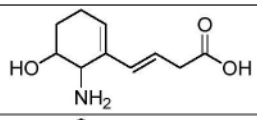
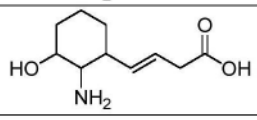
146	
153	
154	
155	
156	
158	
159	
160	
161	
162	
163	
164	
165	
167	
168	
174	
175	
176	
177	

178	

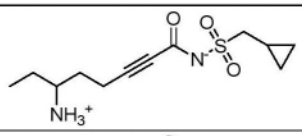
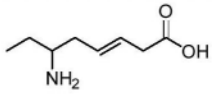
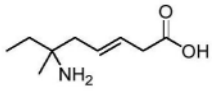
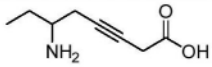
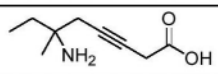
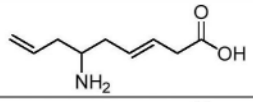
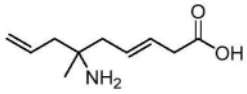
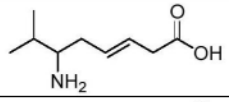
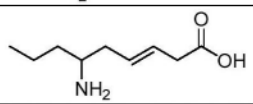
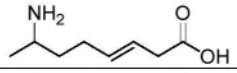
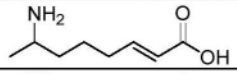
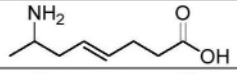
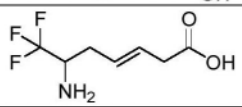
16.根据权利要求2或3所述的化合物,其由以下任何一种结构表示:

化合物编号	结构
100	
101	
102	
103	
104	
110	
115	
116	
117	
118	
132	
133	
134	
135	
136	

137	
138	
139	
140	
141	
142	
143	
144	
145	
147	
148	
149	
150	
151	
152	
153	
172	

175	
176	

17.根据权利要求3所述的化合物,其由以下任何一种结构表示:

化合物编号	结构
105	
106	
107	
108	
109	
113	
114	
157	
166	
169	
170	
171	
173	

18.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中所述化合物是除草剂、杀虫剂或其组合。

19.根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其用于防治不期望的植物的生长。

20.一种农用化学组合物,其包括前述权利要求中任一项所述的化合物,以及农用化学

上可接受的载体或稀释剂。

21.根据权利要求19所述的化合物,其中所述植物是双子叶植物或单子叶植物。

22.根据权利要求19或21所述的化合物,其中所述植物是杂草。

23.根据权利要求22所述的化合物,其中所述杂草包括:苘麻、长芒苋、豚草、大穗看麦娘、不实野燕麦、藜草、小蓬草、马唐、光头稗、白苞猩猩草、多年生黑麦草、硬直黑麦草、德国洋甘菊、奇蒿草、早熟禾、马齿苋、狗尾草、龙葵或其任何组合。

24.根据权利要求21所述的化合物,其中所述双子叶植物是拟南芥,和/或所述单子叶植物是龙爪茅或埃塞俄比亚画眉草。

25.根据权利要求19-24中任一项所述的化合物,其用于种植前处理、萌芽前处理、萌芽后处理或其任何组合。

杀虫和除草化合物及其使用方法

技术领域

[0001] 本发明涉及新型杀虫和/或除草活性化合物、其农用化学组合物、其制备方法及其用于防治例如作物田中的不期望的植物(例如,杂草)的生长的用途。

背景技术

[0002] 杂草常常干扰土地和水资源的有效利用,并且通常与所期望植物竞争水、营养素、光、二氧化碳和空间。许多杂草在美学上也是令人不愉快的,尤其是当杂草出现在一片所期望植物的群落地段内,如房主草坪上的圣奥古斯丁草(St.Augustine grass)或肯塔基蓝草(Kentucky bluegrass)。杂草还可能阻碍能见度,成为建筑物周围的火灾隐患,并且降低灌溉系统的效率。当杂草出现在如河流和湖泊等河道中时,杂草可能会导致水质变差,从而使水不适合于烹饪和工业用途。此外,一些杂草通过分泌被称为化感化合物的有毒物质或通过传播可能引起过敏和/或疾病的药剂以有毒的方式作用于其他植物、动物和人类。最后,杂草为传播疾病或在其他方面对所期望植物、动物或人类有害的昆虫和啮齿动物提供庇护。

[0003] 年复一年,杂草对作物造成的农业损失始终超过其他种类的农业害虫造成的损失。除了减低作物的质量之外,杂草侵扰还可能使可实现的作物产量降低,降低幅度最高达理论上可实现产量的100%。包括机械、农业、生物和化学技术在内的许多方法已经得到逐步发展,以试图防治杂草侵扰。

[0004] 可以采用机械手段,如手拔、锄地或耕作、深耕、修剪、割草、焚烧和/或覆盖,以试图根除或防治杂草。此外,可以种植覆盖作物以在不种植更有价值的作物时保持地面被覆盖,由此将平常预期在裸露的地面区域出现的杂草侵扰通常被最小化。还已经尝试轮作和种植适于比杂草生长更旺盛的“窒息”作物作为防治杂草侵扰的手段。除了这些机械和农业技术之外,还尝试了杂草防治的生物方法,如引入以杂草为食的捕食者种群,并且由此减少杂草种群。

[0005] 杂草防治的机械、农业和生物方法虽然有时有助于降低杂草侵扰的程度,但并不完全令人满意。首先,机械和农业技术是相当劳动密集型的并且需要使用有限的物质和资本资源。此外,超出农民或房主控制的环境因素(如降雨量过多)可能会降低这些机械和农业技术的有效性。同样,如引入捕食者种群等生物技术也不完全令人满意,因为捕食者可能不会仅对杂草种群具有选择性。

[0006] 化学活性除草剂代表另一种潜在的杂草防治技术。这些化学除草剂可以分为萌芽前除草剂和萌芽后除草剂。萌芽前除草剂通常干扰杂草种子的萌芽,而萌芽后除草剂在杂草种子已经萌芽并且杂草开始生长之后杀死杂草。

[0007] 萌芽前除草剂在杂草种子即将萌芽的时机以所需剂量存在时可能有效。然而,这一时机问题指出关于萌芽前除草剂的主要问题。具体地,如果在杂草种子萌芽之前未施用萌芽前除草剂或萌芽前除草剂降解,则杂草种子会自由萌芽并且开始生长成成熟杂草。另外,萌芽前除草剂通常是杂草特异性的,并且对于所有类型的杂草并不是同等有效的。萌芽

前除草剂存在的时间问题通过采用萌芽后除草剂以及仅在杂草种子已经萌芽并且杂草正在活跃生长之后施用萌芽后除草剂来避免。然而,许多目前可获得的萌芽后除草剂是非选择性除草剂,并且因此除了杀死杂草之外,它们还会杀死期望的植物。

[0008] 许多萌芽前除草剂和萌芽后除草剂还面临另一个问题。具体地,许多萌芽前除草剂和萌芽后除草剂对人类和动物具有中度或高度毒性,并且可能由此具有远超出预期杂草防治效果的损害效果。有毒除草剂可能立即或长期地对施用除草剂的人和施用除草剂时在场的人造成伤害。此外,在施用除草剂之后保留在土壤或水中的残余浓度的有毒除草剂在与经处理的区域接触或从所述经处理的区域流出时可能对人类和动物(包含陆基动物和两栖动物和鱼)造成严重威胁。此外,公众对使用有毒化学品作为除草剂以及这些除草剂对环境质量的潜在广泛和长期影响的警觉,要求反对继续使用这些有毒除草剂。

[0009] 需要一种避免萌芽前除草剂施用的关键时机问题的杀虫和/或除草溶液。此外,还需要这样一种杀虫和/或除草溶液,其避免目前可获得的萌芽前除草剂和萌芽后除草剂通常对人类、动物和环境具有的毒性作用。此外,还需要一种经济有效的选择性地防治杂草而不破坏或阻碍所期望植物生长的萌芽后杂草技术。另外,需要一种这样一种组合物,其减少获得充分杂草防治所需的除草剂的量,同时使对作物植物的损害最小化。

[0010] 随着更多的杂草对除草剂产生抗性,需要具有高杂草防治的替代性组合物。另外,随着免耕农业越来越受欢迎,对有效除草剂的需求也越来越大。具有有效杂草防治和较低剂量率的组合物将导致作物植物产量增加,以及环境、人类和哺乳动物健康问题减少。

发明内容

[0011] 在各个实施方案中,本发明涉及一种由下文所定义的式I、II(a)-II(d)和III(a)-III(c)的结构表示的化合物,或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合。

[0012] 在各个实施方案中,本发明涉及如下文所述的由式I的结构表示的化合物,其中A、B和C环中的至少一个存在。

[0013] 在各个实施方案中,本发明涉及如下文所述的由式I的结构表示的化合物,其中R_3和R_4中的一个是NH_2另一个是OH。

[0014] 在各个实施方案中,本发明涉及如下文所述的由式I的结构表示的化合物,其中R_3和R_4中的至少一个是NH_2。

[0015] 在一些实施方案中,所述化合物不是(E)-7-氨基-4-辛烯酸。在一些实施方案中,所述化合物不是7-氨基-4-辛烯酸。在一些实施方案中,化合物由如下所述的式II(a)、II(b)、II(c)、II(d)、III(a)、III(b)或III(c)的结构表示。在一些实施方案中,R_{20}是F或甲基。在一些实施方案中,R_1是H,R_2是CH_3或CH_2CH_3,或者R_1和R_2连接形成环己基。在一些实施方案中,R_2'是H或CH_3,R_3为H、OH或NH_2,或R_3和R_2'连接形成环丙基。在一些实施方案中,R_4是H或NH_2。在一些实施方案中,R_{40}是H,R_3是H、OH或NH_2,或者R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元环烷基环。在一些实施方案中,X_1是O。在一些实施方案中,R_5是H。

[0016] 在一些实施方案中,所述化合物是基本上纯的单一立体异构体。在一些实施方案中,所述基本上纯的立体异构体的纯度高于90%。在一些实施方案中,基本上纯的立体异构

体的纯度高于95％。在一些实施方案中,基本上纯的立体异构体的纯度高于98％。在一些实施方案中,所述化合物是下文表1中列出的化合物中的任何一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物或同位素变体;各自代表根据本发明的单独的实施方案。在一些实施方案中,所述化合物是除草剂、杀虫剂或其组合。

[0017] 在各个实施方案中,本发明涉及一种农用化学组合物,其包含根据本发明的化合物和农用化学上可接受的载体或稀释剂。

[0018] 在各个实施方案中,本发明涉及一种由如下文所定义的式I、II(a)-II(d)和III(a)-III(c)的结构表示的杀虫化合物或除草化合物,或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物或同位素变体(例如,氘代类似物);各自代表根据本发明的单独的实施方案。

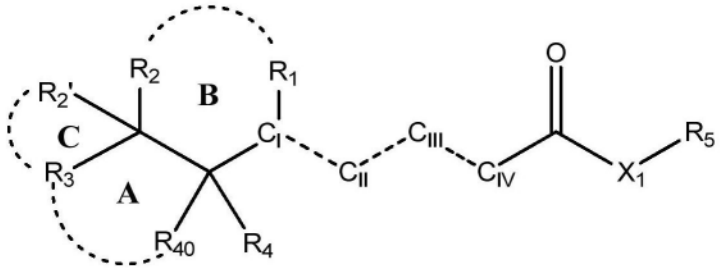
[0019] 在各个实施方案中,本发明涉及一种农用化学组合物,其包括杀虫和/或除草有效量的本发明化合物。

[0020] 在各个实施方案中,本发明涉及一种防治不期望的植物的生长的方法,所述方法包括将根据本发明的化合物或根据本发明的农用化学组合物施用于有用作物田。

[0021] 在各个实施方案中,本发明涉及一种根据本发明的化合物或根据本发明的农用化学组合物,其用于防治不期望的植物的生长。在一些实施方案中,所述植物是双子叶植物(eudicot或dicot)或单子叶植物(monocotyledon或monocot)。在一些实施方案中,所述植物是杂草。在一些实施方案中,所述杂草包括:苘麻(Abutilon theophrasti)、长芒苋(Amaranthus palmeri)、豚草(Ambrosia artemisiifolia)、大穗看麦娘(Alopecurus myosuroides)、不实野燕麦(Avena sterilis)、藜草(Chenopodium album)、小蓬草(Conyza Canadensis)、马唐(Digitaria sanguinalis)、光头稗(Echinochloa colona)、白苞猩猩草(Euphorbia heterophylla)、多年生黑麦草(Lolium perenne)、硬直黑麦草(Lolium rigidum)、德国洋甘菊(Matricaria chamomilla)、奇蒿草(Phalaris paradoxa)、早熟禾(Poa annua)、马齿苋(Portulaca oleracea)、狗尾草(Setaria viridis)、龙葵(Solanum nigrum)或其任何组合。在一些实施方案中,所述双子叶植物是拟南芥(Arabidopsis thaliana),和/或所述单子叶植物是龙爪茅(Dactyloctenium aegyptium)或埃塞俄比亚画眉草(Eragrostis teff)。在一些实施方案中,所述化合物用于种植前处理、萌芽前处理、萌芽后处理或其任何组合;各自代表根据本发明的单独实施方案。

具体实施方式

[0022] 在各个实施方案中,本发明涉及一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式(I)的结构表示:

[0023] 

(I)

[0024] 其中

[0025] C_I、C_{II}、C_{III}和C_{IV}各自独立地是sp、sp^2或sp^3碳原子,这取决于它们分别是否是三键、双键或单键的一部分;对于sp、sp^2或sp^3碳原子,它们各自独立地是C、CH或CR_{20};或CH_2、CHR_{20}或$C(R_{20})_2$。

[0026] 其中R_{20}是卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,

[0027] 甲基);

[0028] C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}、C_{III}---C_{IV}各自独立地为单键或双键,其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个为双键;或C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}各自独立地为单键或三键,其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个为三键;

[0029] R_1是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄

[0030] 基);

[0031] 其中如果C_I---C_{II}是三键则R_1不存在;

[0032] R_2是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0033] 或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环

[0034] 环B(例如,环已基、环已烯基、环戊基);

[0035] R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0036] R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0037] 或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,

[0038] 环丙基);

[0039] R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0040] R_{40}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

[0041] 或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基);

[0042] 或R_4和R_{40}连接形成3-8元取代或未取代、杂环或环烷基环;

[0043] R_5是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取

代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶));

[0044] X_1是O、CH_2、NH或N-R_{50};

[0045] R_8是$[CH_2]_p$

[0046] 其中p是1至10;

[0047] R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))或$S(O)_2R$;

[0048] R_{50}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丁基、异丙基);

[0049] R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基,或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环;

[0050] A环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环己基);

[0051] B环不存在,或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如,环己基、环己烯基、环戊基);

[0052] C环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基)。

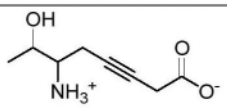
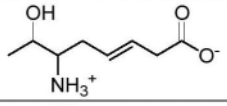
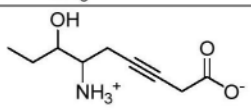
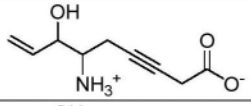
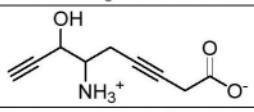
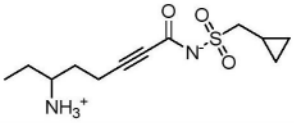
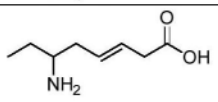
[0053] 在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2。在一些实施方案中,A、B和C环中至少一个存在。在一些实施方案中,R_3和R_4中的一个是NH_2,另一个是OH。在一些实施方案中,所述化合物不是(E)-7-氨基-4-辛烯酸。在一些实施方案中,所述化合物不是7-氨基-4-辛烯酸。在一些实施方案中,所述化合物是基本上纯的单一立体异构体。

[0054] 在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的任何一种化合物。在各个实施方案中,所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中,所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫化合物。

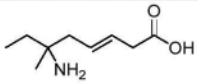
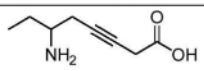
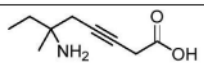
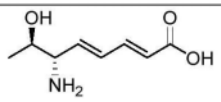
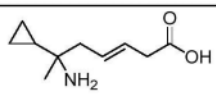
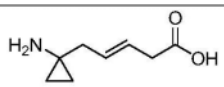
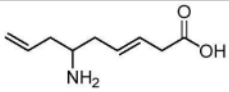
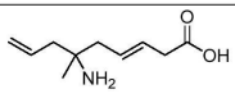
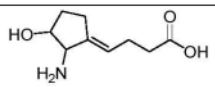
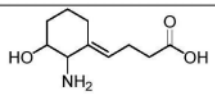
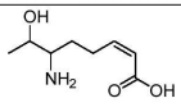
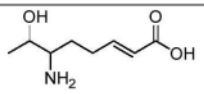
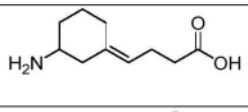
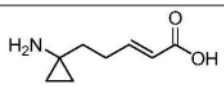
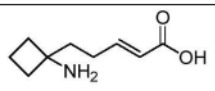
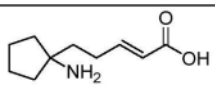
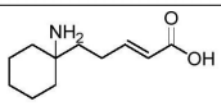
[0055] 在各个实施方案中,式I的化合物由表1所示的任何一种结构表示:

[0056] 表1:

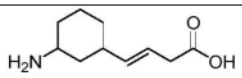
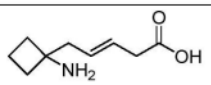
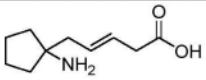
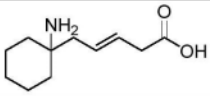
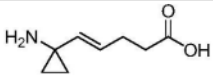
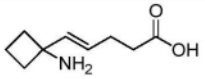
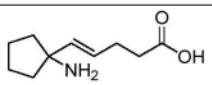
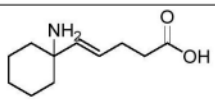
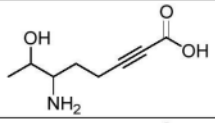
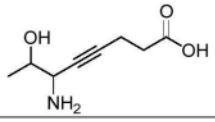
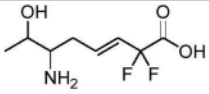
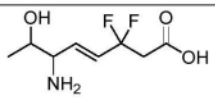
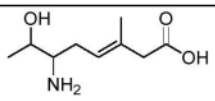
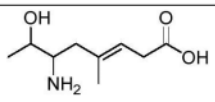
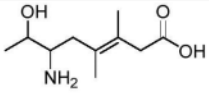
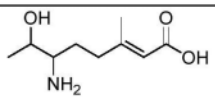
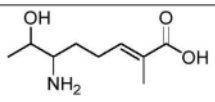
[0057]

化合物编号	结构
100	
101	
102	
103	
104	
105	
106	

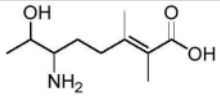
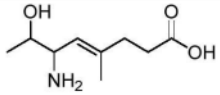
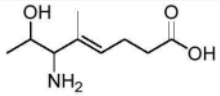
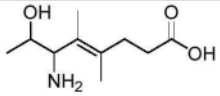
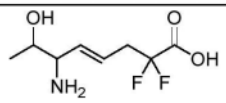
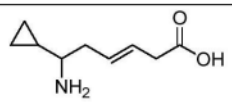
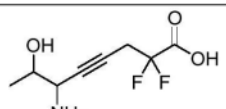
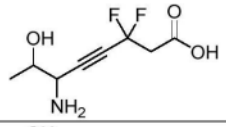
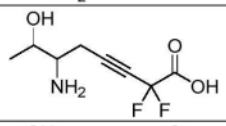
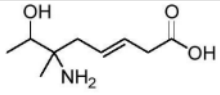
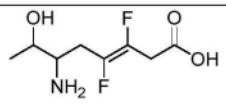
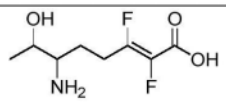
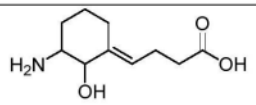
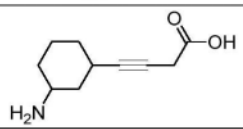
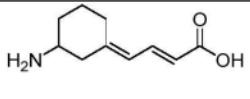
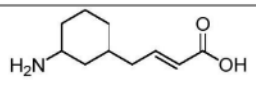
[0058]

107	
108	
109	
110	
111	
112	
113	
114	
115	
116	
117	
118	
119	
120	
121	
122	
123	

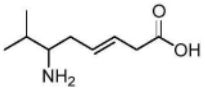
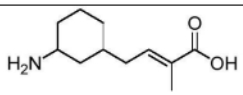
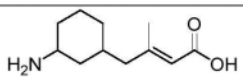
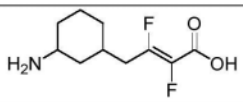
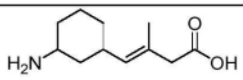
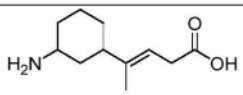
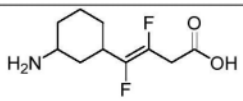
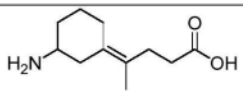
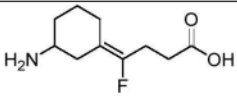
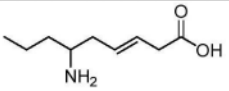
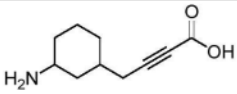
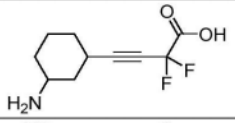
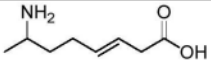
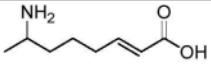
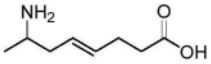
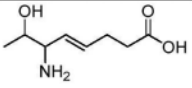
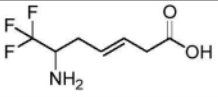
[0059]

124	
125	
126	
127	
128	
129	
130	
131	
132	
133	
134	
135	
136	
137	
138	
139	
140	

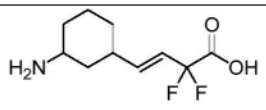
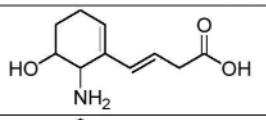
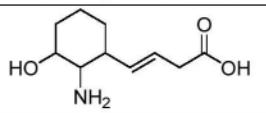
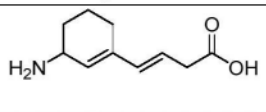
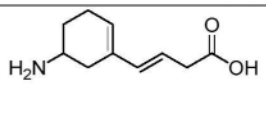
[0060]

141	
142	
143	
144	
145	
146	
147	
148	
149	
150	
151	
152	
153	
154	
155	
156	

[0061]

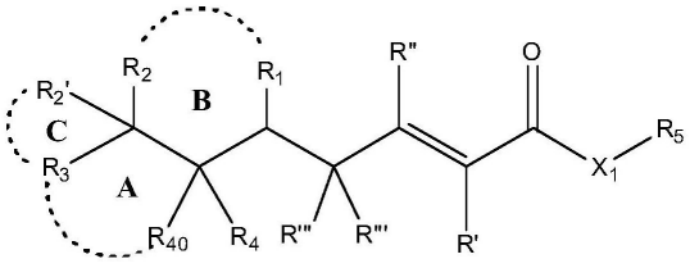
157	
158	
159	
160	
161	
162	
163	
164	
165	
166	
167	
168	
169	
170	
171	
172	
173	

[0062]

174	
175	
176	
177	
178	

[0063] 在各个实施方案中,本发明涉及一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式II(a)的结构表示:

[0064]



II(a)

[0065] 其中

[0066] R'、R"和R"'各自独立地选自卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基);

[0067] R_1是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基);

[0068] R_2是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0069] 或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环

[0070] 环B(例如,环已基、环已烯基、环戊基);

[0071] R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0072] R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0073] 或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,

[0074] 环丙基);

[0075] R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0076] R_{40}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、

叔丁基、异丁基、戊基)；

[0077] 或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基)；

[0078] 或R_4和R_{40}连接形成3-8元取代或未取代的杂环或环烷基环；

[0079] R_5是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph)、C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶))；

[0080] X_1是O、CH_2、NH或N-R_{50}；

[0081] R_8是$[CH_2]_p$

[0082] 其中p是1至10；

[0083] R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))或$S(O)_2R$；

[0084] R_{50}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丁基、异丙基)；

[0085] R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基,或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环；

[0086] A环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基)；

[0087] B环不存在,或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如,环已基、环已烯基、环戊基)；

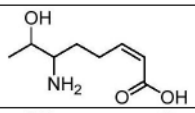
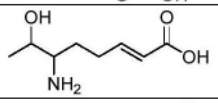
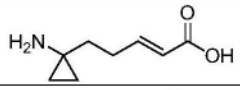
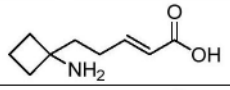
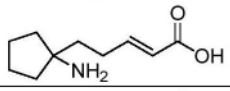
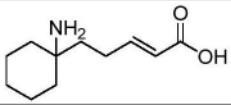
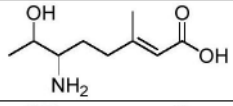
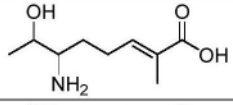
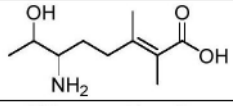
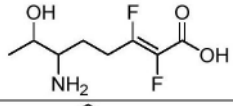
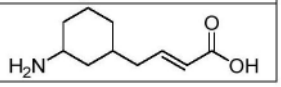
[0088] C环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基)。

[0089] 在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2。在一些实施方案中,A、B和C环中至少一个存在。在一些实施方案中,R_3和R_4中的一个是NH_2,另一个是OH。

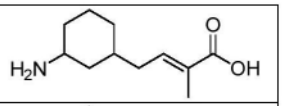
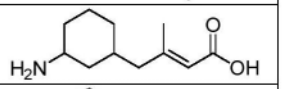
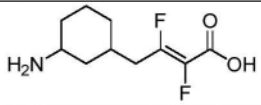
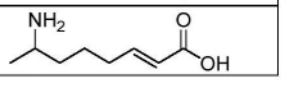
[0090] 在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的任何一种化合物。在各个实施方案中,所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中,所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫化合物。

[0091] 在各个实施方案中,式II(a)的化合物由以下任何一种结构表示：

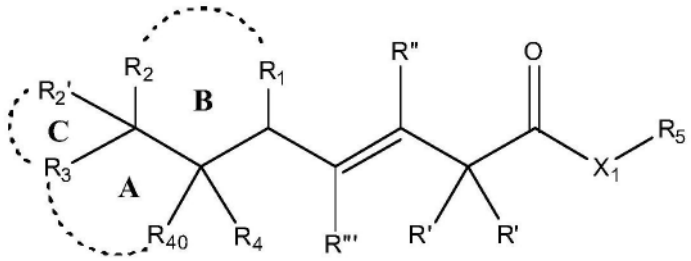
[0092]

化合物编号	结构
117	
118	
120	
121	
122	
123	
139	
140	
141	
152	
156	

[0093]

158	
159	
160	
170	

[0094] 在各个实施方案中,本发明涉及一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式II(b)的结构表示:

[0095] 

II(b)

[0096] 其中

[0097] R'、R"和R"'各自独立地选自卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基);

[0098] R_1是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基);

[0099] R_2是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0100] 或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环

[0101] 环B(例如,环己基、环己烯基、环戊基);

[0102] R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0103] R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0104] 或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,

[0105] 环丙基);

[0106] R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0107] R_{40}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

[0108] 或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环己基);

[0109] 或R_4和R_{40}连接形成3-8元取代或未取代的杂环或环烷基环;

[0110] R_5是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶));

[0111] X_1是O、CH_2、NH或N-R_{50};

[0112] R_8是$[CH_2]_p$

[0113] 其中p是1至10;

[0114] R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))

或$S(O)_2R$；

[0115] R_{50}是H，C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如，甲基、乙基、丁基、异丙基)；

[0116] R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基，或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环；

[0117] A环不存在，或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如，环丙基、环丁基、环戊基、环已基)；

[0118] B环不存在，或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如，环已基、环已烯基、环戊基)；

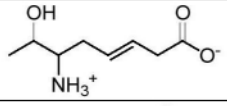
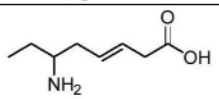
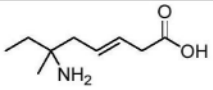
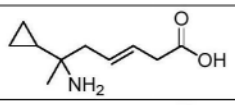
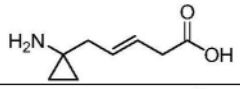
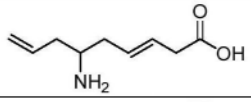
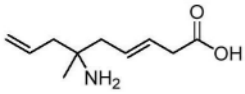
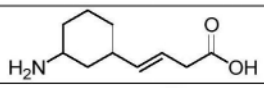
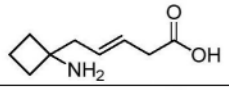
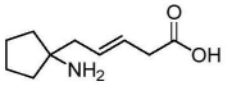
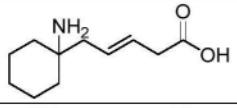
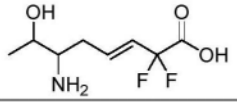
[0119] C环不存在，或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如，环丙基)。

[0120] 在一些实施方案中，R_3和R_4至少一个是NH_2。在一些实施方案中，A、B和C环中至少一个存在。在一些实施方案中，R_3和R_4中的一个是NH_2，另一个是OH。

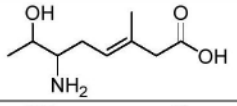
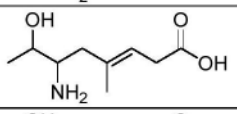
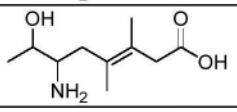
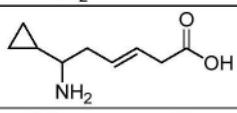
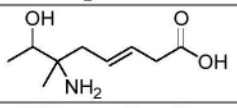
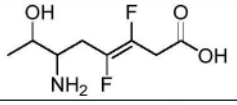
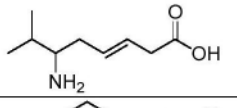
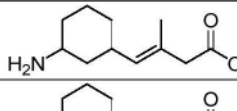
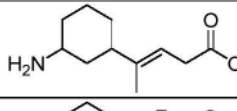
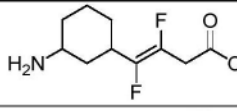
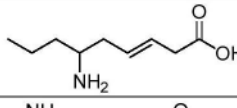
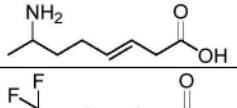
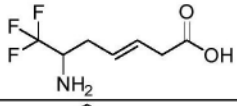
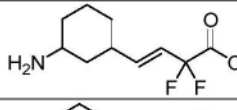
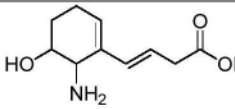
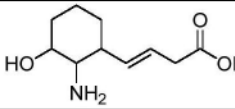
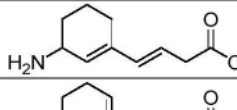
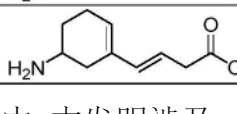
[0121] 在一些实施方案中，所述化合物是表1中列出的任何一种化合物。在各个实施方案中，所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中，所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中，所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中，所述化合物是杀虫化合物。

[0122] 在各个实施方案中，式II(b)的化合物由以下任何一种结构表示：

[0123]

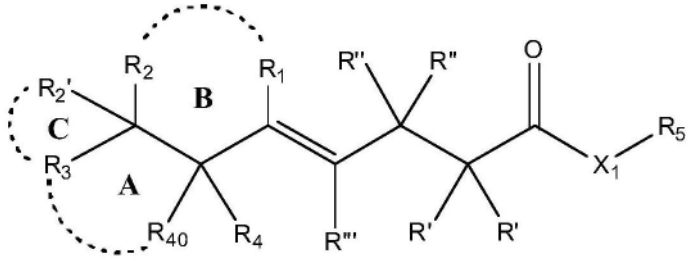
化合物编号	结构
101	
106	
107	
111	
112	
113	
114	
124	
125	
126	
127	
134	

[0124]

136	
137	
138	
146	
150	
151	
157	
161	
162	
163	
166	
169	
173	
174	
175	
176	
177	
178	

[0125] 在各个实施方案中,本发明涉及一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例

如,氘代类似物)或其任何组合,其由式II(c)的结构表示:

[0126] 

II(c)

[0127] 其中

[0128] R'、R"和R"'各自独立地选自卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基);

[0129] R_1是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基);

[0130] R_2是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0131] 或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环

[0132] 环B(例如,环己基、环己烯基、环戊基);

[0133] R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0134] R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0135] 或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,

[0136] 环丙基);

[0137] R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0138] R_{40}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

[0139] 或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A

[0140] (例如,环丙基、环丁基、环戊基、环己基);

[0141] 或R_4和R_{40}连接形成3-8元取代或未取代的杂环或环烷基环;

[0142] R_5是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶));

[0143] X_1是O、CH_2、NH或N-R_{50};

[0144] R_8是$[CH_2]_p$

[0145] 其中p是1至10;

[0146] R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))或$S(O)_2R$;

[0147] R_{50}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丁基、异丙基);

[0148] R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基,或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环;

[0149] A环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环己基);

[0150] B环不存在,或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如,环己基、环己烯基、环戊基);

[0151] C环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基)。

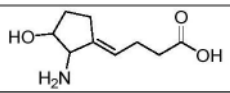
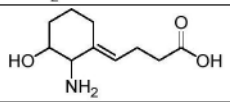
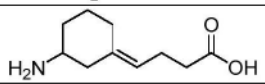
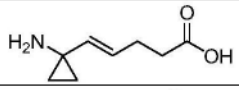
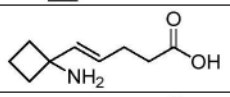
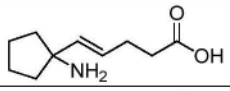
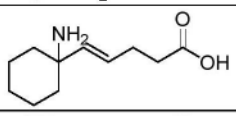
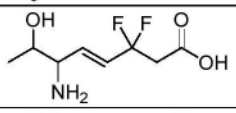
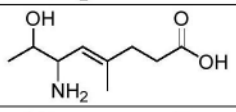
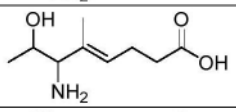
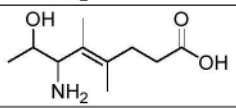
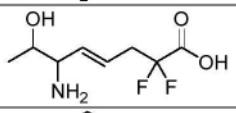
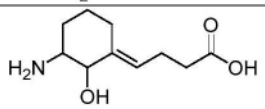
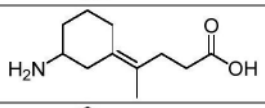
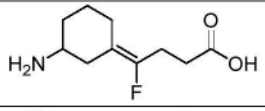
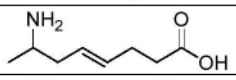
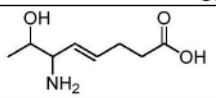
[0152] 在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2。在一些实施方案中,A、B和C环中至少一个存在。在一些实施方案中,R_3和R_4中的一个是NH_2,另一个是OH。

[0153] 在一些实施方案中,所述化合物不是(E)-7-氨基-4-辛烯酸。在一些实施方案中,所述化合物不是7-氨基-4-辛烯酸。

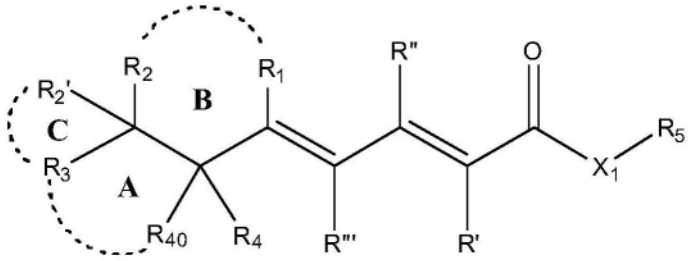
[0154] 在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的任何一种化合物。在各个实施方案中,所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中,所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫化合物。

[0155] 在各个实施方案中,式II(c)的化合物由以下任何一种结构表示:

[0156]

化合物编号	结构
115	
116	
119	
128	
129	
130	
131	
135	
142	
143	
144	
145	
153	
164	
165	
171	
172	

[0157] 在各个实施方案中,本发明涉及一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式II(d)的结构表示:

[0158] 

II(d)

[0159] 其中

[0160] R'、R"和R"'各自独立地选自卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基);

[0161] R_1是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基);

[0162] R_2是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0163] 或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环

[0164] 环B(例如,环己基、环己烯基、环戊基);

[0165] R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0166] R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0167] 或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,

[0168] 环丙基);

[0169] R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0170] R_{40}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

[0171] 或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环己基);

[0172] 或R_4和R_{40}连接形成3-8元取代或未取代的杂环或环烷基环;

[0173] R_5是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶));

[0174] X_1是O、CH_2、NH或N-R_{50};

[0175] R_8是$[CH_2]_p$

[0176] 其中p是1至10;

[0177] R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))

或$S(O)_2R$;

[0178] R_{50}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丁基、异丙基);

[0179] R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基,或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环;

[0180] A环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基);

[0181] B环不存在,或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如,环已基、环已烯基、环戊基);

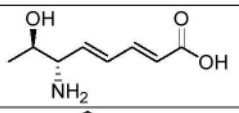
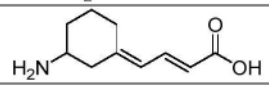
[0182] C环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基)。

[0183] 在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2。在一些实施方案中,A、B和C环中至少一个存在。在一些实施方案中,R_3和R_4中的一个是NH_2,另一个是OH。

[0184] 在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的任何一种化合物。在各个实施方案中,所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中,所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫化合物。

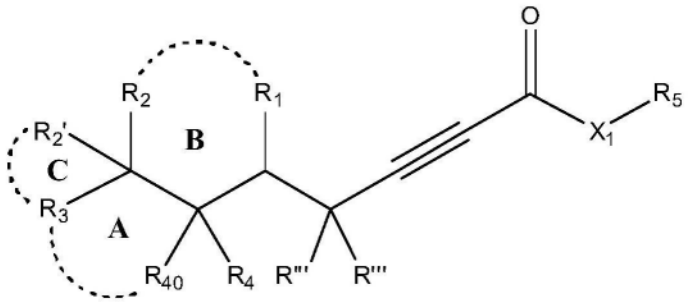
[0185] 在各个实施方案中,式II(d)的化合物由以下任何一种结构表示:

[0186]

化合物编号	结构
110	
155	

[0187] 在各个实施方案中,本发明涉及一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式III(a)的结构表示:

[0188]



III(a)

[0189] 其中

[0190] R"'是卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基);

[0191] R_1是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基);

[0192] R_2是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基

(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0193] 或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环

[0194] 环B(例如,环已基、环已烯基、环戊基);

[0195] R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0196] R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、N(R)$_2$;

[0197] 或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,

[0198] 环丙基);

[0199] R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、N(R)$_2$;

[0200] R_{40}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

[0201] 或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基);

[0202] 或R_4和R_{40}连接形成3-8元取代或未取代的杂环或环烷基环;

[0203] R_5是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶));

[0204] X_1是O、CH_2、NH或N-R_{50};

[0205] R_8是[CH_2]$_p$

[0206] 其中p是1至10;

[0207] R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))或S(O)$_2$R;

[0208] R_{50}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丁基、异丙基);

[0209] R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基,或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环;

[0210] A环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基);

[0211] B环不存在,或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如,环已基、环已烯基、环戊基);

[0212] C环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基)。

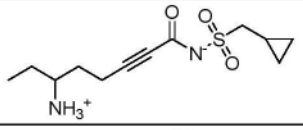
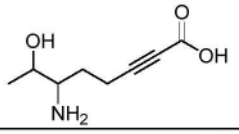
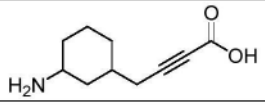
[0213] 在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2。在一些实施方案中,A、B和C环中至少一个存在。在一些实施方案中,R_3和R_4中的一个是NH_2,另一个是OH。

[0214] 在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的任何一种化合物。在各个实施方案中,所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中,所述化合物用于防治不期望的植物的生

长。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫化合物。

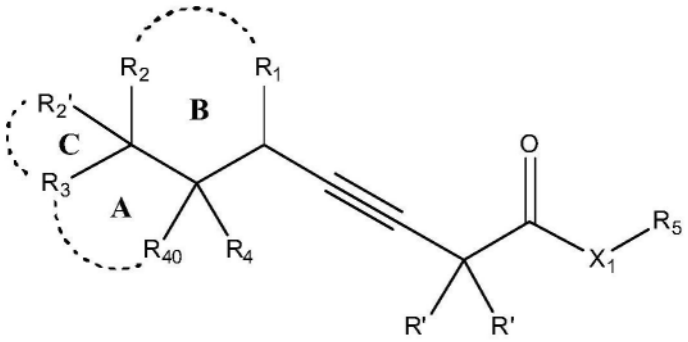
[0215] 在各个实施方案中,式III(a)的化合物由以下任何一种结构表示:

[0216]

化合物编号	结构
105	
132	
167	

[0217] 在各个实施方案中,本发明涉及一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式III(b)的结构表示:

[0218]



III(b)

[0219] 其中

[0220] R'是卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基);

[0221] R_1是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基、苄基);

[0222] R_2是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0223] 或R_1和R_2连接形成3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环

[0224] 环B(例如,环己基、环己烯基、环戊基);

[0225] R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基(CH=CH_2)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0226] R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0227] 或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,

[0228] 环丙基);

[0229] R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$；

[0230] R_{40}是H，C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如，甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基)；

[0231] 或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A

[0232] (例如，环丙基、环丁基、环戊基、环已基)；

[0233] 或R_4和R_{40}连接形成3-8元取代或未取代的杂环或环烷基环；

[0234] R_5是H，C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如，甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3)，C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基，C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如，CCH、CH_2-CCH)，C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如，CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$)，R_8-芳基(例如，CH_2-Ph)，C(=CH_2)-R_{10}(例如，C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN)，取代或未取代的烷基砜(例如，SO_2-CH_2-环丙基)，取代或未取代的芳基(例如，苯基)，取代或未取代的杂芳基(例如，吡啶(2、3和4-吡啶))；

[0235] X_1是O、CH_2、NH或N-R_{50}；

[0236] R_8是$[CH_2]_p$

[0237] 其中p是1至10；

[0238] R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如，甲基、乙基)、C(O)R(例如，C(O)(OCH_3))或$S(O)_2R$；

[0239] R_{50}是H，C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如，甲基、乙基、丁基、异丙基)；

[0240] R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基，或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环；

[0241] A环不存在，或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如，环丙基、环丁基、环戊基、环已基)；

[0242] B环不存在，或是3-8元取代或未取代、饱和或不饱和的碳环(例如，环已基、环已烯基、环戊基)；

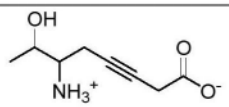
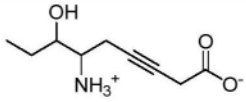
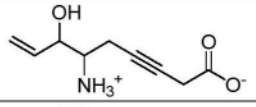
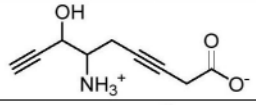
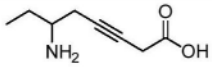
[0243] C环不存在，或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如，环丙基)。

[0244] 在一些实施方案中，R_3和R_4至少一个是NH_2。在一些实施方案中，A、B和C环中至少一个存在。在一些实施方案中，R_3和R_4中的一个是NH_2，另一个是OH。

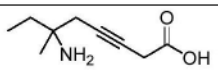
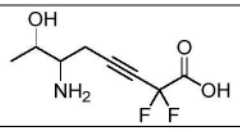
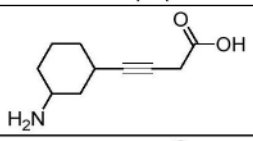
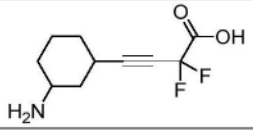
[0245] 在一些实施方案中，所述化合物是表1中列出的任何一种化合物。在各个实施方案中，所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中，所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中，所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中，所述化合物是杀虫化合物。

[0246] 在各个实施方案中，式III(b)的化合物由以下任何一种结构表示：

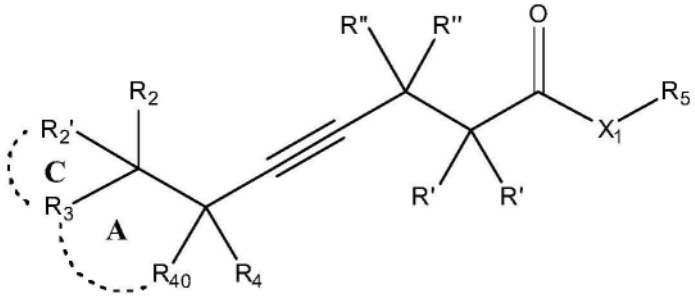
[0247]

化合物编号	结构
100	
102	
103	
104	
108	

[0248]

109	
149	
154	
168	

[0249] 在各个实施方案中,本发明涉及一种化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合,所述化合物由式III(c)的结构表示:

[0250] 

III(c)

[0251] 其中

[0252] R'和R"各自独立地选自卤素(例如,F)或C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基);

[0253] R_2是H,F,Cl,Br,I、C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0254] R_2'是H,F,Cl,Br,I,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基(例如,乙烯基($CH=CH_2$)),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,乙炔基(CCH));

[0255] R_3是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0256] 或R_3和R_2'连接形成3-8元取代或未取代的环烷基环C(例如,

[0257] 环丙基);

[0258] R_4是H、F、Cl、Br、I、OH、SH、NH_2、NHR、$N(R)_2$;

[0259] R_{40}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丙基、异丙基、叔丁基、异丁基、戊基);

[0260] 或R_3和R_{40}连接在一起形成3-8元取代或未取代的环烷基环A(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基);

[0261] 或R_4和R_{40}连接形成3-8元取代或未取代的杂环或环烷基环;

[0262] R_5是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2、3和4-吡啶));

[0263] X_1是O、CH_2、NH或N-R_{50};

[0264] R_8是$[CH_2]_p$

[0265] 其中p是1至10;

[0266] R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链的烷基(例如,甲基、乙基)、C(O)R(例如,C(O)(OCH_3))或$S(O)_2R$;

[0267] R_{50}是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、乙基、丁基、异丙基);

[0268] R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基,或两个偕R取代基连接在一起形成5元或6元杂环;

[0269] A环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基、环丁基、环戊基、环已基);

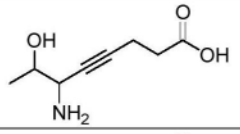
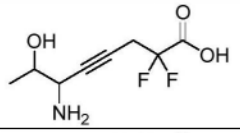
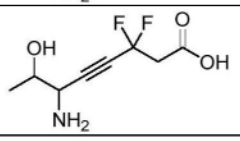
[0270] C环不存在,或是3-8元取代或未取代的环烷基环(例如,环丙基)。

[0271] 在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2。在一些实施方案中,A、B和C环中至少一个存在。在一些实施方案中,R_3和R_4中的一个是NH_2,另一个是OH。

[0272] 在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的任何一种化合物。在各个实施方案中,所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中,所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫化合物。

[0273] 在各个实施方案中,式III(c)的化合物由以下任何一种结构表示:

[0274]

化合物编号	结构
133	
147	
148	

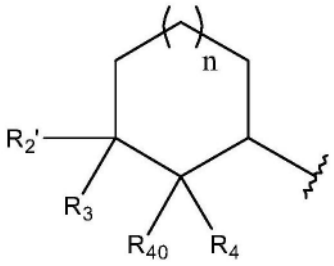
[0275] 在各个实施方案中,所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中,所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫化合物。

[0276] 在各个实施方案中,本发明涉及由上文表1所示的任何一种结构表示的化合物。在各个实施方案中,所述化合物是除草化合物。在各个实施方案中,所述化合物用于防治不期望的植物的生长。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在各个实施方案中,所述化合物是杀虫化合物。

[0277] 在各个实施方案中,本发明涉及杀虫和/或除草化合物和/或由表1所示的任何一种结构表示的化合物或其农用化学组合物在防治不期望的植物的生长中的用途。

[0278] 在各个实施方案中,式I、II(a-d)和III(a-c)的化合物的环A是3-8元取代或未取代的环烷基。在各个实施方案中,环A不存在。在各个实施方案中,环A是未取代的3-8元环烷基。在各个实施方案中,环A是取代的3-8元环烷基。在各个实施方案中,环A是环丙基。在各个实施方案中,环A是环丁基。在各个实施方案中,环A是环戊基。在各个实施方案中,环A是环己基。

[0279] 在各个实施方案中,式I、II(a-d)和III(a-b)的化合物的环B是3-8元、取代或未取代、饱和或不饱和的碳环。在各个实施方案中,环B不存在。在各个实施方案中,环B是3-8元取代的饱和环。在各个实施方案中,环B是3-8元取代的环烷基。在各个实施方案中,环B是3-8元未取代的饱和环。在各个实施方案中,环B是环己基。在各个实施方案中,环B是3-8元未取代的环烷基。在各个实施方案中,环B是3-8元取代的不饱和环。在各个实施方案中,环B是3-8元取代的环烯基。在各个实施方案中,环B是3-8元未取代的不饱和环。在各个实施方案中,环B是3-8元未取代的环烯基。在各个实施方案中,环B是取代或未取代的环己烯基。在各个实施方案中,环B是取代或未取代的环戊基。在各个实施方案中,环B是胺取代的环烷基。在各个实施方案中,环B是胺取代的环烯基。在各个实施方案中,环B被R_4、R_{40}、R_2'和R_3取代。在各个实施方案中,环B被R_4、R_{40}、R_2'和R_3取代,其中R_3和R_4至少一个是胺(例如,NH_2)。在各个实施方案中,环B由式(B)表示:

[0280] 

B

[0281] 其中n是0、1或2。

[0282] 应理解,上文环B中的弯曲线表示环B与分子其余部分的连接点。

[0283] 在各个实施方案中,式I、II(a-d)和III(a-c)的化合物的环C是3-8元取代或未取代的环烷基。在各个实施方案中,环C不存在。在各个实施方案中,环C是未取代的环丙基。在各个实施方案中,环C是取代的环丙基。在各个实施方案中,环C为环丁基、环戊基、环己基;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0284] 在一些实施方案中,A、B和C环中至少一个存在。

[0285] 在一些实施方案中,式(I)的C_I是取代或未取代的碳中心。在一些实施方案中,C_I是未取代的碳中心,R_1是H。在一些实施方案中,C_I是取代的碳中心,R_1定义如下。在一些实施方案中,C_I是取代的碳中心,R_1是R_{20},定义如下。在一些实施方案中,C_I是sp、sp^2或sp^3碳原子,这取决于它分别是否是三键、双键或单键的一部分。在一些实施方案中,式I的C_I是sp碳原子;在这种情况下R_1不存在。在一些实施方案中,C_I是C。在一些实施方案中,C_I是sp^2碳原子。在一些实施方案中,C_I是CH。在一些实施方案中,C_I是$C(R_{20})$。在一些实施方案中,C_I是$C\text{-}R_1$。在一些实施方案中,C_I是sp^3碳原子。在一些实施方案中,C_I是CH_2。在一些实施方案中,C_I是$CH(R_{20})$。在一些实施方案中,C_I是$CH\text{-}R_1$。在一些实施方案中,C_I是$C(R_{20})_2$。

[0286] 在一些实施方案中,式(I)的C_{II}是取代或未取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{II}是未取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{II}是取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{II}是sp、sp^2或sp^3碳原子,这取决于它分别是否是三键、双键或单键的一部分。在一些实施方案中,式I的C_{II}是sp碳原子。在一些实施方案中,C_{II}是C。在一些实施方案中,C_{II}是sp^2碳原子。在一些实施方案中,C_{II}为CH。在一些实施方案中,C_{II}为$C(R_{20})$。在一些实施方案中,C_{II}是sp^3碳原子。在一些实施方案中,C_{II}是CH_2。在一些实施方案中,C_{II}是$CH(R_{20})$。在一些实施方案中,C_{II}是$C(R_{20})_2$。

[0287] 在一些实施方案中,式(I)的C_{III}是取代或未取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{III}是未取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{III}是取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{III}是sp、sp^2或sp^3碳原子,这取决于它分别是否是三键、双键或单键的一部分。在一些实施方案中,式I的C_{III}是sp碳原子。在一些实施方案中,C_{III}是C。在一些实施方案中,C_{III}是sp^2碳原子。在一些实施方案中,C_{III}为CH。在一些实施方案中,C_{III}为$C(R_{20})$。在一些实施方案中,C_{III}是sp^3碳原子。在一些实施方案中,C_{III}是CH_2。在一些实施方案中,C_{III}是$CH(R_{20})$。在一些实施方案中,C_{III}是$C(R_{20})_2$。

[0288] 在一些实施方案中,式(I)的C_{IV}是取代或未取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{IV}是未取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{IV}是取代的碳中心。在一些实施方案中,C_{IV}是sp、sp^2或sp^3碳原子,这取决于它分别是否是三键、双键或单键的一部分。在一些实施方案中,式

I的C_{IV}是sp碳原子。在一些实施方案中,C_{IV}是C。在一些实施方案中,C_{IV}是sp^2碳原子。在一些实施方案中,C_{IV}为CH。在一些实施方案中,C_{IV}为C(R_{20})。在一些实施方案中,C_{IV}是sp^3碳原子。在一些实施方案中,C_{IV}是CH_2。在一些实施方案中,C_{IV}是CH(R_{20})。在一些实施方案中,C_{IV}是C(R_{20})$_2$。

[0289] 在一些实施方案中,式(I)的R_{20}是卤素。在一些实施方案中,R_{20}是F。在一些实施方案中,R_{20}是Cl。在一些实施方案中,R_{20}是Br。在一些实施方案中,R_{20}是I。在一些实施方案中,R_{20}是C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R_{20}是甲基。在一些实施方案中,R_{20}是乙基。在一些实施方案中,R_{20}是丙基。在一些实施方案中,R_{20}是异丙基。在一些实施方案中,R_{20}是丁基。在其他实施方案中,R_{20}不是H。在一些实施方案中,R_{20}是卤素或C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R_{20}是F或甲基。

[0290] 在一些实施方案中,式(I)、II(a-d)和/或III(a-c)的R是C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R是甲基。在一些实施方案中,R是乙基。在一些实施方案中,R是丙基。在一些实施方案中,R是异丙基。在一些实施方案中,R是丁基。在一些实施方案中,R是C_1-C_5直链或支链烷氧基。在其它实施方案中,R是甲氧基。在一些实施方案中,R是苯基。在一些实施方案中,R是芳基。在一些实施方案中,R是杂芳基。在一些实施方案中,两个偕R取代基连接在一起形成5或6元杂环。在其他实施方案中,R是C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、苯基、芳基或杂芳基。在其他实施方案中,R不是H。

[0291] 在一些实施方案中,式(I)化合物的C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}各自独立地是单键或双键,其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个是双键。在一些实施方案中,C_I---C_{II}是单键。在一些实施方案中,C_I---C_{II}是双键。在一些实施方案中,C_{II}---C_{III}是单键。在一些实施方案中,C_{II}---C_{III}是双键。在一些实施方案中,C_{III}---C_{IV}是单键。在一些实施方案中,C_{III}---C_{IV}是双键。在一些实施方案中,C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}各自独立地是单键或三键,其中C_I---C_{II}、C_{II}---C_{III}和C_{III}---C_{IV}中至少一个是三键。在一些实施方案中,C_I---C_{II}是三键。在一些实施方案中,如果C_I---C_{II}是三键,则R_1不存在。在一些实施方案中,C_{II}---C_{III}是三键。在一些实施方案中,C_{III}---C_{IV}是三键。

[0292] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-b)的化合物的R_1是H。在一些实施方案中,R_1是F。在一些实施方案中,R_1是Cl。在一些实施方案中,R_1是Br。在一些实施方案中,R_1是I。在一些实施方案中,R_1是取代或未取代的C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R_1是甲基。在一些实施方案中,R_1是乙基。在一些实施方案中,R_1是丙基。在一些实施方案中,R_1是异丙基。在一些实施方案中,R_1是叔丁基。在一些实施方案中,R_1是异丁基。在一些实施方案中,R_1是戊基。在一些实施方案中,R_1是苄基。在一些实施方案中,如果C_I---C_{II}是三键,则R_1不存在。在一些实施方案中,R_1可进一步被选自以下的至少一种取代基取代:F,Cl,Br,I,OH,SH,C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基、乙基),C_2-C_5直链或支链烯基,C_2-C_5直链或支链炔基(例如,CCH),C_3-C_8环烷基,直链、支链或环状的烷氧基,COOH,COO(R),NH_2,N(R)$_2$,CF_3,芳基,苯基,杂芳基(例如,咪唑),C_3-C_8环烷基(例如,环己基),CN和NO_2;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0293] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_2是H。在一些实施方案中,R_2是F。在一些实施方案中,R_2是Cl。在一些实施方案中,R_2是Br。在一些实施方案中,R_2是I。在一些实施方案中,R_2是取代或未取代的C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R_2

是甲基。在一些实施方案中,R_2是乙基。在一些实施方案中,R_2是丙基。在一些实施方案中,R_2是异丙基。在一些实施方案中,R_2是叔丁基。在一些实施方案中,R_2是异丁基。在一些实施方案中,R_2是戊基。在一些实施方案中,R_2是取代或未取代的C_2-C_5直链或支链烯基。在一些实施方案中,R_2是乙烯基。在一些实施方案中,R_2是$CH=CH_2$。在一些实施方案中,R_2是取代或未取代的C_2-C_5直链或支链炔基。在一些实施方案中,R_2是乙炔基。在一些实施方案中,R_2是CCH。在一些实施方案中,R_2可进一步被选自以下的至少一种取代基取代:F,Cl,Br,I,OH,SH,C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基、乙基),C_2-C_5直链或支链烯基,C_2-C_5直链或支链炔基(例如,CCH),C_3-C_8环烷基,直链、支链或环状的烷氧基,COOH,COO(R),NH_2,N(R)$_2$,CF_3,芳基,苯基,杂芳基(例如,咪唑),C_3-C_8环烷基(例如,环己基),CN和NO_2;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0294] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-b)的R_1和R_2连接形成如上所定义的环B。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成取代或未取代、饱和或不饱和的3-8元碳环。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成取代的饱和3-8元的碳环。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成取代的不饱和3-8元碳环。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成未取代的饱和3-8元碳环。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成未取代的不饱和3-8元碳环。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成环己基。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成环己烯基。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成环戊基。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成环丙基。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成环丁基。在一些实施方案中,R_1和R_2连接形成环庚基。

[0295] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_2'是H。在一些实施方案中,R_2'是F。在一些实施方案中,R_2'是Cl。在一些实施方案中,R_2'是Br。在一些实施方案中,R_2'是I。在一些实施方案中,R_2'是取代或未取代的C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R_2'是甲基。在一些实施方案中,R_2'为乙基。在一些实施方案中,R_2'是丙基。在一些实施方案中,R_2'是异丙基。在一些实施方案中,R_2'是叔丁基。在一些实施方案中,R_2'是异丁基。在一些实施方案中,R_2'是戊基。在一些实施方案中,R_2'是取代或未取代的C_2-C_5直链或支链烯基。在一些实施方案中,R_2'是乙烯基。在一些实施方案中,R_2'为$CH=CH_2$。在一些实施方案中,R_2'是取代或未取代的C_2-C_5直链或支链炔基。在一些实施方案中,R_2'是乙炔基。在一些实施方案中,R_2'是CCH。在一些实施方案中,R_2'可进一步被选自以下的至少一种取代基取代:F,Cl,Br,I,OH,SH,C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基、乙基),C_2-C_5直链或支链烯基,C_2-C_5直链或支链炔基(例如,CCH),C_3-C_8环烷基,直链、支链或环状的烷氧基,COOH,COO(R),NH_2,N(R)$_2$,CF_3,芳基,苯基,杂芳基(例如,咪唑),C_3-C_8环烷基(例如,环己基),CN和NO_2;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0296] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_3是H。在一些实施方案中,R_3是F。在一些实施方案中,R_3是Cl。在一些实施方案中,R_3是Br。在一些实施方案中,R_3是I。在一些实施方案中,R_3是OH。在一些实施方案中,R_3是SH。在一些实施方案中,R_3是NH_2。在一些实施方案中,R_3是NHR。在一些实施方案中,R_3是N(R)$_2$。在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2、NH(R)或N(R)$_2$。在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2。

[0297] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_3和R_2'连接形成如上所定义的环C。在一些实施方案中,R_3和R_2'连接形成取代或未取代的3-8元环烷基。在一些实施方案中,R_3和R_2'连接形成未取代的3-8元环烷基。在一些实施方案中,R_3和R_2'连接形成环

丙基。在一些实施方案中,R_3和R_2'连接形成环丁基、环戊基、环己基或环庚基;各自代表根据本发明的单独实施方案。在一些实施方案中,R_3和R_2'连接形成取代的3-8元环烷基。

[0298] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_4是H。在一些实施方案中,R_4是F。在一些实施方案中,R_4是Cl。在一些实施方案中,R_4是Br。在一些实施方案中,R_4是I。在一些实施方案中,R_4是OH。在一些实施方案中,R_4是SH。在一些实施方案中,R_4是NH_2。在一些实施方案中,R_4是NHR。在一些实施方案中,R_4是$N(R)_2$。在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2、NH(R)或$N(R)_2$。在一些实施方案中,R_3和R_4至少一个是NH_2。

[0299] 在一些实施方案中,R_3和R_4中的一个是NH_2,另一个是OH。在一些实施方案中,R_3是NH_2,R_4是OH。在一些实施方案中,R_4是NH_2,R_3是OH。在一些实施方案中,R_3是NH_2,R_4是OH;或R_4是NH_2,R_3是OH。

[0300] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_{40}是H。在一些实施方案中,R_{40}是C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基。在一些实施方案中,R_{40}是C_1-C_5直链未取代的烷基。在一些实施方案中,R_{40}是C_1-C_5直链取代的烷基。在一些实施方案中,R_{40}是C_1-C_5支链取代的烷基。在一些实施方案中,R_{40}是C_1-C_5支链未取代的烷基。在一些实施方案中,R_{40}是甲基。在一些实施方案中,R_{40}是乙基。在一些实施方案中,R_{40}是丙基。在一些实施方案中,R_{40}是异丙基。在一些实施方案中,R_{40}是叔丁基。在一些实施方案中,R_{40}是异丁基。在一些实施方案中,R_{40}是戊基。在一些实施方案中,R_{40}可进一步被选自以下的至少一种取代基取代:F,Cl,Br,I,OH,SH,C_1-C_5直链或支链烷基(例如,甲基、乙基),C_2-C_5直链或支链烯基,C_2-C_5直链或支链炔基(例如,CCH),C_3-C_8环烷基,直链、支链或环状的烷氧基,COOH,COO(R),NH_2,$N(R)_2$,CF_3,芳基,苯基,杂芳基(例如,咪唑),C_3-C_8环烷基(例如,环己基),CN和NO_2;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0301] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_3和R_{40}连接在一起形成如上所述的环A。在一些实施方案中,R_3和R_{40}连接在一起形成取代或未取代的3-8元环烷基。在一些实施方案中,R_3和R_{40}连接在一起形成未取代的3-8元环烷基。在一些实施方案中,R_3和R_{40}连接在一起形成取代的3-8元环烷基。在一些实施方案中,R_3和R_{40}连接在一起形成环丙基。在一些实施方案中,R_3和R_{40}连接在一起形成环丁基。在一些实施方案中,R_3和R_{40}连接在一起形成环戊基。在一些实施方案中,R_3和R_{40}连接在一起形成环己基。

[0302] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_4和R_{40}连接在一起形成取代或未取代的3-8元杂环。在一些实施方案中,R_4和R_{40}连接形成取代或未取代的3-8元环烷基。在一些实施方案中,R_4和R_{40}连接形成未取代的3-8元环烷基。在一些实施方案中,R_4和R_{40}连接形成取代的3-8元环烷基。在一些实施方案中,R_4和R_{40}连接形成环丙基。在一些实施方案中,R_4和R_{40}连接形成环丁基。在一些实施方案中,R_4和R_{40}连接形成环戊基。在一些实施方案中,R_4和R_{40}连接形成环己基。

[0303] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的化合物的R_5是H,C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基(例如,甲基、CH_2SH、乙基、丁基、CH_2-CCH、异丙基、CH_2-C(O)-OCH_3),C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基,C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基(例如,CCH、CH_2-CCH),C_1-C_5直链或支链的卤代烷基(例如,CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$、$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$),R_8-芳基(例如,CH_2-Ph),C(=CH_2)-R_{10}(例如,C(=CH_2)-C(O)-OCH_3、C(=CH_2)-CN),取代或未取代的烷基砜(例如,SO_2-CH_2-环丙基),取代或未取代的

芳基(例如,苯基),取代或未取代的杂芳基(例如,吡啶(2,3和4-吡啶));各自代表根据本发明的单独实施方案。在一些实施方案中,R_5是H。在一些实施方案中,R_5是C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基。在一些实施方案中,R_5是甲基、乙基、异丙基、丁基、CH_2-CCH、CH_2-C(O)-OCH_3;各自代表根据本发明的单独实施方案。在一些实施方案中,R_5是C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的烯基。在一些实施方案中,R_5是C_2-C_5直链或支链、取代或未取代的炔基。在一些实施方案中,R_5是CCH。在一些实施方案中,R_5是CH_2-CCH。在一些实施方案中,R_5是C_1-C_5直链或支链的卤代烷基。在一些实施方案中,R_5是取代或未取代的烷基砜。在一些实施方案中,R_5是SO_2-CH_2-环戊基。在一些实施方案中,R_5是SO_2-CH_2-环丙基。在一些实施方案中,R_5是取代的或未取代的芳基。在一些实施方案中,R_5是取代的或未取代的杂芳基。在一些实施方案中,R_5是吡啶。在一些实施方案中,R_5可进一步被选自以下的至少一种取代基取代:F,Cl,Br,I,OH,SH,C_1-C_5直链或支链烷基,C_2-C_5直链或支链烯基,C_2-C_5直链或支链炔基(例如,CCH),C_3-C_8环烷基,直链、支链或环烷氧基,COOH,COO(R),NH_2,N(R)$_2$,CF_3,芳基,苯基,杂芳基,C_3-C_8环烷基,CN和NO_2;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0304] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的X_1是O。在其他实施方案中,X_1是CH_2。在其他实施方案中,X_1是NH。在其他实施方案中,X_1是N-R_{50}。

[0305] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的R_8是CH_2。在其他实施方案中,R_8是CH_2CH_2。在其他实施方案中,R_8是$CH_2CH_2CH_2$。

[0306] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的p是1。在其他实施方案中,p是2。在其他实施方案中,p是3。

[0307] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的R_{10}是H。在其他实施方案中,R_{10}是H、CN、C_1-C_5直链或支链烷基、甲基、乙基、C(O)R、C(O)(OCH_3)或S(O)$_2$R;各自代表根据本发明的单独实施方案。在其他实施方案中,R_{10}是C_1-C_5直链或支链烷基。在其他实施方案中,R_{10}是CH_3。在其他实施方案中,R_{10}是CH_2CH_3。在其他实施方案中,R_{10}是$CH_2CH_2CH_3$。在其他实施方案中,R_{10}是CN。在其他实施方案中,R_{10}是C(O)R。在其他实施方案中,R_{10}是C(O)(OCH_3)。在其他实施方案中,R_{10}是S(O)$_2$R。

[0308] 在一些实施方案中,式II(a-d)和/或III(b-c)的R'是卤素。在一些实施方案中,R'是F。在一些实施方案中,R'是Cl。在一些实施方案中,R'是Br。在一些实施方案中,R'是I。在一些实施方案中,R'是C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R'是甲基。在一些实施方案中,R'是乙基。在一些实施方案中,R'是丙基。在一些实施方案中,R'是异丙基。在一些实施方案中,R'是丁基。在一些实施方案中,R'是叔丁基。在一些实施方案中,R'是戊基。在一些实施方案中,R'是异戊基。

[0309] 在一些实施方案中,式II(a-d)和/或III(c)的R"是卤素。在一些实施方案中,R"是F。在一些实施方案中,R"是Cl。在一些实施方案中,R"是Br。在一些实施方案中,R"是I。在一些实施方案中,R"是C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R"是甲基。在一些实施方案中,R"是乙基。在一些实施方案中,R"是丙基。在一些实施方案中,R"是异丙基。在一些实施方案中,R"是丁基。在一些实施方案中,R"是叔丁基。在一些实施方案中,R"是戊基。在一些实施方案中,R"是异戊基。

[0310] 在一些实施方案中,式II(a-d)和/或III(a)的R"'是卤素。在一些实施方案中,R"'是F。在一些实施方案中,R"'是Cl。在一些实施方案中,R"'是Br。在一些实施方案中,R"'是

I。在一些实施方案中,R"'是C_1-C_5直链或支链烷基。在一些实施方案中,R"'是甲基。在一些实施方案中,R"'是乙基。在一些实施方案中,R"'是丙基。在一些实施方案中,R"'是异丙基。在一些实施方案中,R"'是丁基。在一些实施方案中,R"'是叔丁基。在一些实施方案中,R"'是戊基。在一些实施方案中,R"'是异戊基。

[0311] 在一些实施方案中,式I、II(a-d)和/或III(a-c)的R_{50}是H。在一些实施方案中,R_{50}是C_1-C_5直链或支链、取代或未取代的烷基。在一些实施方案中,R_{50}是甲基。在一些实施方案中,R_{50}是乙基。在一些实施方案中,R_{50}是丁基。在一些实施方案中,R_{50}是异丙基。在一些实施方案中,R_{50}可进一步被选自以下的至少一种取代基取代:F,Cl,Br,I,OH,SH,C_1-C_5直链或支链烷基,C_2-C_5直链或支链烯基,C_2-C_5直链或支链炔基(例如,CCH),C_3-C_8环烷基,直链、支链或环状的烷氧基,COOH,COO(R),NH_2,N(R)$_2$,CF_3,芳基,苯基,杂芳基,C_3-C_8环烷基,CN和NO_2;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0312] 在一些实施方案中,式B的n是0。在其他实施方案中,n是1。在其他实施方案中,n是2。

[0313] 在各个实施方案中,本发明涉及如上所述表1所示的任何一种化合物、其农用化学组合物和/或用于防治不期望植物生长的使用方法。

[0314] 在各个实施方案中,本发明涉及如上所述表2所示的任何一种化合物和/或其农用化学组合物在防治不期望植物的生长中的用途。

[0315] 应很好理解的是,在碳原子具有少于4个键的本发明所示结构中,存在H原子以完成碳的化合价。应很好理解的是,在氮原子具有少于3个键的本发明所示结构中,存在H原子以完成氮的化合价。

[0316] 在一些实施方案中,本发明涉及如上所列出的化合物、其农用化学组合物和/或使用方法,其中所述化合物是农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、光学异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(氘代类似物)或其任何组合。在一些实施方案中,所述化合物是除草剂。在一些实施方案中,所述化合物是杀虫剂。在一些实施方案中,所述化合物防治不期望的植物的生长。

[0317] 在各个实施方案中,根据本发明的化合物包括基本上纯的立体异构体。基本上纯的,是指立体异构体的纯度为至少约90%,更优选地纯度为至少约95%,甚至更优选地纯度为至少约98%,最优选地纯度为至少约99%。在各个实施方案中,所述化合物包括纯度>80%、>85%、>90%、>91%、>92%、>93%、>94%、>95%、>96%、>97%、>98%、>99%、>99.5%对映异构体过量(ee)的单一立体异构体;各自代表根据本发明的单独实施方案。在各个实施方案中,所述化合物包括纯度>80%、>85%、>90%、>91%、>92%、>93%、>94%、>95%、>96%、>97%、>98%、>99%、>99.5%对映异构体比率(er)的单一立体异构体;各自代表根据本发明的单独实施方案。在各个实施方案中,所述化合物包括纯度高于80%、85%、90%、91%、92%、93%、94%、95%、96%、97%、98%、99%、99.5%的单一立体异构体;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0318] 在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的单一对映异构体。在各个实施方案中,所述化合物包括立体异构体的混合物。在各个实施方案中,所述化合物包括对映异构体的混合物。在各个实施方案中,所述化合物是外消旋体。

[0319] 在各个实施方案中,所述化合物具有两个手性中心。在各个实施方案中,所述化合

物包括立体异构体的混合物。在各个实施方案中,所述化合物包括2种、3种或4种立体异构体的混合物;各自代表根据本发明的单独实施方案。在各个实施方案中,所述化合物是单一立体异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的单一立体异构体。在各个实施方案中,所述基本上纯的立体异构体是如下所述的化合物110。在各个实施方案中,基本上纯的立体异构体的纯度为至少80%、85%、90%、95%、97%、98%、99%;各自代表根据本发明的单独实施方案。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的RR立体异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的SS立体异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的RS立体异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的SR立体异构体。

[0320] 如本文所使用的,除非另有说明,否则术语"烷基"可以是含有至多约30个碳的任何直链或支链烷基。在一些实施方案中,烷基包含C_1-C_5碳。在一些实施方案中,烷基包含C_1-C_6碳。在一些实施方案中,烷基包含C_1-C_8碳。在一些实施方案中,烷基包含C_2-C_5碳。在一些实施方案中,烷基包含C_2-C_8碳。在一些实施方案中,烷基包含C_1-C_{10}碳。在一些实施方案中,烷基是C_1-C_{12}碳。在一些实施方案中,烷基是C_1-C_{20}碳。在一些实施方案中,支链烷基是被具有1至5个碳的烷基侧链取代的烷基。在各个实施方案中,烷基可以是未取代的。在一些实施方案中,烷基可以被以下取代:卤素、卤代烷基、羟基、烷氧基、羰基、酰胺基、烷基酰胺基、二烷基酰胺基、氰基、硝基、CO_2H、氨基、烷基氨基、二烷基氨基、羧基、硫代、硫代烷基、C_1-C_5直链或支链卤代烷氧基、CF_3、苯基、卤代苯基、(苄氧基)苯基、-CH_2CN、NH_2、NH-烷基、N(烷基)$_2$、-OC(O)CF_3、-OCH_2Ph、-NHC(O)-烷基、-C(O)Ph、C(O)O-烷基、C(O)H、-C(O)NH_2或其任何组合。

[0321] 烷基可以是唯一的取代基,或其可以是较大取代基的组分,例如在烷氧基、烷氧基烷基、卤代烷基、芳基烷基、烷基氨基、二烷基氨基、烷基酰胺基、烷基脲等中。优选的烷基是甲基、乙基和丙基,以及由此优选卤代甲基、二卤代甲基、三卤代甲基、卤代乙基、二卤代乙基、三卤代乙基、卤代丙基、二卤代丙基、三卤代丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、芳基甲基、芳基乙基、芳基丙基、甲基氨基、乙基氨基、丙基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、甲酰胺基、乙酰胺基、丙酰胺基、卤代甲基酰胺基、卤代乙基酰胺基、卤代丙基酰胺基、甲基脲、乙基脲、丙基脲、2-CH_2-C_6H_4-Cl、3-CH_2-C_6H_4-Cl或4-CH_2-C_6H_4-Cl、C(OH)(CH_3)(Ph)等。

[0322] 如本文所使用的,术语"烯基"可以是含有至多约30个碳(如上文针对术语"烷基"所定义)和至少一个碳-碳双键的任何直链或支链烯基。因此,如本文所定义的术语烯基还包含链二烯、链三烯、链四烯等。在一些实施方案中,烯基含有一个碳-碳双键。在一些实施方案中,烯基含有两个、三个、四个、五个、六个、七个或八个碳-碳双键;各自代表根据本发明的单独实施方案。烯基的非限制性实例包含:乙烯基、丙烯基、丁烯基(即,1-丁烯基、反式-2-丁烯基、顺式-2-丁烯基和异丁烯基)、戊烯(即,1-戊烯基、顺式-2-戊烯基和反式-2-戊烯基)、己烯(例如,1-己烯基、(E)-2-己烯基、(Z)-2-己烯基、(E)-3-己烯基、(Z)-3-己烯基、2-甲基-1-戊烯等),它们都可以如上文针对术语"烷基"所定义的那样被取代。

[0323] 如本文所使用的,术语"炔基"可以是含有至多约30个碳(如上文针对术语"烷基"所定义)和至少一个碳-碳三键的任何直链或支链炔基。因此,如本文所定义的术语炔基还包含链二炔、链三炔、链四炔等。在一些实施方案中,炔基含有一个碳-碳三键。在一些实施方案中,炔基含有两个、三个、四个、五个、六个、七个或八个碳-碳三键;各自代表根据本发明的单独实施方案。炔基的非限制性实例包含:乙炔基、丙炔基、丁炔基(即,1-丁炔基、2-丁炔基和异丁炔基)、戊炔(即,1-戊炔基、2-戊炔基)、己炔(例如,1-己炔基、2-己炔基、3-己炔

基等),它们都可以如上文针对术语“烷基”所定义的那样被取代。

[0324] 如本文所使用的,术语“芳基”是指与另一个基团直接键合的任何芳环并且可以是取代或未取代的。芳基可以是唯一的取代基,或者芳基可以是更大的取代基的组分,如在芳基烷基、芳基氨基、芳基酰胺基等中。示例性芳基包括但不限于苯基、甲苯基、二甲苯基、呋喃基、萘基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、噻唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、咪唑基、噻吩基、吡咯基、吲哚基、苯基甲基、苯基乙基、苯基氨基、苯酰胺基、3-甲基-4H-1,2,4-三唑基、5-甲基-1,2,4-噁二唑基等。取代基包括但不限于:F、Cl、Br、I、C_1-C_5直链或支链烷基、C_1-C_5直链或支链卤代烷基、C_1-C_5直链或支链烷氧基、C_1-C_5直链或支链卤代烷氧基、CF_3、苯基、卤代苯基、(苄氧基)苯基、CN、NO_2、-CH_2CN、NH_2、NH-烷基、N(烷基)$_2$、羟基、-OC(O)CF_3、-OCH_2Ph、-NHC(O)-烷基、COOH、-C(O)Ph、C(O)O-烷基、C(O)H、-C(O)NH_2或其任何组合。

[0325] 如本文所使用的,“杂芳基”可以是任何这样的环,包括但不限于:吡啶基、(2-、3-和4-吡啶基)、喹啉基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基、噻唑基、异噻唑基、噁唑基、异噁唑基、咪唑基、1-甲基咪唑、吡唑基、吡咯基、呋喃基、噻吩基、喹啉基、异喹啉基、2,3-二氢茚基、茚基、四氢萘基、3,4-二氢-2H-苯并[b][1,4]dioxepine、苯并二氧戊烯基(benzodioxolyl)、苯并[d][1,3]间二氧杂环戊烯、四氢萘基、吲哚基、1H-吲哚、异吲哚基、蒽基、苯并咪唑基、2,3-二氢-1H-苯并[d]咪唑基、吲唑基、2H-吲唑、三唑基、4,5,6,7-四氢-2H-吲唑、3H-吲哚-3-酮、噁吟基、苯并噁唑基、1,3-苯并噁唑基、苯并异噁唑基(benzisoxazolyl)、苯并噻唑基、1,3-苯并噻唑、4,5,6,7-四氢-1,3-苯并噻唑、噻唑啉基、喹噁啉基、1,2,3,4-四氢喹噁啉、1-(吡啶-1(2H)-基)乙酮、噌啉基、酞嗪基、喹啉基、异喹啉基、吖啶基、苯并呋喃基、1-苯并呋喃、异苯并呋喃、苯并呋喃-2(3H)-酮、苯并苯硫基、苯并噁二唑、苯并[c][1,2,5]噁二唑基、苯并[c]苯硫基、苯并二氧戊烯基、噻二唑基、[1,3]噁唑并[4,5-b]吡啶、噁二唑基、咪唑并[2,1-b][1,3]噻唑、4H,5H,6H-环戊二烯并[d][1,3]噻唑、5H,6H,7H,8H-咪唑并[1,2-a]吡啶、7-氧代-6H,7H-[1,3]噻唑并[4,5-d]嘧啶、[1,3]噻唑并[5,4-b]吡啶、2H,3H-咪唑并[2,1-b][1,3]噻唑、噻吩并[3,2-d]嘧啶-4(3H)-酮、4-氧代-4H-噻吩并[3,2-d][1,3]噻嗪、咪唑并[1,2-a]吡啶、1H-咪唑并[4,5-b]吡啶、1H-咪唑并[4,5-c]吡啶、3H-咪唑并[4,5-c]吡啶、吡唑并[1,5-a]吡啶、咪唑并[1,2-a]吡嗪、咪唑并[1,2-a]嘧啶、1H-吡咯并[2,3-b]吡啶、吡啶并[2,3-b]吡嗪、吡啶并[2,3-b]吡嗪-3(4H)-酮、4H-噻吩并[3,2-b]吡咯、喹噁啉-2(1H)-酮、1H-吡咯并[3,2-b]吡啶、7H-吡咯并[2,3-d]嘧啶基、噁唑并[5,4-b]吡啶、噻唑并[5,4-b]吡啶、噻吩并[3,2-c]吡啶、3-甲基-4H-1,2,4-三唑、5-甲基-1,2,4-噁二唑、甲基噁唑烷-2-酮等;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0326] 如本文所使用的,术语“烷氧基”是指被如上文所定义的烷基取代的醚基。烷氧基是指直链烷氧基和支链烷氧基两者。烷氧基的非限制性实例有甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、叔丁氧基。

[0327] 在一些实施方案中,“卤代烷基”是指如上文所定义的烷基,其被一个或多个卤素原子取代,例如被F、Cl、Br或I取代。术语“卤代烷基”包括但不限于氟代烷基,即带有至少一个氟原子的烷基。卤代烷基的非限制性实例是CF_3、CF_2CF_3、CF_2CH_3、CH_2CF_3、$CF_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2CF_3$、$CF_2CH(CH_3)_2$和$CF(CH_3)$-$CH(CH_3)_2$。

[0328] 在一些实施方案中,“卤代苯基”是指被一个或多个卤素原子例如F、Cl、Br或I取代的苯基取代基。在一个实施方案中,卤代苯基是4-氯代苯基。

[0329] 在一些实施方案中,“烷氧基烷基”是指如上文所定义的烷基,其被如上文所定义的烷氧基例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、叔丁氧基等取代。烷氧基烷基的非限制性实例是-CH_2-O-CH_3、-CH_2-O-CH(CH_3)$_2$、-CH_2-O-C(CH_3)$_3$、-CH_2-CH_2-O-CH_3、-CH_2-CH_2-O-CH(CH_3)$_2$、-CH_2-CH_2-O-C(CH_3)$_3$。

[0330] 在各个实施方案中,“环烷基(cycloalkyl)”或“碳环”基团是指包括碳原子作为环原子的环结构,其可以是饱和或不饱和的、取代或未取代的、单一或稠合的。在一些实施方案中,环烷基是3-10元环。在一些实施方案中,环烷基是3-12元环。在一些实施方案中,环烷基是6元环。在一些实施方案中,环烷基是5-7元环。在一些实施方案中,环烷基是3-8元环。在一些实施方案中,环烷基可以是未取代的或被以下取代:卤素、烷基、卤代烷基、羟基、烷氧基、羰基、酰胺基、烷基酰胺基、二烷基酰胺基、氰基、硝基、CO_2H、氨基、烷基氨基、二烷基氨基、羧基、硫代、硫代烷基、C_1-C_5直链或支链卤代烷氧基、CF_3、苯基、卤代苯基、(苄氧基)苯基、-CH_2CN、NH_2、NH-烷基、N(烷基)$_2$、-OC(O)CF_3、-OCH_2Ph、-NHC(O)-烷基、-C(O)Ph、C(O)O-烷基、C(O)H、-C(O)NH_2或其任何组合。在一些实施方案中,环烷基环可以与另一饱和或不饱和环烷基或杂环3-8元环稠合。在一些实施方案中,环烷基环是饱和环。在一些实施方案中,环烷基环是不饱和环。环烷基的非限制性实例包括环己基、环己烯基、环丙基、环丙烯基、环戊基、环戊烯基、环丁基、环丁烯基、环辛基、环辛二烯基(COD)、环辛烯(COE)等。

[0331] 在各个实施方案中,“杂环(heterocycle)”或“杂环(heterocyclic)”基团是指除了碳原子之外还包括硫、氧、氮或其任何组合作为环的一部分的环结构。在各个实施方案中,“杂芳环”是指除了碳原子之外还包括硫、氧、氮、硒或其任何组合作为环的一部分的芳环结构。在一些实施方案中,杂环或杂芳环是3-10元环。在一些实施方案中,杂环或杂芳环是3-12元环。在一些实施方案中,杂环或杂芳环是6元环。在一些实施方案中,杂环或杂芳环是5-7元环。在一些实施方案中,杂环或杂芳环是3-8元环。在一些实施方案中,杂环基团或杂芳环可以是未经取代的或被以下取代:卤素、烷基、卤代烷基、羟基、烷氧基、羰基、酰胺基、烷基酰胺基、二烷基酰胺基、氰基、硝基、CO_2H、氨基、烷基氨基、二烷基氨基、羧基、硫醇、硫代烷基、C_1-C_5直链或支链卤代烷氧基、CF_3、苯基、卤代苯基、(苄氧基)苯基、-CH_2CN、NH_2、NH-烷基、N(烷基)$_2$、-OC(O)CF_3、-OCH_2Ph、-NHC(O)-烷基、-C(O)Ph、C(O)O-烷基、C(O)H、-C(O)NH_2或其任何组合。在一些实施方案中,杂环或杂芳环可以与另一饱和或不饱和环烷基或杂环3-8元环稠合。在一些实施方案中,杂环是饱和环。在一些实施方案中,杂环是不饱和环。在一些实施方案中,杂环是脂肪族环。杂环或杂芳环体系的非限制性实例包括吡啶、哌啶、吗啉、哌嗪、噻吩、吡咯、苯并间二氧杂环戊烯、苯并呋喃-2(3H)-酮、苯并[d][1,3]间二氧杂环戊烯、吲哚、噁唑、异噁唑、咪唑和1-甲基咪唑、呋喃、三唑、嘧啶、吡嗪、氧杂环丁烷(1-氧杂环丁烷或2-氧杂环丁烷)、萘、四氢噻吩1,1-二氧化物、噻唑、苯并咪唑、哌啶、1-甲基哌啶、异喹啉、1,3-二氢异苯并呋喃、苯并呋喃、3-甲基-4H-1,2,4-三唑、5-甲基-1,2,4-噁二唑、噁唑烷-2-酮、甲基噁唑烷-2-酮或吲哚;各自是根据本发明的单独实施方案。

[0332] 在各个实施方案中,本发明提供了本发明的化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、立体异构体、光学异构体、互变异构体、水合物、N-氧化物、反向酰胺类似物、同位素变体(例如,氘代类似物)或其任何组合。在各个实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的单一立体异构体。在一些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的光学异构体。在一些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的农用化学上可接受的盐。在一

些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的互变异构体。在一些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的水合物。在一些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的N-氧化物。在一些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的反向酰胺类似物。在一些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的同位素变体(包括但不限于氘代类似物)。在一些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的多晶型物。在一些实施方案中,本发明提供了本发明的化合物的晶体。在一些实施方案中,本发明提供了一种农用化学组合物,其包括如本文所述的本发明的化合物,或在一些实施方案中,包括本发明的化合物的立体异构体、光学异构体、农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)、互变异构体、水合物、N-氧化物、同位素变体(氘代类似物)、多晶型物或晶体的任何组合。

[0333] 在各个实施方案中,术语"异构体"包括但不限于立体异构体,所述立体异构体包含光学异构体和类似物、结构异构体和类似物、构象异构体和类似物等。在一些实施方案中,所述异构体是立体异构体。在另一个实施方案中,所述异构体是光学异构体。

[0334] 本发明的某些化合物可以特定的几何或立体异构形式存在。本发明预期所有这样的化合物,包括其顺式和反式异构体、R-和S-对映异构体、非对映异构体、外消旋混合物,及它们的其他混合物,都在本发明的范围内。另外的不对称碳原子可以存在于例如烷基的取代基中。所有这些异构体及其混合物都包括在本发明中。

[0335] 在各个实施方案中,本发明涵盖本发明的化合物的各种立体异构体的用途。本领域的技术人员将理解,本发明的化合物可以含有至少一个手性中心。因此,在本发明的方法中使用的化合物可以以光学活性或外消旋形式存在且以所述形式分离。根据本发明的化合物可以进一步以以下形式存在:作为立体异构体,可以是光学活性异构体(例如,对映异构体,如(R)或(S));作为对映异构体富集的混合物,外消旋混合物;或作为单一非对映异构体,非对映异构体混合物,或任何其它立体异构体,包括但不限于:(R)(R)、(R)(S)、(S)(S)、(S)(R)、(R)(R)(R)、(R)(R)(S)、(R)(S)(R)、(S)(R)(R)、(R)(S)(S)、(S)(R)(S)、(S)(S)(R)或(S)(S)(S)立体异构体。一些化合物还可以展现出多态现象。应当理解,本发明涵盖任何外消旋、光学活性、多晶型或立体异构形式,或其混合物,所述形式具有可用于防治如本文所述的各种不期望的植物的生长的性质。

[0336] 本领域中熟知如何制备光学活性形式(例如,通过利用再结晶技术拆分外消旋形式、通过由光学活性起始材料合成、通过手性合成或通过使用手性固定相进行色谱分离)。

[0337] 本发明的化合物还可以以外消旋混合物的形式存在,其含有基本上相等的量的立体异构体。在一些实施方案中,本发明的化合物可以使用已知程序来制备或以其它方式分离,以获得基本上不含其对应立体异构体(即,基本上纯的)的立体异构体。基本上纯的是指立体异构体的纯度为至少约95%,更优选地纯度为至少约98%,最优选地纯度为至少约99%。在各个实施方案中,根据本发明的化合物包括基本上纯的立体异构体。在一些实施方案中,基本上纯的立体异构体的纯度为至少70%;75%;80%;85%;90%;93%;95%;97%;98%;99%;99.5%;各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0338] 在各个实施方案中,所述化合物包括单一立体异构体,其纯度>80%、>85%、>90%、>91%、>92%、>93%、>94%、>95%、>96%、>97%、>98%、>99%、>99.5%对映异构体过量(ee)的单一对映异构体;各自代表根据本发明的单独实施方案。在各个实施方案中,所述化合物包括纯度>80%、>85%、>90%、>91%、>92%、>93%、>94%、>95%、>96%、>97%、>

98%、>99%、>99.5%对映异构体比率(er)的单一立体异构体;各自代表根据本发明的单独实施方案。在各个实施方案中,所述化合物包括纯度高于80%、85%、90%、91%、92%、93%、94%、95%、96%、97%、98%、99%、99.5%的单一立体异构体;各自代表根据本发明的单独实施方案。在一些实施方案中,所述化合物是化合物110。

[0339] 在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的单一对映异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的S对映异构体。在各个实施方案中,所述化合物包括对映异构体的混合物。在各个实施方案中,所述化合物是外消旋体。

[0340] 在各个实施方案中,所述化合物具有两个手性中心。在各个实施方案中,所述化合物包括立体异构体的混合物。在各个实施方案中,所述化合物包括2种、3种或4种立体异构体的混合物;各自代表根据本发明的单独实施方案。在各个实施方案中,所述化合物是单一立体异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的单一立体异构体。在各个实施方案中,所述基本上纯的立体异构体的纯度为至少80%、85%、90%、95%、97%、98%、99%;各自代表根据本发明的单独实施方案。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的RR立体异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的SS立体异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的RS立体异构体。在各个实施方案中,所述化合物是基本上纯的SR立体异构体。

[0341] 本发明的化合物还可以呈水合物形式,这意味着所述化合物进一步包含化学计量或非化学计量的量的通过非共价分子间力结合的水。

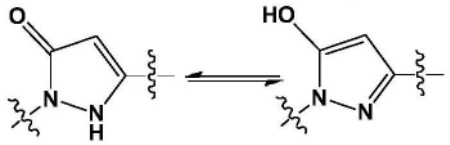
[0342] 如本文所使用的,当一些化学官能团(例如,烷基或芳基)被称为“取代(substituted)”时,本文定义一个或多个取代是可能的。

[0343] 本发明的化合物可以以一种或多种可能的互变异构体的形式存在,并且取决于条件,有可能将一些或所有互变异构体分离成单独且不同的实体。应当理解,本文涵盖所有可能的互变异构体,包含所有另外的烯醇和酮互变异构体和/或异构体。例如,包含以下互变异构体(但不限于这些互变异构体):

[0344] 咪唑环的互变异构

[0345] 

[0346] 吡唑啉酮环的互变异构:

[0347] 

[0348] 本发明包含本发明的化合物的“农用化学上可接受的盐”,所述盐可以通过本发明的化合物与酸或碱的反应而制备。某些化合物,特别是具有酸性基团或碱性基团的那些化合物,也可以呈盐的形式,优选地是农用化学上可接受的盐。术语“农用化学上可接受的盐”是指保留游离碱或游离酸的农用化学有效性和性质的那些盐,其在农用化学上或其它方面都不是非所需的。所述盐由无机酸和有机酸形成,所述无机酸如盐酸、氢溴酸、硫酸、硝酸、磷酸等,所述有机酸如乙酸、丙酸、乙醇酸、丙酮酸、草酸、马来酸、丙二酸、琥珀酸、富马酸、

酒石酸、柠檬酸、苯甲酸、肉桂酸、扁桃酸、甲磺酸、乙磺酸、对甲苯磺酸、水杨酸、N-乙酰半胱氨酸等。其它盐是本领域的技术人员已知的并且可以容易地适应根据本发明使用。

[0349] 本发明的化合物的胺的合适的农用化学上可接受的盐可以由无机酸或有机酸制备。在各个实施方案中,胺的无机盐的实例是硫酸氢盐、硼酸盐、溴化物、氯化物、半硫酸盐、氢溴酸盐、盐酸盐、2-羟乙基磺酸盐(羟基乙烷磺酸盐)、碘酸盐、碘化物、异硫氰酸盐、硝酸盐、过硫酸盐、磷酸盐、硫酸盐、氨基磺酸盐、磺胺酸盐、磺酸(烷基磺酸盐、芳基磺酸盐、卤素取代的烷基磺酸盐、卤素取代的芳基磺酸盐)、磺酸盐和硫氰酸盐。

[0350] 在各个实施方案中,胺的有机盐的实例可以选自脂肪族、脂环族、芳香族、芳脂族、杂环、羧酸和磺酸类的有机酸,其实例为乙酸盐、天冬氨酸盐、抗坏血酸盐、己二酸盐、邻氨基苯甲酸盐、海藻酸盐、烷烃羧酸盐、经取代的烷烃羧酸盐、海藻酸盐、苯磺酸盐、苯甲酸盐、硫酸氢盐、丁酸盐、碳酸氢盐、酒石酸氢盐、柠檬酸盐、樟脑酸盐、樟脑磺酸盐、环己基氨基磺酸盐、环戊烷丙酸盐、依地酸钙(calcium edetate)、樟脑磺酸盐(camsylate)、碳酸盐、克拉维酸盐(clavulanate)、肉桂酸盐、二羧酸盐、二葡萄糖酸盐、十二烷基磺酸盐、二盐酸盐、癸酸盐、庚酸盐、乙磺酸盐(ethanesulfonate)、依地酸盐、乙二磺酸盐、丙酸酯十二烷基硫酸盐、乙磺酸盐(esylate)、富马酸盐、甲酸盐、氟化物、半乳糖醛酸盐、葡糖酸盐、谷氨酸盐、乙醇酸盐(glycolate)、葡糖酸盐(glucorate)、葡庚糖酸盐(glucoheptanoate)、甘油磷酸盐、葡庚糖酸盐(gluceptate)、对羟乙酰氨基苯砷酸盐(glycollylarsanilate)、戊二酸盐、谷氨酸盐、庚酸盐、己酸盐、羟基马来酸盐、羟基羧酸、己基间苯二酚盐、羟基苯甲酸盐、羟萘甲酸盐、氢氟酸盐、乳酸盐、乳糖酸盐、月桂酸盐、苹果酸盐、马来酸盐、亚甲基双(β-氧萘甲酸盐)(methylenebis(beta-oxynaphthoate))、丙二酸盐、扁桃酸盐、甲磺酸盐(mesylate)、甲烷磺酸盐(methane sulfonate)、甲基溴化物、甲基硝酸盐、甲基磺酸盐、马来酸单钾盐、粘酸盐(mucate)、单羧酸盐、萘磺酸盐(naphthalenesulfonate)、2-萘磺酸盐、烟酸盐、硝酸盐、萘磺酸盐(napsylate)、N-甲基葡糖胺、草酸盐、辛酸盐、油酸盐、双羟萘酸盐、苯乙酸盐、苦味酸盐、苯基苯甲酸盐、新戊酸盐、丙酸盐、邻苯二甲酸盐、苯乙酸盐、果胶酸盐、苯丙酸盐、棕榈酸盐、泛酸盐、聚半乳糖酸盐、丙酮酸盐、奎尼酸盐、水杨酸盐、琥珀酸盐、硬脂酸盐、磺胺酸盐、次乙酸盐、酒石酸盐、茶碱乙酸盐(theophyllineacetate)、对甲苯磺酸盐(甲苯磺酸盐)、三氟乙酸盐、对苯二甲酸盐、单宁酸盐(tannate)、氯茶碱盐(teoclate)、三卤乙酸盐、三乙基碘(triethiodide)、三羧酸盐、十一碳酸盐(undecanoate)和戊酸盐。

[0351] 在各个实施方案中,羧酸或羟基的无机盐的实例可以选自铵、碱金属(包含锂、钠、钾、铯);碱土金属(包含钙、镁、铝);锌、钡、季铵。

[0352] 在一些实施方案中,羧酸或羟基的有机盐的实例可以选自精氨酸;有机胺,包含脂肪族有机胺、脂环族有机胺、芳香族有机胺;苄星青霉素(benzathine)、叔丁胺、苯乙苄胺(N-苄基苯乙胺)、二环己胺、二甲胺、二乙醇胺、乙醇胺、乙二胺、海巴胺(hydrabamine)、咪唑、赖氨酸、甲胺、葡甲胺(meglamine)、N-甲基-D-葡糖胺、N,N'-二苄基乙二胺、烟酰胺、有机胺、鸟氨酸、吡啶、皮考啉、哌嗪、普鲁卡因、三(羟甲基)甲胺、三乙胺、三乙醇胺、三甲胺、氨基丁三醇和尿素。

[0353] 在各个实施方案中,盐可以通过常规方式形成,如通过使游离碱或游离酸形式的产物与一个或多个适当的酸或碱的等效物在盐不可溶的溶剂或介质中或者在溶剂(如水)中反应,所述溶剂在真空中或通过冷冻干燥或通过将现有盐的离子交换为另一离子或合适

的离子交换树脂而除去。

[0354] 农用化学组合物

[0355] 本发明的另一个方面涉及一种农用化学组合物,所述农用化学组合物包含农用化学上可接受的载体或稀释剂和根据本发明的各方面所述的化合物。农用化学组合物可以含有一种或多种上述鉴定的本发明化合物。通常,本发明的农用化学组合物将包含本发明的化合物或其农用化学上可接受的盐、两性离子(内盐)以及农用化学上可接受的载体或稀释剂。术语"农用化学上可接受的载体"是指任何合适的佐剂、载体、赋形剂或稳定剂,并且可以呈固体或液体形式,如喷雾剂、气溶胶、粉末、溶液、悬浮液或乳液。

[0356] 根据本发明的化合物可以以未改性的形式用作杀虫剂或除草剂,但是所述化合物通常使用如载体、溶剂和表面活性物质等制剂佐剂以各种方式配制成组合物。制剂可以呈各种物理形式,例如,粉剂、凝胶、可湿性粉末、水可分散性颗粒、水可分散性片剂、泡腾片剂、乳油、微乳油、水包油乳液、油流动剂(oil-flowable)、水性分散体、油性分散体、悬乳剂(suspo-emulsion)、胶囊悬浮液、可乳化颗粒、可溶性液体、水可溶性浓缩物(以水或与水混溶性有机溶剂作为载体)、浸渍的聚合物膜的形式或呈其它已知形式。所述制剂可以直接使用或在使用前稀释。稀释液可以例如由水、液体肥料、微量营养素、生物有机体、油或溶剂制成。

[0357] 通常,所述组合物将含有约0.01%至99%,优选地约20%至75%的活性化合物以及佐剂、载体和/或赋形剂。尽管个体需要可能有所不同,但确定每种组分的有效量的最佳范围在本领域技术范围内。

[0358] 可制备所述制剂,例如,通过将活性成分与制剂佐剂混合以便获得细碎固体、颗粒、溶液、分散体或乳液形式的组合物来制备。活性成分也可以与其它佐剂一起配制,如细碎固体、矿物油、植物或动物来源的油、植物或动物来源的改性油、有机溶剂、水、表面活性物质或其组合。

[0359] 活性成分还可以包含在非常细的微胶囊中。微胶囊含有在多孔载体中的活性成分。这使得活性成分能够以受控量释放到环境中(例如,缓释)。微胶囊的直径通常为0.1至500微米。它们含有的活性成分的量占胶囊重量的约25重量%至95重量%。活性成分可以呈整体固体的形式、固体或液体分散体中的细颗粒的形式或合适溶液的形式。包封膜可以包括例如天然或合成橡胶、纤维素、苯乙烯/丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚酰胺、聚脲、聚氨酯或化学改性聚合物和淀粉黄原酸酯或本领域的技术人员已知的其它聚合物。可替代地,可以形成非常细的微胶囊,其中活性成分以细碎颗粒的形式包含在基础物质的固体基质中,但微胶囊本身不包封。

[0360] 适用于制备根据本发明的组合物的制剂佐剂本身是已知的。作为液体载体,可以使用:水、甲苯、二甲苯、石油醚、植物油、丙酮、甲基乙基酮、环己酮、酸酐、乙腈、苯乙酮、乙酸戊酯、2-丁酮、碳酸亚丁酯、氯苯、环己烷、环己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、对二乙基苯、二甘醇、二甘醇松香酸酯、二甘醇丁醚、二甘醇乙醚、二甘醇甲醚、二甲基甲酰胺(DMF)、二甲基亚砜(DMSO)、1,4-二噁烷、二丙二醇、二丙二醇甲醚、二丙二醇二苯甲酸酯、diproxitol、烷基吡咯烷酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸亚乙酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、α-蒎烯、d-柠檬烯、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁醚、乙二醇甲醚、γ-丁内酯、丙三醇、乙酸甘油酯、二乙酸甘油酯、三乙酸甘油酯、十六烷、己二醇、乙酸异戊酯、乙酸异冰片

酯、异辛烷、异佛尔酮、异丙基苯、肉豆蔻酸异丙酯、乳酸、月桂胺、异亚丙基丙酮、甲氧基丙醇、甲基异戊基酮、甲基异丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、间二甲苯、正已烷、正辛胺、十八烷酸、乙酸辛胺、油酸、油胺、邻二甲苯、苯酚、聚乙二醇、丙酸、乳酸丙酯、碳酸丙烯酯、丙二醇、丙二醇甲醚、对二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三甘醇、二甲苯磺酸、石蜡、矿物油、三氯乙烯、全氯乙烯、乙酸乙酯、乙酸戊酯、乙酸丁酯、丙二醇甲醚、二乙二醇甲醚、甲醇、乙醇、异丙醇和具有更高分子量的醇如戊醇、四氢糠醇、已醇、辛醇、甲基-2-吡咯烷酮等。

[0361] 合适的固体载体是例如滑石、二氧化钛、叶蜡石粘土、二氧化硅、凹凸棒石粘土、硅藻土、石灰石、碳酸钙、膨润土、钙蒙脱石、棉籽壳、小麦粉、大豆粉、浮石、木粉、磨碎的胡桃壳、木质素和类似物质。

[0362] 大量的表面活性物质可以有利地用于固体制剂和液体制剂两者中,尤其是在使用前可以用载体稀释的那些制剂中。表面活性物质可以是阴离子的、阳离子的、非离子的或聚合物的,并且它们可以用作乳化剂、润湿剂或悬浮剂或用于其它目的。典型的表面活性物质包含例如,烷基硫酸酯的盐,如月桂基硫酸二乙醇铵;烷基芳基磺酸盐,如十二烷基苯磺酸钙;烷基酚/环氧烷加成产物,如壬基酚乙氧基化物;醇/环氧烷加成产物,如十三烷醇乙氧基化物;皂类,如硬脂酸钠;烷基萘磺酸盐,如二丁基萘磺酸钠;磺基琥珀酸盐的二烷基酯,如二(2-乙基已基)磺基琥珀酸钠;山梨醇酯,如山梨醇油酸酯;季胺,如月桂基三甲基氯化铵;脂肪酸的聚乙二醇酯,如聚乙二醇硬脂酸酯;环氧乙烷和环氧丙烷的嵌段共聚物;以及单烷基磷酸酯和二烷基磷酸酯的盐;以及本领域技术人员已知的其他物质。

[0363] 可以用于杀虫或除草制剂的其他佐剂包括结晶抑制剂、粘度改性剂、悬浮剂、染料、抗氧化剂、起泡剂、光吸收剂、混合助剂、消泡剂、络合剂、中和或pH调节物质和缓冲液、腐蚀抑制剂、香料、润湿剂、吸收增强剂、微量营养素、增塑剂、助流剂、润滑剂、分散剂、增稠剂、防冻剂、杀微生物剂以及液体和固体肥料。

[0364] 根据本发明的组合物可以包含添加剂,所述添加剂包括植物或动物来源的油、矿物油、这些油的烷基酯或这些油的混合物和油衍生物。基于待施用的混合物计,根据本发明的组合物中的油添加剂的量通常为0.01%至10%。例如,在已经制备喷雾混合物之后,可以将油添加剂以期望浓度添加到喷雾罐中。优选的油添加剂包括矿物油或植物来源的油,例如,菜籽油、橄榄油或葵花油、乳化植物油、植物来源的油的烷基酯,例如甲基衍生物,或动物来源的油,如鱼油或牛油。优选的油添加剂包括C_8-C_{22}脂肪酸的烷基酯,尤其是C_{12}-C_{18}脂肪酸的甲基衍生物,例如,月桂酸、棕榈酸和油酸的甲酯(分别为月桂酸甲酯、棕榈酸甲酯和油酸甲酯)。其它油衍生物是本领域的技术人员已知的,例如,来自Compendium of Herbicide Adjuvants,第10版,Southern Illinois University,2010。

[0365] 杀虫或除草组合物通常包括0.1重量%至99重量%、尤其是0.1重量%至95重量%的根据本发明的化合物以及1重量%至99.9重量%的制剂佐剂,所述制剂佐剂优选地包含0重量%至25重量%的表面活性物质。本发明的组合物通常包括0.1重量%至99重量%、尤其是0.1重量%至95重量%的本发明的化合物以及1重量%至99.9重量%的制剂佐剂,所述制剂佐剂优选地包含0重量%至25重量%的表面活性物质。尽管市售产品可以优选地被配制成浓缩物,但最终用户通常采用稀释的制剂。

[0366] 施用比率具有较大变化幅度,并且取决于土壤的性质、施用方法、作物植物、要防

治的有害生物、主要气候条件以及由施用方法、施用时间和目标作物决定的其它因素。作为一般指导,化合物可以以1l/ha至2000l/ha、尤其是10l/ha至1000l/ha的比率施用。优选的制剂可以具有以下组成(重量%):

[0367] 乳油:

[0368] • 活性成分:1%至95%,优选地60%至90%

[0369] • 表面活性剂:1%至30%,优选地5%至20%

[0370] • 液体载体:1%至80%,优选地1%至35%

[0371] 粉剂:

[0372] • 活性成分:0.1%至10%,优选地0.1%至5%

[0373] • 固体载体:90%至99.9%,优选地99%至99.9%

[0374] 悬浮浓缩物:

[0375] • 活性成分:5%至75%,优选地10%至50%

[0376] • 水:24%至94%,优选地30%至88%

[0377] • 表面活性剂:1%至40%,优选地2%至30%

[0378] 可湿性粉剂:

[0379] • 活性成分:0.5%至90%,优选地1%至80%

[0380] • 表面活性剂:0.5%至20%,优选地1%至15%

[0381] • 固体载体:5%至95%,优选地15%至90%

[0382] 颗粒剂:

[0383] • 活性成分:0.1%至30%,优选地0.1%至15%

[0384] • 固体载体:70%至99.5%,优选地85%至97%

[0385] 当施用本发明的化合物或农用化学组合物以防治不期望的植物的生长时,农用化学组合物还可以包括目前已知的或下文开发的用于各种类型植物的生长防治的其它农用化学药剂或处理方案或可以与目前已知的或下文开发的用于各种类型植物的生长防治的其它农用化学药剂或处理方案结合施用。

[0386] 因此,本发明的组合物可以进一步包括至少一种另外的农药,包括但不限于除草剂。例如,根据本发明的化合物也可以与其它农药、除草剂或植物生长调节剂组合使用。在优选的实施方案中,另外的农药是除草剂和/或除草剂安全剂。

[0387] 可以与本发明的化合物组合使用的除草剂的实例包括但不限于:乙草胺(acetochlor)、氟锁草醚(acifluorfen)(包括三氟羧草醚(acifluorfen-sodium))、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、禾草灭(alloxydim)、莠灭净(ametryn)、氨唑草酮(amicarbazone)、酰嘧磺隆(amidosulfuron)、氯丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、氯氨吡啶酸(aminopyralid)、杀草强(amitrole)、黄草灵(asulam)、莠去津(atrazine)、苄嘧磺隆(bensulfuron)(包括苄嘧磺隆(bensulfuron-methyl))、灭草松(bentazone)、氟吡草酮(bicyclopyrone)、双丙氨膦(bilanafos)、治草醚(bifenox)、双草醚(bispyribac-sodium)、二氯异噁草酮(bixlozone)、除草定(bromacil)、溴草腈(bromoxynil)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、唑草胺(cafenstrole)、唑草酮(carfentrazone)(包括唑酮草酯(carfentrazone-ethyl))、氯酯磺草胺酸(cloransulam)(包括氯酯磺草胺(cloransulam-methyl))、氯嘧磺隆(chlorimuron)(包括氯嘧黄隆(chlorimuron-ethyl))、

绿麦隆(chlorotoluron)、醚磺隆(cinosulfuron)、氯磺隆(chlorsulfuron)、环庚草醚(cinmethylin)、氯酰草膦(clacyfos)、烯草酮(clethodim)、炔草酯(clodinafop)(包括炔草酸(clodinafop-propargyl))、广灭灵(clomazone)、二氯吡啶酸(clopyralid)、cyclopyranil、cyclopyrimorate、环丙嘧磺隆(cyclosulfamuron)、氰氟草酸(cyhalofop)(包括氰氟草酯(cyhalofop-butyl))、2,4-D(包括胆碱盐和其2-乙基己基酯)、2,4-DB、杀草隆(daimuron)、甜菜安(desmedipham)、麦草畏(dicamba)(包括其铝、氨基丙基、双氨基丙基甲基、胆碱、二氯丙、二甘醇胺、二甲胺、二甲基铵、钾盐和钠盐)、禾草灵(diclofop-methyl)、双氯磺草胺(diclosulam)、吡氟酰草胺(diflufenican)、野燕枯(difenzoquat)、吡氟酰草胺(diflufenican)、氟吡草腙(diflufenzopyr)、二甲草胺(dimethachlor)、精二甲吩草胺(dimethenamid-P)、敌草快(diquat dibromide)、敌草隆(diuron)、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟灵(ethalfluralin)、甜菜呋(ethofumesate)、噁唑禾草灵(fenoxaprop)(包括精唑禾草灵(fenoxaprop-P-ethyl))、苯磺噁唑草(fenoxasulfone)、fenquinotrione、四唑酰草胺(fentrazamide)、啶嘧磺隆(flazasulfuron)、双氟磺草胺(florasulam)、氯氟吡啶酯(florpyrauxifen)、吡氟禾草灵(fluazifop)(包括精吡氟禾草灵(fluazifop-P-butyl))、氟酮磺隆(flucarbazone)(包括氟唑磺隆(flucarbazone-sodium))、氟噻草胺(flufenacet)、氟节胺(flumetralin)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、氟啶嘧磺隆(flupyrsulfuron)(包括氟啶嘧磺隆钠(flupyrsulfuron-methyl-sodium))、使它隆(fluroxypyr)(包括氯氟吡氧乙酸(fluroxypyr-meptyl))、嗪草酸甲酯(fluthiacet-methyl)、氟磺胺草醚(fomesafen)、甲酰胺磺隆(foramsulfuron)、草铵膦(glufosinate)(包含其铵盐)、草甘膦(glyphosate)(包括其二铵、异丙基铵和钾盐)、氟氯吡啶酸(halauxifen)(包括氟氯吡啶酯(halauxifen-methyl))、氯吡嘧磺隆(halosulfuron-methyl)、吡氟氯禾灵(haloxyfop)(包括氟吡甲禾灵(haloxyfop-methyl))、环嗪酮(hexazinone)、hydantocidin、甲氧咪草烟(imazamox)、甲咪唑烟酸(imazapic)、灭草烟(imazapyr)、咪唑喹啉酸(imazaquin)、咪唑乙烟酸(imazethapyr)、茚嗪氟草胺(indaziflam)、碘甲磺隆(iodosulfuron)(包括碘甲磺隆钠盐(iodosulfuron-methyl-sodium))、iofensulfuron、iofensulfuron钠、碘苯腈(ioxynil)、三唑酰草胺(ipfencarbazone)、异丙隆(isoproturon)、异噁酰草胺(isoxaben)、异噁唑草酮(isoxaflutole)、乳氟禾草灵(lactofen)、lancotrione、利谷隆(linuron)、MCPA、MCPB、mecoprop-P、苯噻草胺(mefenacet)、甲基二磺隆(mesosulfuron)、甲磺胺磺隆(mesosulfuron-methyl)、硝磺草酮(mesotrione)、苯嗪草酮(metamitron)、吡草胺(metazachlor)、异噁唑啉除草剂(methiozolin)、秀谷隆(metobromuron)、异丙甲草胺(metolachlor)、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、赛克津(metribuzin)、甲磺隆(metsulfuron)、草达灭(molinate)、敌草胺(napropamide)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、达草灭(norflurazon)、甲嘧啶磺隆(orthosulfamuron)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、噁草灵(oxadiazon)、环氧嘧磺隆(oxasulfuron)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、百草枯二氯盐(paraquat dichloride)、二甲戊乐灵(pendimethalin)、五氟磺草胺(penoxsulam)、甜菜宁(phenmedipham)、毒莠定(picloram)、氟吡酰草胺(picolinafen)、唑啉草酯(pinoxaden)、丙草胺(pretilachlor)、甲基氟嘧磺隆(primisulfuron-methyl)、氨氟乐灵(prodiamine)、扑草净(prometryn)、毒草安(propachlor)、敌稗(propanil)、喔草酯(propaquizafop)、苯

胺灵(propham)、丙嗪嘧磺隆(propyrisulfuron)、拿草特(propyzamide)、苄草丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、双唑草腈(pyraclonil)、吡草醚(pyraflufen)(包含氟唑草酯(pyraflufen-ethyl))、磺酰草吡唑(pyrasulfotole)、吡唑特(pyrazolynate)、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron-ethyl)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、哒草特(pyridate)、环酯草醚(pyriftalid)、吡丙醚(pyrimisulfan)、嘧草硫醚(pyrithiobac-sodium)、罗克杀草砜(pyroxasulfone)、啶磺草胺(pyroxsulam)、快杀稗(quinclorac)、氯甲喹啉酸(quinmerac)、喹禾灵(quizalofop)(包含精喹禾灵(quizalofop-P-ethyl)和喹禾糠酯(quizalofop-P-tefuryl))、玉嘧磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、稀禾定(sethoxydim)、西玛津(simazine)、精异丙甲草胺(S-metolachlor)、磺草酮(sulcotrione)、甲磺草胺(sulfentrazone)、磺酰磺隆(sulfosulfuron)、丁噻隆(tebuthiuron)、呋喃磺草酮(tefuryltrione)、环磺酮(tembotrione)、特丁津(terbuthylazine)、去草净(terbutryn)、噻酮磺隆(thiencarbazone)、噻吩磺隆(thifensulfuron)、氟嘧硫草酯(tiafenacil)、tolpyralate、苯吡唑草酮(topramezone)、肟草酮(tralkoxydim)、氟酮磺草胺(triafamone)、野麦畏(triallate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、苯黄隆(tribenuron)(包含苯磺隆(tribenuron-methyl))、绿草定(triclopyr)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)(包含三氟啶磺隆钠盐(trifloxysulfuron-sodium))、三氟草嗪(trifludimoxazin)、氟乐灵(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、4-羟基-1-甲氧基-5-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮、4-羟基-1,5-二甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮、5-乙氧基-4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮、4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮、4-羟基-1,5-二甲基-3-[1-甲基-5-(三氟甲基)吡唑-3-基]咪唑烷-2-酮、(4R)1-(5-叔丁基异噁唑-3-基)-4-乙氧基-5-羟基-3-甲基-咪唑烷-2-酮、3-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]二环[3.2.1]辛烷-2,4-二酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-甲基-环己烷-1,3-二酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]环己烷-1,3-二酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮、6-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,4,4-四甲基-环己烷-1,3,5-三酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-乙基-环己烷-1,3-二酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-4,4,6,6-四甲基-环己烷-1,3-二酮、2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-甲基-环己烷-1,3-二酮、3-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]二环[3.2.1]辛烷-2,4-二酮、2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮、6-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,4,4-四甲基-环己烷-1,3,5-三酮、2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]环己烷-1,3-二酮、4-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,6,6-四甲基-四氢吡喃-3,5-二酮和I+4-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,6,6-四甲基-四氢吡喃-3,5-二酮。这些另外的剂还可以以其酯或盐的形式存在。

[0388] 本发明的化合物还可以与除草剂安全剂组合。除草剂安全剂的实例包括但不限于:解草酮(benoxacor)、喹氧乙酸(cloquintocet)(包含解草喹(cloquintocet-mexyl))、

环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(fenchlorazole)(包含解草唑(fenchlorazole-ethyl))、解草啶(fenclorim)、氟草肟(fluxofenim)、解草噁唑(furilazole)、双苯噁唑酸(isoxadifen)(包括双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl))、吡唑解草酸(mefenpyr)(包含吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl))、metcamifen、N-(2-甲氧基苯甲酰基)-4-[(甲基氨基羰基)氨基]苯磺酰胺和解草腈(oxabetrinil);所有这些都可以呈其酯或盐的形式。

[0389] 本发明的化合物还可以与如杀真菌剂、杀线虫剂或杀昆虫剂等其它农用化学品混合使用,其实例是本领域技术人员已知的。

[0390] 本发明的化合物与另外的剂的混合比优选地为1:100至1000:1。优选地,本发明的化合物与安全剂的混合比为100:1至1:10,尤其是20:1至1:1。

[0391] 混合物可以有利地用于上述制剂中(在这种情况下,“活性成分”涉及本发明的化合物与另外的剂的相应混合物)。

[0392] 除草活性在各个实施方案中,本发明提供了用于本发明的任何方法中的化合物和组合物,包含本文所述的任何实施方案。在各个实施方案中,如本领域的技术人员会理解的,本发明的化合物或包括所述化合物的组合物的用途将在抑制、遏制、增强或刺激期望响应方面具有效用。在一些实施方案中,所述组合物可以进一步包括另外的活性成分,所述另外的活性成分的活性对于施用本发明的化合物的特定应用是有用的。

[0393] 本发明的化合物可用作杀虫剂和/或除草剂,或杀虫和/或除草化合物。因此,本发明进一步包括用于防治不期望的植物的生长的方法,所述方法包括在有效防治有用植物的作物中的不期望的植物的生长(特别是杂草的生长)的条件下,向植物或包括所述植物的所在地施用有效量的本发明化合物或其农用化学组合物。

[0394] 在各个实施方案中,本发明涉及一种用于防治不期望的植物的生长的方法,所述方法包括在有效防治有用植物的作物中的不期望的植物的生长(特别是杂草的生长)的条件下,向植物或包括所述植物的所在地施用有效量的本发明化合物或其农用化学组合物。

[0395] 在一些实施方案中,根据本发明的“防治”是指杀死、减少或阻滞生长或防止萌芽或减少萌芽。通常,要防治的植物是不需要的植物(杂草)。在一些实施方案中,“所在地”是指植物正在生长或将生长的区域。

[0396] 本发明的化合物的施用比率可以具有较大变化幅度,并且取决于土壤的性质、施用方法(例如:种植前;萌芽前;萌芽后;施用至播种沟;免耕施用等)、作物植物、要防治的杂草、主要气候条件以及由施用方法、施用时间和目标作物决定的其它因素。本发明的化合物通常以10g/ha至2000g/ha,尤其是50g/ha至1000g/ha的比率施用。

[0397] 在一些实施方案中,通过喷洒组合物,对于大面积而言,通常通过拖拉机悬挂式喷雾器来进行施用,但也可以使用其它方法,如撒粉(对于粉末)、滴灌或浸灌。

[0398] 在一些实施方案中,根据本发明的组合物可以在其上使用的有用植物包括作物,如谷类,包括但不限于大麦和小麦、棉花、油菜、向日葵、玉米、水稻、大豆、甜菜、甘蔗和草皮。

[0399] 在一些实施方案中,作物植物还包括树,如果树、棕榈树、椰子树或其它坚果。还包含藤本植物,如葡萄、水果灌木、水果植物和蔬菜。

[0400] 在一些实施方案中,作物是抗性作物。因此,根据一些实施方案,作物还包括已经

通过常规育种方法或通过基因工程使得对除草剂或除草剂类别(包括但不限于:ALS-抑制剂、GS-抑制剂、EPSPS-抑制剂、PPO-抑制剂、ACCase-抑制剂和HPPD-抑制剂)具有耐受性的那些作物。通过基因工程方法使得对除草剂具有耐受性的作物的实例包括但不限于可以商品名**RoundupReady®**和**LibertyLink®**商购获得的抗草甘膦和抗草铵膦的玉米品种。根据其它实施方案,作物还包括通过基因工程方法使得对有害昆虫具有抗性的作物,此类作物的实例包括但不限于:Bt玉米(抗欧洲玉米螟)、Bt棉花(抗棉铃象甲)和Bt马铃薯(抗科罗拉多甲虫)。Bt玉米的非限制性实例包括**NK®**(先正达种子公司(Syngenta Seeds))的Bt 176玉米杂交体。包括一种或更多种编码杀昆虫抗性并且表达一种或多种毒素的基因的转基因植物的非限制性实例有:**KnockOut®**(玉米)、Yield**Gard®**(玉米)、**NuCOTIN33B®**(棉花)、**Bollgard®**(棉花)、**NewLeaf®**(马铃薯)、**NatureGard®**和**Protexcta®**。植物作物或其种子材料可能对除草剂具有抗性,并且同时对昆虫取食具有抗性("堆叠的"转基因事件)。

[0401] 在一些实施方案中,作物包括通过常规育种方法或基因工程获得的那些作物,并且含有所谓的输出特性(例如,改善的储存稳定性、更高的营养价值和改善的风味)。其它有用的植物包括例如高尔夫球场、草坪、公园和路边的草坪草,或商业种植的草皮,以及观赏植物,如花或灌木。

[0402] 除草化合物或化学活性除草剂可以分为种植前除草剂、萌芽前除草剂和萌芽后除草剂。种植前和萌芽前除草剂通常干扰杂草种子的萌芽,并且分别在种植或播种之前和之后但在种子萌芽之前施用,而萌芽后除草剂在杂草种子已经萌芽并且杂草生长开始之后杀死杂草。

[0403] 当施用本发明的化合物时,所述化合物可以在种植前或萌芽前处理中、萌芽后处理中或两者中施用。

[0404] 在各个实施方案中,本发明涉及一种防治不期望的植物的生长的方法,所述方法包括将根据本发明的化合物或其农用化学组合物施用于作物田。在一些实施方案中,所述化合物是种植前除草剂。在一些实施方案中,所述化合物是萌芽前除草剂。在一些实施方案中,所述化合物是萌芽后除草剂。因此,在一些实施方案中,在不期望的植物萌芽之前将化合物施用于作物田(即,萌芽前或种植前除草剂)。在一些实施方案中,在不期望的植物萌芽之后,将所述化合物施用于作物田(即,萌芽后除草剂)。

[0405] 在各个实施方案中,本发明涉及一种防治不期望的植物的生长的方法,所述方法包括将根据本发明的化合物或其农用化学组合物施用于有用作物田。在一些实施方案中,所述化合物是种植前除草剂。在一些实施方案中,所述化合物是萌芽前除草剂。在一些实施方案中,所述化合物是萌芽后除草剂。因此,在一些实施方案中,在不期望的植物萌芽之前将所述化合物施用于作物田(即,萌芽前或种植前除草剂)。在一些实施方案中,在不期望的植物萌芽之后,将所述化合物施用于作物田(即,萌芽后除草剂)。

[0406] 在各个实施方案中,根据本发明的化合物和其农用化学组合物用于防治不期望的植物,所述植物包括各种品种的单子叶杂草物种和双子叶杂草物种。

[0407] 在一些实施方案中,所述不期望的植物是杂草。在一些实施方案中,所述不期望的植物是双子叶植物(eudicot或dicotyledonous或dicot)。在一些实施方案中,所述不期望

的植物是单子叶植物(monocotyledon或monocotyledon或monocot)。

[0408] 通常可以防治的单子叶植物物种的非限制性实例包含:大穗看麦娘(Alopecurus myosuroides)、野燕麦(Avena fatua)、车前臂形草(Brachiaria plantaginea)、旱雀麦(Bromus tectorum)、油莎草(Cyperus esculentus)、马唐(Digitaria sanguinalis)、稗(Echinochloa crus-galli)、多年生黑麦草(Lolium perenne)、多花黑麦草(Lolium multiflorum)、黍稷(Panicummiliaceum)、早熟禾(Poa annua)、狗尾草(Setaria viridis)、大狗尾草(Setaria faberi)和高粱(Sorghum bicolor);各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0409] 可以防治的双子叶植物物种的非限制性实例包含苘麻(Abutilon theophrasti)、反枝苋(Amaranthus retroflexus)、三叶鬼针草(Bidens pilosa)、藜草(Chenopodium album)、白苞猩猩草(Euphorbia heterophylla)、猪殃殃(Galium aparine)、碗仔花(Ipomoea hederacea)、地肤(Kochia scoparia)、卷茎蓼(Polygonum convolvulus)、刺黄花秕(Sida spinosa)、芥子(Sinapis arvensis)、龙葵(Solanum nigrum)、繁缕(Stellaria media)、阿拉伯婆婆纳(Veronica persica)和苍耳(Xanthium strumarium);各自代表根据本发明的单独实施方案。

[0410] 在一些实施方案中,所述不期望的植物是苘麻、长芒苋、豚草、大穗看麦娘、不实野燕麦、藜、小蓬草、马唐、光头稗、白苞猩猩草、多年生黑麦草、硬直黑麦草、德国洋甘菊、奇蒿草、早熟禾、马齿苋、狗尾草、龙葵或其任何组合。在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的化合物中的任何化合物;每个化合物代表根据本发明的单独实施方案。

[0411] 在一些实施方案中,根据本发明的化合物和组合物用于防治水稻中的不期望的植物。在某些实施方案中,不期望的植物是宽叶臂形草(Brachiaria platyphylla(Groseb.)Nash(阔叶信号草(broadleaf signalgrass),BRAPP)、马唐(Digitaria sanguinalis(L.)Scop)(大马唐草(large crabgrass),DIGSA)、稗(Echinochloa crus-galli(L.)P.Beauv.)(稗(bamyardgrass),ECHCG)、光头稗(Echinochloa colonum(L.)LINK)(芒稷(junglerice),ECHCO)、水田稗(Echinochloa oryzoides(Ard.)Fritsch)(早水草,ECHOR)、稻稗(Echinochloa oryzicola(Vasinger)Vasinger)(晚水草,ECHPH)、田间鸭嘴草(Ischaemum rugosum Salisb.)(鸭嘴草(saramollagrass)、ISCRU)、千金子(Leptochloa chinensis(L.)Nees)(中文千金子属,LEFCH)、丛生千金子(Leptochloa fascicularis(Lam.)Gray)(有芒千金子(bearded sprangletop),LEFFA)、类黍千金子(Leptochloa panicoides(Presl.)Hitchc.)(亚马逊千金子(Amazon sprangletop),LEFPA)、洋野黍(Panicum dichotomiflorum(L.)Michx.)(秋黍子(fall panicum),PANDI)、毛花雀稗(Paspalum dilatatum Poir.)(雀稗草(dallisgrass),PASDI)、莎草目(Cyperus difformis L.)(小花莎草(smallflower flatsedge),CYPDI)、油莎草(Cyperus esculentus L.)(黄莎草(yellow nutsedge),CYPES)、碎米莎草(Cyperus iria L.)(米莎草(rice flatsedge),CYPIR)、香附子(Cyperus rotundus L.)(紫莎草(purple nutsedge),CYPRO)、荸荠属物种(Eleocharis species)(ELOSS)、水虱草(Fimbristylis miliacea(L.)Vahl)(飘拂草(globe fringerush),FIMMI)、萤蔺(Schoenoplectus juncoides Roxb.)(日本芦苇(Japanese bulrush),SCPJU)、马蹄莲(Schoenoplectus maritimus L.)(海芦苇(sea clubrush),SCPMA)、水毛花(Schoenoplectus mucronatus

L.)(稻田芦苇(ricefield bulrush),SCPMU)、合萌属物种(Aeschynomene species)(合萌(jointvetch),AESSS)、喜旱莲子草(Alternanthera philoxeroides(Mart.)Griseb.)(空心莲子草(alligatorweed),ALRPH)、泽泻水生车前草属(Alisma plantago-aquatica L.)(普通水生车前草(common waterplantain),ALSPA)、苋属物种(Amaranthus species)(藜(pigweeds)和苋(amaranths),AMASS)、红水苋(Ammannia coccinea Rottb.)(红茎(redstem),AMMCO)、旱莲草(Eclipta alba(L.)Hassk.)(美国假菊(American false daisy),ECLAL)、沼生异蕊花(Heteranthera limosa(SW.)Willd./Vahl(鸭沙拉(ducksalad),HETLI)、肾形异蕊花(Heteranthera reniformis R.&P.)(圆叶异蕊花属(roundleaf mudplantain),HETRE)、碗仔花(Ipomoea hederacea(L.)Jacq.)(裂叶牵牛(ivyleaf momingglory),IPOHE)、美洲母草(Lindernia dubia(L.)Pennell)(低陌上菜(low false pimpernel),LIDDU)、雨久花(Monochoria korsakowii Regel&Maack)(雨久花属(monochoria),MOOKA)、鸭舌草(Monochoria vaginalis(Burm.F.)C.Presl ex Kuhth)(雨久花属(monochoria),MOOVA)、裸花水竹叶(Murdannia nudifiora(L.)Brenan)(鸽草(doveweed),MUDNU)、宾夕法尼亚蓼属(Polygonum pensylvanicum L.)(宾夕法尼亚蓼麻(Pennsylvania smartweed),POLPY)、春蓼(Polygonum persicaria L.)(桃叶蓼(ladysthumb),POLPE)、杠板归(Polygonum hydropiperoides Michx.)(POLHP,软蓼(mild smartweed))、节节菜(Rotala indica(Willd.)Koehne)(印度紫水苋菜(Indian toothcup),ROTIN)、慈姑属物种(Sagittaria species)(慈姑(arrowhead),SAGSS)、田菁(Sesbania exaltata(Raf)Cory/Rydb.Ex Hill)(大麻田菁属(hemp sesbania),SEBEX)或大麻田菁属(Sphenoclea zeylanica Gaertn.)(鹅草(gooseweed),SPDZE);各自是根据本发明的单独实施方案。在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的化合物中的任何化合物;每个化合物代表根据本发明的单独实施方案。

[0412] 在一些实施方案中,根据本发明的化合物和组合物用于防治谷类中的不期望的植物。在某些实施方案中,所述不期望的植物是大穗看麦娘(Alopecurus myosuroides Huds.)(黑草(blackgrass),ALOMY)、阿坡拉草(Apera spica-venti(L.)Beauv.)(风之草(windgrass),APESV)、野燕麦(Avena fatua L.)(野燕麦(wild oat),AVEFA)、旱雀麦(Bromus tectorum L.)(丘原雀麦草(downy brome),BROTE)、多花黑麦草(Loliummultiflorum Lam.)(意大利黑麦草(Italian ryegrass),LOLMU)、小子蘸草(Phalaris minor Retz.)(小种金丝雀草(littleseed canarygrass),PHAMI)、早熟禾(Poa annua L.)(年生蓝草(annual bluegrass),POAAN)、金狗尾草(Setaria pumila(Poir.)Roemer&J.A.Schultes)(黄色狗尾草(yellow foxtail),SETLU)、狗尾草(Setaria viridis(L.)Beauv.)(绿色狗尾草(green foxtail),SETVI)、丝路蓟(Cirsium arvense(L.)Scop.)(加拿大蓟(Canada thistle),CIRARy)、猪殃殃(Galium aparine L.)(八仙草(catchweed bedstraw),GALAP)、地肤(Kochia scoparia(L.)Schrad.)(地肤属(kochia),KCHSC)、紫花野芝麻(Lamium purpureum L.)(紫色枯荨麻(purpledeadnettle),LAMPU)、母菊(Matricaria recutita L.)(野甘菊(wild chamomile),MATCH)、同花母菊(Matricaria matricarioides(Less.)Porter)(香甘菊(pineappleweed),MATMT)、虞美人(Papaver rhoeas L.)(普通罂粟(common poppy),PAPRH)、卷茎蓼(Polygonum convolvulus L.)(野生荞麦(wild buckwheat),POLCO)、刺沙蓬(Salsola tragus L.)(俄罗斯蓟(Russian

thistle),SASKR)、繁缕(Stellaria media(L.)VilL)(普通繁缕(common chickweed),STEME)、阿拉伯婆婆纳(Veronica persica Poir.)(波斯婆婆纳(Persian speedwell),VERPE)、野生堇菜(Viola arvensis Murr.)(田地紫罗兰(field violet),VIOAR)或三色堇(Viola tricolor L.)(野生紫罗兰(wild violet),VIOTR);各自是根据本发明的单独实施方案。在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的化合物中的任何化合物;每个化合物代表根据本发明的单独实施方案。

[0413] 在一些实施方案中,根据本发明的化合物和组合物用于防治牧区和牧场中的不期望的植物。在某些实施方案中,所述不期望的植物是豚草(Ambrosia artemisiifolia L.)(普通豚草(common ragweed),AMBEL)、钝叶决明(Cassia obtusifolia)(镰果灯心草豆(sickle pod),CASOB)、斑点矢车菊(Centaurea maculosa auct.non-Lam.)(小路边的斑点矢车菊(spotted knapweed),CENMA)、丝路蓟(Cirsium arvense(L.)Scop.)(加拿大蓟,CIRAR)、田旋花(Convolvulus arvensis L.)(野生旋花(field bindweed),CONAR)、乳浆大戟(Euphorbia esula L.)(乳浆大戟(leafy spurge),EPHES)、刺莴苣(Lactuca serriola L./Tom.)(多刺莴苣(prickly lettuce),LACSE)、长叶车前(Plantago lanceolata L.)(鹿角车前(buckhom plantain),PLALA)、钝叶酸模(Rumex obtusifolius L.)(阔叶羊蹄(broadleaf dock),RUMOB)、刺金午时花(Sida spinosa L.)(刺黄花稔(prickly sida),SIDSP)、野欧白芥(Sinapis arvensis L.)(野生芥菜(wild mustard),SINAR)、苣荬菜(Sonchus arvensis L.)(多年生苣荬菜(perennial sowthistle),SONAR)、一枝黄花属物种(Solidago species)(秋麒麟草属(goldenrod),SOOSS)、药用蒲公英(Taraxacum officinale G.H.Weber ex Wiggers)(蒲公英(dandelion),TAROF)、白车轴草(Trifolium repens L.)(白三叶草(white clover),TRFRE)或异株荨麻(Urtica dioica L.)(普通荨麻(common nettle),URTDI);各自是根据本发明的单独实施方案。在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的化合物中的任何化合物;每个化合物代表根据本发明的单独实施方案。

[0414] 在一些实施方案中,根据本发明的化合物和组合物用于防治在行间作物中发现的不期望的植物。在某些实施方案中,所述不期望的植物是大穗看麦娘(黑草,ALOMY)、野燕麦(Avena fatua L.)(野燕麦,AVEFA)、宽叶臂形草Nash(Brachiaria platyphylla(Groseb.)Nash)(阔叶信号草,BRAPP)、马唐(Digitaria sanguinalis(L.)Scop)(大马唐草,DIGSA)、稗(Echinochloa crus-galli(L.)P.Beauv.)(稗(bamyardgrass),ECHCG)、光头稗(Echinochloa colonum(L.)Link)(芒稷(junglerice),ECHCO)、多花黑麦草(Lolium multiflorum Lam.)(意大利黑麦草,LOLMU)、洋野黍(Panicum dichotomiflorum Michx.)(秋黍子(fall panicum),PANDI)、黍稷(Panicum miliaceum L.)(野生小米黍(wild-proso millet),PANMI)、大狗尾草(Setaria faberi Herrm.)(大狗尾草(giant foxtail),SETFA)、狗尾草(Setaria viridis(L.)Beauv.)(绿色狗尾草(green foxtail),SETVI)、詹森草(Sorghum halepense(L.)Pers.)(詹森草(Johnsongrass),SORHA)、蜀黍(Sorghum bicolor(L.)Moench ssp.Arundinaceum)(shattercane,SORVU)、油莎草(Cyperus esculentus L.)(黄莎草(yellow nutsedge),CYPES)、香附子(Cyperus rotundus L.)(紫莎草(purple nutsedge),CYPRO)、苘麻(Abutilon theophrasti Medik.)(绒毛叶(velvetleaf)、ABUTH)、苋属物种(藜和苋,AMASS)、豚草(Ambrosia artemisiifolia L.)(普通豚草,AMBEL)、多年生豚草(Ambrosia psilostachya DC.)(西方豚草(western

ragweed),AMBPS)、三裂叶豚草(Ambrosia trifida L.)(大豚草(giant ragweed),AMBTR)、叙利亚马利筋(Asclepias syriaca L.)(普通乳草(common milkweed),ASCSY)、藜草(Chenopodium album L.)(普通灰菜(common lambsquarters),CHEAL)、丝路蓟(加拿大蓟,CIRAR)、圆叶鸭跖草(Commelina benghalensis L.)(热带紫露草(tropical spiderwort),COMBE)、曼陀罗(Datura stramonium L.)(曼陀罗(jimsonweed),DATST)、胡萝卜(Daucus carota L.)(野生胡萝卜(wild carrot),DAUCA)、白苞猩猩草(Euphorbia heterophylla L.)(野生一品红(wild poinsettia),EPHHL)、野塘蒿(Erigeron bonariensis L.)(毛飞蓬(hairy fleabane),ERIBO)、加拿大蓬(Erigeron canadensis L.)(加拿大飞蓬(Canadian fleabane),ERICA)、向日葵(Helianthus annuus L.)(普通向日葵(common sunflower),HELAN)、小花假牵牛(Jacquemontia tamnifolia(L.)Griseb.)(小花牵牛花(smallflower morningglory),IAQTA)、碗仔花(裂叶牵牛,IPOHE)、小白花牵牛(Ipomoea lacunosa L.)(白牵牛(white morningglory),IPOLA)、刺茵芘(多刺茵芘,LACSE)、马齿苋(Portulaca oleracea L.)(普通马齿苋(common purslane),POROL)、刺金午时花(Sida spinosa L.)(刺黄花稔,SIDSP)、野欧白芥(野生芥菜,SINAR)、东方龙葵(Solanum ptychanthum Dunal)(东方龙葵(eastern black nightshade),SOLPT)或苍耳(Xanthium strumarium L.)(普通苍耳(common cocklebur),XANST);各自是根据本发明的单独实施方案。在一些实施方案中,所述化合物是表1中列出的化合物中的任何化合物;每个化合物代表根据本发明的单独实施方案。

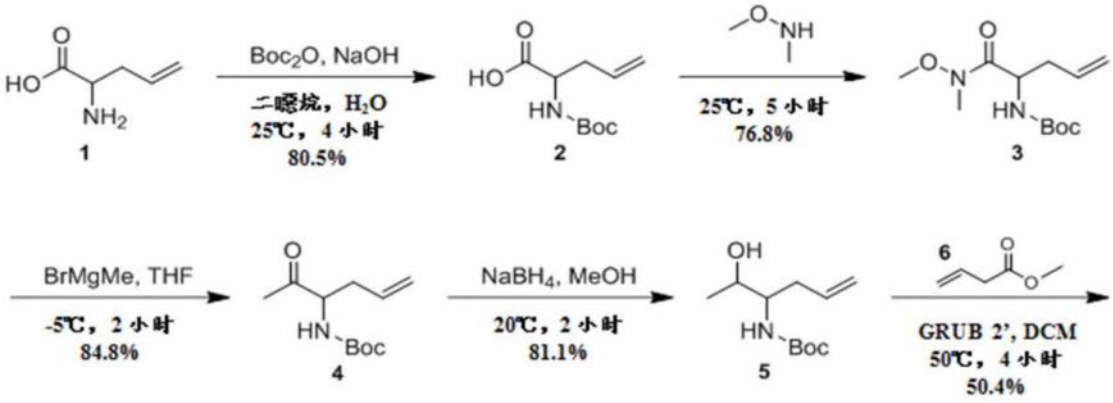
[0415] 呈现以下实施例是为了更全面地举例说明本发明的优选实施方案。然而,它们决不应被解释为限制本发明的广泛范围。

[0416] 实施例

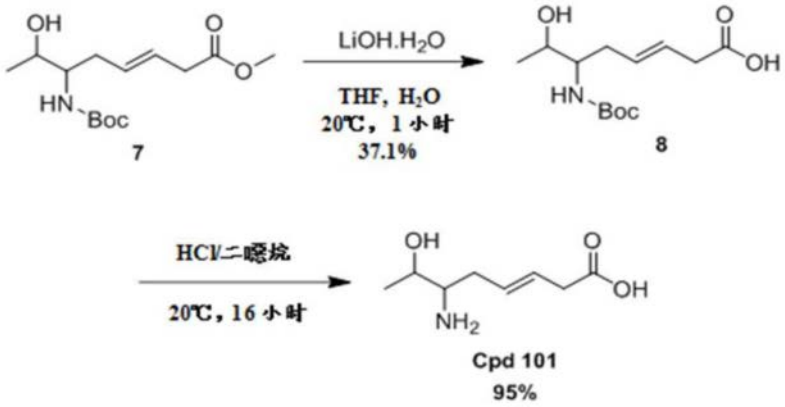
[0417] 实施例1

[0418] 本发明的化合物的合成细节

[0419] 制备化合物101



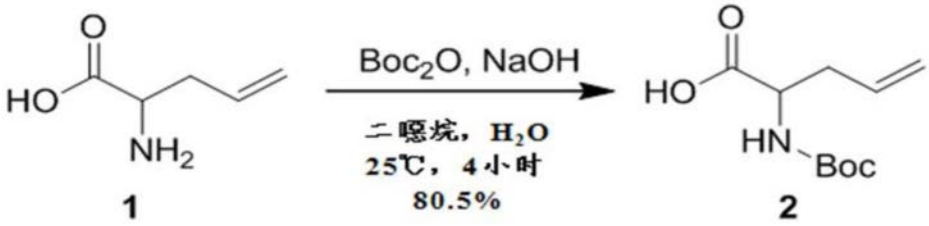
[0420]



[0421] 方案1:制备化合物101

[0422] 制备化合物2的通用步骤(方案1)

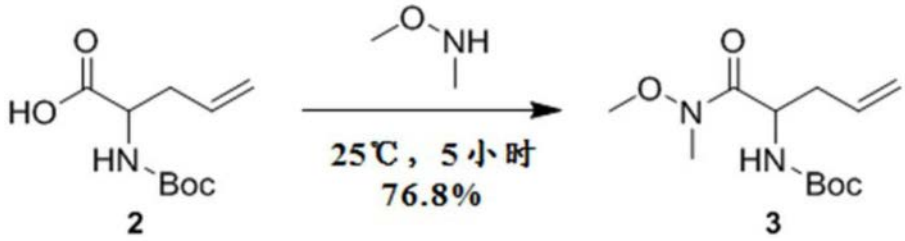
[0423]



[0424] 向化合物1(255g,2.21mol,1.00当量)于二噁烷(1500mL)中的溶液中添加NaOH(97.5g,2.44mol,1.10当量)和H_2O(1500mL)。10分钟后添加Boc_2O(580g,2.66mol,1.20当量)。将混合物在25℃下搅拌4小时。LC-MS显示反应物1被完全消耗,并且检测到一个具有期望质量的主峰。将反应混合物用H_2O(1500mL)稀释并用MTBE(1500mL)洗涤,丢弃有机层。水层用1M HCl水溶液调节pH至3,然后用EtOAc(2000mL×2)萃取。将合并的有机层用盐水(2000mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩,以得到化合物2(384g,1.78mol,80.5%产率),其为白色固体,其无需进一步纯化而用于下一步。

[0425] ^1H NMR(400MHz,DMSO-d_6)δ13.73-11.10(m,1H),7.01(d,J=8.1Hz,1H),5.75(tdd,J=6.9,10.1,17.0Hz,1H),5.17-4.96(m,2H),3.92(dt,J=5.1,8.5Hz,1H),2.46-2.22(m,2H),1.37(s,9H)

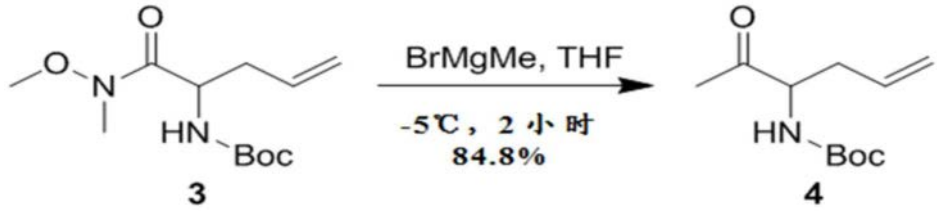
[0426] 制备化合物3的通用步骤(方案1)

[0427] 

[0428] 向化合物2(380g,1.77mol,1.00当量)于DCM(4000mL)中的溶液中分批添加CDI(372g,2.30mol,1.30当量)。将混合物在20℃下搅拌0.5小时。然后添加N-甲氧基甲胺盐酸盐(258g,2.65mol,1.50当量),并在25℃下搅拌5小时。LC-MS显示反应物2被完全消耗,并且检测到一个具有期望质量的主峰。将反应混合物用DCM(3000mL)稀释并用1M HCl(2000mL)和饱和$NaHCO_3$(2000mL)和盐水(2000mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩,以得到粗化合物3(350g,1.35mol,76.8%产率),其为白色固体,其无需进一步纯化而用于下一步。

[0429] ^{1}H NMR:(400MHz,DMSO-d_6)δ7.00(br d,J=8.3Hz,1H),5.82-5.67(m,1H),5.14-4.97(m,2H),4.54-4.25(m,1H),3.72(s,3H),3.09(s,3H),2.33-2.17(m,2H),1.36(s,9H)

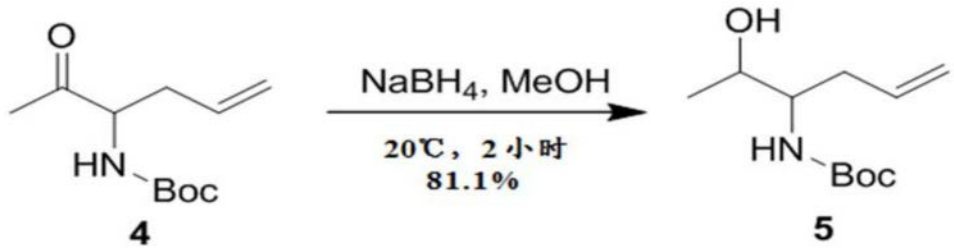
[0430] 制备化合物4的通用步骤(方案1)

[0431] 

[0432] 在-5℃下,向化合物3(120g,465mmol,1.00当量)于THF(1700mL)中的溶液中添加BrMgMe(3M,619mL,4.00当量)。将混合物在-5℃下搅拌2小时。TLC(石油醚:THF=10:1SM R_f=0.64,产物R_f=0.82)表明化合物3被完全消耗,并形成一个新斑点。根据TLC,反应是干净的。将反应溶液倒入冰10% NH_4Cl(1000mL)中并用EtOAc(1000mL×3)萃取。将合并的有机层用盐水(800mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩,以得到残余物。通过快速硅胶色谱法(**ISCO®;**330+330g**SepaFlash®**硅胶快速柱,在100mL/min下,0~4%乙酸乙酯/石油醚梯度的洗脱液)对残余物进行纯化。得到化合物4(84.0g,394mmol,84.8%产率),其为无色油。

[0433] ^{1}H NMR:(400MHz,DMSO-d_6)δ7.13(br d,J=7.6Hz,1H),5.82-5.71(m,1H),5.69(s,1H),5.15-4.95(m,2H),2.47-2.16(m,2H),2.07(s,3H),1.45-1.31(m,9H)

[0434] 制备化合物5的通用步骤(方案1)

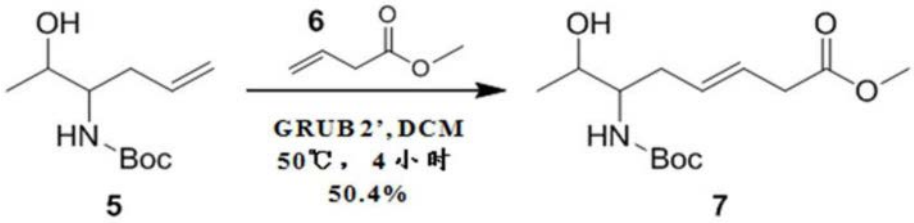
[0435] 

[0436] 在20℃下,向化合物4(113g,530mmol,1.00当量)于MeOH(1200mL)中的溶液中分批添加$NaBH_4$(50.1g,1.32mol,2.50当量)。将混合物在20℃下搅拌2小时。TLC(石油醚:THF=3:1SM R_f=0.80,产物R_f=0.29)表明化合物4被完全消耗,并形成一个新斑点。在5℃下,反

应混合物通过添加H_2O(1500mL)淬灭,并用EtOAc(800mL×2)萃取。将合并的有机层用盐水(600mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩,以得到残余物。通过快速硅胶色谱法(**ISCO®;**330+330g**SepaFlash®**硅胶快速柱,在100mL/min下,0~18% THF/石油醚梯度的洗脱液)对残余物进行纯化。得到化合物5(185g,859mmol,81.1%产率),其为白色固体。

[0437] ^1H NMR:(400MHz,DMSO-d_6)δ6.54-6.06(m,1H),5.80-5.63(m,1H),5.10-4.90(m,2H),4.68-4.44(m,1H),3.47-3.37(m,1H),3.29-3.12(m,1H),2.43-1.92(m,2H),1.43-1.29(m,9H),1.07-0.92(m,3H)

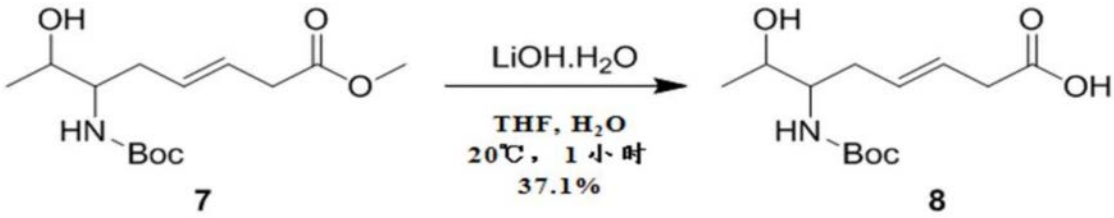
[0438] 制备化合物7的通用步骤(方案1)

[0439] 

[0440] 将化合物5(59.0g,274mmol,1.00当量)和化合物6(32.9g,329mmol,1.20当量)于DCM(700mL)中的溶液减压30分钟,并用N_2吹扫3次,然后添加GRUB 2'(4.65g,5.48mmol,0.02当量),将混合物减压10分钟,并用N_2吹扫3次。将混合物在50℃下搅拌4小时。TLC(石油醚:乙酸乙酯=2:1.5,SM R_f=0.45,产物R_f=0.25)表明反应物5残余~15%,并检测到一个具有较大极性的主要新斑点(~40%)。将反应混合物过滤并用DCM(200mL×3)洗涤,滤液在减压下浓缩以去除溶剂。通过柱色谱法(SiO_2,乙酸乙酯/石油醚=15%-21%)对残余物进行纯化。得到化合物7(119g,414mmol,50.4%产率),其为黄色油。

[0441] ^1H NMR:(400MHz,$CDCl_3$)δ5.71-5.50(m,2H),4.96-4.52(m,1H),3.93-3.79(m,1H),3.76-3.66(m,3H),3.63(br s,1H),3.19-3.00(m,2H),2.43-2.22(m,3H),1.44(s,9H),1.23-1.10(m,3H)

[0442] 制备化合物8的通用步骤(方案1)

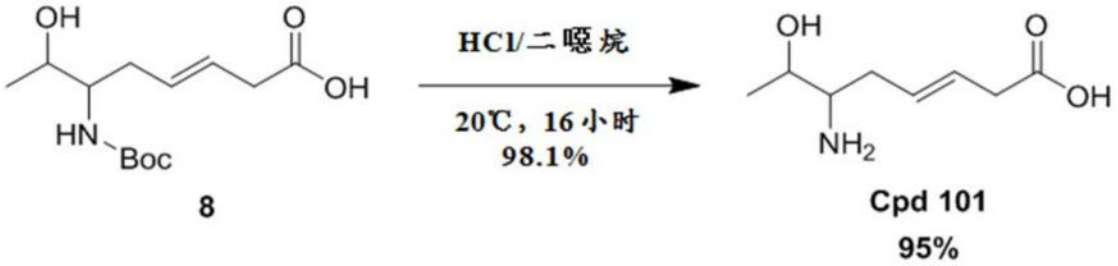
[0443] 

[0444] 向化合物7(119g,414mmol,1.00当量)于THF(700mL)和H_2O(700mL)中的溶液中添加LiOH.H_2O(69.5g,1.66mol,4.00当量)。将混合物在20℃下搅拌1小时。TLC(石油醚:乙酸乙酯=1:1SM R_f=0.50,产物R_f=0.00)显示反应物被完全消耗。将反应混合物用H_2O(800mL)稀释,并用EtOAc(500mL×2)萃取,丢弃有机层。水层用1M HCl调节pH为3,然后用EtOAc(800mL×3)萃取。将合并的有机层用盐水(800mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩以得到残余物(~120g)。将合并的有机层用盐水(600mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩,以得到残余物。在50℃下,通过MTBE(500mL)进行再结晶对粗产物进行纯化,然后在15℃下搅拌16小时,过滤得到24g产物。将滤液在减压下浓缩,在50℃下通过i-Pr_2O(500mL)再结晶纯化,然后在15℃下搅拌16小时,过滤得到26g产物。将产物合并,在15℃下用i-Pr_2O(1000mL)研磨1小时,过滤以得到化合物8(42.0g,154mmol,37.1%产率),其为白

色固体。

[0445] ^{1}H NMR:(400MHz,$CDCl_3$)δ5.68-5.53(m,2H),5.04-4.47(br,1H),3.95-3.76(m,1H),3.73-3.45(m,1H),3.09(d,J=5.1Hz,2H),2.37-2.24(m,1H),2.24-2.11(m,1H),1.44(s,9H),1.17(J=6.4Hz,3H)

[0446] 制备化合物101的通用步骤(方案1)

[0447] 

8 Cpd 101

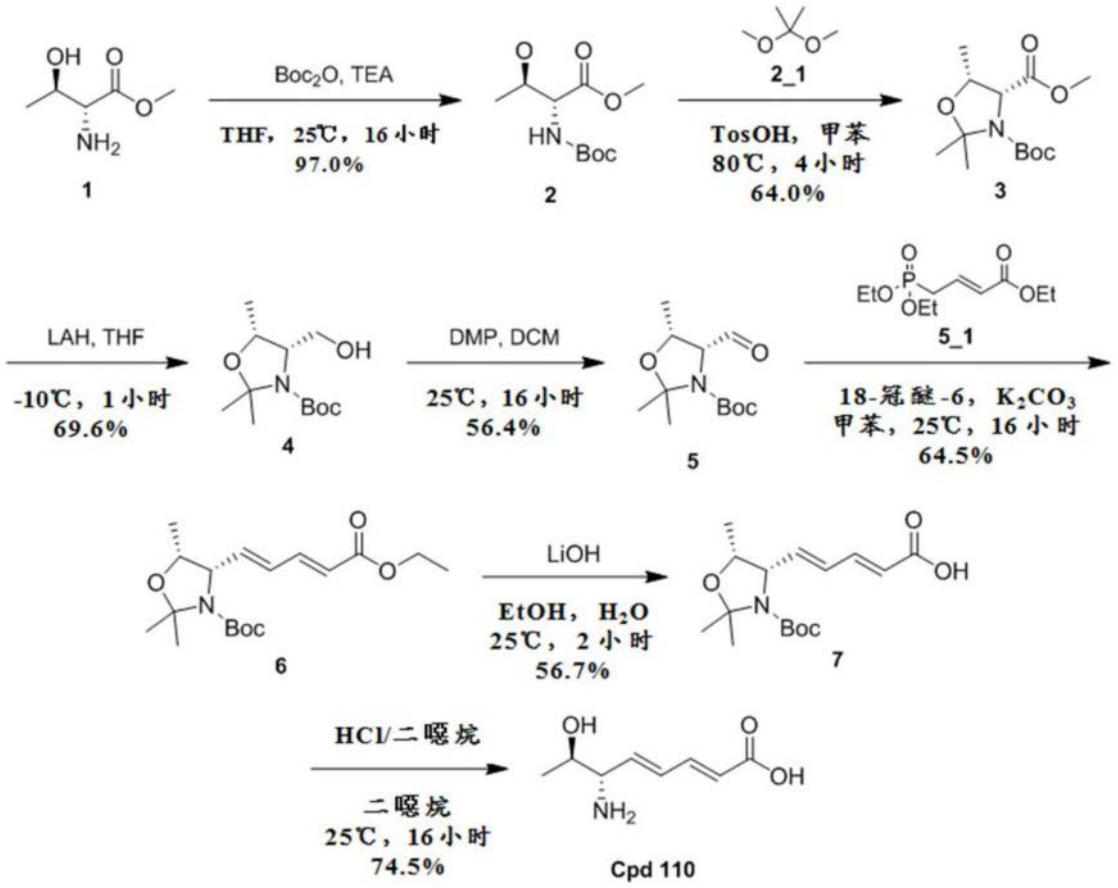
95%

[0448] 向化合物8(40.0g,146mmol,1.00当量)于二噁烷(300mL)中的溶液中添加HCl/二噁烷(4M,137mL,3.74当量)。将混合物在20℃下搅拌16小时。将反应混合物在减压下浓缩以得到残余物。将残余物用纯H_2O(200mL)稀释并用EtOAc(200mL×3)洗涤。将水层冻干以得到Cpd 101(31.5g,144mmol,98.1%产率,95.6%纯度,HCl),其为黄色油。

[0449] ^{1}H NMR:(400MHz,DMSO-d_6)δ13.24-11.15(m,1H),7.98(br s,3H),5.74-5.57(m,1H),5.57-5.43(m,1H),4.99(br dd,J=3.4,6.3Hz,1H),3.86(br dd,J=3.5,6.3Hz,1H),3.11-3.02(m,1H),2.99(br d,J=6.4Hz,2H),2.37-2.20(m,2H),1.08(br d,J=6.5Hz,3H)

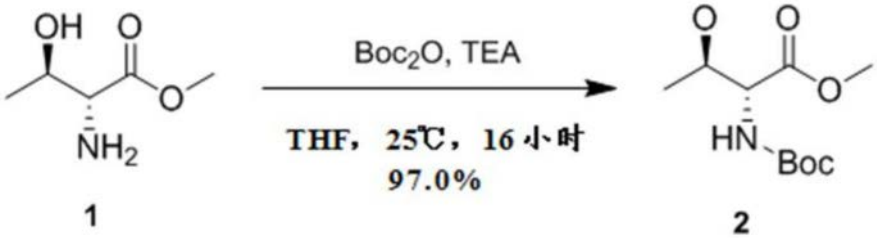
[0450] 使用与化合物101所述方法类似的方法制备化合物172。

[0451] 制备化合物110

[0452] 

[0453] 方案2:制备化合物110

[0454] 制备化合物2的通用步骤(方案2)

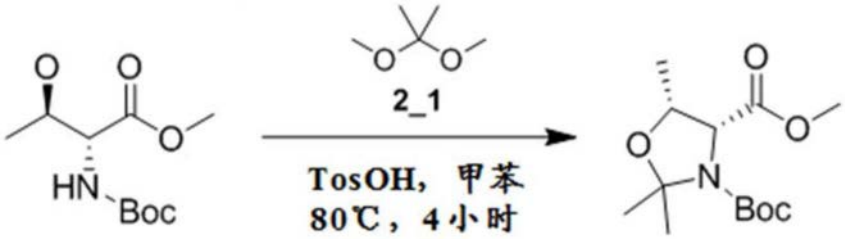
[0455] 

1 2

[0456] 向化合物1(50.0g,375mmol)于THF(200mL)中的溶液中添加Boc_2O(123g,563mmol)和TEA(114g,1.13mol)。将混合物在20℃下搅拌16小时。LC-MS显示反应物1被完全消耗,并且检测到一个具有期望质量的主峰。将反应混合物用水(1000mL)稀释并用EtOAc(1000mL×3)萃取。将合并的有机层用盐水(500mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩以得到残余物。得到化合物2(85g,97.0%产率),其为无色油,其无需进一步纯化而用于下一步。

[0457] ^1H NMR(400MHz,CHLOROFORM-d)δ5.48(br s,1H),4.35(br d,J=3.1Hz,1H),4.12-4.08(m,1H),3.76(s,3H),3.18(br d,J=5.5Hz,1H),1.43(s,9H),1.21-1.15(m,3H)

[0458] 制备化合物3的通用步骤(方案2)

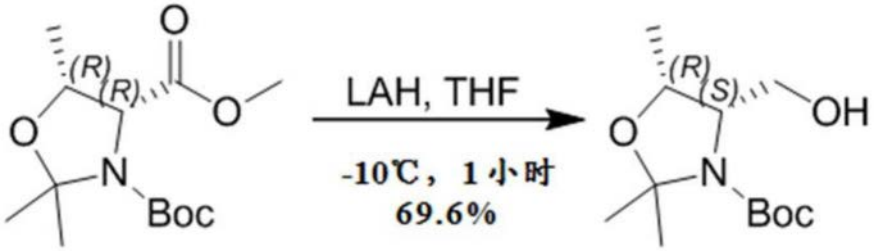
[0459] 

2 3

[0460] 向化合物2(40.0g,171mmol)和化合物2_1(178g,1.71mol)于甲苯(400mL)中的溶液中添加TsOH(4.43g,25.7mmol)。将混合物在80℃下搅拌4小时。LC-MS显示反应物2被完全消耗,并且检测到一个具有期望质量的主峰。将反应混合物在减压下浓缩以去除溶剂。将残余物用$NaHCO_3$水溶液(500mL)稀释并用MTBE(250mL×3)萃取。将合并的有机层用盐水(300mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩以得到残余物。得到粗化合物3(30.0g,64.0%产率),其为黄色油,其无需进一步纯化而用于下一步。

[0461] ^1H NMR:(400MHz,CHLOROFORM-d)δ4.45-4.24(m,2H),3.75(s,3H),1.72(d,J=15.6Hz,3H),1.54-1.47(m,8H),1.41(s,5H),1.27-1.22(m,3H)

[0462] 制备化合物4的通用步骤(方案2)

[0463] 

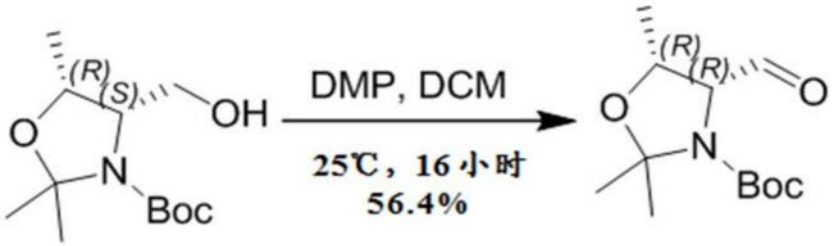
3 4

[0464] 在0℃下,向化合物3(20.0g,73.17mmol)于THF(250mL)中的溶液中添加LAH

(4.17g,110mmol)。将混合物在-10℃下搅拌1小时。TLC(石油醚:乙酸乙酯=10:1,R_f=0.07)表明反应物3被完全消耗,并形成一个新斑点。将混合物用H_2O(4mL)和15% NaOH(4mL)淬灭,过滤并在减压下浓缩以得到残余物。得到化合物4(12.5g,69.6%产率),其为黄色油,其无需进一步纯化而用于下一步。

[0465] ^{1}H NMR:(400MHz,DMSO-d_6)δ4.64(br s,1H),4.28-4.14(m,1H),3.76-3.56(m,1H),3.50-3.37(m,2H),1.41(br d,J=3.5Hz,15H),1.22(d,J=6.5Hz,3H)

[0466] 制备化合物5的通用步骤(方案2)

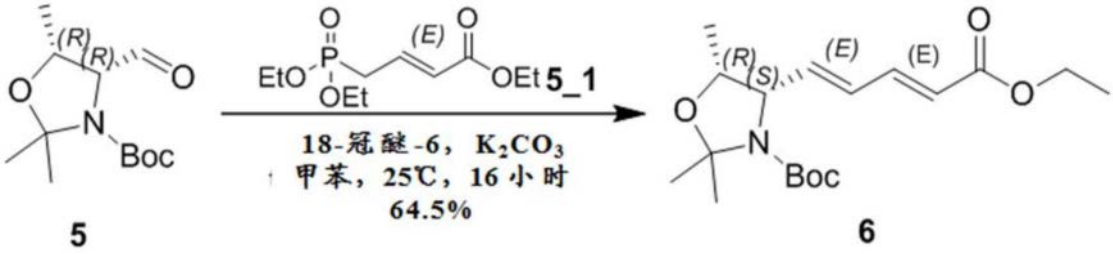
[0467] 

4 5

[0468] 向化合物4(12.5g,50.9mmol)于DCM(200mL)中的溶液中添加DMP(25.9g,61.2mmol)。将混合物在25℃下搅拌16小时。TLC(石油醚:乙酸乙酯=10:1,R_f=0.41)表明反应物4被完全消耗,并形成一个新斑点。将反应混合物过滤并在减压下浓缩以得到残余物。通过快速硅胶色谱法(**ISCO®;**220g**SepaFlash®**硅胶快速柱,在100mL/min下,0~10%乙酸乙酯/石油醚梯度的洗脱液)对残余物进行纯化。得到化合物5(7.01g,56.4%产率),其为黄色油。

[0469] ^{1}H NMR:(400MHz,DMSO-d_6)δ9.58(dd,J=2.5,5.4Hz,1H),4.45(quin,J=6.5Hz,1H),4.27(td,J=3.0,6.5Hz,1H),1.59(s,3H),1.50-1.40(m,9H),1.33(s,5H),1.20(dd,J=3.3,6.4Hz,3H)

[0470] 制备化合物6的通用步骤(方案2)

[0471] 

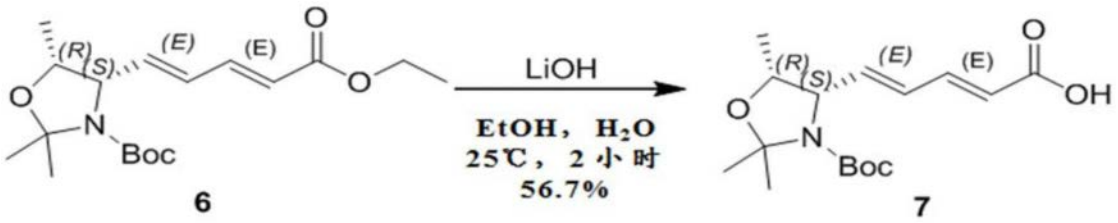
5 6

[0472] 向化合物5(3.5g,14.4mmol)和化合物5_1(4.68g,18.7mmol)于甲苯(60.0mL)中的溶液中添加K_2CO_3(3.98g,28.8mmol)和18-冠醚-6(380mg,1.44mmol)。将混合物在25℃下搅拌16小时。TLC(石油醚:乙酸乙酯=10:1R_f=0.39)表明反应物5被完全消耗,并形成一个新斑点。将反应混合物用水(100mL)稀释并用EtOAc(100mL×3)萃取。将合并的有机层用盐水(100mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩以得到残余物。通过快速硅胶色谱法(**ISCO®;**40g**SepaFlash®**硅胶快速柱,在50mL/min下,0~10%乙酸乙酯/石油醚梯度的洗脱液)对残余物进行纯化。得到化合物6(3.15g,64.5%产率),其为黄色油。

[0473] ^{1}H NMR:(400MHz,CHLOROFORM-d)δ9.54-9.44(m,1H),7.29-7.16(m,1H),6.31-6.09(m,1H),5.93-5.76(m,2H),4.38-4.05(m,4H),1.49-1.45(m,3H),1.44-1.38(m,6H),

1.34-1.30(m,6H),1.27-1.19(m,4H),1.09(d,J＝6.3Hz,3H)

[0474] 制备化合物7的通用步骤(方案2)

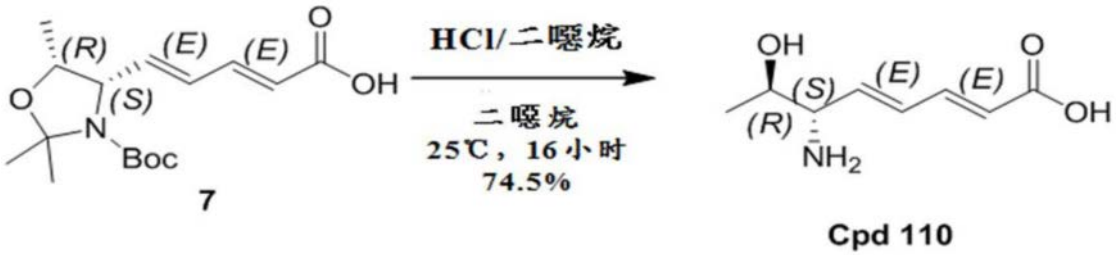
[0475] 

6 7

[0476] 向化合物6(1.00g,2.95mmol)于THF(5mL)和H_2O(5mL)中的溶液中添加LiOH(353mg,14.7mmol)。将混合物在25℃下搅拌2小时。TLC(石油醚:乙酸乙酯＝10:1,R_f＝0.52)表明反应物6被完全消耗,并且检测到一个具有期望质量的主峰。将反应混合物用H_2O(50mL)稀释并用EtOAc(50mL×2)萃取,丢弃有机层。水层用2M HCl调节pH为2,然后用EtOAc(50mL×2)萃取。将合并的有机层用盐水(50mL)洗涤,经$MgSO_4$干燥,过滤并在减压下浓缩以得到残余物。通过快速硅胶色谱法(**ISCO®;**20g**SepaFlash®**硅胶快速柱,在30mL/min下,0～25％乙酸乙酯/石油醚梯度的洗脱液)对残余物进行纯化。得到化合物7(0.52g,56.7％产率),其为黄色油。

[0477] ^{1}H NMR(400MHz,CHLOROFORM-d)δ7.38(td,J＝11.4,15.2Hz,1H),6.44-6.17(m,1H),6.00(br dd,J＝8.4,15.0Hz,1H),5.90(d,J＝15.4Hz,1H),4.42-4.20(m,2H),4.20-4.08(m,1H),1.70-1.52(m,6H),1.51-1.37(m,10H),1.33-1.24(m,1H),1.18(d,J＝6.4Hz,3H)

[0478] 制备化合物110的通用步骤(方案2)

[0479] 

7 Cpd 110

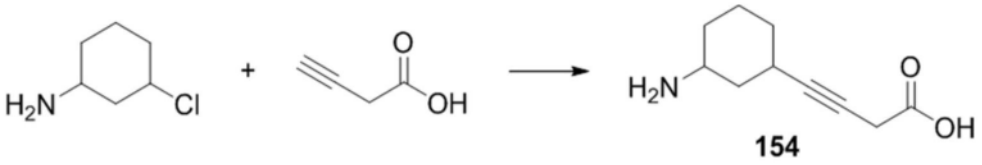
[0480] 向化合物7(500mg,1.61mmol)于4M HCl/二噁烷(3mL)和二噁烷(3mL)中的溶液中。将混合物在25℃下搅拌16小时。LC-MS显示反应物7被完全消耗,并且检测到一个具有期望质量的主峰。将反应混合物在减压下浓缩以得到残余物。将残余物溶解于H_2O(20mL)中并用EtOAc(20mL×2)洗涤,将液体层冻干以得到橙色胶状Cpd 110(205mg,74.5％产率)。

[0481] ^{1}H NMR(400MHz,DEUTERIUM OXIDE)δ7.42-7.24(m,1H),6.70-6.53(m,1H),6.22-6.00(m,2H),4.17-4.06(m,1H),3.99-3.86(m,1H),3.79-3.71(m,1H),3.81-3.70(m,1H),1.25-1.12(m,3H)

[0482] 实施例2

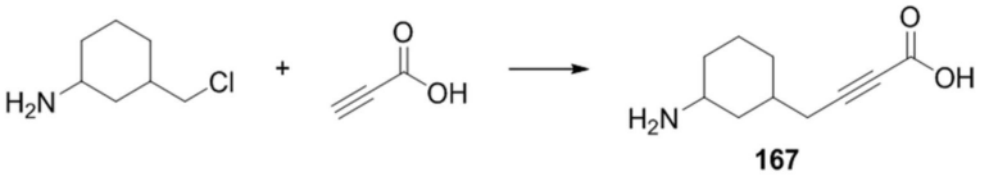
[0483] 本发明化合物的通用合成方案

[0484] 合成化合物154和167的通用方案



154

[0485]



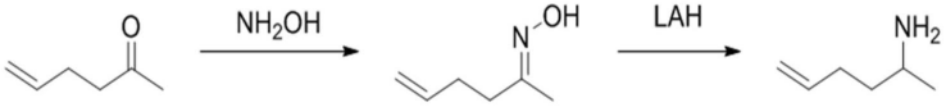
167

[0486] Zwikker等人,Synthesis(2003),(15),2427-2428

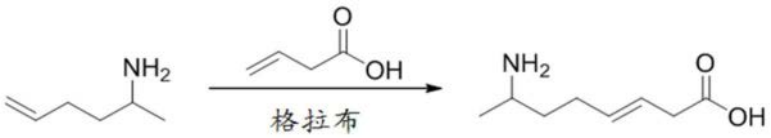
[0487] 方案3:制备化合物154和167的通用方案

[0488] 化合物154和167按照Zwikker等人的记载(方案3),由含炔的脂族羧酸与具有卤素取代基的环己胺反应合成。该反应的预期产率为71%。

[0489] 合成化合物169、170、112、125、146、157和166的通用方案

[0490] 

[0491] Clark等人,Synlett(1999),(4),444-446 Kim等人,Org Lett(2005),7(20),4391-4393

[0492] 

169

[0493] Leigh等人,Angew Chem Int Ed(2001),40(8),1538-1543

[0494] 方案4:制备化合物169的通用方案

[0495] 化合物169通过以下方法合成:使己-5-烯-2-酮与羟胺反应,随后用LAH还原得到己-5-烯-2-胺,己-5-烯-2-胺进一步与丁-3-烯酸和Grubbs催化剂反应(方案4)。

[0496] 化合物170、112、125、146、157和166以类似的方式通过适当地替换起始酮和羧酸制备(方案4)。

[0497] 实施例3

[0498] 除草活性数据

[0499] 在杂草小组上的施用

[0500] 化合物(活性成分;A.I.)的除草活性通过以下温室实验来证明:

[0501] 植物体内低通量筛选(LTP)结果

[0502] 萌芽后处理

[0503] 将八种杂草物种的基础小组(表3)播种在含有花园混合物(klasmann公司(klasmann))的4×4×7cm的塑料花盆中。将每个物种播种在单独的花盆中。在每个花盆中,根据物种活力播种10-15粒种子。在1-2片真叶期确定施用时间。将植物在受控温室(白天26±2℃,夜晚20±2℃)中生长30天。漫灌(自来水+Shefer 5:3:8 8mM)是以50重量%的水含

量进行的。在施用前两天,所测试的植物间苗至每个花盆三株植物。化合物可溶于水(DDW),并且市售除草剂对照可溶于制剂B(表4)。在施用之前,将1%(v/v)的作物油和0.02%(v/v)的表面活性剂(Tergitol™ 15-S-7)添加到溶液中。用工业喷雾器(TeeJet 6502E喷嘴)以2kg/ha的比率和480l/ha的喷雾量进行施用。在3个时间点(施用后4天、8天、12天(DAA))对植物进行评估。在每个时间点,使用0-6级(0:无可见效果,6:最大效果)记录视觉表型分型。在12DAA,收获植物叶子,干燥并称重,以进行干重分析。

[0504] 萌芽后高级剂量反应实验包括4种物种:SETVI、ECHCO、AMAPA、ABUTH(表3、5)。以介于0.6kg/ha-0.0187kg/ha之间的六个比率和480l/ha的喷雾量进行施用。在4个时间点(6、12、18和26DAA)对植物进行评估。在每个时间点,使用0-6级(0:无可见效果,6:最大效果)记录视觉表型分型。在26DAA,收获植物叶子,干燥并称重,以进行干重分析。

[0505] 萌芽后高级宽小组实验包括24种杂草物种(表5)。以2kg/ha和0.25kg/ha的2个比率和480l/ha的喷雾量进行施用。在4、11、17和20DAA,使用0-6级(0:无可见效果,6:最大效果)记录视觉表型分型。在21DAA,收获植物叶子,干燥并称重,以进行干重分析。所有实验均包括未处理的对照、溶剂对照和阳性对照(市售除草剂A.I.)。通过≥3.5的中值和费希尔检验(Fisher test)(pval≤0.05)确定视觉表型分型的统计分析。通过抑制%≥50和T检验(pval≤0.05)以及威尔科克斯检验(Wilcox test)(pval≤0.05)确定干重的统计分析。

[0506] 萌芽前处理

[0507] 将8种杂草物种的基础小组(表3)播种在含有惰性沙(甜沙)的4×4×7cm的塑料花盆中,用渗透水彻底洗涤。将每个物种播种在单独的花盆中。在每个花盆中,根据物种活力播种10-15粒种子。在施用前一天进行播种。将植物在受控温室(白天26±2℃,夜晚20±2℃)中生长21天。漫灌(自来水+Shefer 5:3:8 8mM)是以50重量%的水含量进行的。化合物可溶于水(DDW),并且市售除草剂对照可溶于制剂B(表4)。用工业喷雾器(TeeJet 6502E喷嘴)以2kg/ha的比率和480l/ha的喷雾量进行施用。

[0508] 以介于1kg/ha-0.0312kg/ha之间的六个比率和480l/ha的喷雾量进行萌芽前高级剂量反应实验施用。在15DAA评估萌芽百分比。在18DAA,使用0-6级(0:无可见效果,6:最大效果)记录视觉表型分型。所有实验均包括未处理的对照、溶剂对照和阳性对照(市售除草剂A.I.)。通过≥3.5的中值和费希尔检验(pval≤0.05)确定视觉表型分型的统计分析。通过萌芽%≥50和T检验(pval≤0.05)以及威尔科克斯检验(pval≤0.05)确定植物萌芽的统计分析。

[0509] 表3:基础杂草小组物种

[0510]

拜耳代码	学名
ABUTH	苘麻
AMBEL	豚草
AMAPA	长芒苋
MATCH	德国洋甘菊
ALOMY	大穗看麦娘
POAAN	早熟禾
LOLPE	多年生黑麦草
SETVI	狗尾草

[0511] 表4:制剂

[0512]

制剂	成分
A	100% DDW
B	48.5%丙酮 40% DDW 10%异丙醇 1.5% DMSO

[0513] 表5:高级小组物种

[0514]

拜耳代码	学名
ABUTH	*苘麻*
AMBEL	*豚草*
AMAPA	*长芒苋*
MATCH	*德国洋甘菊*
ERICA	*小蓬草*
EPHHL	*白苞猩猩草*
AMARE	*反枝苋*
SOLNI	*龙葵*
CHEAL	*藜*
POROL	*马齿苋*
GLXMA	*大豆（Glycine max）*
BRSNN	*欧洲油菜（Brassica napus）*
ALOMY	*大穗看麦娘*
POAAN	*早熟禾*
LOLPE	*多年生黑麦草*
SETVI	*狗尾草*
DIGSA	*马唐*
ECHCO	*光头稗*
LOLRI	*硬直黑麦草*
PHAPA	*奇蒿草*
ZEAMX	*玉蜀黍*
AVEST	*不实野燕麦*

[0515]

TRZAX	*小麦（Triticum aestivum）*
ORYSA	*稻*

[0516] 结果:

[0517] 化合物101、110、125、119、124、146和154的植物体内低通量(LTP)结果呈现于下表6中:

[0518] 表6:根据本发明的化合物的除草活性(植物体内)

[0519]

LTP – 萌芽前	101	110	125	146	154	124	119	170	169
狗尾草	IG (100)	IG (80)	IG (100)	IG (60)	IG (100)	IG (100)	IG (80)	IG (100)	IG (95)
大穗看麦娘	IG (80)		IG (60)	IG (60)	IG (80)	IG (80)			
多年生黑麦草	IG (80)		IG (80)						
早熟禾	IG (100)	IG (60)	IG (100)	IG (60)	IG (100)	IG (100)			
光头稗	IG (100)				IG (100)	IG (100)	IG (60)		
马唐	IG (100)								
长芒苋		IG (80)	IG (80)	IG (80)	IG (80)	IG (80)	IG (80)		
德国洋甘菊		IG (60)	IG (60)						
稗	IG (100)								
多花黑麦草	IG (100)								
奇蒿草	IG (80)								
反枝苋								IG (90)	IG (80)

[0520]

LTP – 萌芽后	101	110	125
狗尾草	IG (60), DAB (60)		IG (60)
苦豆子（Alopecurus monureide's）	IG (80), DAB (80), Drd (80), Bl (60)		
多年生黑麦草	IG (60), Drd (80)		
早熟禾	IG (80), Drd (80)		IG (60)
光头稗	IG (80), DAB (60), Drd (80)		
马唐	IG (80), DAB (80), Drd (80)		
长芒苋			IG (60)
多花黑麦草	Drd (60)		
藜果苋		Drd (80)	
稗	IG (80), DAB (60), Drd (80)		
猪殃殃		Bl (60)	

[0521] Bl:退色

[0522] IG:生长受抑制

[0523] Drd:根系生长受干扰

[0524] DAB:顶芽受干扰

[0525] 结果显示,对于大部分受试物种,化合物101对单子叶和双子叶杂草物种的萌芽后和萌芽前施用方式下均有优异的防治效果。化合物110在萌芽前施用时对双子叶和单子叶植物表现出好至中等的活性。此外,化合物125、119、124、146和154显示出非常好至中等的生长抑制,主要显示在萌芽前施用中。

[0526] 植物体内高通量筛选(HTPS)结果

[0527] 小型双子叶植物模型植物上的萌芽后施用

[0528] 将拟南芥种子播种在填充有使用自来水洗去盐和矿物质的灌溉甜沙(10%>粘土)的96孔板中。将5-10个种子播种在每个孔的中央。播种后7-8天,在2片真叶期,进行间苗以确保在每孔单株植物上进行化合物施用。将板以随机顺序置于受控温室中的浴槽内,所述浴槽允许用补充有肥料的自来水进行漫灌。将所施用的化合物溶解在50%丙酮、49.9%DDW、0.1%吐温-20的最终溶液中。

[0529] 将96孔板用作用于制备8份重复的施用溶液的储备板。每行含有每种化学品的不同浓度。用于施用的最大浓度为1.5kg/ha,并且稀释系数为2.5。在化学通风橱中间苗后一天进行化学施用。使用12个通道移液管将5μL施用于每个孔中的前两个真叶上。数据收集:使用照相机记录每孔绿地面积的RGB(红、绿、蓝)数据。在实验期间的几个时间点收集数据:间苗后一天以及在进行化学施用之前,施用后两天、六天或九天。在最后两次记录期间,进行了视觉表型分型。数据分析:给定RGB结果和视觉表型评分,进行学生t检验以比较处理和对照表现之间的连续数据(RGB),并且进行费希尔精确检验以分析非连续数据(表型评分)。为每次处理生成剂量-反应曲线以推断ED_{50}和最大抑制参数,其中使用处理的对数浓度范围作为因变量以及归一化的绿色面积。

[0530] 在双子叶植物和单子叶植物模型植物上的萌芽前施用

[0531] 以类似的方式进行这些实验,不同之处在于,播种拟南芥或埃塞俄比亚画眉草种子(分别为5-10粒或5-7粒),未进行植物间苗,将化合物溶解在50%丙酮、49.9% DDW的最终溶液中,在植物萌芽之前以每孔30μL的体积直接在播种的土壤上施用化合物,并且分别在双子叶植物或单子叶植物上进行化学施用后10或7天收集数据。

[0532] 成像、RGB和统计分析

[0533] 在11和18DAA进行板成像。记录每孔绿色面积的RGB数据,并且将所述数据用于提取抑制%。为每次处理建立剂量-反应曲线以推断EC_{50}、EC_{75}和EC_{90}参数,其中使用处理的对数浓度范围作为自变量并且将归一化的绿色面积作为因变量。给定RGB结果并且使用学生t检验(p-val≤0.05),将处理与对照表现进行比较。

[0534] 结果:

[0535] 按照上述方法,将化合物101、110、112、119、124、125、146、154、157、172、170、169、112和166以萌芽前、萌芽后或两者兼有的方式施用于单子叶植物或双子叶植物或单子叶植物和双子叶植物模型植物。这些化合物以如上所列出的浓度梯度进行施用,并据此计算出ED_{50}。

[0536] 化合物101、110、112、119、124、125、146、154、157、172、170、169、112和166的植物体内高通量筛选(HTPS)结果呈现于下表7中:

[0537] 表7:根据本发明的化合物的除草活性

[0538]

体系	化合物	最大抑制（%）	ED_{50}（kg/ha）
HTPS 萌芽后双子叶植物（HTPS post dicot）	101	100	0.003
	110	100	0.009
	119	100	0.049
	124	100	0.013
	125	100	0.006
	146	100	0.271
	154	100	0.038
	157	100	0.151
	172	100	0.192
	170	100	0.099
	169	100	0.676
	112	87.5	0.452
	166	75	N/A
HTPS 萌芽前双子叶植物（HTPS Pre dicot）	146	100	N/A
	157	100	0.152
	172	100	0.202
	112	100	0.716
HTPS 萌芽前单子叶植物（HTPS Pre monocot）	146	100	N/A
	112	51	N/A
	166	47	N/A

[0539] 表中的结果显示,在所试验的体系中,大部分化合物(特别是化合物101和110)防治效果优异至非常好。