



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 109311842 B

(45) 授权公告日 2022.03.25

(21) 申请号 201780031783.1

R·R·埃文斯 A·兰德斯

(22) 申请日 2017.05.22

(74) 专利代理机构 北京市中咨律师事务所  
11247

(65) 同一申请的已公布的文献号  
申请公布号 CN 109311842 A

代理人 刘娜 刘金辉

(43) 申请公布日 2019.02.05

(51) Int.Cl.

(30) 优先权数据  
16171063.7 2016.05.24 EP

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 213/75 (2006.01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日  
2018.11.22

C07D 401/12 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

(86) PCT国际申请的申请数据  
PCT/EP2017/062262 2017.05.22

(56) 对比文件

WO 2011137088 A1, 2011.11.03

WO 9952892 A2, 1999.10.21

(87) PCT国际申请的公布数据  
W02017/202768 EN 2017.11.30

WO 2002098227 A1, 2002.12.12

CN 1316426 A, 2001.10.10

(73) 专利权人 巴斯夫欧洲公司  
地址 德国莱茵河畔路德维希港

CN 1420873 A, 2003.05.28

CN 1537110 A, 2004.10.13

CN 1255042 A, 2000.05.31

(72) 发明人 T·塞萨尔 M·维切尔  
M·约翰尼斯 D·马萨  
L·帕尔拉帕多 R·阿朋特  
T·米茨纳 T·W·牛顿 T·塞茨

审查员 耿佳琳

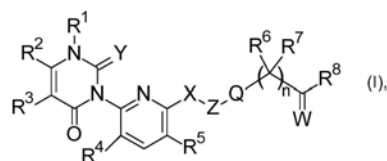
权利要求书3页 说明书161页 附图1页

(54) 发明名称

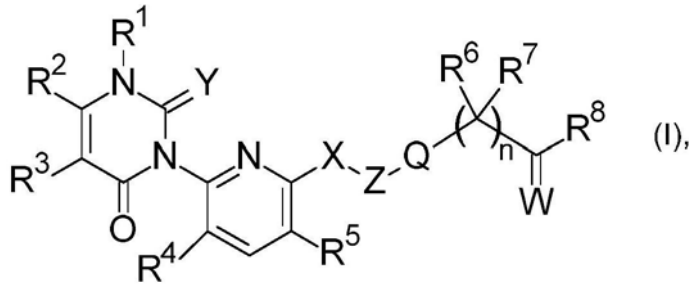
除草的尿嘧啶吡啶类

(57) 摘要

本发明涉及式(I)的尿嘧啶吡啶类或其可农用盐或衍生物,其中变量根据说明书定义,制备式(I)的尿嘧啶吡啶类的方法和中间体,包含它们的组合物及其作为除草剂,即控制有害植物的用途,以及还有一种控制不希望的植物生长的方法,包括使除草有效量的至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶作用于植物、其种子和/或其生长地上。



1. 式 (I) 的尿嘧啶吡啶类:



其中各变量具有下列含义:

$R^1$ :  $C_1$ - $C_6$ 烷基;

$R^2$ :  $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基;

$R^3$ : 氢或 $C_1$ - $C_6$ 烷基;

$R^4$ : H或卤素;

$R^5$ : 卤素、CN;

$R^6$ : H、卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基;

$R^7$ : H、卤素或 $C_1$ - $C_3$ 烷基;

$R^8$ :  $OR^9$ 、 $SR^9$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^9OR^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 或 $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ , 其中

$R^9$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基;

$C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 杂环基、 $C_3$ - $C_6$ 杂环基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、苯基或苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基,

$R^{10}$ 为氢或 $C_1$ - $C_6$ 烷基,

$R^{11}$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基或 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基;

$n$ : 1;

$Q$ : 0;

$W$ : 0;

$X$ : 0或S;

$Y$ : 0;

$Z$ : 苯基或吡啶基,

苯基任选被1-3个选自卤素的取代基取代;

包括其可农用盐。

2. 根据权利要求1的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中 $R^1$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基,  $R^2$ 为 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基且 $R^3$ 为H。

3. 根据权利要求1的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中 $R^4$ 为H或F且 $R^5$ 为F、Cl、Br或CN。

4. 根据权利要求2的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中 $R^4$ 为H或F且 $R^5$ 为F、Cl、Br或CN。

5. 根据权利要求1-4中任一项的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中 $R^6$ 为H、 $C_1$ - $C_3$ 烷基或 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基且 $R^7$ 为H。

6. 根据权利要求1-4中任一项的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中 $R^8$ 为 $OR^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 或 $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ , 其中

$R^9$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_6$ 烷基；以及

$R^{10}$ 、 $R^{11}$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基。

7. 根据权利要求5的式(I)的尿嘧啶吡啶类,其中 $R^8$ 为 $OR^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 或 $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ,其中

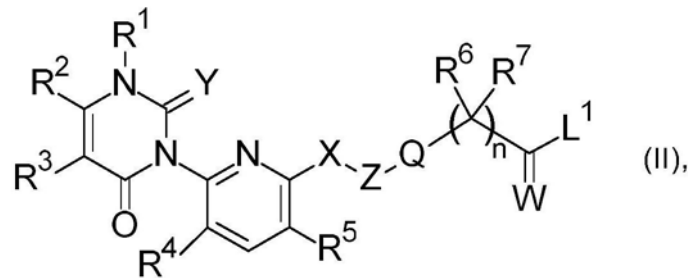
$R^9$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_6$ 烷基；以及

$R^{10}$ 、 $R^{11}$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基。

8. 根据权利要求1-4中任一项的式(I)的尿嘧啶吡啶类,其中Q、W和X为O。

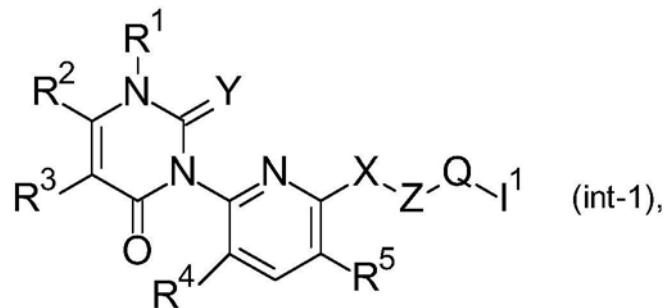
9. 根据权利要求7的式(I)的尿嘧啶吡啶类,其中Q、W和X为O。

10. 式(II)的酰卤:



其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $n$ 、 $Q$ 、 $W$ 、 $X$ 、 $Y$ 和 $Z$ 如权利要求1-9中任一项所定义,以及 $L^1$ 为卤素。

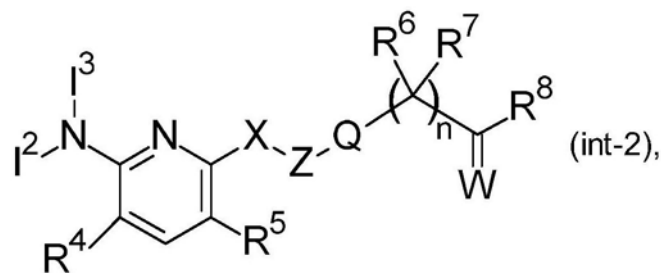
11. 式(int-1)的中间体:



其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $Q$ 、 $X$ 、 $Y$ 和 $Z$ 如权利要求1-9中任一项所定义,以及 $I^1$ 为H,

及其盐。

12. 式(int-2)的中间体:



其中 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $n$ 、 $Q$ 、 $W$ 、 $X$ 和 $Z$ 如权利要求1-9中任一项所定义,以及 $I^2$ 为H;以及

I<sup>3</sup>为H,  
及其盐。

13. 一种包含除草活性量的至少一种如权利要求1-9中任一项所要求保护的式(I)的尿嘧啶吡啶和至少一种惰性液体和/或固体载体以及任选地至少一种表面活性物质的除草组合物。

14. 一种制备除草活性组合物的方法,包括将除草活性量的至少一种如权利要求1-9中任一项所要求保护的式(I)的尿嘧啶吡啶和至少一种惰性液体和/或固体载体以及任选地至少一种表面活性物质混合。

15. 一种控制不希望的植物生长的方法,包括使除草活性量的至少一种如权利要求1-9中任一项所要求保护的式(I)的尿嘧啶吡啶作用于植物、其环境或种子上。

16. 如权利要求1-9中任一项所要求保护的式(I)的尿嘧啶吡啶作为除草剂的用途。

## 除草的尿嘧啶吡啶类

[0001] 本发明涉及如下所定义的通式 (I) 的尿嘧啶吡啶类及其作为除草剂的用途。此外，本发明涉及作物保护组合物和一种控制不希望的植物生长的方法。

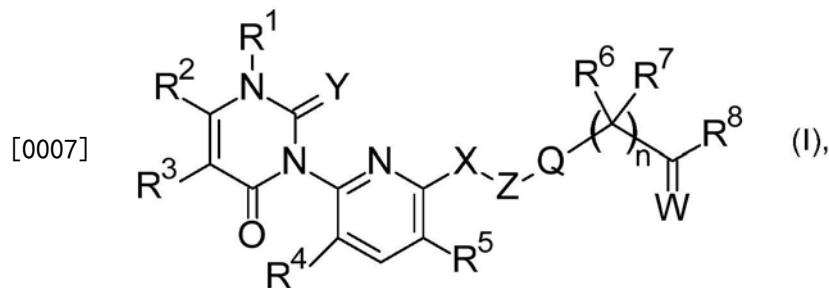
[0002] WO 02/098227 和 WO 11/137088 描述了结构类似化合物，其与本发明尿嘧啶吡啶类 (I) 的不同尤其在于该尿嘧啶被苯基取代，而本发明的尿嘧啶被吡啶基取代。

[0003] 然而，这些已知化合物对有害植物的除草性能并不总是令人满意。

[0004] 因此，本发明的目的是要提供具有改进除草作用的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类。尤其要提供如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其具有高除草活性，尤其甚至在低施用率下，并且与商业利用的农作物充分相容。

[0005] 这些和其他目的由下面所定义的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类及其可农用盐实现。

[0006] 因此，本发明提供了式 (I) 的尿嘧啶吡啶类：



[0008] 其中各取代基具有下列含义：

[0009]  $R^1$ ：氢、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基或 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 炔基；

[0010]  $R^2$ ：氢、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基或 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 卤代烷基；

[0011]  $R^3$ ：氢或 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基；

[0012]  $R^4$ ：H或卤素；

[0013]  $R^5$ ：卤素、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 或 $\text{C}(=\text{S})\text{NH}_2$ ；

[0014]  $R^6$ ：H、卤素、 $\text{CN}$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 卤代烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷基氨基、二- $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷基氨基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷氧羰基；

[0015]  $R^7$ ：H、卤素、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷氧基；

[0016]  $R^8$ ： $\text{OR}^9$ 、 $\text{SR}^9$ 、 $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ 、 $\text{NR}^9\text{OR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{10}$ 或 $\text{NR}^9\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ ，

[0017] 其中

[0018]  $R^9$ 为氢、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 卤代链烯基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 卤代炔基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 氰基烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、二- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 卤代烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 链烯氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 卤代链烯氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 链烯氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷硫基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基亚磺酰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基磺酰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基羰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧羰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 卤代烷氧羰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 链烯氧羰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 炔氧羰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、氨基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基、二- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基羰基氨基、氨基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、二- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、氨基羰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基羰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、二- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基氨基羰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $-\text{N}=\text{CR}^{12}\text{R}^{13}$ ，其中 $\text{R}^{12}$ 和

$R^{13}$ 相互独立地为H、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或苯基； $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 杂环基、 $C_3$ - $C_6$ 杂环基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、苯基、苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基或5或6员杂芳基，

[0019] 其中环烷基、杂环基、苯基或杂芳基环各自可以被1-4个选自 $R^{14}$ 或3-7员碳环的取代基取代，

[0020] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自-N( $R^{12}$ )-、-N=N-、-C(=O)-、-O-和-S-的环成员，以及

[0021] 该碳环任选被1-4个选自 $R^{14}$ 的取代基取代；

[0022] 其中 $R^{14}$ 为卤素、 $NO_2$ 、CN、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧羰基；

[0023]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 相互独立地为 $R^9$ ，或者一起形成3-7员碳环，

[0024] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自-N( $R^{12}$ )-、-N=N-、-C(=O)-、-O-和-S-的环成员，以及

[0025] 该碳环任选被1-4个选自 $R^{14}$ 的取代基取代；

[0026] n:1-3；

[0027] Q:CH<sub>2</sub>、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NH或( $C_1$ - $C_3$ 烷基)N；

[0028] W:O或S；

[0029] X:NH、NCH<sub>3</sub>、O或S；

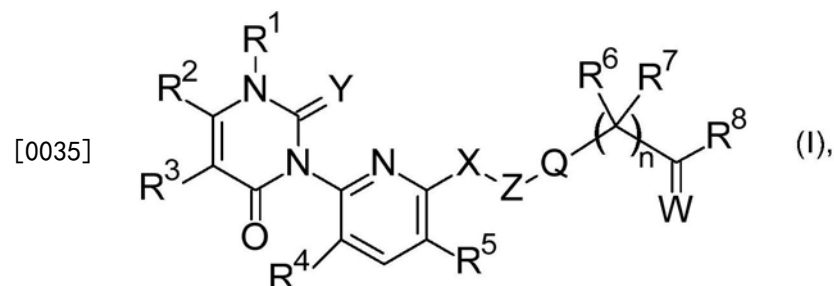
[0030] Y:O或S；

[0031] Z:苯基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基，

[0032] 它们各自任选被1-4个选自卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基的取代基取代；

[0033] 包括其可农用盐或衍生物，条件是式(I)化合物具有羧基。

[0034] 本发明还提供了式(I)的尿嘧啶吡啶类：



[0036] 其中各取代基具有下列含义：

[0037]  $R^1$ : 氢、 $NH_2$ 、 $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_3$ - $C_6$ 炔基；

[0038]  $R^2$ : 氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基；

[0039]  $R^3$ : 氢或 $C_1$ - $C_6$ 烷基；

[0040]  $R^4$ : H或卤素；

[0041]  $R^5$ : 卤素、CN、 $NO_2$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 或C(=S) $NH_2$ ；

[0042]  $R^6$ : H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 烷硫基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基氨基、二- $C_1$ - $C_3$ 烷基氨基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧羰基；

[0043]  $R^7$ : H、卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基；

[0044]  $R^8$ :  $OR^9$ 、 $SR^9$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^9OR^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 或 $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ，

[0045] 其中

[0046]  $R^9$ 为氢、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯基、 $C_3-C_6$ 炔基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_3-C_6$ 卤代链烯基、 $C_3-C_6$ 卤代炔基、 $C_1-C_6$ 氰基烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 卤代链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 炔氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、氨基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基、二- $C_1-C_6$ 烷基氨基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基氨基、氨基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷基氨基- $C_1-C_6$ 烷基、氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $-N=CR^{12}R^{13}$ ，其中 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 相互独立地为H、 $C_1-C_4$ 烷基或苯基； $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 杂环基、 $C_3-C_6$ 杂环基- $C_1-C_6$ 烷基、苯基、苯基- $C_1-C_4$ 烷基或5或6员杂芳基，

[0047] 其中环烷基、杂环基、苯基或杂芳基环各自可以被1-4个选自 $R^{14}$ 或3-7员碳环的取代基取代，

[0048] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 和 $-S-$ 的环成员，以及

[0049] 该碳环任选被1-4个选自 $R^{14}$ 的取代基取代；

[0050] 其中 $R^{14}$ 为卤素、 $NO_2$ 、 $CN$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基或 $C_1-C_4$ 烷氧羰基；

[0051]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 相互独立地为 $R^9$ ，或者一起形成3-7员碳环，

[0052] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 和 $-S-$ 的环成员，以及

[0053] 该碳环任选被1-4个选自 $R^{14}$ 的取代基取代；

[0054]  $n$ : 1-3；

[0055]  $Q$ :  $O$ 、 $S$ 、 $SO$ 、 $SO_2$ 、 $NH$ 或 $(C_1-C_3$ 烷基) $N$ ；

[0056]  $W$ :  $O$ 或 $S$ ；

[0057]  $X$ :  $O$ 或 $S$ ；

[0058]  $Y$ :  $O$ 或 $S$ ；

[0059]  $Z$ : 苯基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基，

[0060] 它们各自任选被1-4个选自卤素、 $CN$ 、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基的取代基取代；

[0061] 包括其可农用盐或衍生物，条件是式(I)化合物具有羧基。

[0062] 本发明还提供了包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶和常用于配制作物保护剂的助剂的农业化学组合物。

[0063] 本发明还提供了包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物。

[0064] 本发明还提供了式(I)的尿嘧啶吡啶类作为除草剂，即控制有害植物的用途。

[0065] 此外，本发明提供了一种控制不希望的植物生长的方法，其中使除草有效量的至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶类作用于植物、其种子和/或其生长地。施用可以在不希望的植物出苗之前、之中和/或之后，优选之中和/或之后进行。

[0066] 此外，本发明涉及制备式(I)的尿嘧啶吡啶类的方法和中间体。

[0067] 本发明的其他实施方案由权利要求书、说明书和实施例明了。还应理解的是本发明主题的上面提到且下文仍要说明的特征在不背离本发明范围下不仅可以以在每种特定情况下给出的组合使用,而且可以以其他组合使用。

[0068] 本文所用术语“控制”和“防除”是同义词。

[0069] 本文所用术语“不希望的植物生长”和“有害植物”是同义词。

[0070] 若本文所述式(I)的尿嘧啶吡啶类、除草化合物B和/或安全剂C能够形成几何异构体,例如E/Z异构体,则可以在本发明组合物中使用纯异构体及其混合物二者。

[0071] 若本文所述式(I)的尿嘧啶吡啶类、除草化合物B和/或安全剂C具有一个或多个手性中心且因此作为对映体或非对映体存在,则可以在本发明组合物中使用纯对映体和非对映体及其混合物二者。

[0072] 在式(I)的尿嘧啶吡啶类的取代基中,代替氢还可以使用相应的同位素氘。

[0073] 若本文所述式(I)的尿嘧啶吡啶类、除草化合物B和/或安全剂C具有可离子化官能基团,则它们还可以以其可农用盐形式使用。合适的通常是其阳离子和阴离子分别对活性化合物的活性没有不利影响的那些阳离子的盐和那些酸的酸加成盐。

[0074] 优选的阳离子是碱金属的离子,优选锂、钠和钾离子,碱土金属的离子,优选钙和镁离子,以及过渡金属的离子,优选锰、铜、锌和铁离子,此外还有铵和其中1-4个氢原子被 $C_1-C_4$ 烷基、羟基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、羟基- $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、苯基或苄基替代的取代铵,优选铵、甲基铵、异丙基铵、二甲基铵、二乙基铵、二异丙基铵、三甲基铵、三乙基铵、三异丙基铵、庚基铵、十二烷基铵、十四烷基铵、四甲基铵、四乙基铵、四丁基铵、2-羟基乙基铵(醇胺盐)、2-(2-羟基乙-1-氧基)乙-1-基铵(二甘醇胺盐)、二(2-羟基乙-1-基)铵(二醇胺盐)、三(2-羟基乙基)铵(三醇胺盐)、三(2-羟基丙基)铵、苄基三甲基铵、苄基三乙基铵、N,N,N-三甲基乙醇铵(胆碱盐),此外还有磷离子,铈离子,优选三( $C_1-C_4$ 烷基)铈,如三甲基铈,以及氧化铈离子,优选三( $C_1-C_4$ 烷基)氧化铈,最后还有多元胺如N,N-二(3-氨基丙基)甲基胺和二亚乙基三胺的盐。

[0075] 还优选的阳离子是碱金属的离子,优选锂、钠和钾离子,碱土金属的离子,优选钙和镁离子,以及过渡金属的离子,优选锰、铜、锌和铁离子,此外还有铵和其中1-4个氢原子被 $C_1-C_4$ 烷基、羟基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、羟基- $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、苯基或苄基替代的取代铵,优选铵、甲基铵、异丙基铵、二甲基铵、二异丙基铵、三甲基铵、庚基铵、十二烷基铵、十四烷基铵、四甲基铵、四乙基铵、四丁基铵、2-羟基乙基铵(醇胺盐)、2-(2-羟基乙-1-氧基)乙-1-基铵(二甘醇胺盐)、二(2-羟基乙-1-基)铵(二醇胺盐)、三(2-羟基乙基)铵(三醇胺盐)、三(2-羟基丙基)铵、苄基三甲基铵、苄基三乙基铵、N,N,N-三甲基乙醇铵(胆碱盐),此外还有磷离子,铈离子,优选三( $C_1-C_4$ 烷基)铈,如三甲基铈,以及氧化铈离子,优选三( $C_1-C_4$ 烷基)氧化铈,最后还有多元胺如N,N-二(3-氨基丙基)甲基胺和二亚乙基三胺的盐。

[0076] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、碘离子、硫酸氢根、甲基硫酸根、硫酸根、磷酸二氢根、磷酸氢根、硝酸根、碳酸氢根、碳酸根、六氟硅酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根以及还有 $C_1-C_4$ 链烷酸的阴离子,优选甲酸根、乙酸根、丙酸根和丁酸根。

[0077] 本文所述具有羧基的式(I)的尿嘧啶吡啶类、除草化合物B和/或安全剂C可以以酸的形式、以如上所述可农用盐的形式或者以可农用衍生物的形式,例如作为酰胺,如单-和

二- $C_1-C_6$ 烷基酰胺或芳基酰胺,作为酯,例如作为烯丙基酯、炔丙基酯、 $C_1-C_{10}$ 烷基酯、烷氧基烷基酯、四氢呋喃基甲基((四氢呋喃-2-基)甲基)酯以及还有作为硫酯,例如作为 $C_1-C_{10}$ 烷硫基酯使用。优选的单-和二- $C_1-C_6$ 烷基酰胺是甲基和二甲基酰胺。优选的芳基酰胺例如为苯替酰胺和2-氯苯替酰胺。优选的烷基酯例如为甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、戊基、甲基己基(1-甲基己基)、甲基庚基(1-甲基庚基)、庚基、辛基或异辛基(2-乙基己基)酯。优选的 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基酯是直链或支化 $C_1-C_4$ 烷氧基乙基酯,例如2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-丁氧基乙基(丁氧乙基)、2-丁氧基丙基或3-丁氧基丙基酯。直链或支化 $C_1-C_{10}$ 烷硫基酯的实例是乙硫基酯。

[0078] 在变量 $R^1-R^{14}$ 和 $R^a-R^e$ 的定义中提到的有机结构部分象术语卤素一样为各基团成员的单独列举的集合性术语。术语卤素在每种情况下表示氟、氯、溴或碘。所有烃链,例如所有烷基、链烯基、炔基、烷氧基链,可以是直链或支化的,前缀 $C_n-C_m$ 在每种情况下表示该基团中的可能碳原子数目。

[0079] 该类含义的实例是:

[0080]  $-C_1-C_3$ 烷基以及还有二- $C_1-C_3$ 烷基氨基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基的 $C_1-C_3$ 烷基结构部分:例如 $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、正丙基和 $CH(CH_3)_2$ ;

[0081]  $-C_1-C_4$ 烷基以及还有苯基- $C_1-C_4$ 烷基的 $C_1-C_4$ 烷基结构部分:例如 $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、正丙基、 $CH(CH_3)_2$ 、正丁基、 $CH(CH_3)-C_2H_5$ 、 $CH_2-CH(CH_3)_2$ 和 $C(CH_3)_3$ ;

[0082]  $-C_1-C_6$ 烷基以及还有 $C_1-C_6$ 氰基烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 卤代链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 炔氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基氨基、氨基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷基氨基- $C_1-C_6$ 烷基、氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 杂环基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_1-C_6$ 烷基结构部分:如上所述的 $C_1-C_4$ 烷基以及还有例如正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基或1-乙基-2-甲基丙基,优选甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、正丁基、1,1-二甲基乙基、正戊基或正己基;

[0083]  $-C_1-C_3$ 卤代烷基:部分或完全被氟、氯、溴和/或碘取代的如上所述的 $C_1-C_3$ 烷基,例如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基、溴甲基、碘甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、七氟丙基、1-氟甲基-2-氟乙基、1-氯甲基-2-氯乙基、1-溴甲基-2-溴乙基;

[0084]  $-C_1-C_4$ 卤代烷基:部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代的如上所述的 $C_1-C_4$ 烷基,例

如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基、溴甲基、碘甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、七氟丙基、1-氟甲基-2-氟乙基、1-氯甲基-2-氯乙基、1-溴甲基-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基、九氟丁基、1,1,2,2-四氟乙基和1-三氟甲基-1,2,2,2-四氟乙基；

[0085]  $-C_1-C_6$ 卤代烷基：如上所述的 $C_1-C_4$ 卤代烷基以及还有例如5-氟戊基、5-氯戊基、5-溴戊基、5-碘戊基、十一氟己基、6-氟己基、6-氯己基、6-溴己基、6-碘己基和十二氟己基；

[0086]  $-C_3-C_6$ 链烯基以及还有 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_3-C_6$ 链烯基结构部分：例如1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基和1-乙基-2-甲基-2-丙烯基；

[0087]  $-C_3-C_6$ 卤代链烯基以及还有 $C_3-C_6$ 卤代链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_3-C_6$ 卤代链烯基结构部分：部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代的如上所述的 $C_3-C_6$ 链烯基，例如2-氯丙-2-烯-1-基、3-氯丙-2-烯-1-基、2,3-二氯丙-2-烯-1-基、3,3-二氯丙-2-烯-1-基、2,3,3-三氯丙-2-烯-1-基、2,3-二氯丁-2-烯-1-基、2-溴丙-2-烯-1-基、3-溴丙-2-烯-1-基、2,3-二溴丙-2-烯-1-基、3,3-二溴丙-2-烯-1-基、2,3,3-三溴丙-2-烯-1-基或2,3-二溴丁-2-烯-1-基；

[0088]  $-C_3-C_6$ 炔基以及还有 $C_3-C_6$ 炔氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_3-C_6$ 炔基结构部分：例如1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基和1-乙

基-1-甲基-2-丙炔基；

[0089]  $-C_3-C_6$ 卤代炔基：部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代的如上所述的 $C_3-C_6$ 炔基，例如1,1-二氟丙-2-炔-1-基、3-氯丙-2-炔-1-基、3-溴丙-2-炔-1-基、3-碘丙-2-炔-1-基、4-氟丁-2-炔-1-基、4-氯丁-2-炔-1-基、1,1-二氟丁-2-炔-1-基、4-碘丁-3-炔-1-基、5-氟戊-3-炔-1-基、5-碘戊-4-炔-1-基、6-氟己-4-炔-1-基或6-碘己-5-炔-1-基；

[0090]  $-C_1-C_3$ 烷氧基以及还有 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧羰基的 $C_1-C_3$ 烷氧基结构部分：例如甲氧基、乙氧基、丙氧基；

[0091]  $-C_1-C_4$ 烷氧基以及还有 $C_1-C_4$ 烷氧羰基的 $C_1-C_4$ 烷氧基结构部分：例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基和1,1-二甲基乙氧基；

[0092]  $-C_1-C_6$ 烷氧基以及还有 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_1-C_6$ 烷氧基结构部分：如上所述的 $C_1-C_4$ 烷氧基以及还有例如戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲氧基丁氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基和1-乙基-2-甲基丙氧基。

[0093]  $-C_1-C_3$ 卤代烷氧基：部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代的如上所述的 $C_1-C_3$ 烷氧基，即例如氟代甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、一氯二氟甲氧基、一溴二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2,3-二氯丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、七氟丙氧基、1-氟甲基-2-氟乙氧基、1-氯甲基-2-氯乙氧基、1-溴甲基-2-溴乙氧基；

[0094]  $-C_1-C_4$ 卤代烷氧基：部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代的如上所述的 $C_1-C_4$ 烷氧基，即例如氟代甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、一氯二氟甲氧基、一溴二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2,3-二氯丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、七氟丙氧基、1-氟甲基-2-氟乙氧基、1-氯甲基-2-氯乙氧基、1-溴甲基-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、4-溴丁氧基和九氟丁氧基；

[0095]  $-C_1-C_6$ 卤代烷氧基以及还有 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基结构部分：如上所述的 $C_1-C_4$ 卤代烷氧基以及还有例如5-氟戊氧基、5-氯戊氧基、5-溴戊氧基、5-碘戊氧基、十一氟戊氧基、6-氟己氧基、6-氯己氧基、6-溴己氧基、6-碘己氧基和十二氟己氧基；

[0096]  $-C_1-C_3$ 烷硫基：例如甲硫基、乙硫基、丙硫基、1-甲基乙硫基；

[0097]  $-C_1-C_4$ 烷硫基：例如甲硫基、乙硫基、丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫

基、2-甲基丙硫基和1,1-二甲基乙硫基；

[0098]  $-C_1-C_6$ 烷硫基以及还有 $C_1-C_6$ 烷硫基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_1-C_6$ 烷硫基结构部分：如上所述的 $C_1-C_4$ 烷硫基以及还有例如戊硫基、1-甲基丁硫基、2-甲基丁硫基、3-甲基丁硫基、2,2-二甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、己硫基、1,1-二甲基丙硫基、1,2-二甲基丙硫基、1-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、4-甲基戊硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、2,3-二甲基丁硫基、3,3-二甲基丁硫基、1-乙基丁硫基、2-乙基丁硫基、1,1,2-三甲基丙硫基、1,2,2-三甲基丙硫基、1-乙基-1-甲基丙硫基和1-乙基-2-甲基丙硫基；

[0099]  $-C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基-S(=O)-)以及还有 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基结构部分：例如甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、丙基亚磺酰基、1-甲基乙基亚磺酰基、丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基、2-甲基丙基亚磺酰基、1,1-二甲基乙基亚磺酰基、戊基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、2-甲基丁基亚磺酰基、3-甲基丁基亚磺酰基、2,2-二甲基丙基亚磺酰基、1-乙基丙基亚磺酰基、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、己基亚磺酰基、1-甲基戊基亚磺酰基、2-甲基戊基亚磺酰基、3-甲基戊基亚磺酰基、4-甲基戊基亚磺酰基、1,1-二甲基丁基亚磺酰基、1,2-二甲基丁基亚磺酰基、1,3-二甲基丁基亚磺酰基、2,2-二甲基丁基亚磺酰基、2,3-二甲基丁基亚磺酰基、3,3-二甲基丁基亚磺酰基、1-乙基丁基亚磺酰基、2-乙基丁基亚磺酰基、1,1,2-三甲基丙基亚磺酰基、1,2,2-三甲基丙基亚磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基亚磺酰基和1-乙基-2-甲基丙基亚磺酰基；

[0100]  $-C_1-C_6$ 烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基-S(O)<sub>2</sub>-)以及还有 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基- $C_1-C_6$ 烷基的 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基结构部分：例如甲基磺酰基、乙基磺酰基、丙基磺酰基、1-甲基乙基磺酰基、丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基、2-甲基丙基磺酰基、1,1-二甲基乙基磺酰基、戊基磺酰基、1-甲基丁基磺酰基、2-甲基丁基磺酰基、3-甲基丁基磺酰基、1,1-二甲基丙基磺酰基、1,2-二甲基丙基磺酰基、2,2-二甲基丙基磺酰基、1-乙基丙基磺酰基、己基磺酰基、1-甲基戊基磺酰基、2-甲基戊基磺酰基、3-甲基戊基磺酰基、4-甲基戊基磺酰基、1,1-二甲基丁基磺酰基、1,2-二甲基丁基磺酰基、1,3-二甲基丁基磺酰基、2,2-二甲基丁基磺酰基、2,3-二甲基丁基磺酰基、3,3-二甲基丁基磺酰基、1-乙基丁基磺酰基、2-乙基丁基磺酰基、1,1,2-三甲基丙基磺酰基、1,2,2-三甲基丙基磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基磺酰基和1-乙基-2-甲基丙基磺酰基；

[0101]  $-C_1-C_3$ 烷基氨基：例如甲基氨基、乙基氨基、丙基氨基、1-甲基乙基氨基；

[0102]  $-C_1-C_4$ 烷基氨基：例如甲基氨基、乙基氨基、丙基氨基、1-甲基乙基氨基、丁基氨基、1-甲基丙基氨基、2-甲基丙基氨基或1,1-二甲基乙基氨基；

[0103]  $-C_1-C_6$ 烷基氨基：如上所述的 $C_1-C_4$ 烷基氨基以及还有例如戊基氨基、1-甲基丁基氨基、2-甲基丁基氨基、3-甲基丁基氨基、2,2-二甲基丙基氨基、1-乙基丙基氨基、己基氨基、1,1-二甲基丙基氨基、1,2-二甲基丙基氨基、1-甲基戊基氨基、2-甲基戊基氨基、3-甲基戊基氨基、4-甲基戊基氨基、1,1-二甲基丁基氨基、1,2-二甲基丁基氨基、1,3-二甲基丁基氨基、2,2-二甲基丁基氨基、2,3-二甲基丁基氨基、3,3-二甲基丁基氨基、1-乙基丁基氨基、2-乙基丁基氨基、1,1,2-三甲基丙基氨基、1,2,2-三甲基丙基氨基、1-乙基-1-甲基丙基氨基或1-乙基-2-甲基丙基氨基；

[0104] -二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基:如上所述的二-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基氨基以及还有例如N-甲基-N-戊基氨基、N-甲基-N-(1-甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(2-甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(3-甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(2,2-二甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(1-乙基丙基)氨基、N-甲基-N-己基氨基、N-甲基-N-(1,1-二甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(1,2-二甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(1-甲基戊基)氨基、N-甲基-N-(2-甲基戊基)氨基、N-甲基-N-(3-甲基戊基)氨基、N-甲基-N-(4-甲基戊基)氨基、N-甲基-N-(1,1-二甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(1,2-二甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(1,3-二甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(2,2-二甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(2,3-二甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(3,3-二甲基丁基)氨基、N-甲基-N-(1-乙基丁基)氨基、N-甲基-N-(2-乙基丁基)氨基、N-甲基-N-(1,1,2-三甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(1,2,2-三甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(1-乙基-1-甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(1-乙基-2-甲基丙基)氨基、N-乙基-N-戊基氨基、N-乙基-N-(1-甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(2-甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(3-甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(2,2-二甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1-乙基丙基)氨基、N-乙基-N-己基氨基、N-乙基-N-(1,1-二甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1,2-二甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1-甲基戊基)氨基、N-乙基-N-(2-甲基戊基)氨基、N-乙基-N-(3-甲基戊基)氨基、N-乙基-N-(4-甲基戊基)氨基、N-乙基-N-(1,1-二甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(1,2-二甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(1,3-二甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(2,2-二甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(2,3-二甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(3,3-二甲基丁基)氨基、N-乙基-N-(1-乙基丁基)氨基、N-乙基-N-(2-乙基丁基)氨基、N-乙基-N-(1,1,2-三甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1,2,2-三甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1-乙基-1-甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1-乙基-2-甲基丙基)氨基、N-丙基-N-戊基氨基、N-丁基-N-戊基氨基、N,N-二戊基氨基、N-丙基-N-己基氨基、N-丁基-N-己基氨基、N-戊基-N-己基氨基或N,N-二己基氨基;

[0105] -C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基以及还有C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基的环烷基结构部分:具有3-6个环成员的单环饱和烃,如环丙基、环丁基、环戊基和环己基;

[0106] -C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>杂环基以及还有C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>杂环基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基的杂环基结构部分:具有3-6个环成员的脂族杂环,其除了碳原子外含有1-4个氮原子或者1-3个氮原子和氧或硫原子或者氧或硫原子,例如

[0107] 3或4员杂环,如2-氧杂环丁烷基、3-氧杂环丁烷基、2-硫杂环丁烷基、3-硫杂环丁烷基、1-氮杂环丁烷基、2-氮杂环丁烷基、1-氮杂环丁烯基、2-氮杂环丁烯基;5员饱和杂环,如2-四氢呋喃基、3-四氢呋喃基、2-四氢噻吩基、3-四氢噻吩基、1-吡咯烷基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、3-异噁唑烷基、4-异噁唑烷基、5-异噁唑烷基、2-异噻唑烷基、3-异噻唑烷基、4-异噻唑烷基、5-异噻唑烷基、1-吡唑烷基、3-吡唑烷基、4-吡唑烷基、5-吡唑烷基、2-噁唑烷基、4-噁唑烷基、5-噁唑烷基、2-咪唑烷基、4-咪唑烷基、3-噁唑烷基、1,2,4-噁二唑烷-3-基、1,2,4-噁二唑烷-5-基、3-噁唑烷基、1,2,4-噁二唑烷-3-基、1,2,4-噁二唑烷-5-基、1,2,4-三唑烷-3-基、1,2,4-噁二唑烷-2-基、1,2,4-噁二唑烷-4-基、1,3,4-噁二唑烷-2-基、1,2,4-噁二唑烷-2-基、1,2,4-噁二唑烷-4-基、1,3,4-噁二唑烷-2-基、1,2,4-三唑烷-1-基、1,3,4-三唑烷-2-基;6员饱和杂环如1-哌啶基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基、1,3-二噁烷-5-基、1,4-二噁烷基、1,3-二噻烷-5-基、1,3-二噻烷基、1,3-氧硫杂环己烷-5-基、1,4-氧硫杂环己烷

基、2-四氢吡喃基、3-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基、2-四氢噻喃基、3-四氢噻喃基、4-四氢噻喃基、1-六氢哒嗪基、3-六氢哒嗪基、4-六氢哒嗪基、1-六氢嘧啶基、2-六氢嘧啶基、4-六氢嘧啶基、5-六氢嘧啶基、1-哌嗪基、2-哌嗪基、1,3,5-六氢三嗪-1-基、1,3,5-六氢三嗪-2-基、1,2,4-六氢三嗪-1-基、1,2,4-六氢三嗪-3-基、四氢-1,3-噁嗪-1-基、四氢-1,3-噁嗪-2-基、四氢-1,3-噁嗪-6-基、1-吗啉基、2-吗啉基、3-吗啉基；

[0108] -5或6员杂芳基：具有5或6个环成员的芳族杂芳基，其除了碳原子外含有1-4个氮原子或者1-3个氮原子和氧或硫原子或者氧或硫原子，例如5员芳族环如呋喃基（例如2-呋喃基、3-呋喃基）、噻吩基（例如2-噻吩基、3-噻吩基）、吡咯基（例如吡咯-2-基、吡咯-3-基）、吡唑基（例如吡唑-3-基、吡唑-4-基）、异噁唑基（例如异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基）、异噻唑基（例如异噻唑-3-基、异噻唑-4-基、异噻唑-5-基）、咪唑基（例如咪唑-2-基、咪唑-4-基）、噁唑基（例如噁唑-2-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基）、噻唑基（例如噻唑-2-基、噻唑-4-基、噻唑-5-基）、噁二唑基（例如1,2,3-噁二唑-4-基、1,2,3-噁二唑-5-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基）、噻二唑基（例如1,2,3-噻二唑-4-基、1,2,3-噻二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噻二唑-2-基）、三唑基（例如1,2,3-三唑-4-基、1,2,4-三唑-3-基）；1-四唑基；6员芳族环如吡啶基（例如吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基）、吡嗪基（例如吡嗪-3-基、吡嗪-4-基）、嘧啶基（例如嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、嘧啶-5-基）、吡嗪-2-基、三嗪基（例如1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基、1,2,4-三嗪-6-基）；

[0109] -3-7员碳环：具有3-7个环成员的3-7员单环、饱和、部分不饱和或芳族环，其除了碳原子外任选包含1或2个选自 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 和 $-S-$ 的环成员。

[0110] 下文所述本发明的优选实施方案应理解为相互独立地或者相互组合地是优选的。

[0111] 根据本发明的优选实施方案，还优选如下那些式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中各变量相互独立地或者相互组合地具有下列含义：

[0112] 优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^1$ 为氢、 $NH_2$ 或 $C_1-C_6$ 烷基；优选 $NH_2$ 或 $C_1-C_4$ 烷基；特别优选 $NH_2$ 或 $CH_3$ ；还优选 $C_1-C_6$ 烷基；特别优选 $C_1-C_4$ 烷基；尤其优选 $CH_3$ 。

[0113] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^2$ 为 $C_1-C_6$ 烷基或 $C_1-C_6$ 卤代烷基；优选 $C_1-C_4$ 烷基或 $C_1-C_4$ 卤代烷基；更优选 $C_1-C_4$ 卤代烷基；特别优选 $C_1-C_2$ 卤代烷基；尤其优选 $CF_3$ 。

[0114] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^3$ 为H；还优选 $C_1-C_6$ 烷基，特别优选 $C_1-C_4$ 烷基，尤其优选 $CH_3$ 。

[0115] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^4$ 为H、F或Cl；特别优选H或F；尤其优选H；还特别优选H或Cl；尤其优选Cl；还特别优选F或Cl；尤其优选F。

[0116] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^5$ 为卤素或CN；优选F、Cl、Br或CN；特别优选F、Cl或CN；尤其优选Cl或CN；更优选Cl；还更优选CN；还尤其优选F或Cl；更优选F。

[0117] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^6$ 为H、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基或 $C_1-C_3$ 烷硫基；特别优选H、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基；尤其优选H、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基；更优选H、 $CH_3$ 或 $OCH_3$ 。

[0118] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^7$ 为H、卤素或 $C_1-C_3$ 烷基；特别优选H、F或 $CH_3$ ；尤其优选H。

[0119] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中  $R^8$  为  $OR^9$ 、 $SR^9$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$  或  $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ; 特别优选  $OR^9$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$  或  $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ; 尤其优选  $OR^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$  或  $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ; 尤其优选  $OR^9$  或  $NR^9S(O)_2R^{10}$ 。

[0120] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中

[0121]  $R^9$  为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 炔氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、氨基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基氨基、氨基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、氨基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $-N=CR^{12}R^{13}$ , 其中  $R^{12}$  和  $R^{13}$  相互独立地为 H、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或苯基;  $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 杂环基、苯基、苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基或 5 或 6 员杂芳基,

[0122] 其中环烷基、杂环基、苯基或杂芳基环各自可以被 1-4 个选自  $R^{14}$  或 3-7 员碳环的取代基取代,

[0123] 该碳环任选除了碳原子外具有 1 或 2 个选自  $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$  和  $-S-$  的环成员, 以及

[0124] 该碳环任选被 1-4 个选自  $R^{14}$  的取代基取代,

[0125] 其中  $R^{14}$  为卤素、 $NO_2$ 、 $CN$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或  $C_1$ - $C_4$ 烷氧羰基;

[0126] 优选为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基或  $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_6$ 烷基; 特别优选为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基或  $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基;

[0127] 还特别优选为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基或  $C_3$ - $C_6$ 炔基;

[0128] 尤其优选为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基或  $C_3$ - $C_6$ 炔基;

[0129] 更优选为氢、 $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $CH_2CH=CH_2$  或  $CH_2C\equiv CH$ ;

[0130] 最优选为氢、 $CH_3$ 、 $C_2H_5$  或  $CH_2C\equiv CH$ 。

[0131] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中  $R^{10}$  为 H、 $C_1$ - $C_6$ 烷基或  $C_3$ - $C_6$ 环烷基; 特别优选 H 或  $C_1$ - $C_6$ 烷基; 更优选 H; 还更优选  $C_1$ - $C_6$ 烷基。

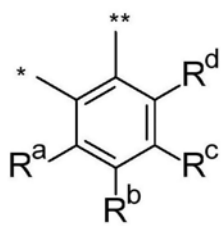
[0132] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中  $R^{11}$  为 H、 $C_1$ - $C_6$ 烷基或  $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基; 特别优选 H 或  $C_1$ - $C_6$ 烷基; 更优选 H; 还更优选  $C_1$ - $C_6$ 烷基。

[0133] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中  $R^{12}$  为苯基或  $C_1$ - $C_4$ 烷基; 特别优选苯基或  $CH_3$ ; 还特别优选苯基; 还特别优选  $C_1$ - $C_4$ 烷基。

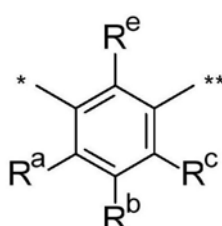
[0134] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中  $R^{13}$  为苯基或  $C_1$ - $C_4$ 烷基; 特别优选苯基或  $CH_3$ ; 还特别优选苯基; 还特别优选  $C_1$ - $C_4$ 烷基。

[0135] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中  $R^{14}$  为卤素或  $C_1$ - $C_6$ 烷基; 特别优选 F、Cl 或  $CH_3$ ; 还特别优选卤素; 尤其优选 F 或 Cl; 还特别优选  $C_1$ - $C_6$ 烷基; 尤其优选  $CH_3$ 。

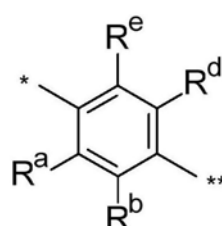
- [0136] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中n为1或2; 特别优选2; 还特别优选1。
- [0137] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中Q为O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NH或(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)N; 优选O或S; 特别优选O。
- [0138] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中W为O, 还优选S。
- [0139] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中X为O, 还优选S。
- [0140] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中Y为O, 还优选S。
- [0141] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中Z为苯基或吡啶基, 它们各自任选被1-4个选自卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代; 优选为苯基, 其任选被1-4个选自卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代; 还优选为吡啶基, 其任选被1-4个选自卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代。
- [0142] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中Z为苯基或吡啶基, 它们各自任选被1-4个选自卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代; 优选苯基或吡啶基, 它们各自任选被1-4个选自卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代; 特别优选苯基或吡啶基, 它们各自任选被1-4个选自卤素或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基的取代基取代; 尤其优选苯基或吡啶基, 它们各自任选被1-4个选自F、Cl或CH<sub>3</sub>的取代基取代; 更优选苯基或吡啶基, 它们各自未被取代。
- [0143] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中Z为苯基, 其任选被1-4个选自卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代; 优选苯基, 其任选被1-4个选自卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代; 特别优选苯基, 其任选被1-4个选自卤素或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基的取代基取代; 尤其优选苯基, 其任选被1-4个选自F、Cl或CH<sub>3</sub>的取代基取代; 更优选未取代的苯基。
- [0144] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中Z为吡啶基, 其任选被1-3个选自卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代; 优选吡啶基, 其任选被1-3个选自卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代; 特别优选吡啶基, 其任选被1-3个选自卤素或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基的取代基取代; 尤其优选吡啶基, 其任选被1-3个选自F、Cl或CH<sub>3</sub>的取代基取代; 更优选未取代的吡啶基。
- [0145] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中Z选自Z<sup>1</sup>-Z<sup>29</sup>:



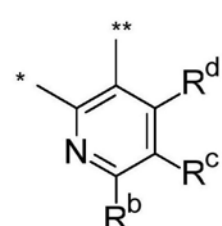
Z-1



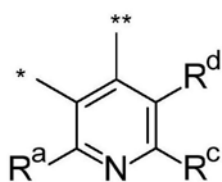
Z-2



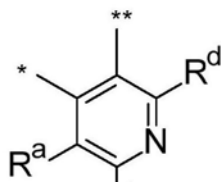
Z-3



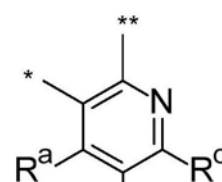
Z-4



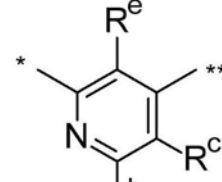
Z-5



Z-6

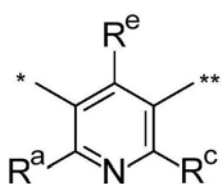


Z-7

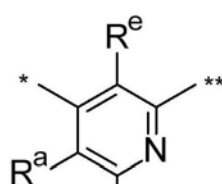


Z-8

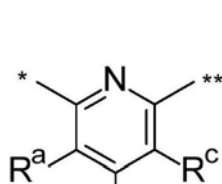
[0146]



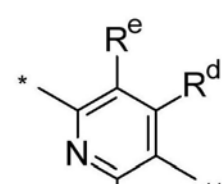
Z-9



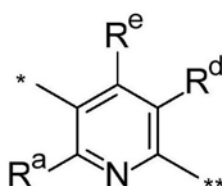
Z-10



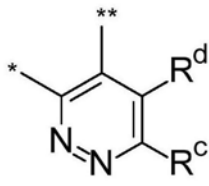
Z-11



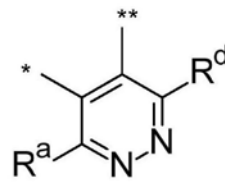
Z-12



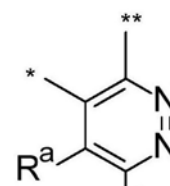
Z-13



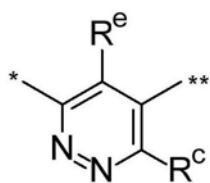
Z-14



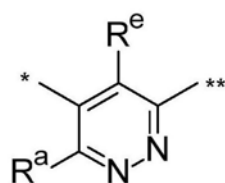
Z-15



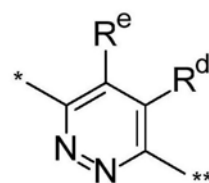
Z-16



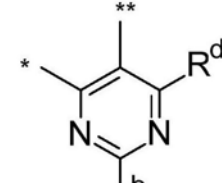
Z-17



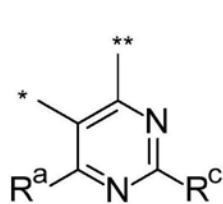
Z-18



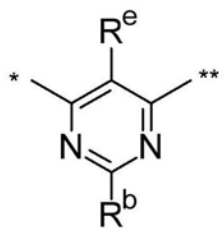
Z-19



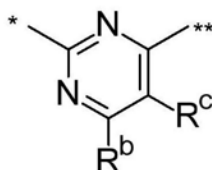
Z-20



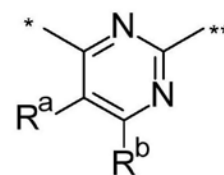
Z-21



Z-22

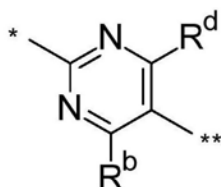


Z-23

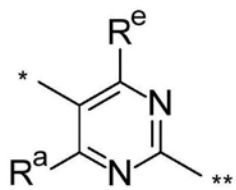


Z-24

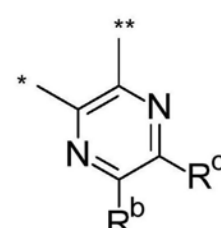
[0147]



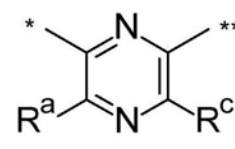
Z-25



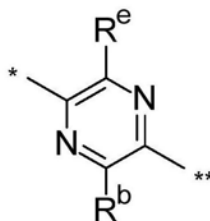
Z-26



Z-27



Z-28



Z-29

[0148] 其中

[0149] \*表示Z与X的连接点；

[0150] \*\*表示Z与O的连接点；以及

[0151]  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；优选H、卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；特别优选H、卤素或 $C_1$ - $C_6$ 烷基；尤其优选H、F、Cl或 $CH_3$ ；更优选H。

[0152] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中Z选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^3$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 、 $Z^7$ 、 $Z^8$ 、 $Z^9$ 、 $Z^{10}$ 、 $Z^{11}$ 、 $Z^{12}$ 、 $Z^{13}$ 和 $Z^{21}$ ；特别优选选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 、 $Z^7$ 、 $Z^8$ 、 $Z^9$ 、 $Z^{10}$ 、 $Z^{11}$ 和 $Z^{21}$ ；更特别优选选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 、 $Z^7$ 和 $Z^{21}$ ；尤其优选选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ；更优选选自如上所定义的 $Z^1$ 和 $Z^7$ 。

[0153] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中Z选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^3$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 、 $Z^7$ 、 $Z^8$ 、 $Z^9$ 、 $Z^{10}$ 、 $Z^{11}$ 、 $Z^{12}$ 、 $Z^{13}$ 和 $Z^{21}$ ；其中

[0154]  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；优选H、卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；特别优选H、卤素或 $C_1$ - $C_6$ 烷基；尤其优选H、F、Cl或 $CH_3$ ；更优选H；

[0155] 特别优选选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 、 $Z^7$ 、 $Z^8$ 、 $Z^9$ 、 $Z^{10}$ 、 $Z^{11}$ 和 $Z^{21}$ ，其中

[0156]  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；优选H、卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；特别优选H、卤素或 $C_1$ - $C_6$ 烷基；尤其优选H、F、Cl或 $CH_3$ ；更优选H；

[0157] 更特别优选选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 、 $Z^7$ 和 $Z^{21}$ ，其中

[0158]  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；优选H、卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；特别优选H、卤素或 $C_1$ - $C_6$ 烷基；尤其优选H、F、Cl或 $CH_3$ ；更优选H；

[0159] 尤其优选选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ，其中

[0160]  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；优选H、卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；特别优选H、卤素或 $C_1$ - $C_6$ 烷基；尤其优选H、F、Cl或 $CH_3$ ；更优选H；

[0161] 更优选选自如上所定义的 $Z^1$ 和 $Z^7$ ，其中

[0162]  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；优选H、卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基；特别优选H、卤素或 $C_1$ - $C_6$ 烷基；尤其优选H、F、Cl或 $CH_3$ ；更优选H。

[0163] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^1$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基， $R^2$ 为 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基， $R^3$ 为H且Y为O。

[0164] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^4$ 为H或F且 $R^5$ 为F、Cl、Br或CN。

[0165] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^4$ 为H或F且 $R^5$ 为F、Cl或CN。

[0166] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其中 $R^6$ 为H、 $C_1$ - $C_3$ 烷基或 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基且 $R^7$ 为H。

[0167] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其中

[0168]  $R^8$ 为 $OR^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 或 $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ，其中

[0169]  $R^9$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_6$ 烷基；以及

[0170]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基。

[0171] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其中n为1。

[0172] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其中Q、W和X为O。

[0173] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类，其中

[0174]  $R^1$ 为氢、 $NH_2$ 或 $C_1$ - $C_6$ 烷基；

[0175]  $R^2$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基；

[0176]  $R^3$ 为H；

[0177]  $R^4$ 为H或卤素；

[0178]  $R^5$ 为卤素或CN；

[0179]  $R^6$ 为H、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基或 $C_1$ - $C_3$ 烷硫基；

[0180]  $R^7$ 为H；

[0181]  $R^8$ 为 $OR^9$ 、 $SR^9$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 或 $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ；其中

[0182]  $R^9$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ -

C<sub>6</sub>烷氧羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>链烯氧羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基氨基、氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、氨基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基，

[0183] -N=CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>，其中R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>相互独立地为H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或苯基；

[0184] C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>杂环基、苯基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或5或6员杂芳基，

[0185] 其中环烷基、杂环基、苯基或杂芳基环各自可以被1-4个选自R<sup>14</sup>或3-7员碳环的取代基取代，

[0186] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自-N(R<sup>12</sup>)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-和-S-的环成员，以及

[0187] 该碳环任选被1-4个选自R<sup>14</sup>的取代基取代；

[0188] R<sup>10</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；

[0189] R<sup>11</sup>为H或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；

[0190] R<sup>12</sup>为苯基或CH<sub>3</sub>；

[0191] R<sup>13</sup>为苯基或CH<sub>3</sub>；

[0192] R<sup>14</sup>为卤素或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；

[0193] n为1或2；

[0194] Q为O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NH或(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)N；

[0195] W为O；

[0196] X为O；

[0197] Y为O；

[0198] Z：如上所定义的Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup>、Z<sup>4</sup>、Z<sup>5</sup>、Z<sup>6</sup>、Z<sup>7</sup>、Z<sup>8</sup>、Z<sup>9</sup>、Z<sup>10</sup>、Z<sup>11</sup>、Z<sup>12</sup>、Z<sup>13</sup>和Z<sup>21</sup>，其中

[0199] R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>和R<sup>e</sup>相互独立地为H、卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基；

[0200] 特别优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类，其中

[0201] R<sup>1</sup>为NH<sub>2</sub>或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

[0202] R<sup>2</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基；

[0203] R<sup>3</sup>为H；

[0204] R<sup>4</sup>为H或卤素；

[0205] R<sup>5</sup>为卤素或CN；

[0206] R<sup>6</sup>为H、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基；

[0207] R<sup>7</sup>为H；

[0208] R<sup>8</sup>：OR<sup>9</sup>、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>或NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>；其中

[0209] R<sup>9</sup>为氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；

[0210] R<sup>10</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；

[0211] R<sup>11</sup>为H或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；

- [0212] n为1;
- [0213] Q为O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NH或(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)N;
- [0214] W为O;
- [0215] X为O;
- [0216] Y为O;
- [0217] Z选自如上所定义的Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>4</sup>、Z<sup>5</sup>、Z<sup>6</sup>、Z<sup>7</sup>、Z<sup>8</sup>、Z<sup>9</sup>、Z<sup>10</sup>、Z<sup>11</sup>和Z<sup>21</sup>,其中R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>和R<sup>e</sup>相互独立地为H、卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基;
- [0218] 尤其优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类,其中
- [0219] R<sup>1</sup>为NH<sub>2</sub>或CH<sub>3</sub>;
- [0220] R<sup>2</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;
- [0221] R<sup>3</sup>为H;
- [0222] R<sup>4</sup>为H、F或Cl;
- [0223] R<sup>5</sup>为F、Cl、Br或CN;
- [0224] R<sup>6</sup>为H、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基;
- [0225] R<sup>7</sup>为H;
- [0226] R<sup>8</sup>为OR<sup>9</sup>或NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>,其中
- [0227] R<sup>9</sup>为氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>炔基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基,以及
- [0228] R<sup>10</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基;
- [0229] n为1;
- [0230] Q为O或S;
- [0231] W为O;
- [0232] X为O;
- [0233] Y为O;
- [0234] Z选自如上所定义的Z<sup>1</sup>、Z<sup>4</sup>、Z<sup>5</sup>、Z<sup>6</sup>、Z<sup>7</sup>和Z<sup>21</sup>,其中R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>和R<sup>e</sup>相互独立地为H、卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基;
- [0235] 还尤其优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类,其中
- [0236] R<sup>1</sup>为NH<sub>2</sub>或CH<sub>3</sub>;
- [0237] R<sup>2</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;
- [0238] R<sup>3</sup>为H;
- [0239] R<sup>4</sup>为H、F或Cl;
- [0240] R<sup>5</sup>为F、Cl或CN;
- [0241] R<sup>6</sup>为H、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基;
- [0242] R<sup>7</sup>为H;
- [0243] R<sup>8</sup>为OR<sup>9</sup>或NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>,其中
- [0244] R<sup>9</sup>为氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>炔基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基,以及
- [0245] R<sup>10</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基;
- [0246] n为1;
- [0247] Q为O或S;
- [0248] W为O;

- [0249] X为0;
- [0250] Y为0;
- [0251] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$
- [0252] 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基;
- [0253] 更优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类,其中
- [0254]  $R^1$ 为 $CH_3$ ;
- [0255]  $R^2$ 为 $CF_3$ ;
- [0256]  $R^3$ 为H;
- [0257]  $R^4$ 为H、F或Cl;
- [0258]  $R^5$ 为F、Cl、Br或CN;
- [0259]  $R^6$ 为H、 $CH_3$ 或 $OCH_3$ ;
- [0260]  $R^7$ 为H;
- [0261]  $R^8$ 为 $OR^9$ 或 $NR^9S(O)_2R^{10}$ ;其中
- [0262]  $R^9$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基或 $C_3$ - $C_6$ 炔基,以及
- [0263]  $R^{10}$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基;
- [0264] n为1;
- [0265] Q为0;
- [0266] W为0;
- [0267] X为0;
- [0268] Y为0;
- [0269] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 和 $Z^7$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基。
- [0270] 还更优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类,其中
- [0271]  $R^1$ 为 $CH_3$ ;
- [0272]  $R^2$ 为 $CF_3$ ;
- [0273]  $R^3$ 为H;
- [0274]  $R^4$ 为H、F或Cl;
- [0275]  $R^5$ 为F、Cl或CN;
- [0276]  $R^6$ 为H、 $CH_3$ 或 $OCH_3$ ;
- [0277]  $R^7$ 为H;
- [0278]  $R^8$ 为 $OR^9$ 或 $NR^9S(O)_2R^{10}$ ;其中
- [0279]  $R^9$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基,或 $C_3$ - $C_6$ 炔基,以及
- [0280]  $R^{10}$ 为 $C_1$ - $C_6$ 烷基;
- [0281] n为1;
- [0282] Q为0;
- [0283] W为0;
- [0284] X为0;
- [0285] Y为0;

[0286] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 和 $Z^7$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基。

[0287] 还优选如下式(I)的尿嘧啶吡啶类,其中

[0288]  $R^1$ 为 $CH_3$ ;

[0289]  $R^2$ 为 $CF_3$ ;

[0290]  $R^3$ 为H;

[0291]  $R^4$ 为H、F或Cl;

[0292]  $R^5$ 为F、Cl、Br或CN;

[0293]  $R^6$ 为H、 $CH_3$ 或 $OCH_3$ ;

[0294]  $R^7$ 为H;

[0295]  $R^8$ : $OR^9$ 、 $SR^9$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^9OR^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 或 $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ,其中

[0296]  $R^9$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 链烯氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 炔氧羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、氨基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基氨基、氨基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、氨基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、二- $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $-N=CR^{12}R^{13}$ ,其中 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 相互独立地为H、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或苯基;

[0297]  $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 杂环基、 $C_3$ - $C_6$ 杂环基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、苯基、苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基或5或6员杂芳基,

[0298] 其中环烷基、杂环基、苯基或杂芳基环各自可以被1-4个选自 $R^{14}$ 或3-7员碳环的取代基取代,

[0299] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 和 $-S-$ 的环成员,以及

[0300] 该碳环任选被1-4个选自 $R^{14}$ 的取代基取代;

[0301] 其中 $R^{14}$ 为卤素、 $NO_2$ 、CN、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧羰基;

[0302]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 相互独立地为 $R^9$ ,或者一起形成3-7员碳环,

[0303] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 和 $-S-$ 的环成员,以及

[0304] 该碳环任选被1-4个选自 $R^{14}$ 的取代基取代;

[0305] n为1;

[0306] Q为0;

[0307] W为0;

[0308] X为0;

[0309] Y为0;

[0310] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 和 $Z^7$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基

基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基。

[0311] 还优选如下式 (I) 的尿嘧啶吡啶类, 其中

[0312]  $R^1$ 为 $CH_3$ ;

[0313]  $R^2$ 为 $CF_3$ ;

[0314]  $R^3$ 为H;

[0315]  $R^4$ 为H、F或Cl;

[0316]  $R^5$ 为F、Cl或CN;

[0317]  $R^6$ 为H、 $CH_3$ 或 $OCH_3$ ;

[0318]  $R^7$ 为H;

[0319]  $R^8$ :  $OR^9$ 、 $SR^9$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^9OR^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 或 $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ,

[0320] 其中

[0321]  $R^9$ 为氢、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯基、 $C_3-C_6$ 炔基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_3-C_6$ 卤代链烯基、 $C_3-C_6$ 卤代炔基、 $C_1-C_6$ 氰基烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 卤代链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧基- $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 炔氧羰基- $C_1-C_6$ 烷基、氨基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基、二- $C_1-C_6$ 烷基氨基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基氨基、氨基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷基氨基- $C_1-C_6$ 烷基、氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、二- $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基- $C_1-C_6$ 烷基、 $-N=CR^{12}R^{13}$ , 其中 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 相互独立地为H、 $C_1-C_4$ 烷基或苯基;  $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 杂环基、 $C_3-C_6$ 杂环基- $C_1-C_6$ 烷基、苯基、苯基- $C_1-C_4$ 烷基或5或6员杂芳基,

[0322] 其中环烷基、杂环基、苯基或杂芳基环各自可以被1-4个选自 $R^{14}$ 或3-7员碳环的取代基取代,

[0323] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 和 $-S-$ 的环成员, 以及

[0324] 该碳环任选被1-4个选自 $R^{14}$ 的取代基取代;

[0325] 其中 $R^{14}$ 为卤素、 $NO_2$ 、CN、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基或 $C_1-C_4$ 烷氧羰基;

[0326]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 相互独立地为 $R^9$ , 或者一起形成3-7员碳环,

[0327] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 和 $-S-$ 的环成员, 以及

[0328] 该碳环任选被1-4个选自 $R^{14}$ 的取代基取代;

[0329] n为1;

[0330] Q为0;

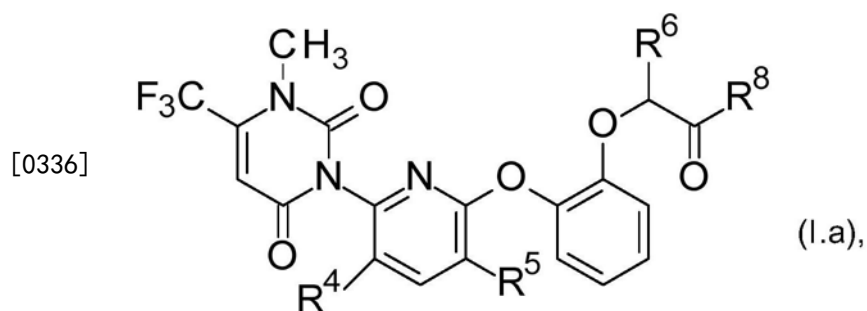
[0331] W为0;

[0332] X为0;

[0333] Y为0;

[0334] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 和 $Z^7$ , 其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基。

[0335] 特别优选式 (I.a) 的尿嘧啶嘧啶类 (对应于式 (I), 其中  $R^1$  为  $CH_3$ ,  $R^2$  为  $CF_3$ ,  $R^3$  为  $H$ ,  $R^7$  为  $H$ ,  $n$  为 1,  $Q$ 、 $W$ 、 $X$  和  $Y$  为 0 且  $Z$  为如上所定义的  $Z-1$ , 其中  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$  和  $R^d$  为  $H$ ) :



[0337] 其中变量  $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $R^8$  具有如上所定义的含义, 尤其是优选含义。

[0338] 特别优选表 A 的式 (I.a.1) - (I.a.672) 的中间体, 优选式 (I.a.1) - (I.a.504) 的中间体, 其中变量  $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $R^8$  的定义不仅相互组合地而且在每种情况下也独立地对本发明化合物而言特别重要:

[0339] 表 A

[0340]

序号	$R^4$	$R^5$	$R^6$	$R^8$
I.a.1.	H	F	H	OH
I.a.2.	H	F	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.3.	H	F	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.4.	H	F	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.5.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0341]

I.a.6.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.7.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.8.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.9.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.10.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.11.	H	F	H	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.12.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.13.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.14.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.15.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.16.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.17.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.18.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.19.	H	F	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.20.	H	F	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.21.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.22.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.23.	H	F	H	SCH <sub>3</sub>
I.a.24.	H	F	H	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.25.	H	F	H	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.26.	H	F	H	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.27.	H	F	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.28.	H	F	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.29.	H	F	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.30.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.31.	H	F	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.32.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.33.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.34.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.35.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.36.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.37.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.38.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.39.	H	F	CH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.40.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.41.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.42.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.43.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.44.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.45.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.46.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.47.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>

[0342]

I.a.48.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.49.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.50.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.51.	H	F	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.52.	H	F	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.53.	H	F	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.54.	H	F	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.55.	H	F	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.56.	H	F	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.57.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.58.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.59.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.60.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.61.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.62.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.63.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.64.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.65.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.66.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.67.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.68.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.69.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.70.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.71.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.72.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.73.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.74.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.75.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.76.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.77.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.78.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.79.	H	F	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.80.	H	F	OCH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.81.	H	F	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.82.	H	F	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.83.	H	F	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.84.	H	F	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.85.	H	Cl	H	OH
I.a.86.	H	Cl	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.87.	H	Cl	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.88.	H	Cl	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.89.	H	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0343]

I.a.90.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.91.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
I.a.92.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
I.a.93.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$
I.a.94.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{CHF}_2$
I.a.95.	H	Cl	H	$\text{OC}_6\text{H}_5$
I.a.96.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2(\text{C}_6\text{H}_5)$
I.a.97.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{OCH}_3$
I.a.98.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.99.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
I.a.100.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.101.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.102.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.103.	H	Cl	H	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.104.	H	Cl	H	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.105.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2$ -环丙基
I.a.106.	H	Cl	H	$\text{OCH}_2$ -环丁基
I.a.107.	H	Cl	H	$\text{SCH}_3$
I.a.108.	H	Cl	H	$\text{SC}_2\text{H}_5$
I.a.109.	H	Cl	H	$\text{NHSO}_2\text{CH}_3$
I.a.110.	H	Cl	H	$\text{NHSO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.111.	H	Cl	H	$\text{NHSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
I.a.112.	H	Cl	H	$\text{NHSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$
I.a.113.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OH}$
I.a.114.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_3$
I.a.115.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OC}_2\text{H}_5$
I.a.116.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.117.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
I.a.118.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.119.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
I.a.120.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
I.a.121.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$
I.a.122.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CHF}_2$
I.a.123.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OC}_6\text{H}_5$
I.a.124.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{C}_6\text{H}_5)$
I.a.125.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{OCH}_3$
I.a.126.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.127.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
I.a.128.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.129.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.130.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.131.	H	Cl	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_3$

[0344]

I.a.132.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.133.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.134.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.135.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.136.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.137.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.138.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.139.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.140.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.141.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.142.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.143.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.144.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.145.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.146.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.147.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.148.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.149.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.150.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.151.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.152.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.153.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.154.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.155.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.156.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.157.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.158.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.159.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.169.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.161.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.162.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.163.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.164.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.165.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.166.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.167.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.168.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.169.	H	CN	H	OH
I.a.170.	H	CN	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.171.	H	CN	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.172.	H	CN	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.173.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0345]

I.a.174.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.175.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.176.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.177.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.178.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.179.	H	CN	H	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.180.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.181.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.182.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.183.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.184.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.185.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.186.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.187.	H	CN	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.188.	H	CN	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.189.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.190.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.191.	H	CN	H	SCH <sub>3</sub>
I.a.192.	H	CN	H	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.193.	H	CN	H	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.194.	H	CN	H	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.195.	H	CN	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.196.	H	CN	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.197.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.198.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.199.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.200.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.201.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.202.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.203.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.204.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.205.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.206.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.207.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.208.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.209.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.210.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.211.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.212.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.213.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.214.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.215.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>

[0346]

I.a.216.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.217.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.218.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.219.	H	CN	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.220.	H	CN	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.221.	H	CN	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.222.	H	CN	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.223.	H	CN	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.224.	H	CN	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.225.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.226.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.227.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.228.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.229.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.230.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.231.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.232.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.233.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.234.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.235.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.236.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.237.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.238.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.239.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.240.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.241.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.242.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.243.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.244.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.245.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.246.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.247.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.248.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.249.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.250.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.251.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.252.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.253.	F	F	H	OH
I.a.254.	F	F	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.255.	F	F	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.256.	F	F	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.257.	F	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0347]

I.a.258.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.259.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
I.a.260.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
I.a.261.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$
I.a.262.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{CHF}_2$
I.a.263.	F	F	H	$\text{OC}_6\text{H}_5$
I.a.264.	F	F	H	$\text{OCH}_2(\text{C}_6\text{H}_5)$
I.a.265.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{OCH}_3$
I.a.266.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.267.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
I.a.268.	F	F	H	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.269.	F	F	H	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.270.	F	F	H	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.271.	F	F	H	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.272.	F	F	H	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.273.	F	F	H	$\text{OCH}_2$ -环丙基
I.a.274.	F	F	H	$\text{OCH}_2$ -环丁基
I.a.275.	F	F	H	$\text{SCH}_3$
I.a.276.	F	F	H	$\text{SC}_2\text{H}_5$
I.a.277.	F	F	H	$\text{NHSO}_2\text{CH}_3$
I.a.278.	F	F	H	$\text{NHSO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.279.	F	F	H	$\text{NHSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
I.a.280.	F	F	H	$\text{NHSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$
I.a.281.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OH}$
I.a.282.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_3$
I.a.283.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OC}_2\text{H}_5$
I.a.284.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.285.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
I.a.286.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.287.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
I.a.288.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
I.a.289.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$
I.a.290.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CHF}_2$
I.a.291.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OC}_6\text{H}_5$
I.a.292.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{C}_6\text{H}_5)$
I.a.293.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{OCH}_3$
I.a.294.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.295.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
I.a.296.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.297.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.298.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.299.	F	F	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_3$

[0348]

I.a.300.	F	F	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.301.	F	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.302.	F	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.303.	F	F	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.304.	F	F	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.305.	F	F	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.306.	F	F	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.307.	F	F	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.308.	F	F	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.309.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.310.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.311.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.312.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.313.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.314.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.315.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.316.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.317.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.318.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.319.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.320.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.321.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.322.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.323.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.324.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.325.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.326.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.327.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.328.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.329.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.330.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.331.	F	F	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.332.	F	F	OCH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.333.	F	F	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.334.	F	F	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.335.	F	F	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.336.	F	F	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.337.	F	Cl	H	OH
I.a.338.	F	Cl	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.339.	F	Cl	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.340.	F	Cl	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.341.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0349]

I.a.342.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.343.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.344.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.345.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.346.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.347.	F	Cl	H	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.348.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.349.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.350.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.351.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.352.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.353.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.354.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.355.	F	Cl	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.356.	F	Cl	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.357.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.358.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.359.	F	Cl	H	SCH <sub>3</sub>
I.a.360.	F	Cl	H	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.361.	F	Cl	H	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.362.	F	Cl	H	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.363.	F	Cl	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.364.	F	Cl	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.365.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.366.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.367.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.368.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.369.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.370.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.371.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.372.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.373.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.374.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.375.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.376.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.377.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.378.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.379.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.380.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.381.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.382.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.383.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>

[0350]

I.a.384.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.385.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.386.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.387.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.388.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.389.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.390.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.391.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.392.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.393.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.394.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.395.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.396.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.397.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.398.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.399.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.400.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.401.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.402.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.403.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.404.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.405.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.406.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.407.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.408.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.409.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.410.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.411.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.412.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.413.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.414.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.415.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.416.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.417.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.418.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.419.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.420.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.421.	F	CN	H	OH
I.a.422.	F	CN	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.423.	F	CN	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.424.	F	CN	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.425.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0351]

I.a.426.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.426.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.427.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.428.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.430.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.431.	F	CN	H	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.432.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.433.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.434.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.435.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.436.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.437.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.438.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.439.	F	CN	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.440.	F	CN	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.441.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.442.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.443.	F	CN	H	SCH <sub>3</sub>
I.a.444.	F	CN	H	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.445.	F	CN	H	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.446.	F	CN	H	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.447.	F	CN	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.448.	F	CN	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.449.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.450.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.451.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.452.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.453.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.454.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.455.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.456.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.457.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.458.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.459.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.460.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.461.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.462.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.463.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.464.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.465.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.466.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.467.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>

[0352]

I.a.468.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.469.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.470.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.471.	F	CN	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.472.	F	CN	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.473.	F	CN	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.474.	F	CN	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.475.	F	CN	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.476.	F	CN	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.477.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.478.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.479.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.480.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.481.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.482.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.483.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.484.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.485.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.486.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.487.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.488.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.489.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.490.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.491.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.492.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.493.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.494.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.495.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.496.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.497.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.498.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.499.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.500.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.501.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.502.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.503.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.504.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.505.	H	Br	H	OH
I.a.506.	H	Br	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.507.	H	Br	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.508.	H	Br	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.509.	H	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0353]

I.a.510.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.511.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
I.a.512.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
I.a.513.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$
I.a.514.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{CHF}_2$
I.a.515.	H	Br	H	$\text{OC}_6\text{H}_5$
I.a.516.	H	Br	H	$\text{OCH}_2(\text{C}_6\text{H}_5)$
I.a.517.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{OCH}_3$
I.a.518.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.519.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
I.a.520.	H	Br	H	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.521.	H	Br	H	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.522.	H	Br	H	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.523.	H	Br	H	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.524.	H	Br	H	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.525.	H	Br	H	$\text{OCH}_2$ -环丙基
I.a.526.	H	Br	H	$\text{OCH}_2$ -环丁基
I.a.527.	H	Br	H	$\text{SCH}_3$
I.a.528.	H	Br	H	$\text{SC}_2\text{H}_5$
I.a.529.	H	Br	H	$\text{NHSO}_2\text{CH}_3$
I.a.530.	H	Br	H	$\text{NHSO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.531.	H	Br	H	$\text{NHSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
I.a.532.	H	Br	H	$\text{NHSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$
I.a.533.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OH}$
I.a.534.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_3$
I.a.535.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OC}_2\text{H}_5$
I.a.536.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.537.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
I.a.538.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I.a.539.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
I.a.540.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
I.a.541.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$
I.a.542.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CHF}_2$
I.a.543.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OC}_6\text{H}_5$
I.a.544.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{C}_6\text{H}_5)$
I.a.545.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{OCH}_3$
I.a.546.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.547.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
I.a.548.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.549.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_3$
I.a.550.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}_2(\text{CO})\text{OCH}_2\text{CH}_3$
I.a.551.	H	Br	$\text{CH}_3$	$\text{OCH}(\text{CH}_3)(\text{CO})\text{OCH}_3$

[0354]

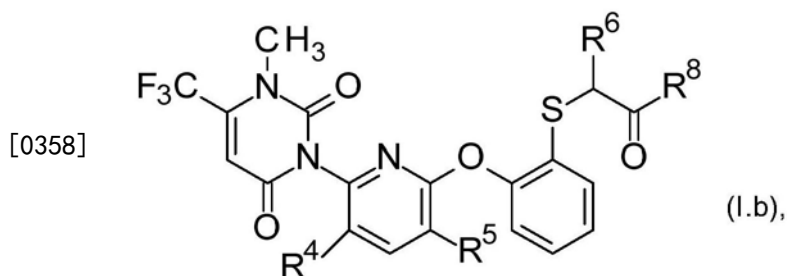
I.a.552.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.553.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.554.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.555.	H	Br	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.556.	H	Br	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.557.	H	Br	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.558.	H	Br	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.559.	H	Br	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.560.	H	Br	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.561.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.562.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.563.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.564.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.565.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.566.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.567.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.568.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.569.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.570.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.571.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.572.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.573.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.574.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.575.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.576.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.577.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.578.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.579.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.580.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.581.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.582.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.583.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.584.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.585.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.586.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.587.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.588.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.589.	F	Br	H	OH
I.a.590.	F	Br	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.591.	F	Br	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.592.	F	Br	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.593.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0355]

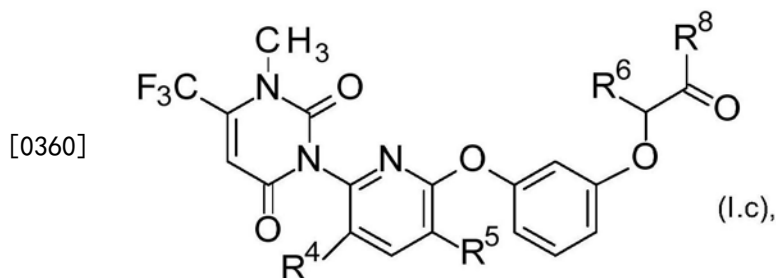
I.a.594.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.595.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.596.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.597.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.598.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.599.	F	Br	H	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.600.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.601.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.602.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.603.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.604.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.605.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.606.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.607.	F	Br	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.608.	F	Br	H	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.609.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.610.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.611.	F	Br	H	SCH <sub>3</sub>
I.a.612.	F	Br	H	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.613.	F	Br	H	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.614.	F	Br	H	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.615.	F	Br	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.616.	F	Br	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.617.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.618.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.619.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.620.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.621.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.622.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.623.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.624.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.625.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
I.a.626.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.627.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.628.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.629.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.630.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.631.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.632.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.633.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.634.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.635.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>

I.a.636.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.637.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.638.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.639.	F	Br	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.640.	F	Br	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.641.	F	Br	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.642.	F	Br	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.643.	F	Br	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.644.	F	Br	CH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
I.a.645.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.646.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.647.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.648.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.649.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.650.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.651.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
I.a.652.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C≡CH
I.a.653.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
[0356] I.a.654.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
I.a.655.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
I.a.656.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
I.a.657.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.658.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.659.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.660.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.661.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.662.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.663.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>3</sub>
I.a.664.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> )(CO)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.665.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丙基
I.a.666.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> -环丁基
I.a.667.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
I.a.668.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.669.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.670.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.671.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.672.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]

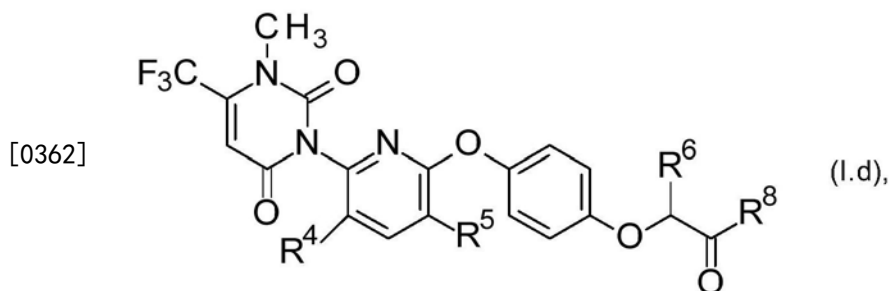
[0357] 还优选式(I.b)的尿嘧啶吡啶类,优选式(I.b.1)-(I.b.672)的尿嘧啶吡啶类,特别优选式(I.b.1)-(I.b.504)的尿嘧啶吡啶类,其与式(I.a.1)-(I.a.672)的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于Q为S:



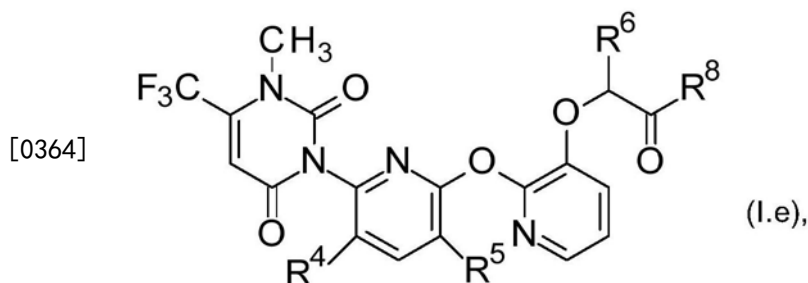
[0359] 还优选式 (I.c) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.c.1) - (I.c.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.c.1) - (I.c.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-2, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H:



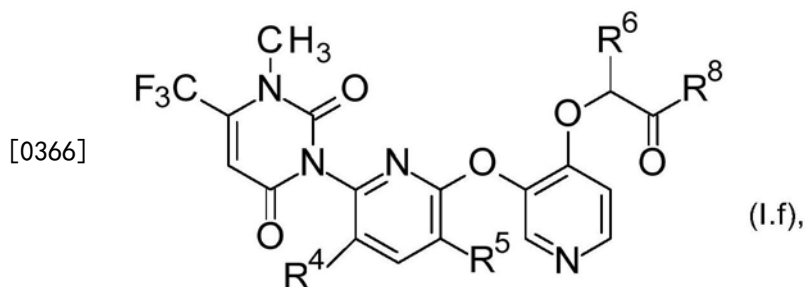
[0361] 还优选式 (I.d) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.d.1) - (I.d.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.d.1) - (I.d.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-3, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H:



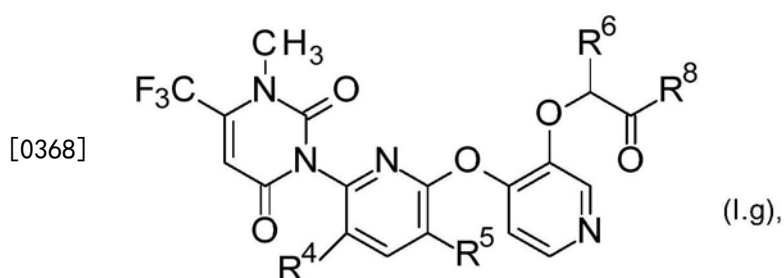
[0363] 还优选式 (I.e) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.e.1) - (I.e.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.e.1) - (I.e.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-4, 其中 R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>d</sup> 为 H:



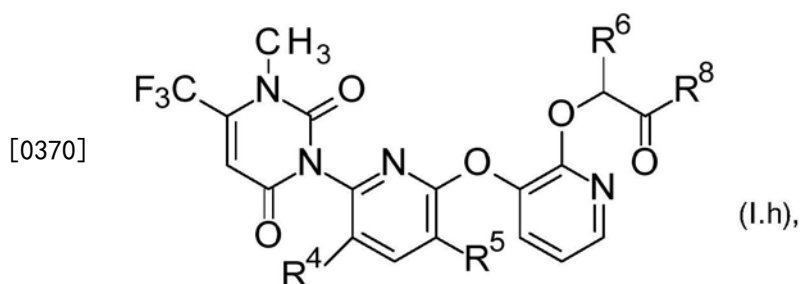
[0365] 还优选式 (I.f) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.f.1) - (I.f.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.f.1) - (I.f.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-5, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>d</sup> 为 H:



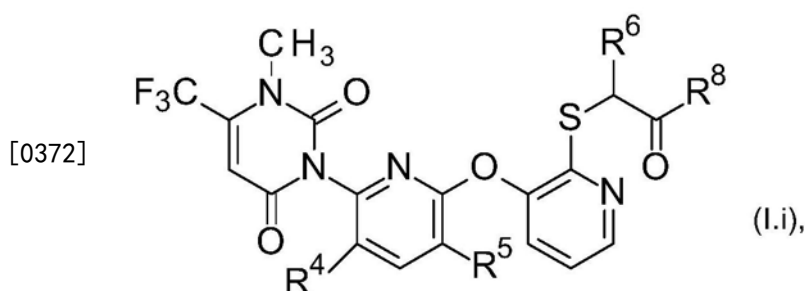
[0367] 还优选式 (I.g) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.g.1) - (I.g.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.g.1) - (I.g.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-6, 其中  $R^a$ 、 $R^b$  和  $R^d$  为 H:



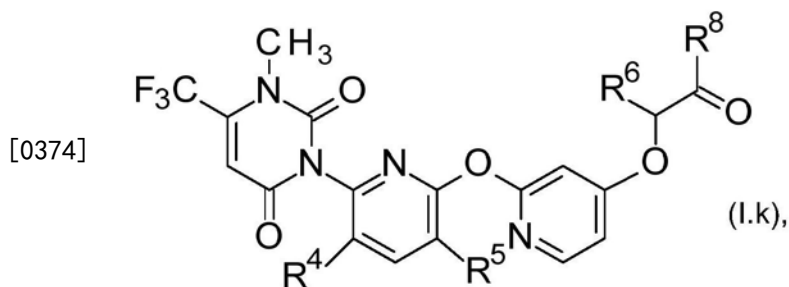
[0369] 还优选式 (I.h) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.h.1) - (I.h.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.h.1) - (I.h.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-7, 其中  $R^a$ 、 $R^b$  和  $R^c$  为 H:



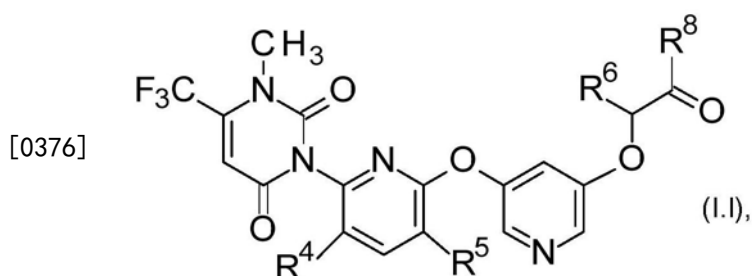
[0371] 还优选式 (I.i) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.i.1) - (I.i.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.i.1) - (I.i.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-7, 其中  $R^a$ 、 $R^b$  和  $R^c$  为 H 且 Q 为 S:



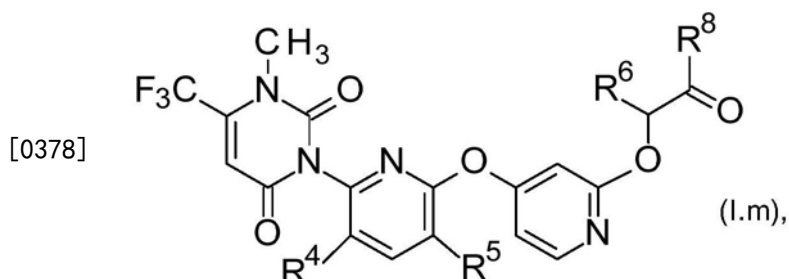
[0373] 还优选式 (I.k) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.k.1) - (I.k.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.k.1) - (I.k.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-8, 其中  $R^b$ 、 $R^c$  和  $R^e$  为 H:



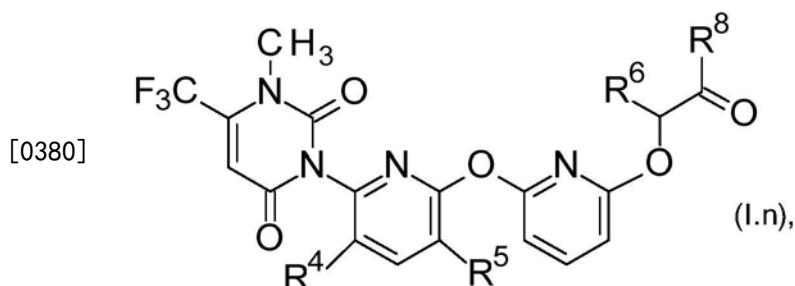
[0375] 还优选式 (I.1) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.1.1) - (I.1.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.1.1) - (I.1.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-9, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>c</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H:



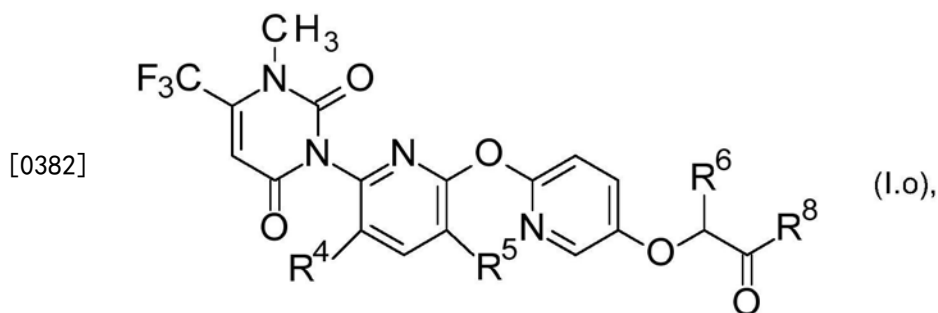
[0377] 还优选式 (I.m) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.m.1) - (I.m.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.m.1) - (I.m.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-10, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H:



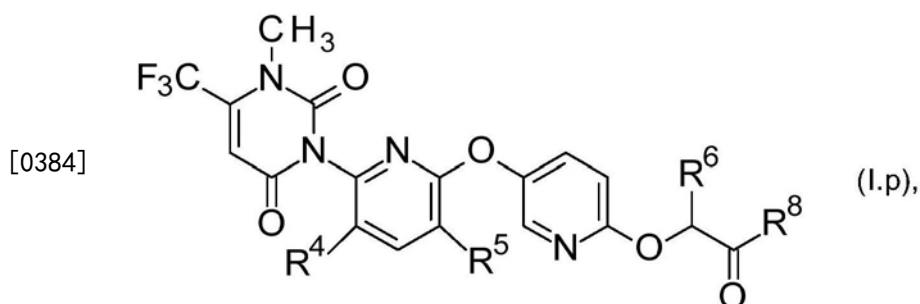
[0379] 还优选式 (I.n) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.n.1) - (I.n.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.n.1) - (I.n.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-11, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>c</sup> 为 H:



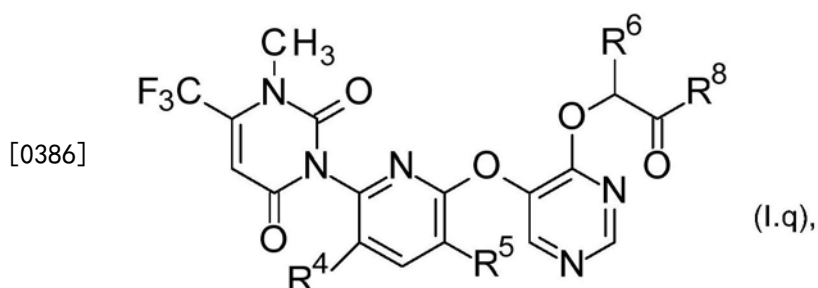
[0381] 还优选式 (I.o) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.o.1) - (I.o.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.o.1) - (I.o.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-12, 其中 R<sup>b</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H:



[0383] 还优选式 (I.p) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.p.1) - (I.p.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.p.1) - (I.p.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-13, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>d</sup> 和 R<sup>e</sup> 为 H:



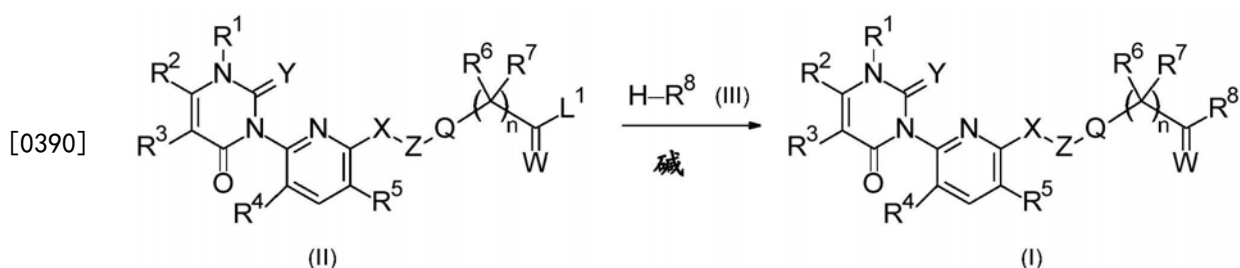
[0385] 还优选式 (I.q) 的尿嘧啶吡啶类, 优选式 (I.q.1) - (I.q.672) 的尿嘧啶吡啶类, 特别优选式 (I.q.1) - (I.q.504) 的尿嘧啶吡啶类, 其与式 (I.a.1) - (I.a.672) 的相应尿嘧啶吡啶类的不同仅在于 Z 为 Z-21, 其中 R<sup>a</sup> 和 R<sup>c</sup> 为 H:



[0387] 本发明式 (I) 的尿嘧啶吡啶类可以通过有机化学的标准方法, 例如通过下列方法 A-H 制备:

[0388] 方法 A)

[0389] 式 (I) 的尿嘧啶吡啶类通过与式 (III) 化合物在碱存在下反应由式 (II) 的酰卤得到:



[0391] 在式 (II) 的酰卤中, L<sup>1</sup> 为卤素; 优选 F、Cl 或 Br; 尤其优选 F 或 Cl, 更优选 Cl。

[0392] 代替式 (II) 的酰卤, 还可以使用与活化试剂如羰基二咪唑、N,N'-二环己基碳二亚

胺(DCC)、1-乙基-3-(3-二甲氨基丙基)碳二亚胺(EDC)或氯化N-甲基-2-氯吡啶<sup>1</sup>组合的相应酸(例如式(II)的酰卤,其中L<sup>1</sup>为OH)。反应条件与对式(II)的酰卤所述相同。

[0393] 化合物(III)还可以以其盐的形式,尤其是钠和钾盐使用,此时不必存在碱。

[0394] 酰卤(II)与化合物(III)的反应通常在0℃至反应混合物的沸点,优选0-100℃,特别优选0-40℃下在惰性有机溶剂中在碱存在下进行。

[0395] 该反应原则上可以本体进行。然而,优选使酰卤(II)与化合物(III)在有机溶剂中反应。原则上合适的是能够在反应条件下至少部分和优选完全溶解酰卤(II)和化合物(III)的所有溶剂。

[0396] 合适溶剂的实例是脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷、硝基甲烷和C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>链烷烃的混合物;芳族烃类如苯、氯苯、甲苯、甲酚类、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯;卤代烃类如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氯化碳和氯苯;醚类如乙醚、二异丙醚、叔丁基甲基醚(TBME)、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃(THF);酯类如乙酸乙酯和乙酸丁酯;腈类如乙腈和丙腈;酮类如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮、叔丁基甲基酮、环己酮;偶极非质子溶剂如环丁砜、二甲亚砜、N,N-二甲基甲酰胺(DMF)、N,N-二甲基乙酰胺(DMAC)、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮(DMI)、N,N'-二甲基亚丙基脲(DMPU)、二甲亚砜(DMSO)和1-甲基-2-吡咯烷酮(NMP)。

[0397] 优选的溶剂是如上所述的醚类和偶极非质子溶剂。

[0398] 还可以使用所述溶剂的混合物。

[0399] 合适碱的实例包括含金属碱和含氮碱。

[0400] 合适含金属碱的实例是无机化合物如碱金属和碱土金属氧化物,以及其他金属氧化物,如氧化锂、氧化钠、氧化钾、氧化镁、氧化钙和氧化镁、氧化铁、氧化银;碱金属和碱土金属氢化物如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙;碱金属和碱土金属碳酸盐如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾、碳酸镁和碳酸钙;碱金属碳酸氢盐如碳酸氢锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾;碱金属和碱土金属磷酸盐如磷酸钾、磷酸钙;此外还有有机碱,如叔胺如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺、三丁胺和N-甲基哌啶,吡啶,取代吡啶如可力丁、卢剔啶、N-甲基吗啉和4-二甲氨基吡啶以及还有双环胺。

[0401] 合适含氮碱的实例是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺,优选三烷基胺,例如三乙胺、三甲胺、N-乙基二异丙基胺;吡啶、卢剔啶、可力丁、4-二甲氨基吡啶(DMAP)、咪唑、1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)或1,5-二氮杂双环[4.3.0]壬-5-烯(DBN)。

[0402] 优选的碱是如上所定义的碱金属和碱土金属碳酸盐以及含氮碱;尤其优选三乙胺、吡啶或碳酸钠。

[0403] 本文所用术语碱还包括两种或更多种,优选两种上述化合物的混合物。特别优选使用一种碱。

[0404] 碱通常过量使用,更优选基于酰卤(II)以1-3当量使用,并且它们还可以用作溶剂。

[0405] 对于该反应,可以以任何本身的方式使酰卤(II)、化合物(III)和碱接触。

[0406] 因此,可以分开、同时或依次将反应配对和碱引入反应容器中并反应。

[0407] 反应物通常以等摩尔量使用。可能有利的是过量使用反应物之一,例如为的是使另一反应物的反应完全。

[0408] 该反应可以在大气压力、减压或升高的压力下,合适的话在惰性气体下连续或分

批进行。

[0409] 反应的结束可以由熟练技术人员借助常规方法容易地确定。

[0410] 反应混合物以常规方式后处理,例如与水混合,分离各相以及合适的话层析提纯粗产物。

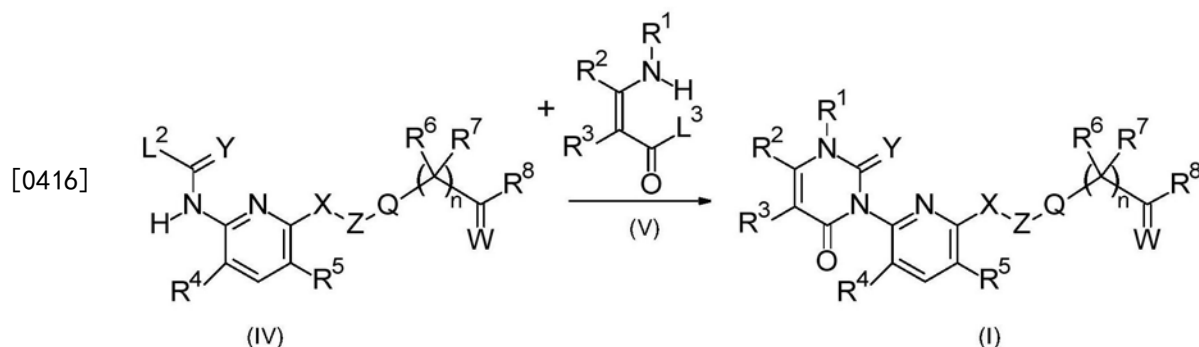
[0411] 一些中间体和终产物以粘稠油形式得到,可以将它们在减压和温和升高的温度下提纯或除去挥发性组分。

[0412] 若中间体和终产物以固体得到,则也可通过重结晶或蒸煮进行提纯。

[0413] 式(III)化合物可市购。

[0414] 方法B)

[0415] 作为替换,式(I)的尿嘧啶吡啶类可以通过使式(IV)的(硫代)氨基甲酸酯与式(V)的烯胺反应而制备:



[0417] 在式(IV)的(硫代)氨基甲酸酯中 $L^2$ 为可亲核置换的离去基团,优选 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基或芳氧基,其中芳基结构部分本身可以部分或完全被卤代和/或可以被1-3个选自氰基、硝基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基和 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基的取代基取代;特别优选 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基或苯氧基,其中苯基结构部分本身可以部分或完全被卤代和/或可以被1-3个选自氰基、硝基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基和 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基的基团取代;更优选 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基或苯氧基;最优选 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基。

[0418] 在式(V)的烯胺中, $L^3$ 为可亲核置换的离去基团,优选 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_2$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_2$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯氧基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代链烯氧基、 $C_3$ - $C_6$ 炔氧基、 $C_3$ - $C_6$ 卤代炔氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷氧基或苯氧基,其中苯基环本身可以部分或完全被卤代和/或可以被1-3个选自氰基、硝基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基和 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基的取代基取代;特别优选 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_2$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯氧基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代链烯氧基、 $C_3$ - $C_6$ 炔氧基或 $C_3$ - $C_6$ 卤代炔氧基;尤其优选 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_2$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯氧基或 $C_3$ - $C_6$ 炔氧基;更优选 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基。

[0419] 在该反应的优选实施方案中, $R^1$ 为氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_3$ - $C_6$ 炔基;优选氢或 $C_1$ - $C_6$ 烷基,最优选氢。

[0420] 式(IV)的(硫代)氨基甲酸酯与式(V)的烯胺的反应通常在高于室温的温度,例如25-200 $^{\circ}C$ ,优选90-190 $^{\circ}C$ ,更优选100-140 $^{\circ}C$ 下在惰性有机溶剂中在碱存在下进行(例如W0 99/31091;W0 11/057935)。

[0421] 合适的溶剂是脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷和 $C_5$ - $C_{12}$ 链烷烃的混合物,芳族烃类如甲苯、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯,卤代烃类如二氯甲烷、氯仿和氯苯,醚类如乙醚、

二异丙醚、叔丁基甲基醚、二噁烷、二甘醇二甲基醚、茴香醚和四氢呋喃，腈类如乙腈和丙腈，醇类如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇，羧酸酯类如乙酸丁酯，还有二甲亚砜、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和N-甲基吡咯烷酮。

[0422] 优选的溶剂是二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和N-甲基吡咯烷酮。

[0423] 还可以使用所述溶剂的混合物。

[0424] 有用的碱通常是无机化合物，如碱金属和碱土金属氢氧化物如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾和氢氧化钙，碱金属和碱土金属氧化物如氧化锂、氧化钠、氧化钙和氧化镁，碱金属和碱土金属氢化物如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙，碱金属氮化物如氨基锂、氨基钠和氨基钾，碱金属和碱土金属碳酸盐如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾、碳酸钙和碳酸铯，还有碱金属碳酸氢盐如碳酸氢钠，有机金属化合物，尤其是碱金属烷基化物如甲基锂、丁基锂和苯基锂，碱金属和碱土金属醇盐如甲醇锂、甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾、叔戊醇钾和二甲基氧基镁，以及还有有机碱，例如叔胺如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺和N-甲基哌啶，吡啶，取代吡啶如可力丁、卢剔啶和4-二甲氨基吡啶以及还有双环胺。

[0425] 特别优选碱金属和碱土金属氢氧化物，碱金属和碱土金属碳酸盐以及还有碱金属和碱土金属醇盐。

[0426] 碱通常基于式 (IV) 的(硫代)氨基甲酸酯过量使用，并且它们还可以用作溶剂。可能有利的是在一定时间内错开地加入该碱。

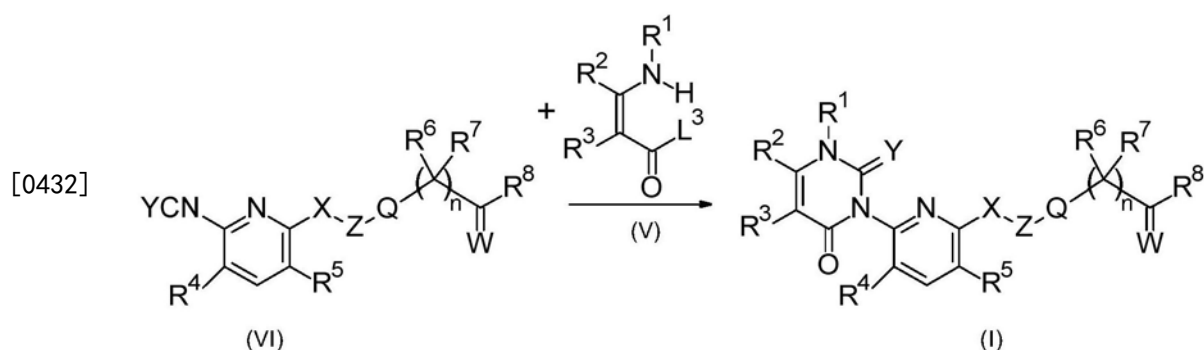
[0427] 反应混合物以常规方式后处理，例如与水混合，分离各相以及合适的话层析提纯粗产物。

[0428] 以粘稠油形式得到的化合物可以在减压和温和升高的温度下提纯或除去挥发性组分。

[0429] 若终产物以固体得到，则也可以通过重结晶或蒸煮进行提纯。

[0430] 方法C)

[0431] 作为替换，式 (I) 的尿嘧啶吡啶类也可以通过使式 (VI) 的异(硫)氰酸酯与式 (V) 的烯胺反应而制备：



[0433] 在式 (V) 的烯胺中，L<sup>3</sup>如上所定义(方法B)。

[0434] 式 (VI) 的异(硫)氰酸酯与式 (V) 的烯胺的反应通常在 -20°C 至 80°C 下在惰性有机溶剂中在碱存在下进行(例如 WO 05/054208)。

[0435] 合适的溶剂是脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷和 C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub> 链烷烃的混合物，芳族烃类如甲苯、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯，卤代烃类如二氯甲烷、氯仿和氯苯，醚类如乙醚、二异丙醚、叔丁基甲基醚、二噁烷、二甘醇二甲基醚、茴香醚和四氢呋喃，腈类如乙腈和丙

腈,醇类如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇,羧酸酯类如乙酸丁酯,还有二甲亚砜、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和N-甲基吡咯烷酮。

[0436] 优选的溶剂是二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和N-甲基吡咯烷酮。

[0437] 还可以使用所述溶剂的混合物。

[0438] 有用的碱通常是无机化合物,如碱金属和碱土金属氢氧化物如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾和氢氧化钙,碱金属和碱土金属氧化物如氧化锂、氧化钠、氧化钙和氧化镁,碱金属和碱土金属氢化物如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙,碱金属氮化物如氨基锂、氨基钠和氨基钾,碱金属和碱土金属碳酸盐如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾、碳酸钙和碳酸铯,还有碱金属碳酸氢盐如碳酸氢钠,有机金属化合物,尤其是碱金属烷基化物如甲基锂、丁基锂和苯基锂,碱金属和碱土金属醇盐如甲醇锂、甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾、叔戊醇钾和二甲氧基镁,以及还有有机碱,例如叔胺如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺和N-甲基哌啶,吡啶,取代吡啶如可力丁、卢剔啶和4-二甲氨基吡啶以及还有双环胺。

[0439] 特别优选碱金属和碱土金属氢氧化物、碱金属和碱土金属碳酸盐以及还有碱金属和碱土金属醇盐。

[0440] 碱通常基于式(VI)的异(硫)氰酸酯过量使用,并且它们还可以用作溶剂。

[0441] 可能有利的是在一定时间内错开地加入该碱。

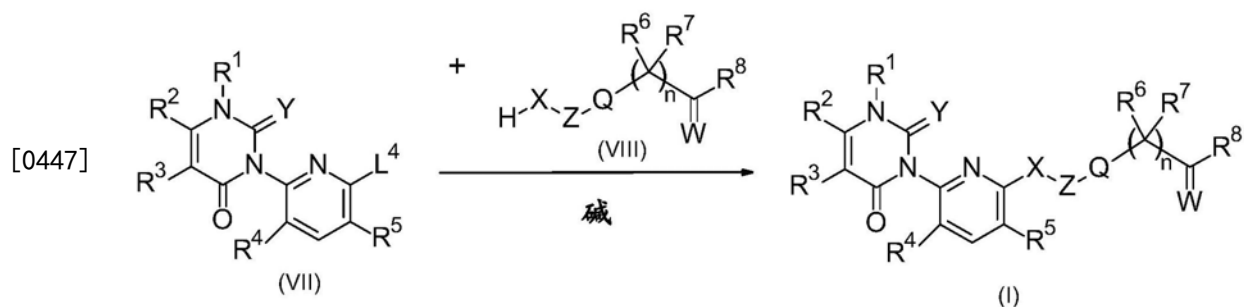
[0442] 反应混合物以常规方式后处理,例如与水混合,分离各相以及合适的话层析提纯粗产物。

[0443] 以粘稠油形式得到的化合物可以在减压和温和升高的温度下提纯或除去挥发性组分。

[0444] 若终产物以固体得到,则也可以通过重结晶或蒸煮进行提纯。

[0445] 方法D)

[0446] 作为替换,式(I)的尿嘧啶吡啶类还可以通过使式(VII)化合物与式(VIII)化合物在碱存在下反应而制备:



[0448] 在式(VII)化合物中, $L^4$ 为离去基团如卤素、 $C_1-C_6$ 烷基磺酸酯或芳基磺酸酯;优选F、Cl、 $C_1-C_6$ 烷基磺酸酯或芳基磺酸酯;尤其优选F、Cl、甲磺酸酯或甲苯磺酸酯;更优选F或Cl。

[0449] 该反应原则上可以本体进行。然而,优选使式(VII)化合物与式(VIII)化合物在有机溶剂中反应。

[0450] 原则上合适的是能够在反应条件下至少部分和优选完全溶解式(VII)化合物和式(VIII)化合物的所有溶剂。

[0451] 合适溶剂的实例是脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷、硝基甲烷和 $C_5-C_8$ 链烷烃的混合

物,芳族烃类如苯、氯苯、甲苯、甲酚类、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯,卤代烃类如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氯化碳和氯苯,醚类如乙醚、二异丙醚、叔丁基甲基醚(TBME)、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃(THF),酯类如乙酸乙酯和乙酸丁酯;腈类如乙腈和丙腈,酮类如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮、叔丁基甲基酮、环己酮;以及偶极非质子溶剂如环丁砜、二甲亚砜、N,N-二甲基甲酰胺(DMF)、N,N-二甲基乙酰胺(DMAC)、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮(DMI)、N,N'-二甲基亚丙基脲(DMPU)、二甲亚砜(DMSO)和1-甲基-2-吡咯烷酮(NMP)。

[0452] 优选的溶剂是如上所述的醚类、腈类、酮类和偶极非质子溶剂。

[0453] 更优选的溶剂是如上所述的醚类和偶极非质子溶剂。

[0454] 还可以使用所述溶剂的混合物。

[0455] 合适碱的实例包括含金属碱和含氮碱。

[0456] 合适含金属碱的实例是无机化合物,如碱金属和碱土金属氢氧化物以及其他金属氢氧化物,如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化镁、氢氧化钙和氢氧化铝;碱金属和碱土金属氧化物以及其他金属氧化物,如氧化锂、氧化钠、氧化钾、氧化镁、氧化钙和氧化镁、氧化铁、氧化银;碱金属和碱土金属氢化物如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙,碱金属氮化物如氨基锂、氨基钠和氨基钾,碱金属和碱土金属碳酸盐如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾、碳酸镁和碳酸钙,以及碱金属碳酸氢盐如碳酸氢锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾;碱金属和碱土金属磷酸盐如磷酸钾、磷酸钙;金属有机化合物,优选碱金属烷基化物如甲基锂、丁基锂和苯基锂,烷基卤化镁如甲基氯化镁以及碱金属和碱土金属醇盐如甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾、叔戊醇钾和二甲氧基镁;此外还有有机碱,如叔胺如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺和N-甲基哌啶,吡啶,取代吡啶如可力丁、卢剔啶、N-甲基吗啉和4-二甲氨基吡啶以及还有双环胺。

[0457] 合适含氮碱的实例是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺,优选三烷基胺,例如三乙胺、三甲胺、N-乙基二异丙基胺;氨、吡啶、卢剔啶、可力丁、4-二甲氨基吡啶(DMAP)、咪唑、1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)或1,5-二氮杂双环[4.3.0]壬-5-烯(DBN)。

[0458] 优选的碱是碱金属和碱土金属氢化物、碱金属和碱土金属碳酸盐以及碱金属碳酸氢盐;碱金属和碱土金属磷酸盐;金属有机化合物、烷基卤化镁以及碱金属和碱土金属醇盐;此外还有有机碱,如叔胺、吡啶、取代吡啶以及还有双环胺。

[0459] 尤其优选的碱是碱金属和碱土金属碳酸盐,金属有机化合物、烷基卤化镁以及碱金属和碱土金属醇盐;此外还有有机碱,如叔胺、吡啶、取代吡啶以及还有双环胺。

[0460] 本文所用术语碱还包括两种或更多种,优选两种上述化合物的混合物。特别优选使用一种碱。

[0461] 碱通常以等摩尔量或者过量使用;然而,它们还可以用作溶剂或者合适的话以催化量使用。

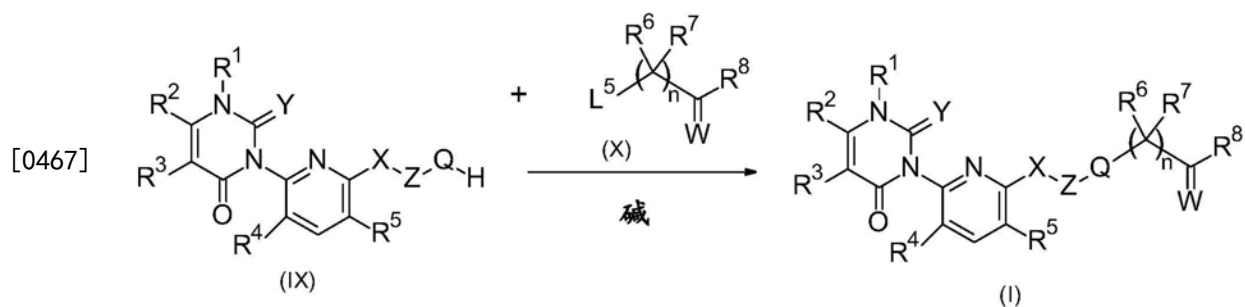
[0462] 碱通常过量使用,更优选基于式(VIII)化合物以1-20摩尔当量使用,并且它们还可以用作溶剂。

[0463] 优选碱基于式(VIII)化合物以1-5摩尔当量,非常优选1-3摩尔当量,更优选1-2摩尔当量使用。

[0464] 可能有利的是在一定时间内错开地加入该碱。

[0465] 方法E)

[0466] 作为替换,式(I)的尿嘧啶吡啶类还可以通过使式(IX)化合物与式(X)的烷基化剂在碱存在下类似于已知方法(例如WO 11/137088)反应而制备:



[0468] 在式(X)的烷基化剂中, $L^5$ 为离去基团如卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酸酯或芳基磺酸酯;优选Cl、Br、I、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酸酯或芳基磺酸酯;尤其优选Cl、Br或I;更优选Cl或Br。

[0469] 该反应原则上可以本体进行。然而,优选使式(IX)化合物与式(X)的烷基化剂在有机溶剂中反应。

[0470] 合适的原则上是能够在反应条件下至少部分和优选完全溶解式(IX)化合物和式(X)的烷基化剂的所有溶剂。

[0471] 合适溶剂的实例是脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷、硝基甲烷和 $C_5$ - $C_8$ 链烷烃的混合物,芳族烃类如苯、氯苯、甲苯、甲酚类、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯,卤代烃类如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氯化碳和氯苯,醚类如乙醚、二异丙醚、叔丁基甲基醚(TBME)、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃(THF),酯类如乙酸乙酯和乙酸丁酯;腈类如乙腈和丙腈,酮类如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮、叔丁基甲基酮、环己酮;以及偶极非质子溶剂如环丁砜、二甲亚砜、N,N-二甲基甲酰胺(DMF)、N,N-二甲基乙酰胺(DMAC)、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮(DMI)、N,N'-二甲基亚丙基脒(DMPU)、二甲亚砜(DMSO)和1-甲基-2-吡咯烷酮(NMP)。

[0472] 优选的溶剂是如上所述的醚类、腈类、酮类和偶极非质子溶剂。

[0473] 更优选的溶剂是如上所述的醚类和偶极非质子溶剂。

[0474] 还可以使用所述溶剂的混合物。

[0475] 合适碱的实例包括含金属碱和含氮碱。

[0476] 合适含金属碱的实例是无机化合物如碱金属和碱土金属氢氧化物,以及其他金属氢氧化物,如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化镁、氢氧化钙和氢氧化铝;碱金属和碱土金属氧化物,以及其他金属氧化物,如氧化锂、氧化钠、氧化钾、氧化镁、氧化钙和氧化镁、氧化铁、氧化银;碱金属和碱土金属氢化物如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙,碱金属氮化物,如氨基锂、氨基钠和氨基钾,碱金属和碱土金属碳酸盐如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾、碳酸镁和碳酸钙,以及碱金属碳酸氢盐如碳酸氢锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾;碱金属和碱土金属磷酸盐如磷酸钾、磷酸钙;金属有机化合物,优选碱金属烷基化物如甲基锂、丁基锂和苯基锂,烷基卤化镁如甲基氯化镁以及碱金属和碱土金属醇盐如甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾、叔戊醇钾和二甲氧基镁;此外还有有机碱,如叔胺如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺和N-甲基哌啶,吡啶,取代吡啶如可力丁、卢剔啶、N-甲基吗啉和4-二甲氨基吡啶以及还有双环胺。

[0477] 合适含氮碱的实例是 $C_1$ - $C_6$ 烷基胺,优选三烷基胺,例如三乙胺、三甲胺、N-乙基二异丙基胺;氨、吡啶、卢剔啶、可力丁、4-二甲氨基吡啶(DMAP)、咪唑、1,8-二氮杂双环

[5.4.0]十一碳-7-烯 (DBU) 或1,5-二氮杂双环[4.3.0]壬-5-烯 (DBN)。

[0478] 优选的碱是碱金属和碱土金属氢化物、碱金属和碱土金属碳酸盐以及碱金属碳酸氢盐;碱金属和碱土金属磷酸盐;金属有机化合物、烷基卤化镁以及碱金属和碱土金属醇盐;此外还有有机碱,如叔胺、吡啶、取代吡啶以及还有双环胺。

[0479] 尤其优选的碱是碱金属和碱土金属碳酸盐,金属有机化合物、烷基卤化镁以及碱金属和碱土金属醇盐;此外还有有机碱,如叔胺、吡啶、取代吡啶以及还有双环胺。

[0480] 本文所用术语碱还包括两种或更多种,优选两种上述化合物的混合物。特别优选使用一种碱。

[0481] 碱通常以等摩尔量或过量使用,更优选基于式 (IX) 化合物以1-20摩尔当量使用,并且它们还可以用作溶剂。

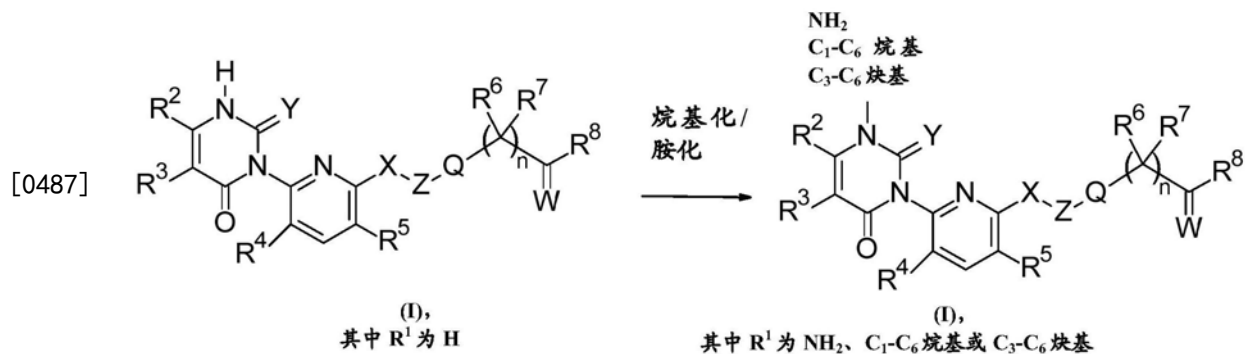
[0482] 碱优选基于式 (IX) 化合物以1-5摩尔当量,非常优选1-3摩尔当量,更优选1-2摩尔当量使用。

[0483] 可能有利的是在一定时间内错开地加入该碱。

[0484] 式 (X) 的烷基化剂可市购或者可以通过已知方法 (例如Lowell, Andrew N. 等, Tetrahedron, 6 (30), 5573-5582, 2010; WO 11/137088) 制备。

[0485] 方法F)

[0486] 作为替换,那些其中 $R^1$ 为 $NH_2$ 、 $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_3$ - $C_6$ 炔基的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类可以通过胺化或烷基化那些其中 $R^1$ 为H的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类制备:



[0488] 该胺化或烷基化可以类似于已知方法 (例如WO 05/054208; WO 06/125746) 进行。

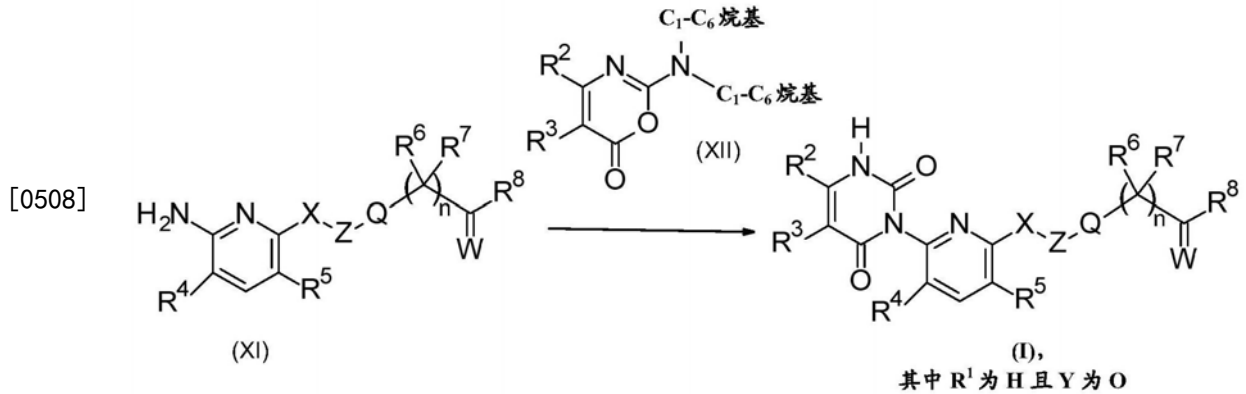
[0489] 该反应原则上可以本体进行。然而,优选使其中 $R^1$ 为H的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类在有机溶剂中反应。

[0490] 原则上合适的是所有能够在反应条件下至少部分和优选完全溶解其中 $R^1$ 为H的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类的溶剂。

[0491] 合适溶剂的实例是脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷、硝基甲烷和 $C_5$ - $C_8$ 链烷烃的混合物,芳族烃类如苯、氯苯、甲苯、甲酚类、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯,卤代烃类如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氯化碳和氯苯,醚类如乙醚、二异丙醚、叔丁基甲基醚 (TBME)、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃 (THF),酯类如乙酸乙酯和乙酸丁酯;腈类如乙腈和丙腈,酮类如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮、叔丁基甲基酮、环己酮;以及偶极非质子溶剂如环丁砜、二甲亚砜、N,N-二甲基甲酰胺 (DMF)、N,N-二甲基乙酰胺 (DMAC)、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮 (DMI)、N,N'-二甲基亚丙基脒 (DMPU)、二甲亚砜 (DMSO) 和1-甲基-2-吡咯烷酮 (NMP)。

[0492] 优选的溶剂是如上所述的醚类、腈类、酮类和偶极非质子溶剂。

- [0493] 更优选的溶剂是如上所述的醚类和偶极非质子溶剂。
- [0494] 还可以使用所述溶剂的混合物。
- [0495] 合适碱的实例包括含金属碱和含氮碱。
- [0496] 合适含金属碱的实例是无机化合物如碱金属和碱土金属氢氧化物,以及其他金属氢氧化物,如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化镁、氢氧化钙和氢氧化铝;碱金属和碱土金属氧化物,以及其他金属氧化物,如氧化锂、氧化钠、氧化钾、氧化镁、氧化钙和氧化镁、氧化铁、氧化银;碱金属和碱土金属氢化物如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙,碱金属氮化物,如氨基锂、氨基钠和氨基钾,碱金属和碱土金属碳酸盐如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾、碳酸镁和碳酸钙,以及碱金属碳酸氢盐如碳酸氢锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾;碱金属和碱土金属磷酸盐如磷酸钾、磷酸钙;金属有机化合物,优选碱金属烷基化物如甲基锂、丁基锂和苯基锂,烷基卤化镁如甲基氯化镁以及碱金属和碱土金属醇盐如甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾、叔戊醇钾和二甲氧基镁;此外还有有机碱,如叔胺如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺和N-甲基哌啶,吡啶,取代吡啶如可力丁、卢剔啶、N-甲基吗啉和4-二甲氨基吡啶以及还有双环胺。
- [0497] 合适含氮碱的实例是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺,优选三烷基胺,例如三乙胺、三甲胺、N-乙基二异丙基胺;氨、吡啶、卢剔啶、可力丁、4-二甲氨基吡啶(DMAP)、咪唑、1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)或1,5-二氮杂双环[4.3.0]壬-5-烯(DBN)。
- [0498] 优选的碱是碱金属和碱土金属氢化物、碱金属和碱土金属碳酸盐以及碱金属碳酸氢盐;碱金属和碱土金属磷酸盐;金属有机化合物、烷基卤化镁以及碱金属和碱土金属醇盐;此外还有有机碱,如叔胺、吡啶、取代吡啶以及还有双环胺。
- [0499] 尤其优选的碱是碱金属和碱土金属碳酸盐,金属有机化合物、烷基卤化镁以及碱金属和碱土金属醇盐;此外还有有机碱,如叔胺、吡啶、取代吡啶以及还有双环胺。
- [0500] 本文所用术语碱还包括两种或更多种,优选两种上述化合物的混合物。特别优选使用一种碱。
- [0501] 碱通常以等摩尔量或过量使用,更优选基于其中R<sup>1</sup>为H的式(I)的尿嘧啶吡啶类以1-20摩尔当量使用,并且它们还可以用作溶剂。
- [0502] 碱优选基于其中R<sup>1</sup>为H的式(I)的尿嘧啶吡啶类以1-5摩尔当量,非常优选1-3摩尔当量,更优选1-2摩尔当量使用。
- [0503] 可能有利的是在一定时间内错开地加入该碱。
- [0504] 作为烷基化试剂可以使用市售C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基卤和炔基卤。
- [0505] 合适的胺化试剂由文献(例如US 6333296或DE 10005284)已知。
- [0506] 方法G)
- [0507] 作为替换,其中R<sup>1</sup>为H且Y为O的式(I)的尿嘧啶吡啶类可以通过使式(XI)的胺与式(XII)的嘧啶酮类在酸存在下反应而制备:



[0509] 该反应原则上可以本体进行。然而，优选使式 (XI) 的胺与式 (XII) 的嘧啶酮类在有机溶剂中反应。

[0510] 合适的原则上是能够在反应条件下至少部分和优选完全溶解式 (XI) 的胺和式 (XII) 嘧啶酮类的所有溶剂。

[0511] 合适溶剂的实例是脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷、硝基甲烷和C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>链烷烃的混合物，芳族烃类如苯、氯苯、甲苯、甲酚类、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯，卤代烃类如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氯化碳和氯苯，醚类如乙醚、二异丙醚、叔丁基甲基醚 (TBME)、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃 (THF)，酯类如乙酸乙酯和乙酸丁酯；腈类如乙腈和丙腈，酮类如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮、叔丁基甲基酮、环己酮；醇类如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇，有机酸如甲酸、乙酸、丙酸、草酸、甲基苯磺酸、苯磺酸、樟脑磺酸、柠檬酸、三氟乙酸以及偶极非质子溶剂如环丁砜、二甲亚砜、N,N-二甲基甲酰胺 (DMF)、N,N-二甲基乙酰胺 (DMAC)、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮 (DMI)、N,N'-二甲基亚丙基脲 (DMPU)、二甲亚砜 (DMSO) 和1-甲基-2-吡咯烷酮 (NMP)。

[0512] 优选的溶剂是如上所述的有机酸。

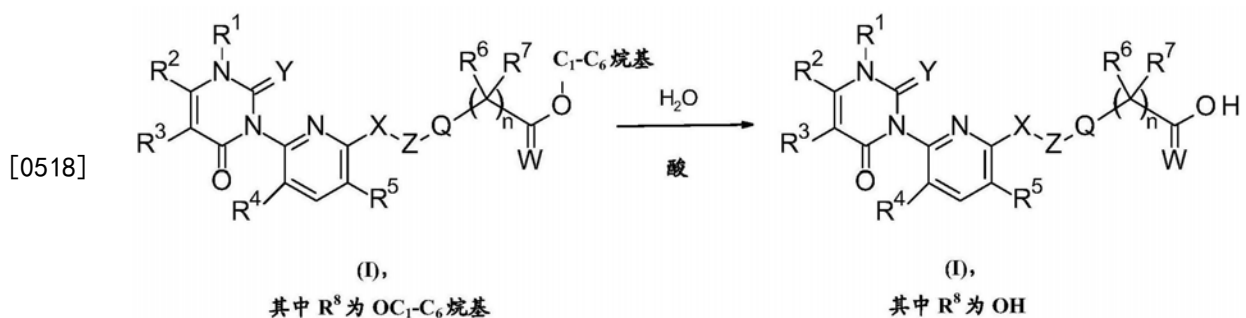
[0513] 还可以使用所述溶剂的混合物。

[0514] 作为酸可以使用无机酸如盐酸、氢溴酸或硫酸，以及有机酸如甲酸、乙酸、丙酸、草酸、甲基苯磺酸、苯磺酸、樟脑磺酸、柠檬酸、三氟乙酸。

[0515] 酸通常以等摩尔量、过量使用或者合适的话可以用作溶剂，然而，它们还可以以催化量使用。

[0516] 方法H)

[0517] 作为替换，其中R<sup>8</sup>为OR<sup>9</sup>且R<sup>9</sup>为H的式 (I) 的尿嘧啶吡啶类可以由其中R<sup>8</sup>为OR<sup>9</sup>且R<sup>9</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基的式 (I) 的相应尿嘧啶吡啶类制备：



[0519] 合适的原则上是能够在反应条件下至少部分和优选完全溶解其中R<sup>8</sup>为OR<sup>9</sup>且R<sup>9</sup>为

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基的式(I)的尿嘧啶吡啶类的所有溶剂。

[0520] 合适溶剂的实例是H<sub>2</sub>O;脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷、硝基甲烷和C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>链烷烃的混合物,芳族烃类如苯、氯苯、甲苯、甲酚类、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯,卤代烃类如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氯化碳和氯苯,醚类如乙醚、二异丙醚、叔丁基甲基醚(TBME)、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃(THF),酯类如乙酸乙酯和乙酸丁酯;腈类如乙腈和丙腈,酮类如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮、叔丁基甲基酮、环己酮;醇类如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇,有机酸如甲酸、乙酸、丙酸、草酸、甲基苯磺酸、苯磺酸、樟脑磺酸、柠檬酸、三氟乙酸以及偶极非质子溶剂如环丁砜、二甲亚砜、N,N-二甲基甲酰胺(DMF)、N,N-二甲基乙酰胺(DMAC)、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮(DMI)、N,N'-二甲基亚丙基脲(DMPU)、二甲亚砜(DMSO)和1-甲基-2-吡咯烷酮(NMP)。

[0521] 优选的溶剂是如上所定义的H<sub>2</sub>O、醚类、腈类、酮类和偶极非质子溶剂。

[0522] 更优选的溶剂是如上所定义的H<sub>2</sub>O和醚类。

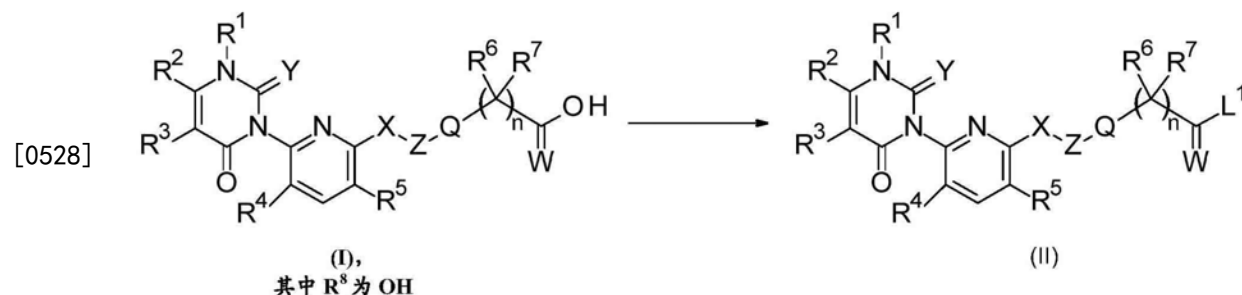
[0523] 还可以使用所述溶剂的混合物。

[0524] 作为酸和酸性催化剂,可以使用无机酸如盐酸、氢溴酸和硫酸,以及有机酸如甲酸、乙酸、丙酸、草酸、甲基苯磺酸、苯磺酸、樟脑磺酸、柠檬酸、三氟乙酸。

[0525] 酸通常以催化量使用,然而它们还可以以等摩尔量、过量使用或者合适的话可以用作溶剂。

[0526] 制备本发明式(I)的尿嘧啶吡啶类所需要且在上面的方法A-H中提到的中间体可以市购或者可以通过有机化学的标准方法,例如通过下列方法制备:

[0527] 式(II)的酰卤(上述方法A所需)可以由其中R<sup>8</sup>为OR<sup>9</sup>且R<sup>9</sup>为H的式(I)的尿嘧啶吡啶类制备:



[0529] 作为替换,可以使用其中R<sup>8</sup>为OR<sup>9</sup>且R<sup>9</sup>为H的式(I)的尿嘧啶吡啶类的相应碱金属盐。

[0530] 合适的卤化剂例如为POCl<sub>3</sub>、POBr<sub>3</sub>、PCl<sub>3</sub>、PBr<sub>3</sub>、PCl<sub>5</sub>、PBr<sub>5</sub>、SOCl<sub>2</sub>、SOBr<sub>2</sub>、草酰氯、光气、双光气、三光气、氰尿酰氯、氰尿酰氟和二乙氨基三氟化硫(DAST)。

[0531] 根据本发明的优选实施方案,将氯化剂用作卤化剂。优选将POCl<sub>3</sub>、SOCl<sub>2</sub>、草酰氯、光气、双光气、三光气用作氯化剂。

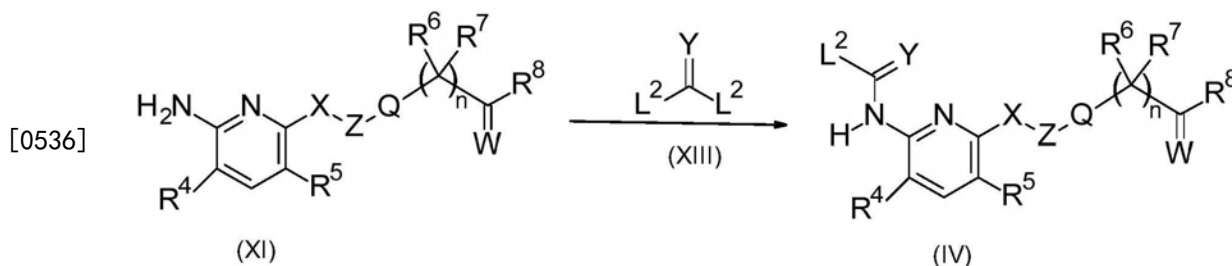
[0532] 例如,酰氯可以通过氯化其中R<sup>8</sup>为OR<sup>9</sup>且R<sup>9</sup>为H的式(I)的尿嘧啶吡啶类而制备。

[0533] 合适的氯化剂例如为亚硫酸氯、草酰氯、三氯化磷、五氯化磷、磷酰氯、光气、双光气或三光气。

[0534] 进行该类氯化反应的更多信息公开于下列参考文献中:A.J.Meyers和M.E.Flanagan,Org.Synth.71,107(1992);H.J.Scheifele Jr.和D.F.DeTar,

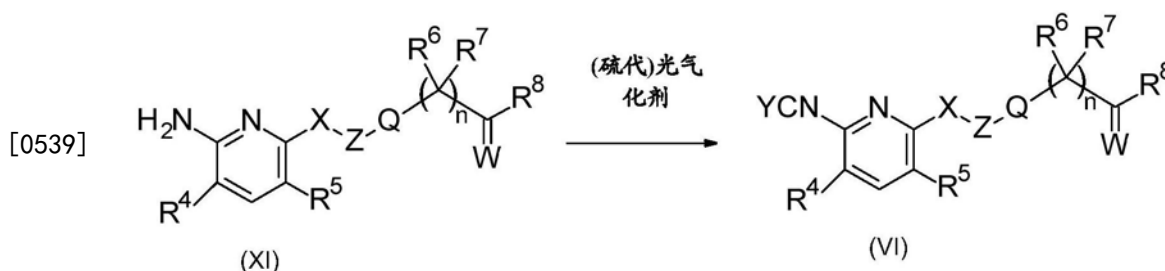
Org.Synth.Coll. 第IV卷,第34页(1963);G.H.Coleman等,Org.Synth.Coll. 第III卷,第712页(1955);H.Henecka,Houben-Weyl,Methoden der Organischen Chemie[有机化学方法],第VIII卷,第4版,Stuttgart 1952,第463页及随后各页。

[0535] 式(IV)的(硫代)氨基甲酸酯(上述方法B所需)可以通过使式(XI)的胺(上述方法G所需)与式(XIII)化合物类似于已知的方法(即Houben-Weyl,Methoden der organischen Chemie[有机化学方法],E5,1985,第972-980页以及还有VIII,第655页和XI,第2部分,第10页)反应而制备:



[0537] 式(V)的烯胺(上述方法B所需)公开于文献(例如A.Lutz,A.和S.Trotto,J.of Heterocyclic Chem.1972,9,3,513-522)中并且可以按此制备。

[0538] 式(VI)的异(硫)氰酸酯(上述方法C所需)可以由式(XI)的相应胺得到:



[0540] 式(XI)的胺的反应通常在 $-20^{\circ}\text{C}$ 至反应混合物的沸点,优选 $10-200^{\circ}\text{C}$ ,特别优选 $20-150^{\circ}\text{C}$ 下在惰性有机溶剂以及合适的话在碱存在下进行(例如W0 04/39768)。

[0541] 合适的(硫代)光气化剂是光气、双光气或三光气以及各自的相应硫代衍生物,优选双光气。

[0542] 合适的溶剂是脂族烃类如戊烷、己烷、环己烷和 $\text{C}_5$ - $\text{C}_8$ 链烷烃的混合物,芳族烃类如甲苯、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯,卤代烃类如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿和氯苯,醚类如乙醚、二异丙醚、叔丁基甲基醚、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃,二醇醚类如二甲基乙二醇醚、二乙基乙二醇醚、二甘醇二甲基醚,酯类如乙酸乙酯、乙酸丙酯、异丁酸甲酯、乙酸异丁酯,酰胺类如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、N,N-二甲基乙酰胺,腈类如乙腈和丙腈,酮类如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮和叔丁基甲基酮,以及二甲亚砜。

[0543] 特别优选芳族烃类如甲苯、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯。

[0544] 还可以使用所述溶剂的混合物。

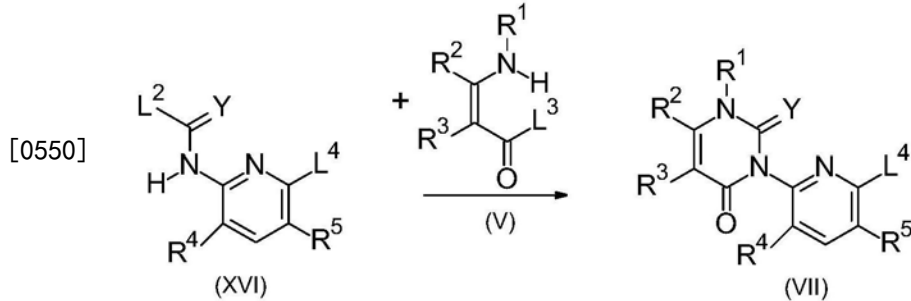
[0545] 合适的碱通常为无机化合物如碱金属和碱土金属碳酸盐如碳酸锂、碳酸钾和碳酸钙,以及碱金属碳酸氢盐如碳酸氢钠,此外还有有机碱,如叔胺如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺和N-甲基哌啶,吡啶,取代吡啶如可力丁、卢剔啶、N-甲基吗啉和4-二甲氨基吡啶以及还有双环胺。

[0546] 特别优选叔胺如三乙胺。

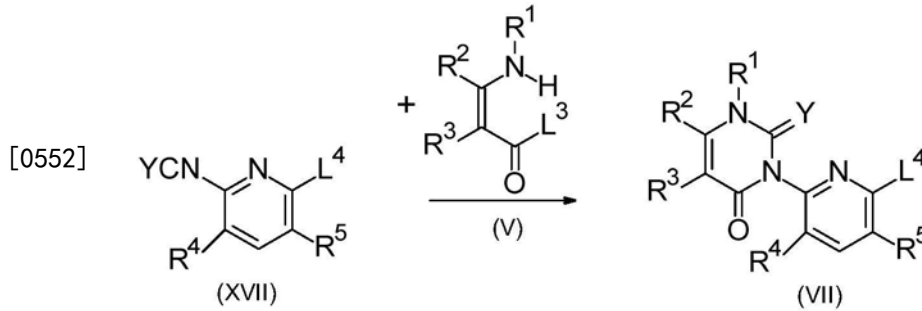
[0547] 碱通常以催化量使用,然而它们还可以以等摩尔量、过量使用或者合适的话可以用作溶剂。

[0548] 后处理可以以已知方式进行。

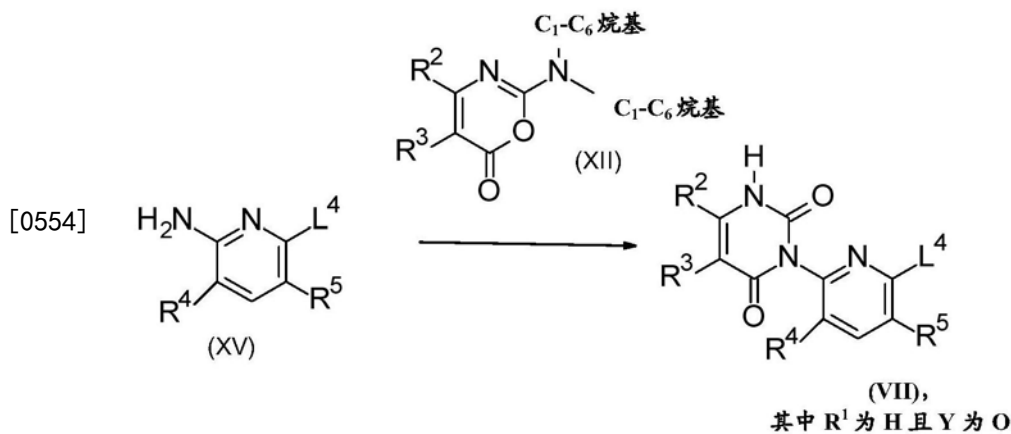
[0549] 式 (VII) 化合物 (上述方法D所需) 可以通过使式 (XVI) 化合物与式 (V) 的烯胺类似于上述方法B反应而制备:



[0551] 作为替换,式 (VII) 化合物 (上述方法D所需) 还可以通过使式 (XVII) 化合物与式 (V) 的烯胺类似于上述方法C反应而制备:



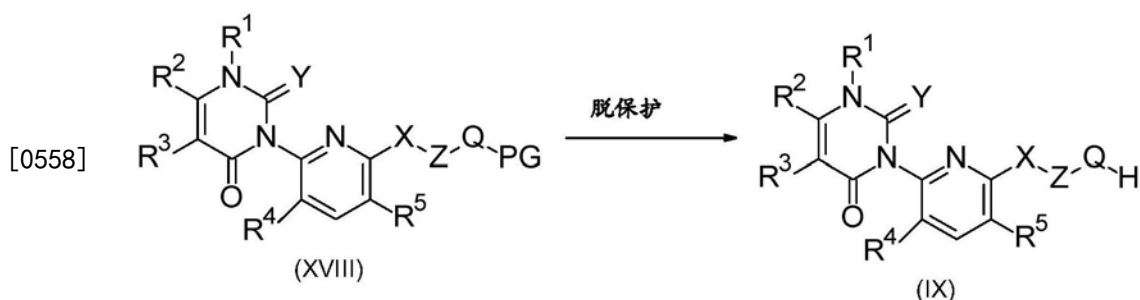
[0553] 作为替换,其中R<sup>1</sup>为H且Y为O的式 (VII) 化合物可以通过使式 (XV) 化合物与式 (XII) 的噁嗪酮类类似于上述方法G反应而制备:



[0555] 那些其中R<sup>1</sup>为NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>炔基的式 (VII) 化合物可以通过胺化或烷基化那些其中R<sup>1</sup>为H的式 (VII) 化合物而制备。该胺化或烷基化可以类似于已知方法 (例如W0 05/054208;W0 06/125746) 进行。

[0556] 式 (VIII) 化合物 (上述方法D所需) 可市购或者可以通过已知方法 (例如W0 02/098227或W0 07/083090) 制备。

[0557] 式 (IX) 化合物 (上述方法E所需) 可以通过使式 (XVIII) 的相应化合物脱保护制备:



[0559] 在式 (XVIII) 化合物中,“PG”为选自 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基- $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基、 $C_3$ - $C_6$ 炔基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_5$ - $C_6$ 环烯基、四氢吡喃基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基、(二苯基) ( $C_1$ - $C_4$ 烷基) 甲硅烷基、甲酰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基- $O$ -羰基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基- $O$ -羰基、(二苯基) ( $C_1$ - $C_4$ 烷基) 甲硅烷基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、苯硫基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、苯基羰基的保护基团,其中各苯基环可以被1-3个选自卤素、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C_1$ - $C_4$ 烷基和 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基的取代基取代。

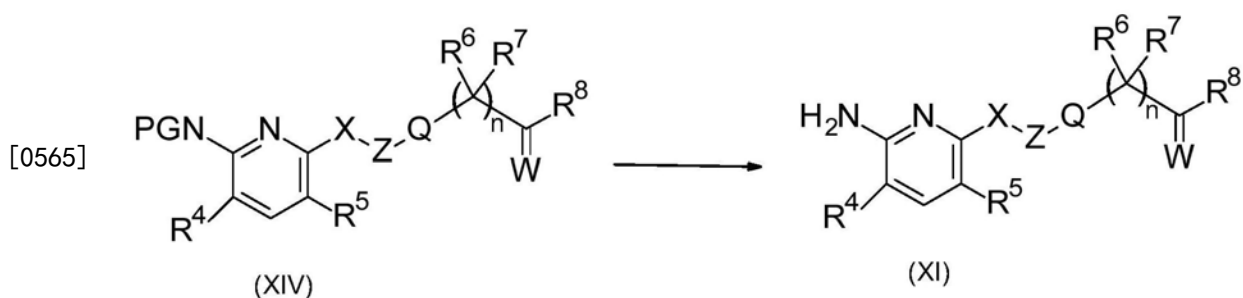
[0560] 优选PG为 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基、四氢吡喃基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基、(二苯基) ( $C_1$ - $C_4$ 烷基) 甲硅烷基或苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基。

[0561] 例如,式 (IX) 化合物可以通过在溶剂如二氯甲烷、乙腈或1,4-二噁烷中或者在没有溶剂下在0-150°C的温度下用三溴化硼处理其中“PG”为甲基的式 (XVIII) 化合物而制备。

[0562] 或者,式 (IX) 化合物可以通过在氢气气氛中在70-700kPa,优选270-350kPa的压力下在悬浮于溶剂如乙醇中的金属催化剂如负载在惰性载体如活性炭上的钯存在下在环境温度下催化氢化使其中“PG”为苄基的式 (XVIII) 化合物脱保护而制备,其中金属与载体的重量比为5-20%。

[0563] 保护基团的使用和选择对化学合成中的熟练人员是明了的(例如见Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis, 第4版; Wiley: New York, 2007)。

[0564] 式 (XI) 的胺(上述方法G以及还有制备式 (IV) 的(硫代)氨基甲酸酯所需)可以由式 (XIV) 的相应吡啶类得到:



[0566] 在式 (XIV) 的吡啶类中,基团“PGN”为选自 $N_3$ 、脂族或芳族氨基甲酸酯、脂族或芳族酰胺、 $N$ - $C_1$ - $C_6$ 烷基胺、 $N$ -芳基胺或杂芳基酰胺的被保护胺取代基。

[0567] 优选PGN选自 $N_3$ 、 $C_1$ - $C_6$ 烷基- $O$  (CO)  $NH$ -、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基- $O$  (CO)  $NH$ -、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基-Si- $C_1$ - $C_6$ 烷基- $O$  (CO)  $NH$ -、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基- $O$  (CO)  $NH$ -、 $C_3$ - $C_6$ 炔基- $O$  (CO)  $NH$ -、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $O$  (CO)  $NH$ -、苄基- $O$  (CO)  $NH$ -、 $H$  (CO)  $N$ -、 $C_1$ - $C_6$ 烷基- (CO)  $NH$ -、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基- (CO)  $NH$ -、 $C_1$ - $C_6$ 烷

基-NH、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-N-、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)NH-、二(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)N-、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基-NH、二(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基)N-、三-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-Si-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-NH-、二[三-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-Si-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基]N-、苄基甲基-NH-、二(苄基甲基)N-、N-苯邻二甲酰亚胺、N-2,3-二甲基马来酰亚胺或N-2,5-二甲基吡咯、苯基-0(CO)NH-、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-0(CO)NH-、苯基-(CO)NH-、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-(CO)NH-、吡啶基-(CO)-NH-、邻-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)苯基-NH、二[邻-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)苯基]N-、对-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)苯基-NH、二[对-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)苯基]N-、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-NH-、二(苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)N-、对-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-NH、二[对-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基]N-，其中苯基或吡啶基环各自可以被1-3个选自卤素、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基的取代基取代；更优选PGN选自C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-0(CO)NH-、苄基甲基-0(CO)NH-、H(CO)N-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-(CO)-NH-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-(CO)-NH-、N-苯邻二甲酰亚胺、苯基-0(CO)NH-、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-0(CO)NH-、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-NH-、二(苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)N-，其中苯基或吡啶基环各自可以被1-3个C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基取代基取代。

[0568] 在“PGN”为叠氮化物取代基的情况下，可以使用还原性反应条件如在氯化铵水溶液中的锌将式(XIV)的吡啶类转化成式(XI)的胺。

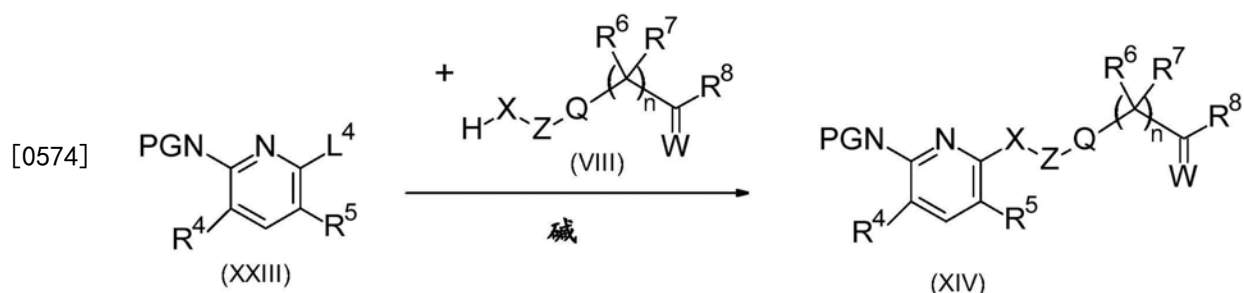
[0569] 在“PGN”为酰化胺取代基的情况下，可以使用酸将式(XIV)的吡啶类转化成式(XI)的胺。

[0570] “PGN”取代基的使用和选择以及合适的脱保护方法对化学合成中的熟练人员是明了的(例如参见Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis, 第4版; Wiley: New York, 2007)。

[0571] 式(XII)的噁嗪酮类(上述方法G所需)可市购或者可以通过已知方法(WO 2000/049002)制备。

[0572] 制备式(IV)的(硫代)氨基甲酸酯所要求的式(XIII)化合物公开于文献(例如Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, E4, 1983, 第6-17页)中并且可以相应地制备或者可以市购。

[0573] 式(XIV)的吡啶类(制备上述式(IX)的胺所需)可以通过使式(XXIII)化合物与式(VIII)化合物(上述方法D所需)在碱存在下类似于上述方法D反应而制备:

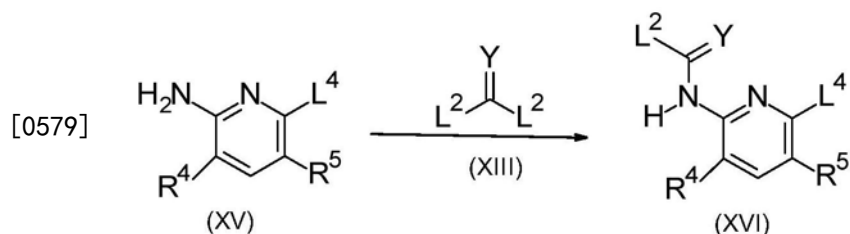


[0575] 在式(XXIII)化合物中，L<sup>4</sup>是离去基团如卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酸酯或芳基磺酸酯；优选F、Cl、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酸酯或芳基磺酸酯；尤其优选F、Cl、甲磺酸酯或甲苯磺酸酯；更优选F或Cl。

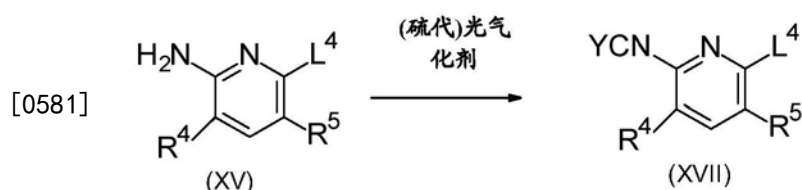
[0576] 在式(XIV)和(XXIII)化合物中，基团“PGN”是如上面对式(XI)的胺所定义的被保护胺取代基。

[0577] 制备式 (XVI) 的吡啶类所要求的式 (XV) 化合物、式 (XVII) 化合物和式 (XXIII) 化合物可以市购。

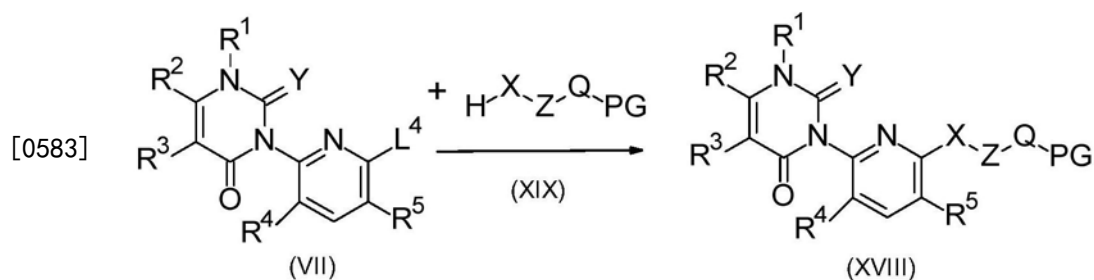
[0578] 制备式 (VII) 化合物所要求的式 (XVI) 化合物可以通过使式 (XV) 化合物与式 (XIII) 化合物类似于已知方法 (即Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie [有机化学方法], E5, 1985, 第972-980页以及还有VIII, 第655页和XI, 第2部分, 第10页) 反应而制备:



[0580] 替换制备式 (VII) 化合物所要求的式 (XVII) 化合物可以类似于如上所述由式 (XI) 的相应胺制备式 (VI) 的异(硫)氰酸酯由式 (XV) 化合物制备:



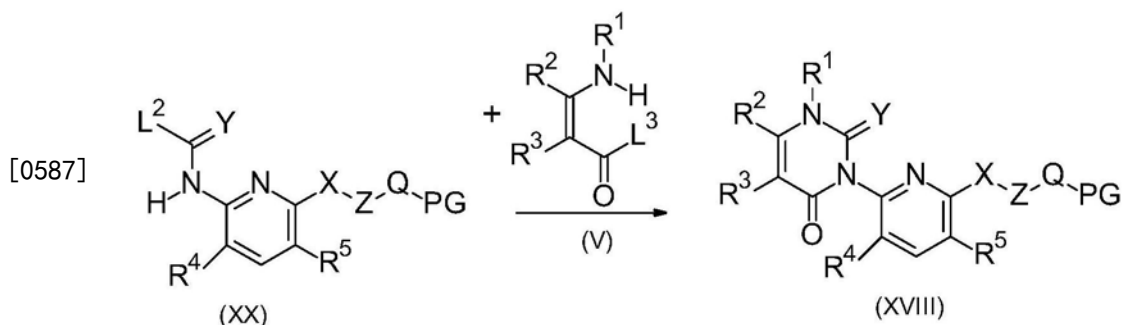
[0582] 制备式 (IX) 化合物所要求的式 (XVIII) 化合物可以通过使式 (VII) 化合物与式 (XIX) 化合物在碱存在下类似于上述方法D反应而制备:



[0584] 在式 (VII) 化合物中,  $\text{L}^4$  为离去基团如卤素、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$  烷基磺酸酯或芳基磺酸酯; 优选 F、Cl、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$  烷基磺酸酯或芳基磺酸酯; 尤其优选 F、Cl、甲磺酸酯或甲苯磺酸酯; 更优选 F 或 Cl。

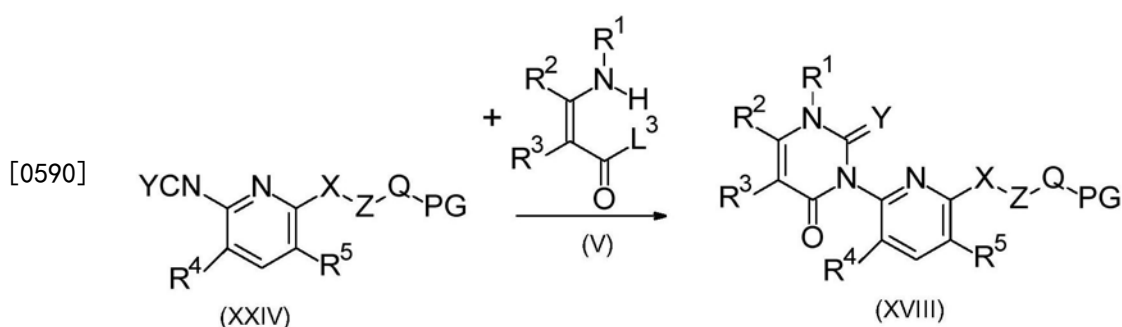
[0585] 在式 (XIX) 和 (XVIII) 化合物中, 基团“PG”为如上面对式 (IX) 化合物所定义的保护基团。

[0586] 作为替换, 制备式 (IX) 化合物所要求的式 (XVIII) 化合物还可以通过使式 (XX) 的(硫代)氨基甲酸酯与式 (V) 的烯胺类似于上述方法B反应而制备:



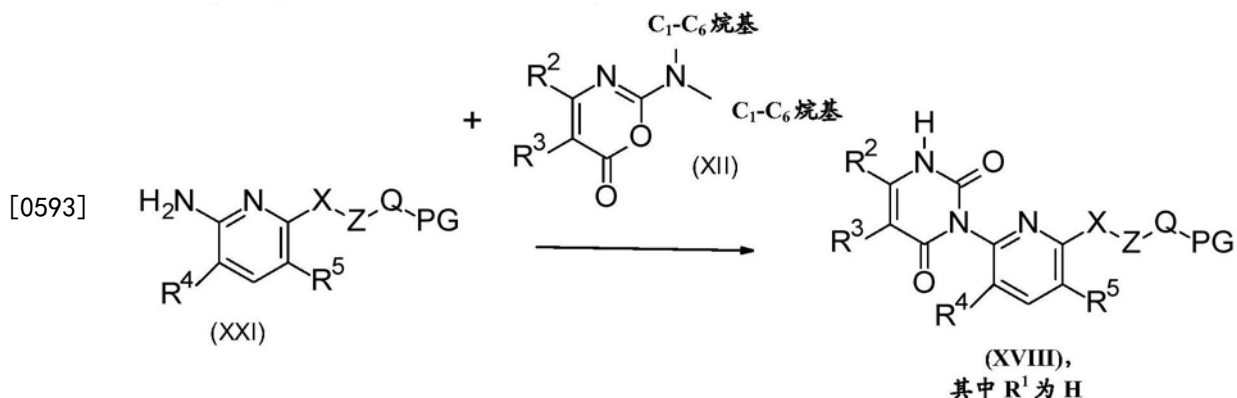
[0588] 在式 (XX) 的 (硫代) 氨基甲酸酯中, “PG” 为如上面对式 (IX) 化合物所定义的保护基团。

[0589] 作为替换, 制备式 (IX) 化合物所要求的式 (XVIII) 化合物还可以通过使式 (XXIV) 的异 (硫) 氰酸酯与式 (V) 的烯胺类似于上述方法 C 反应而制备:



[0591] 在式 (XXIV) 和 (XVIII) 化合物中, 基团 “PG” 为如上面对式 (IX) 化合物所定义的保护基团。

[0592] 作为替换, 其中 R<sup>1</sup> 为 H 且 Y 为 O 的式 (XVIII) 化合物可以通过使式 (XXI) 的胺与式 (XII) 的噁嗪酮类类似于上述方法 G 反应而制备:

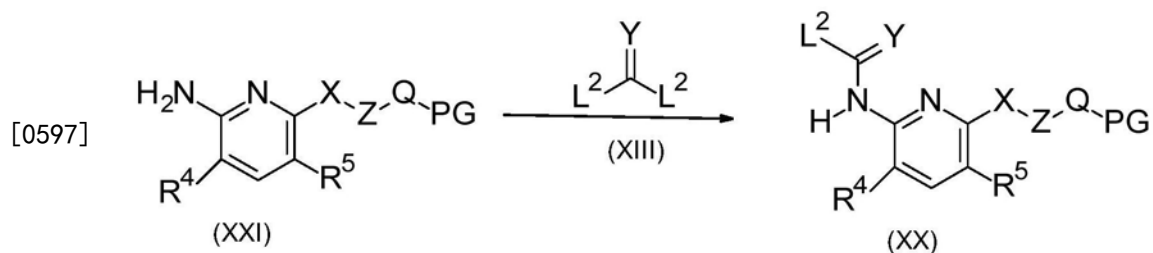


[0594] 那些其中 R<sup>1</sup> 为 NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 炔基的式 (XVIII) 化合物可以通过胺化或烷基化那些其中 R<sup>1</sup> 为 H 的式 (XVIII) 化合物而制备。该胺化或烷基化可以类似于已知方法 (例如 WO 05/054208; WO 06/125746) 进行。

[0595] 制备式 (XVIII) 化合物所要求的式 (XIX) 化合物可以市购。

[0596] 制备式 (XVIII) 化合物所要求的式 (XX) 的 (硫代) 氨基甲酸酯可以通过使式 (XXI) 的胺与式 (XIII) 化合物类似于已知方法 (即 Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie [有机化学方法], E5, 1985, 第 972-980 页以及还有 VIII, 第 655 页和 XI, 第 2 部分, 第 10

页) 反应而制备:



[0598] 在式 (XX) 的 (硫代) 氨基甲酸酯和式 (XXI) 的胺中, 基团“PG”为如上面对式 (IX) 化合物所定义的保护基团。

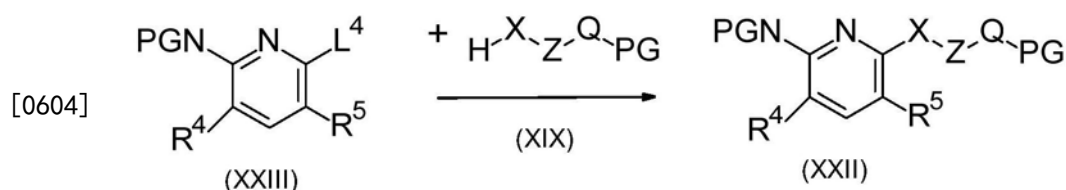
[0599] 制备式 (XX) 的 (硫代) 氨基甲酸酯所要求的式 (XXI) 的胺可以由式 (XXII) 的相应吡啶类制备:



[0601] 在式 (XXII) 的吡啶类中, 基团“PG”为如上面对式 (IX) 化合物所定义的保护基团。

[0602] 在式 (XXII) 的吡啶类中, 基团“PGN”为如上面对式 (XI) 的胺所定义的被保护胺取代基。

[0603] 制备式 (XXI) 的胺所要求的式 (XXII) 的吡啶类可以由式 (XXIII) 化合物与式 (XIX) 化合物在碱存在下类似于上述方法D制备:



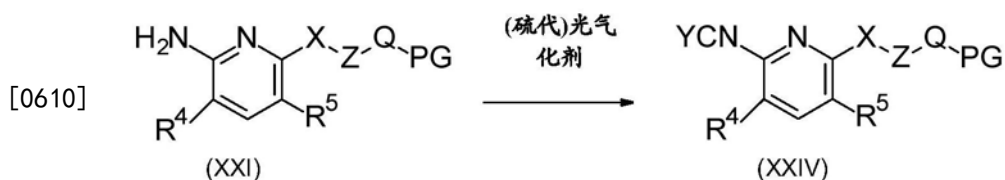
[0605] 在式 (XXIII) 化合物中,  $L^4$  为离去基团如卤素、 $C_1-C_6$  烷基磺酸酯或芳基磺酸酯; 优选 F、Cl、 $C_1-C_6$  烷基磺酸酯或芳基磺酸酯; 尤其优选 F、Cl、甲磺酸酯或甲苯磺酸酯; 更优选 F 或 Cl。

[0606] 在式 (XXII) 的吡啶类和式 (XIX) 化合物中, 基团“PG”为如上面对式 (IX) 化合物所定义的保护基团。

[0607] 在式 (XXII) 的吡啶类和式 (XXIII) 化合物中, 基团“PGN”为如上面对式 (XI) 的胺所定义的被保护胺取代基。

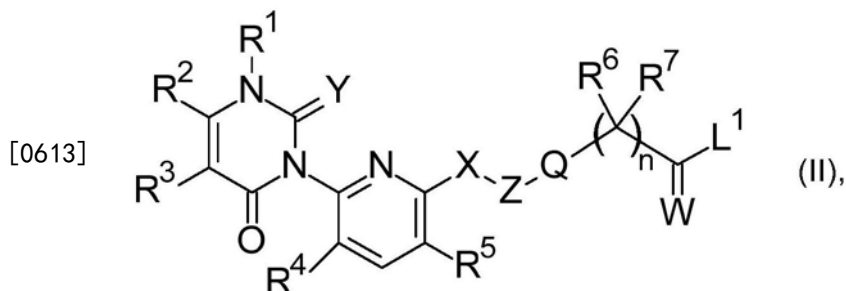
[0608] 制备式 (XXII) 的吡啶类所要求的式 (XXIII) 化合物可以市购或者可以通过已知方法由相应胺 XV 制备 (例如 Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis, 第4版; Wiley: New York, 2007)。

[0609] 替换制备式 (XVIII) 化合物所要求的式 (XXIV) 的异 (硫) 氰酸酯可以由式 (XXI) 的胺类似于如上所述由式 (XI) 的相应胺制备式 (VI) 的异 (硫) 氰酸酯得到:



[0611] 式(II)的酰卤是新化合物且如上所示为制备本发明式(I)的尿嘧啶吡啶类的合适中间体。

[0612] 因此,本发明还提供了式(II)的酰卤:



[0614] 其中各取代基具有下列含义:

[0615] R<sup>1</sup>: 氢、NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>炔基;

[0616] R<sup>2</sup>: 氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基;

[0617] R<sup>3</sup>: 氢或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基;

[0618] R<sup>4</sup>: H或卤素;

[0619] R<sup>5</sup>: 卤素、CN、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>或C(=S)NH<sub>2</sub>;

[0620] R<sup>6</sup>: H、卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧羰基;

[0621] R<sup>7</sup>: H、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基;

[0622] n: 1-3;

[0623] Q: O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NH或(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)N;

[0624] W: O或S;

[0625] X: O或S;

[0626] Y: O或S;

[0627] Z: 苯基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基,它们各自任选被1-4个选自卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基的取代基取代;以及

[0628] L<sup>1</sup>为卤素。

[0629] 优选如下那些式(II)的酰卤,其中L<sup>1</sup>为F、Cl或Br;尤其优选F或Cl;更优选Cl。

[0630] 对于各变量,式(II)的酰卤的特别优选实施方案相互独立地或者相互组合地对应于式(I)的尿嘧啶吡啶类的变量R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、n、Q、W、X、Y、Z的那些,或者相互独立地或者相互组合地具有下列含义:

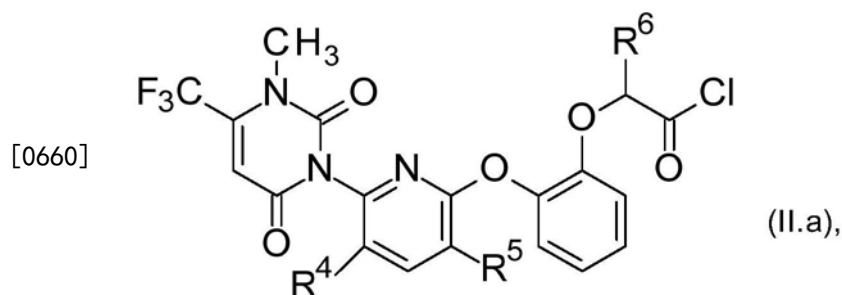
[0631] R<sup>1</sup>为NH<sub>2</sub>或CH<sub>3</sub>;

[0632] R<sup>2</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;

[0633] R<sup>3</sup>为H;

[0634] R<sup>4</sup>为H、F或Cl;

- [0635]  $R^5$ 为F、Cl、Br或CN；
- [0636]  $R^6$ 为H、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基；
- [0637]  $R^7$ 为H；
- [0638] n为1；
- [0639] Q为0或S；
- [0640] W为0；
- [0641] X为0；
- [0642] Y为0；
- [0643] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ，其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基；以及
- [0644]  $L^1$ 为Cl；
- [0645] 优选 $R^1$ 为 $NH_2$ 或 $CH_3$ ；
- [0646]  $R^2$ 为 $C_1-C_4$ 卤代烷基；
- [0647]  $R^3$ 为H；
- [0648]  $R^4$ 为H、F或Cl；
- [0649]  $R^5$ 为F、Cl或CN；
- [0650]  $R^6$ 为H、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基；
- [0651]  $R^7$ 为H；
- [0652] n为1；
- [0653] Q为0或S；
- [0654] W为0；
- [0655] X为0；
- [0656] Y为0；
- [0657] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ，其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基；以及
- [0658]  $L^1$ 为Cl。
- [0659] 特别优选式(II.a)的酰卤(对应于式(II)，其中 $R^1$ 为 $CH_3$ ， $R^2$ 为 $CF_3$ ， $R^3$ 为H， $R^7$ 为H，n为1，Q、W、X和Y为0，Z为如上所定义的Z-1，其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 和 $R^d$ 为H且 $L^1$ 为Cl)：



[0661] 其中变量 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 和 $L^1$ 具有如上所定义的含义，尤其是优选含义。

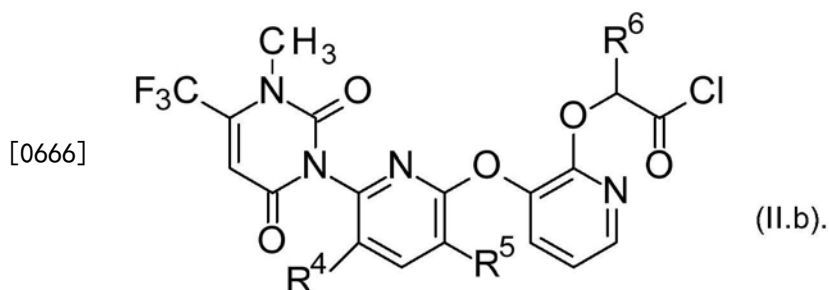
[0662] 特别优选表I-1的式(II.a.1) - (II.a.24)的酰卤，优选式(II.a.1) - (II.a.18)的酰卤，其中变量 $R^4$ 、 $R^5$ 和 $R^6$ 的定义不仅相互组合地而且在每种情况下也独立地对本发明化合物而言特别重要：

[0663] 表I-1

[0664]

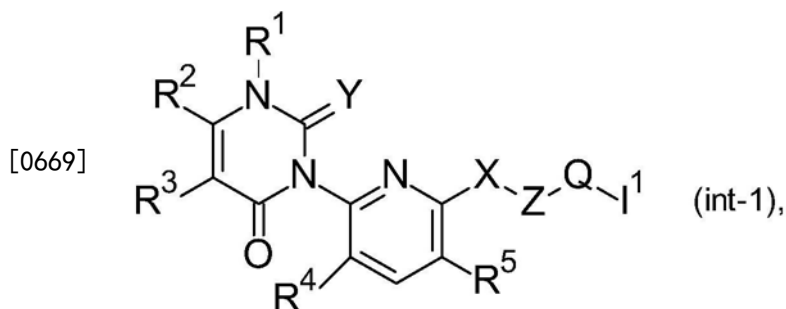
序号	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
II.a.1.	H	F	H
II.a.2.	H	F	CH <sub>3</sub>
II.a.3.	H	F	OCH <sub>3</sub>
II.a.4.	H	Cl	H
II.a.5.	H	Cl	CH <sub>3</sub>
II.a.6.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>
II.a.7.	H	CN	H
II.a.8.	H	CN	CH <sub>3</sub>
II.a.9.	H	CN	OCH <sub>3</sub>
II.a.10.	F	F	H
II.a.11.	F	F	CH <sub>3</sub>
II.a.12.	F	F	OCH <sub>3</sub>
II.a.13.	F	Cl	H
II.a.14.	F	Cl	CH <sub>3</sub>
II.a.15.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>
II.a.16.	F	CN	H
II.a.17.	F	CN	CH <sub>3</sub>
II.a.18.	F	CN	OCH <sub>3</sub>
II.a.19.	H	Br	H
II.a.20.	H	Br	CH <sub>3</sub>
II.a.21.	H	Br	OCH <sub>3</sub>
II.a.22.	F	Br	H
II.a.23.	F	Br	CH <sub>3</sub>
II.a.24.	F	Br	OCH <sub>3</sub>

[0665] 还优选式 (II.b) 的酰卤, 优选式 (II.b.1) - (II.b.24) 的酰卤, 特别优选式 (II.b.1) - (II.b.18) 的酰卤, 其与式 (II.a.1) - (II.a.24) 的相应酰卤的不同仅在于Z为Z-7, 其中R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>和R<sup>c</sup>为H:



[0667] 组合了式 (IX) 和 (XVIII) 化合物的式 (int-1) 的中间体是新化合物且如上所示是适合制备本发明式 (I) 的尿嘧啶吡啶类的中间体。

[0668] 因此, 本发明还提供了式 (int-1) 的中间体:



[0670] 其中各取代基具有下列含义：

[0671]  $R^1$ : 氢、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基或 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 炔基；

[0672]  $R^2$ : 氢、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基或 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 卤代烷基；

[0673]  $R^3$ : 氢或 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基；

[0674]  $R^4$ : H或卤素；

[0675]  $R^5$ : 卤素、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 或 $\text{C}(=\text{S})\text{NH}_2$ ；

[0676] Q: O、S、SO、 $\text{SO}_2$ 、NH或( $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ 烷基)N；

[0677] X: O或S；

[0678] Y: O或S；

[0679] Z: 苯基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基，它们各自任选被1-4个选自卤素、CN、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 卤代烷氧基的取代基取代；以及

[0680]  $I^1$ 为H或PG，其中PG为选自 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 氰基烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 卤代烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷硫基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、三- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基甲硅烷基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、三- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基甲硅烷基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_5$ - $\text{C}_6$ 环烯基、四氢吡喃基、三- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基甲硅烷基、(二苯基)( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基)甲硅烷基、甲酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基羰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基-0-羰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基-0-羰基、(二苯基)( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基)甲硅烷基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、苯基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、苯硫基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、苯基羰基的保护基团，其中各苯基环可以被1-3个选自卤素、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基和 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基的取代基取代；

[0681] 包括其可农用盐或衍生物，条件是式(int-1)的中间体具有羧基。

[0682] 优选如下那些式(int-1)的中间体，其中 $I^1$ 为H、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷氧基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、三- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基甲硅烷基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ 链烯基、四氢吡喃基、三- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基甲硅烷基、(二苯基)( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基)甲硅烷基或苯基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基；尤其优选H。

[0683] 对于各变量，式(int-1)的中间体的特别优选实施方案相互独立地或者相互组合地对应于式(I)的尿嘧啶吡啶类的变量 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、Q、X、Y和Z的那些，或相互独立地或者相互组合地具有下列含义：

[0684]  $R^1$ 为 $\text{NH}_2$ 或 $\text{CH}_3$ ；

[0685]  $R^2$ 为 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 卤代烷基；

[0686]  $R^3$ 为H；

[0687]  $R^4$ 为H、F或Cl；

[0688]  $R^5$ 为F、Cl、Br或CN；

[0689] n为1；

[0690] Q为O或S;

[0691] X为O;

[0692] Y为O;

[0693] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基;以及

[0694]  $I^1$ 为H、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基、四氢吡喃基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基、(二苯基)( $C_1$ - $C_4$ 烷基)甲硅烷基或苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基;

[0695] 优选 $R^1$ 为 $NH_2$ 或 $CH_3$ ;

[0696]  $R^2$ 为 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基;

[0697]  $R^3$ 为H;

[0698]  $R^4$ 为H、F或Cl;

[0699]  $R^5$ 为F、Cl或CN;

[0700] n为1;

[0701] Q为O或S;

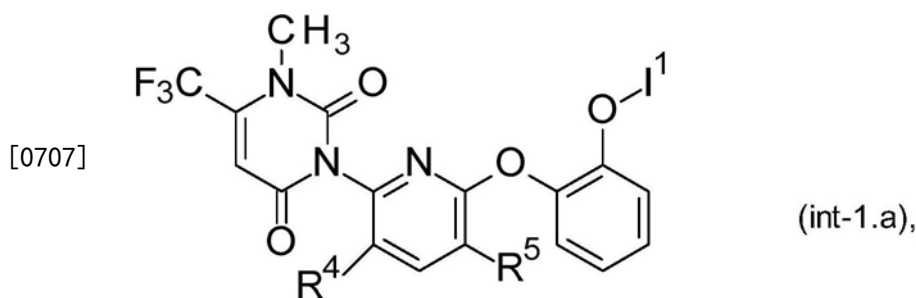
[0702] X为O;

[0703] Y为O;

[0704] Z选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基;以及

[0705]  $I^1$ 为H、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 链烯基、四氢吡喃基、三- $C_1$ - $C_6$ 烷基甲硅烷基、(二苯基)( $C_1$ - $C_4$ 烷基)甲硅烷基或苯基- $C_1$ - $C_4$ 烷基。

[0706] 特别优选式(int-1.a)的中间体(对应于式(int-1)),其中 $R^1$ 为 $CH_3$ , $R^2$ 为 $CF_3$ , $R^3$ 为H, $Q$ 、 $X$ 和 $Y$ 为O, $Z$ 为如上所定义的 $Z^1$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 和 $R^d$ 为H:



[0708] 其中变量 $R^4$ 、 $R^5$ 和 $I^1$ 具有如上所定义的含义,尤其是优选含义。

[0709] 特别优选表I-2的式(int-1.a.1) - (int-1.a.24)的中间体,优选式(int-1.a.1) - (int-1.a.18)的中间体,其中变量 $R^4$ 、 $R^5$ 和 $I^1$ 的定义不仅相互组合地而且在每种情况下也独立地对本发明化合物而言特别重要:

[0710] 表I-2

[0711]

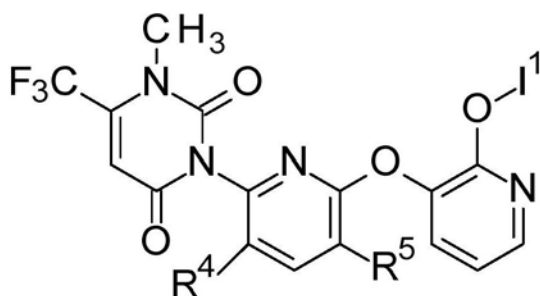
序号	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	I <sup>1</sup>
int-1.a.1.	H	F	H
int-1.a.2.	H	F	CH <sub>3</sub>
int-1.a.3.	H	F	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-1.a.4.	H	Cl	H
int-1.a.5.	H	Cl	CH <sub>3</sub>
int-1.a.6.	H	Cl	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-1.a.7.	H	CN	H
int-1.a.8.	H	CN	CH <sub>3</sub>

[0712]

int-1.a.9.	H	CN	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-1.a.10.	F	F	H
int-1.a.11.	F	F	CH <sub>3</sub>
int-1.a.12.	F	F	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-1.a.13.	F	Cl	H
int-1.a.14.	F	Cl	CH <sub>3</sub>
int-1.a.15.	F	Cl	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-1.a.16.	F	CN	H
int-1.a.17.	F	CN	CH <sub>3</sub>
int-1.a.18.	F	CN	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-1.a.19.	H	Br	H
int-1.a.20.	H	Br	CH <sub>3</sub>
int-1.a.21.	H	Br	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-1.a.22.	F	Br	H
int-1.a.23.	F	Br	CH <sub>3</sub>
int-1.a.24.	F	Br	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>

[0713] 还优选式 (int-1.b) 的中间体, 优选式 (int-1.b.1) - (int-1.b.24) 的中间体, 特别优选式 (int-1.b.1) - (int-1.b.18) 的中间体, 其与式 (int-1.a.1) - (int-1.a.24) 的相应中间体的不同仅在于 Z 为 Z-7, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>c</sup> 为 H:

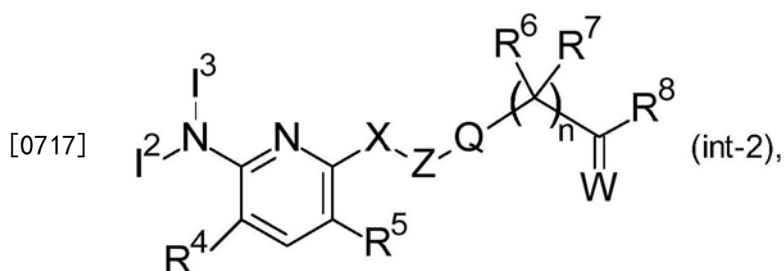
[0714]



(int-1.b).

[0715] 组合了式 (IV) 的 (硫代) 氨基甲酸酯、式 (VI) 的异 (硫) 氰酸酯、式 (XI) 的胺和式 (XIV) 的吡啶类的式 (int-2) 的中间体是新化合物且如上所示是适合制备本发明式 (I) 的尿嘧啶吡啶类的中间体。

[0716] 因此, 本发明还提供了式 (int-2) 的中间体:



[0718] 其中各取代基具有下列含义：

[0719]  $R^4$ : H或卤素；

[0720]  $R^5$ : 卤素、CN、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>或C(=S)NH<sub>2</sub>；

[0721]  $R^6$ : H、卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧羰基；

[0722]  $R^7$ : H、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基；

[0723]  $R^8$ : OR<sup>9</sup>、SR<sup>9</sup>、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、NR<sup>9</sup>OR<sup>9</sup>、NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>或NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>，其中

[0724]  $R^9$ 为氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>链烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>卤代链烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>氰基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>链烯氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>卤代链烯氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>链烯氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>链烯氧羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>炔氧羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基氨基、氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、氨基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-N=CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>，其中R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>相互独立地为H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或苯基；C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>杂环基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>杂环基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、苯基、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或5或6员杂芳基，

[0725] 其中环烷基、杂环基、苯基或杂芳基环各自可以被1-4个选自R<sup>14</sup>或3-7员碳环的取代基取代，

[0726] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自-N(R<sup>12</sup>)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-和-S-的环成员，以及

[0727] 该碳环任选被1-4个选自R<sup>14</sup>的取代基取代；

[0728] 其中R<sup>14</sup>为卤素、NO<sub>2</sub>、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧羰基；

[0729] R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>相互独立地为R<sup>9</sup>，或者一起形成3-7员碳环，

[0730] 该碳环任选除了碳原子外具有1或2个选自-N(R<sup>12</sup>)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-和-S-的环成员，以及

[0731] 该碳环任选被1-4个选自R<sup>14</sup>的取代基取代；

[0732] n: 1-3；

[0733] Q: O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NH或(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)N；

[0734] W: O或S；

[0735] X: O或S；

[0736] Z: 苯基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基，它们各自任选被1-4个选自卤素、CN、

$C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基的取代基取代；

[0737]  $I^2$ :H;

[0738]  $I^3$ :H或C(=Y) $L^2$ ,其中

[0739] Y为O或S,以及

[0740]  $L^2$ 为可亲核置换的离去基团,优选 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基或芳氧基,其中芳基结构部分本身可以部分或完全被卤代和/或可以被1-3个选自氰基、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基和 $C_1-C_4$ 烷硫基的取代基取代;

[0741] 或者 $I^2$ 和 $I^3$ 与它们所连接的N原子一起形成基团“YCN”,其中Y为O或S,或基团“PGN”,其为选自 $N_3$ 、脂族或芳族氨基甲酸酯、脂族或芳族酰胺、N- $C_1-C_6$ 烷基胺、N-芳基胺或杂芳基酰胺的被保护胺取代基,包括其盐。

[0742]  $L^2$ 优选为 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基或苯氧基,其中苯基结构部分本身可以部分或完全被卤代和/或可以被1-3个选自氰基、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基和 $C_1-C_4$ 烷硫基的基团取代;更优选 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基或苯氧基;最优选 $C_1-C_6$ 烷氧基。

[0743] 优选PGN选自 $N_3$ 、 $C_1-C_6$ 烷基-0(CO)NH-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基-0(CO)-NH-、三- $C_1-C_6$ 烷基-Si- $C_1-C_6$ 烷基-0(CO)NH-、 $C_2-C_6$ 链烯基-0(CO)NH-、 $C_3-C_6$ 炔基-0(CO)NH-、 $C_3-C_6$ 环烷基-0(CO)NH-、苄基甲基-0(CO)NH-、H(CO)N-、 $C_1-C_6$ 烷基-(CO)-NH-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基-(CO)-NH-、 $C_1-C_6$ 烷基-NH-、二- $C_1-C_6$ 烷基-N-、( $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基)NH-、二( $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基)N-、 $C_2-C_6$ 链烯基-NH-、二( $C_2-C_6$ 链烯基)N-、三- $C_1-C_4$ 烷基-Si- $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基-NH-、二[三- $C_1-C_4$ 烷基-Si- $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基]N-、苄基甲基-NH-、二(苄基甲基)N-、N-苯邻二甲酰亚胺、N-2,3-二甲基马来酰亚胺或N-2,5-二甲基吡咯、苯基-0(CO)NH-、苯基- $C_1-C_4$ 烷基-0(CO)NH-、苯基-(CO)NH-、苯基- $C_1-C_6$ 烷基-(CO)NH-、吡啶基-(CO)-NH-、邻-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基-NH-、二[邻-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基]N-、对-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基-NH-、二[对-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基]N-、苯基- $C_1-C_4$ 烷基-NH-、二(苯基- $C_1-C_4$ 烷基)N-、对-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基- $C_1-C_4$ 烷基-NH-、二[对-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基- $C_1-C_4$ 烷基]N-,其中苯基或吡啶基环各自可以被1-3个选自卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基和 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基的取代基取代;更优选PGN选自 $C_1-C_6$ 烷基-0(CO)NH-、苄基甲基-0(CO)NH-、H(CO)N-、 $C_1-C_6$ 烷基-(CO)-NH-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基-(CO)-NH-、N-苯邻二甲酰亚胺、苯基-0(CO)NH-、苯基- $C_1-C_4$ 烷基-0(CO)NH-、苯基- $C_1-C_4$ 烷基-NH-、二(苯基- $C_1-C_4$ 烷基)N-,其中苯基或吡啶基环各自可以被1-3个 $C_1-C_4$ 烷氧基取代基取代。

[0744] 式(int-2)的中间体的合适盐包括所述酰胺或氨基甲酸酯衍生物的 $NH_4^+$ 、 $Li^+$ 、 $Na^+$ 、 $K^+$ 或 $Mg^{2+}$ 盐。

[0745] 特别优选那些其中 $I^2$ 和 $I^3$ 为H的式(int-2)的中间体。

[0746] 对于各变量,式(int-2)的中间体的特别优选实施方案相互独立地或者相互组合地对应于式(I)的尿嘧啶吡啶类的变量 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、n、Q、W、X、Y和Z的那些,或相互独立地或者相互组合地具有下列含义:

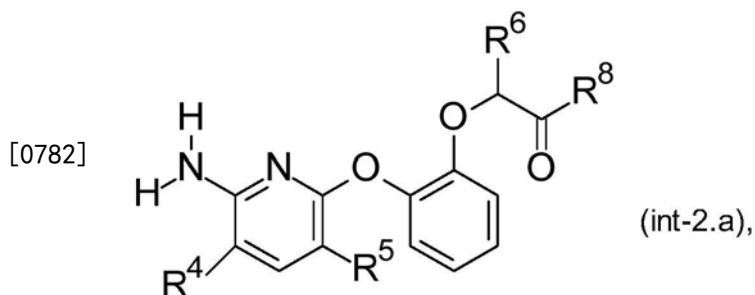
[0747]  $R^4$ 为H、F或Cl;

[0748]  $R^5$ 为F、Cl、Br或CN;

[0749]  $R^6$ 为H、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基;

[0750]  $R^7$ 为H;

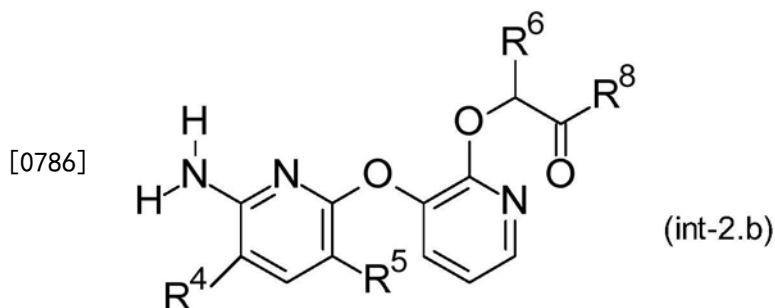
- [0751]  $R^8$ 为 $OR^9$ 或 $NR^9S(O)_2R^{10}$ ,其中
- [0752]  $R^9$ 为氢、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯基、 $C_3-C_6$ 炔基或 $C_1-C_6$ 卤代烷基,以及
- [0753]  $R^{10}$ 为 $C_1-C_6$ 烷基;
- [0754]  $n$ 为1;
- [0755]  $Q$ 为0或S;
- [0756]  $W$ 为0;
- [0757]  $X$ 为0;
- [0758]  $Y$ 为0;
- [0759]  $Z$ 选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基;
- [0760]  $I^2$ 为H;以及
- [0761]  $I^3$ 为H或 $C(=Y)L^2$ ,其中 $Y$ 为0且 $L^2$ 为 $C_1-C_5$ 烷氧基。
- [0762] 或者 $I^2$ 和 $I^3$ 与它们所连接的N原子一起形成选自“YCN”的基团,其中 $Y$ 为0,
- [0763] 包括式(int-2)的中间体的盐;
- [0764] 优选 $R^4$ 为H、F或Cl;
- [0765]  $R^5$ 为F、Cl或CN;
- [0766]  $R^6$ 为H、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基;
- [0767]  $R^7$ 为H;
- [0768]  $R^8$ 为 $OR^9$ 或 $NR^9S(O)_2R^{10}$ ,其中
- [0769]  $R^9$ 为氢、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 链烯基、 $C_3-C_6$ 炔基或 $C_1-C_6$ 卤代烷基,以及
- [0770]  $R^{10}$ 为 $C_1-C_6$ 烷基;
- [0771]  $n$ 为1;
- [0772]  $Q$ 为0或S;
- [0773]  $W$ 为0;
- [0774]  $X$ 为0;
- [0775]  $Y$ 为0;
- [0776]  $Z$ 选自如上所定义的 $Z^1$ 、 $Z^4$ 、 $Z^5$ 、 $Z^6$ 和 $Z^7$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 和 $R^e$ 相互独立地为H、卤素、CN、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基;
- [0777]  $I^2$ 为H;以及
- [0778]  $I^3$ 为H或 $C(=Y)L^2$ ,其中 $Y$ 为0且 $L^2$ 为 $C_1-C_5$ 烷氧基。
- [0779] 或者 $I^2$ 和 $I^3$ 与它们所连接的N原子一起形成选自“YCN”的基团,其中 $Y$ 为0,
- [0780] 包括式(int-2)的中间体的盐。
- [0781] 优选式(int-2.a)的中间体(对应于式(int-2),其中 $R^7$ 为H, $n$ 为1, $Q$ 、 $W$ 、 $X$ 和 $Y$ 为0, $Z$ 为如上所定义的 $Z-1$ ,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 和 $R^d$ 为H且 $I^2$ 和 $I^3$ 为H):



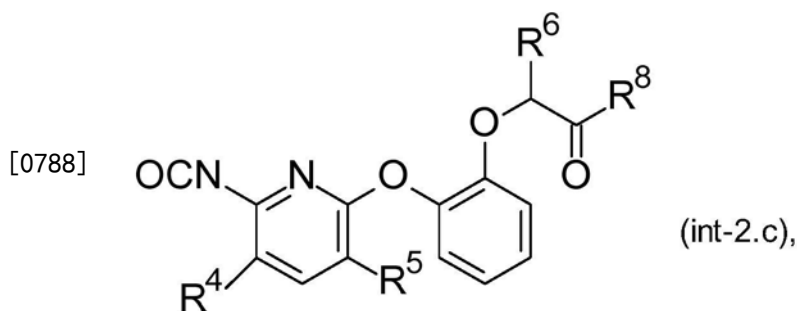
[0783] 其中变量 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 和 $R^8$ 具有如上所定义的含义,尤其是优选的含义。

[0784] 特别优选式(int-2.a.1) - (int-2.a.672)的中间体,优选式(int-2.a.1) - (int-2.a.504)的中间体,其中变量 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 和 $R^8$ 的定义如上面在表A中所定义。

[0785] 还优选式(int-2.b)的中间体,优选式(int-2.b.1) - (int-2.b.672)的中间体,特别优选式(int-2.b.1) - (int-2.b.504)的中间体,其与式(int-2.a.1) - (int-2.a.672)的相应中间体的不同仅在于Z为Z-7,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 和 $R^c$ 为H:

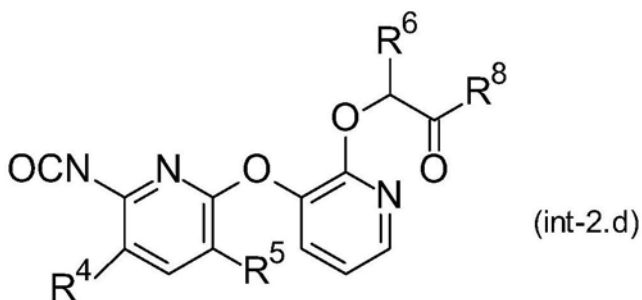


[0787] 还优选式(int-2.c)的中间体,优选式(int-2.c.1) - (int-2.c.672)的中间体,特别优选式(int-2.c.1) - (int-2.c.504)的中间体,其与式(int-2.a.1) - (int-2.a.672)的相应中间体的不同仅在于 $I^2$ 和 $I^3$ 与它们所连接的N原子一起形成基团“OCN”:



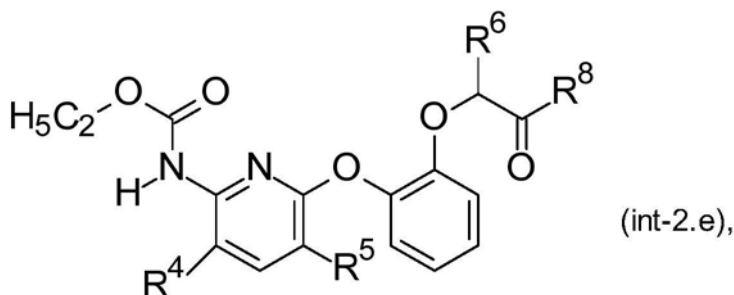
[0789] 还优选式(int-2.d)的中间体,优选式(int-2.d.1) - (int-2.d.672)的中间体,特别优选式(int-2.d.1) - (int-2.d.504)的中间体,其与式(int-2.a.1) - (int-2.a.672)的相应中间体的不同仅在于Z为Z-7,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 和 $R^c$ 为H且 $I^2$ 和 $I^3$ 与它们所连接的N原子一起形成基团“OCN”:

[0790]



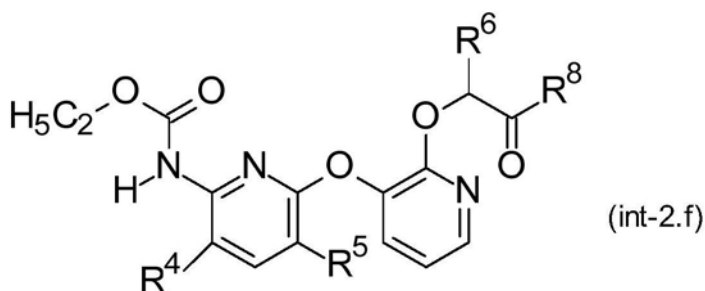
[0791] 还优选式 (int-2.e) 的中间体, 优选式 (int-2.e.1) - (int-2.e.672) 的中间体, 特别优选式 (int-2.e.1) - (int-2.e.672) 的中间体, 其与式 (int-2.a.1) - (int-2.a.504) 的相应中间体的不同仅在于 I<sup>3</sup> 为 (CO)OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>:

[0792]



[0793] 还优选式 (int-2.f) 的中间体, 优选式 (int-2.f.1) - (int-2.f.672) 的中间体, 特别优选式 (int-2.f.1) - (int-2.f.504) 的中间体, 其与式 (int-2.a.1) - (int-2.a.672) 的相应中间体的不同仅在于 Z 为 Z-7, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>c</sup> 为 H 且 I<sup>3</sup> 为 (CO)OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>:

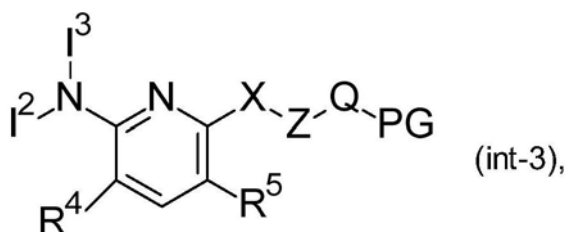
[0794]



[0795] 组合了式 (XX) 的 (硫代) 氨基甲酸酯、式 (XXIV) 的异 (硫) 氰酸酯、式 (XXI) 的胺和式 (XXII) 的吡啶的式 (int-3) 的中间体是新化合物并且如上所示为适合制备本发明式 (I) 的尿嘧啶吡啶类的中间体。

[0796] 因此, 本发明还提供了式 (int-3) 的中间体:

[0797]



[0798] 其中各取代基具有下列含义:

[0799] R<sup>4</sup>: H 或卤素;

[0800] R<sup>5</sup>: 卤素、CN、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub> 或 C(=S)NH<sub>2</sub>;

[0801] Q: O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NH 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)N;

[0802] X:O或S;

[0803] Z:苯基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基,它们各自任选被1-4个选自卤素、CN、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基的取代基取代;

[0804] PG为选自 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 氰基烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、三- $C_1-C_6$ 烷基甲硅烷基- $C_1-C_4$ 烷基、三- $C_1-C_6$ 烷基甲硅烷基- $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、 $C_3-C_6$ 炔基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_5-C_6$ 环烯基、四氢吡喃基、三- $C_1-C_6$ 烷基甲硅烷基、(二苯基)( $C_1-C_4$ 烷基)甲硅烷基、甲酰基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基、 $C_1-C_6$ 烷基-0-羰基、 $C_2-C_6$ 链烯基-0-羰基、(二苯基)( $C_1-C_4$ 烷基)甲硅烷基- $C_1-C_4$ 烷基、苯基- $C_1-C_4$ 烷基、苯硫基- $C_1-C_6$ 烷基、苯基羰基的保护基团,其中各苯基环可以被1-3个选自卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1-C_4$ 烷基和 $C_1-C_4$ 烷氧基的取代基取代;

[0805]  $I^2$ :H;

[0806]  $I^3$ :H或 $C(=Y)L^2$ ,其中

[0807] Y为O或S,以及

[0808]  $L^2$ 为可亲核置换的离去基团,优选 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_6$ 烷硫基或芳氧基,其中芳基结构部分本身可以部分或完全被卤代和/或可以被1-3个选自氰基、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基和 $C_1-C_4$ 烷硫基的取代基取代;

[0809] 或者 $I^2$ 和 $I^3$ 与它们所连接的N原子一起形成基团“YCN”,

[0810] 其中Y为O或S,

[0811] 或基团“PGN”,其为选自 $N_3$ 、脂族或芳族氨基甲酸酯、脂族或芳族酰胺、N- $C_1-C_6$ 烷基胺、N-芳基胺或杂芳基酰胺的被保护胺取代基,

[0812] 包括其盐。

[0813] 优选如下那些式(int-3)的中间体,其中PG为 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、三- $C_1-C_6$ 烷基甲硅烷基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_2-C_6$ 链烯基、四氢吡喃基、三- $C_1-C_6$ 烷基甲硅烷基、(二苯基)( $C_1-C_4$ 烷基)甲硅烷基或苯基- $C_1-C_4$ 烷基。

[0814] 优选如下那些式(int-3)的中间体,其中

[0815] PGN选自 $N_3$ 、 $C_1-C_6$ 烷基-0(CO)NH-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基-0(CO)-NH-、三- $C_1-C_6$ 烷基-Si- $C_1-C_6$ 烷基-0(CO)NH-、 $C_2-C_6$ 链烯基-0(CO)NH-、 $C_3-C_6$ 炔基-0(CO)NH-、 $C_3-C_6$ 环烷基-0(CO)NH-、苄基甲基-0(CO)NH-、H(CO)N-、 $C_1-C_6$ 烷基-(CO)-NH-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基-(CO)-NH-、 $C_1-C_6$ 烷基-NH-、二- $C_1-C_6$ 烷基-N-、( $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基)NH-、二( $C_1-C_6$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基)N-、 $C_2-C_6$ 链烯基-NH-、二( $C_2-C_6$ 链烯基)N-、三- $C_1-C_4$ 烷基-Si- $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基-NH-、二[三- $C_1-C_4$ 烷基-Si- $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基]N-、苄基甲基-NH-、二(苄基甲基)N-、N-苯邻二甲酰亚胺、N-2,3-二甲基马来酰亚胺或N-2,5-二甲基吡咯、苯基-0(CO)NH-、苯基- $C_1-C_4$ 烷基-0(CO)NH-、苯基-(CO)NH-、苯基- $C_1-C_6$ 烷基-(CO)NH-、吡啶基-(CO)-NH-、邻-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基-NH-、二[邻-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基]N-、对-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基-NH-、二[对-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基]N-、苯基- $C_1-C_4$ 烷基-NH-、二(苯基- $C_1-C_4$ 烷基)N-、对-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基- $C_1-C_4$ 烷基-NH-、二[对-( $C_1-C_4$ 烷氧基)苯基- $C_1-C_4$ 烷基]N-、其中苯基或吡啶基环各自可以被1-3个选自卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基和 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基的取代基取代;

[0816] 更优选PGN选自 $C_1-C_6$ 烷基-0(CO)NH-、苄基甲基-0(CO)NH-、H(CO)N-、 $C_1-C_6$ 烷基-(CO)-NH-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基-(CO)-NH-、N-苯邻二甲酰亚胺、苯基-0(CO)NH-、苯基- $C_1-C_4$ 烷基-0

(CO)NH-、苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-NH-、二(苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)N-

[0817] 其中苯基或吡啶基环各自可以被1-3个C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基取代基取代。

[0818] 式(int-3)的中间体的合适盐包括所述酰胺或氨基甲酸酯衍生物的NH<sub>4</sub><sup>+</sup>、Li<sup>+</sup>、Na<sup>+</sup>、K<sup>+</sup>或Mg<sup>2+</sup>盐。

[0819] 特别优选那些其中I<sup>2</sup>和I<sup>3</sup>为H的式(int-3)的中间体。

[0820] 对于各变量,式(int-3)的中间体的特别优选实施方案相互独立地或者相互组合地对应于式(I)的尿嘧啶吡啶类的变量R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、Q、X、Y和Z的那些,或者相互独立地或者相互组合地具有下列含义:

[0821] R<sup>4</sup>为H、F或Cl;

[0822] R<sup>5</sup>为F、Cl、Br或CN;

[0823] Q为O或S;

[0824] X为O;

[0825] Y为O;

[0826] Z选自如上所定义的Z<sup>1</sup>、Z<sup>4</sup>、Z<sup>5</sup>、Z<sup>6</sup>、Z<sup>7</sup>和Z<sup>21</sup>,其中R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>和R<sup>e</sup>相互独立地为H、卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基;

[0827] PG为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、三-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基甲硅烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基或四氢吡喃基;

[0828] I<sup>2</sup>为H;以及

[0829] I<sup>3</sup>为H或C(=Y)L<sup>2</sup>,其中Y为O且L<sup>2</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>烷氧基,

[0830] 或者I<sup>2</sup>和I<sup>3</sup>与它们所连接的N原子一起形成选自“YCN”的基团,其中Y为O,

[0831] 包括式(int-3)的中间体的盐;

[0832] 优选R<sup>4</sup>为H、F或Cl;

[0833] R<sup>5</sup>为F、Cl或CN;

[0834] Q为O或S;

[0835] X为O;

[0836] Y为O;

[0837] Z选自如上所定义的Z<sup>1</sup>、Z<sup>4</sup>、Z<sup>5</sup>、Z<sup>6</sup>和Z<sup>7</sup>,其中R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>和R<sup>e</sup>相互独立地为H、卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基;

[0838] PG为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、三-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基甲硅烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>链烯基或四氢吡喃基;

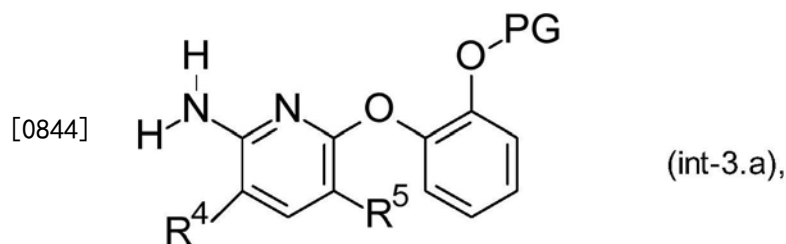
[0839] I<sup>2</sup>为H;以及

[0840] I<sup>3</sup>为H或C(=Y)L<sup>2</sup>,其中Y为O且L<sup>2</sup>为C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>烷氧基,

[0841] 或者I<sup>2</sup>和I<sup>3</sup>与它们所连接的N原子一起形成选自“YCN”的基团,其中Y为O,

[0842] 包括式(int-3)的中间体的盐。

[0843] 特别优选式(int-3.a)的中间体(对应于式(int-3),其中Q和X为O,Z为如上所定义的Z-1,其中R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>和R<sup>d</sup>为H且I<sup>2</sup>和I<sup>3</sup>为H):



[0845] 其中变量 $R^4$ 、 $R^5$ 和PG具有如上所定义的含义,尤其是优选含义。

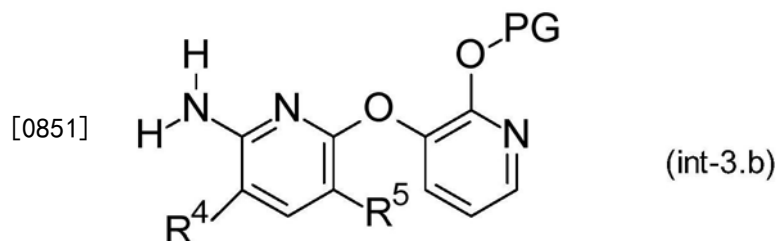
[0846] 特别优选表I-3的式(int-3.a.1) - (int-3.a.14)的中间体,优选式(int-3.a.1) - (int-3.a.12)的中间体,其中变量 $R^4$ 、 $R^5$ 和PG的定义不仅相互组合而且在每种情况下还独立地对于本发明化合物而言特别重要:

[0847] 表I-3

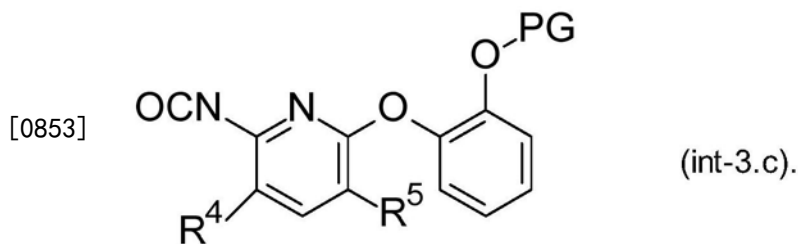
[0848]

序号	$R^4$	$R^5$	PG
int-3.a.1.	H	F	CH <sub>3</sub>
int-3.a.2.	H	F	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-3.a.3.	H	Cl	CH <sub>3</sub>
int-3.a.4.	H	Cl	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-3.a.5.	H	CN	CH <sub>3</sub>
int-3.a.6.	H	CN	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-3.a.7.	F	F	CH <sub>3</sub>
[0849] int-3.a.8.	F	F	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-3.a.9.	F	Cl	CH <sub>3</sub>
int-3.a.10.	F	Cl	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-3.a.11.	F	CN	CH <sub>3</sub>
int-3.a.12.	F	CN	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
int-3.a.13.	H	Br	CH <sub>3</sub>
int-3.a.14.	F	Br	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>

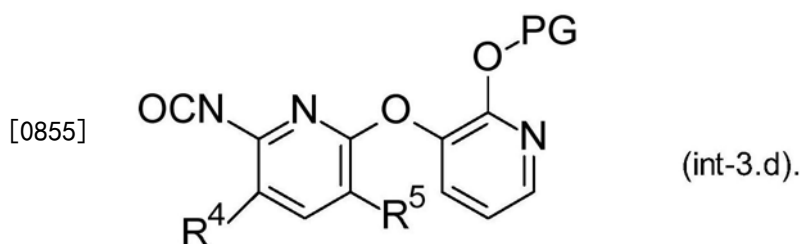
[0850] 还优选式(int-3.b)的中间体,优选式(int-3.b.1) - (int-3.b.14)的中间体,特别优选式(int-3.b.1) - (int-3.b.12)的中间体,其与式(int-3.a.1) - (int-3.a.14)的相应中间体的不同仅在于Z为Z-7,其中 $R^a$ 、 $R^b$ 和 $R^c$ 为H:



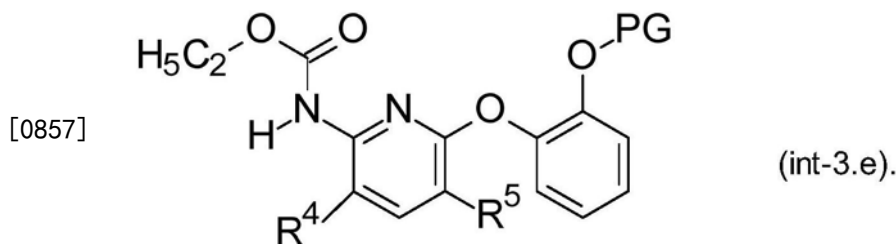
[0852] 还优选式(int-3.c)的中间体,优选式(int-3.c.1) - (int-3.c.14)的中间体,特别优选式(int-3.c.1) - (int-3.c.12)的中间体,其与式(int-3.a.1) - (int-3.a.14)的相应中间体的不同仅在于I<sup>2</sup>和I<sup>3</sup>与它们所连接的N原子一起形成基团“OCN”:



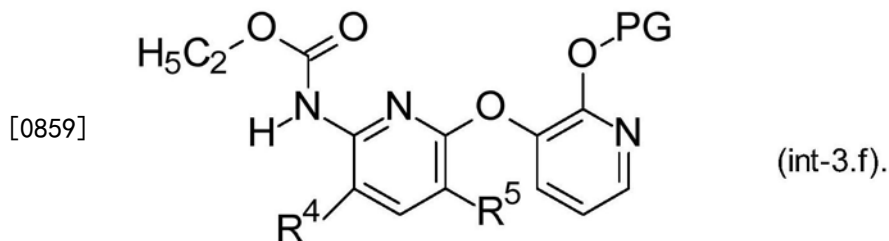
[0854] 还优选式 (int-3.d) 的中间体, 优选式 (int-3.d.1) - (int-3.d.14) 的中间体, 特别优选式 (int-3.d.1) - (int-3.d.12) 的中间体, 其与式 (int-3.a.1) - (int-3.a.14) 的相应中间体的不同仅在于 Z 为 Z-7, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>c</sup> 为 H 且 I<sup>2</sup> 和 I<sup>3</sup> 与它们所连接的 N 原子一起形成基团 “OCN”:



[0856] 还优选式 (int-3.e) 的中间体, 优选式 (int-3.e.1) - (int-3.e.14) 的中间体, 特别优选式 (int-3.e.1) - (int-3.e.12) 的中间体, 其与式 (int-3.a.1) - (int-3.a.14) 的相应中间体的不同仅在于 I<sup>3</sup> 为 (CO)OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>:



[0858] 还优选式 (int-3.f) 的中间体, 优选式 (int-3.f.1) - (int-3.f.14) 的中间体, 特别优选式 (int-3.f.1) - (int-3.f.12) 的中间体, 其与式 (int-3.a.1) - (int-3.a.14) 的相应中间体的不同仅在于 Z 为 Z-7, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>c</sup> 为 H 且 I<sup>3</sup> 为 (CO)OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>:



[0860] 为了拓宽作用谱并实现协同增效效果, 可以将式 (I) 的尿嘧啶吡啶类与大量其他除草或生长调节活性成分组的代表混合并随后同时施用。

[0861] 适合混合物的组分例如为选自如下类别的除草剂: 乙酰胺类、酰胺类、芳氧基苯氧基丙酸酯类、苯甲酰胺类、苯并咪唑、苯甲酸类、苯并噻二嗪酮类、联吡啶<sup>噻</sup>、氨基甲酸酯类、氯代乙酰胺类、氯代羧酸、环己烷二酮类、二硝基苯胺类、二硝基苯酚、二苯基醚、甘氨酸类、咪唑啉酮类、异噁<sup>噻</sup>唑类、异噁<sup>噻</sup>唑烷酮类、腈类、N-苯基苯邻二甲酰亚胺类、噁<sup>噻</sup>二唑类、

噁唑烷二酮类、羟乙酰胺类、苯氧基羧酸类、苯基氨基甲酸酯类、苯基吡唑类、苯基吡唑啉类、苯基哒嗪类、次膦酸类、氨基磷酸酯类、二硫代磷酸酯类、邻氨甲酰苯甲酸酯类、吡唑类、哒嗪酮类、吡啶类、吡啶羧酸类、吡啶羧酰胺类、嘧啶二酮类、嘧啶基(硫代)苯甲酸酯类、喹啉羧酸类、缩氨基脲类、磺酰氨基羰基三唑啉酮类、磺酰脲类、四唑啉酮类、噁二唑类、硫代氨基甲酸酯类、三嗪类、三嗪酮类、三唑类、三唑啉酮类、三唑并羧酰胺类、三唑并嘧啶类、三酮类、尿嘧啶类、脲类。

[0862] 此外,可能有益的是单独或与其他除草剂组合或者以与其他作物保护剂的混合物形式,例如与防治害虫或植物病原性真菌或细菌的试剂一起施用式(I)的尿嘧啶吡啶类。还令人感兴趣的是与用于处理营养和痕量元素缺乏的无机盐溶液的溶混性。还可以加入其他添加剂如非植物毒性油和油浓缩物。

[0863] 在本发明的一个实施方案中,本发明组合物包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(化合物A)以及至少一种选自除草剂B,优选b1)-b15)组除草剂B和安全剂C(化合物C)的其他活性化合物。

[0864] 在本发明的另一实施方案中,本发明组合物包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶和至少一种其他活性化合物B(除草剂B)。

[0865] 该其他除草化合物B(组分B)优选选自b1)-b15)组除草剂:

[0866] b1) 类脂生物合成抑制剂;

[0867] b2) 乙酰乳酸合成酶抑制剂(ALS抑制剂);

[0868] b3) 光合成抑制剂;

[0869] b4) 原卟啉原-IX氧化酶抑制剂,

[0870] b5) 漂白剂除草剂;

[0871] b6) 烯醇丙酮酰莽草酸3-磷酸合成酶抑制剂(EPSP抑制剂);

[0872] b7) 谷氨酰胺合成酶抑制剂;

[0873] b8) 7,8-二氢蝶酸合成酶抑制剂(DHP抑制剂);

[0874] b9) 有丝分裂抑制剂;

[0875] b10) 非常长链脂肪酸合成抑制剂(VLCFA抑制剂);

[0876] b11) 纤维素生物合成抑制剂;

[0877] b12) 去偶剂除草剂;

[0878] b13) 植物生长素除草剂;

[0879] b14) 植物生长素输送抑制剂;以及

[0880] b15) 选自如下的其他除草剂:溴丁酰草胺(bromobutide)、氯甲丹(chlorflurenol)、氯甲丹(chlorflurenol-methyl)、环庚草醚(cinmethylin)、苜草隆(cumyluron)、茅草枯(dalapon)、棉隆(dazomet)、苯敌快(difenzoquat)、苯敌快(difenzoquat-metilsulfate)、噁节因(dimethipin)、甲腈钠(DSMA)、香草隆(dymron)、敌草腈(endothal)及其盐、乙苯酰草(etobenzanid)、氟燕灵(flamprop)、氟燕灵(flamprop-isopropyl)、甲氟燕灵(flamprop-methyl)、强氟燕灵(flamprop-M-isopropyl)、麦草伏(flamprop-M-methyl)、抑草丁(flurenol)、抑草丁(flurenol-butyl)、调啞醇(flurprimidol)、膦胺素(fosamine)、膦胺素(fosamine-ammonium)、茛草酮(indanofan)、茛嗪氟草胺(indaziflam)、抑芽丹(maleic hydrazide)、氟草磺(mefluidide)、威百亩

(metam)、methiozolin (CAS 403640-27-7)、叠氮甲烷 (methylazide)、溴甲烷 (methyl bromide)、苯丙隆 (methyl-dymron)、碘甲烷 (methyl iodide)、甲胍一钠 (MSMA)、油酸 (oleic acid)、氯噁嗪草 (oxaziclomefone)、壬酸 (pelargonic acid)、稗草畏 (pyributicarb)、灭藻醌 (quinoclamine)、苯氧丙胺津 (triaziflam)、灭草环 (tridiphane) 和 6-氯-3-(2-环丙基-6-甲基苯氧基)-4-吡嗪醇 (CAS 499223-49-3) 及其盐和酯;

[0881] 包括其可农用盐或衍生物。

[0882] 优选那些包含至少一种选自 b2、b3、b4、b5、b6、b7、b9、b10 和 b13 类除草剂的除草剂 B 的本发明组合物。

[0883] 具体优选那些包含至少一种选自 b4、b6、b7、b9、b10 和 b13 类除草剂的除草剂 B 的本发明组合物。

[0884] 特别优选那些包含至少一种选自 b4、b6、b10 和 b13 类除草剂的除草剂 B 的本发明组合物。

[0885] 可以与本发明式 (I) 的尿嘧啶吡啶类组合使用的除草剂 B 的实例为:

[0886] b1) 选自如下的类脂生物合成抑制剂: ACC 除草剂如 枯杀达 (alloxydim)、枯杀达 (alloxydim-sodium)、丁氧环酮 (butoxydim)、烯草酮 (clethodim)、炔草酯 (clodinafop)、炔草酯 (clodinafop-propargyl)、噁草酮 (cycloxydim)、氰氟草酯 (cyhalofop)、氰氟草酯 (cyhalofop-butyl)、氯甲草 (diclofop)、禾草灵 (diclofop-methyl)、噁唑禾草灵 (fenoxaprop)、噁唑禾草灵 (fenoxaprop-ethyl)、高噁唑禾草灵 (fenoxaprop-P)、高噁唑禾草灵 (fenoxaprop-P-ethyl)、吡氟禾草灵 (fluzifop)、吡氟禾草灵 (fluzifop-butyl)、精吡氟禾草灵 (fluzifop-P)、精吡氟禾草灵 (fluzifop-P-butyl)、吡氟氯禾灵 (haloxyfop)、吡氟氯禾灵 (haloxyfop-methyl)、精吡氟氯禾灵 (haloxyfop-P)、精吡氟氯禾灵 (haloxyfop-P-methyl)、噁唑酰草胺 (metamifop)、唑啉草酯 (pinoxaden)、环苯草酮 (profoxydim)、啻草酯 (propaquizafop)、喹禾灵 (quizalofop)、喹禾灵 (quizalofop-ethyl)、喹禾灵 (四氢糠基酯) (quizalofop-tefuryl)、精喹禾灵 (quizalofop-P)、精喹禾灵 (quizalofop-P-ethyl)、精喹禾灵 (四氢糠基酯) (quizalofop-P-tefuryl)、稀禾定 (sethoxydim)、酞肟草 (tepraloxym)、肟草酮 (tralkoxydim)、4-(4'-氯-4-环丙基-2'-氟[1,1'-联苯]-3-基)-5-羟基-2,2,6,6-四甲基-2H-吡喃-3(6H)-酮 (CAS 1312337-72-6)、4-(2',4'-二氯-4-环丙基[1,1'-联苯]-3-基)-5-羟基-2,2,6,6-四甲基-2H-吡喃-3(6H)-酮 (CAS 1312337-45-3)、4-(4'-氯-4-乙基-2'-氟[1,1'-联苯]-3-基)-5-羟基-2,2,6,6-四甲基-2H-吡喃-3(6H)-酮 (CAS 1033757-93-5)、4-(2',4'-二氯-4-乙基[1,1'-联苯]-3-基)-2,2,6,6-四甲基-2H-吡喃-3,5(4H,6H)-二酮 (CAS 1312340-84-3)、5-乙酰氧基-4-(4'-氯-4-环丙基-2'-氟[1,1'-联苯]-3-基)-3,6-二氢-2,2,6,6-四甲基-2H-吡喃-3-酮 (CAS 1312337-48-6)、5-乙酰氧基-4-(2',4'-二氯-4-环丙基-[1,1'-联苯]-3-基)-3,6-二氢-2,2,6,6-四甲基-2H-吡喃-3-酮、5-乙酰氧基-4-(4'-氯-4-乙基-2'-氟[1,1'-联苯]-3-基)-3,6-二氢-2,2,6,6-四甲基-2H-吡喃-3-酮 (CAS 1312340-82-1)、5-乙酰氧基-4-(2',4'-二氯-4-乙基[1,1'-联苯]-3-基)-3,6-二氢-2,2,6,6-四甲基-2H-吡喃-3-酮 (CAS 1033760-55-2)、4-(4'-氯-4-环丙基-2'-氟[1,1'-联苯]-3-基)-5,6-二氢-2,2,6,6-四甲基-5-氧代-2H-吡喃-3-基甲酸甲酯 (CAS 1312337-51-1)、4-(2',4'-二氯-4-环丙基-[1,1'-联苯]-

3-基)-5,6-二氢-2,2,6,6-四甲基-5-氧代-2H-吡喃-3-基甲酸甲酯、4-(4'-氯-4-乙基-2'-氟[1,1'-联苯]-3-基)-5,6-二氢-2,2,6,6-四甲基-5-氧代-2H-吡喃-3-基甲酸甲酯(CAS1312340-83-2)、4-(2',4'-二氯-4-乙基[1,1'-联苯]-3-基)-5,6-二氢-2,2,6,6-四甲基-5-氧代-2H-吡喃-3-基甲酸甲酯(CAS 1033760-58-5);以及非ACC除草剂如呋草黄(benfuresate)、苏达灭(butylate)、草灭特(cycloate)、茅草枯(dalapon)、哌草丹(dimepiperate)、扑草灭(EPTC)、禾草畏(esprocarb)、乙呋草黄(ethofumesate)、四氟丙酸(flupropanate)、草达灭(molinate)、坪草丹(orbencarb)、克草猛(pebulate)、苜草丹(prosulfocarb)、TCA、杀草丹(thiobencarb)、丁草威(tiocarbazil)、野麦畏(triallate)和灭草猛(vernolate);

[0887] b2) 选自如下的ALS抑制剂:磺酰胺类,如磺氨黄隆(amidosulfuron)、四唑黄隆(azimsulfuron)、苜嘧黄隆(bensulfuron)、苜嘧黄隆(bensulfuron-methyl)、氯嘧黄隆(chlorimuron)、氯嘧黄隆(chlorimuron-ethyl)、绿黄隆(chlorsulfuron)、醚黄隆(cinosulfuron)、环丙黄隆(cyclosulfamuron)、胺苯黄隆(ethametsulfuron)、胺苯黄隆(ethametsulfuron-methyl)、乙氧嘧黄隆(ethoxysulfuron)、啶嘧黄隆(flazasulfuron)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氟定黄隆(flupyrsulfuron)、氟定黄隆(flupyrsulfuron-methyl-sodium)、甲酰氨磺隆(foramsulfuron)、吡氯黄隆(halosulfuron)、吡氯黄隆(halosulfuron-methyl)、啶咪黄隆(imazosulfuron)、碘黄隆(iodosulfuron)、碘甲黄隆钠(iodosulfuron-methyl-sodium)、iofensulfuron、iofensulfuron-sodium、甲基二磺隆(mesosulfuron)、metazosulfuron、甲黄隆(metsulfuron)、甲黄隆(metsulfuron-methyl)、烟嘧黄隆(nicosulfuron)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、环丙氧黄隆(oxasulfuron)、氟嘧黄隆(primisulfuron)、氟嘧黄隆(primisulfuron-methyl)、propyrisulfuron、氟丙黄隆(prosulfuron)、吡嘧黄隆(pyrazosulfuron)、吡嘧黄隆(pyrazosulfuron-ethyl)、玉嘧黄隆(rimsulfuron)、嘧黄隆(sulfometuron)、嘧黄隆(sulfometuron-methyl)、乙黄黄隆(sulfosulfuron)、噻黄隆(thifensulfuron)、噻黄隆(thifensulfuron-methyl)、醚苯黄隆(triasulfuron)、苯黄隆(tribenuron)、苯黄隆(tribenuron-methyl)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、氟胺磺隆(triflusulfuron-methyl)和三氟甲磺隆(tritosulfuron),咪唑啉酮类如咪草酯(imazamethabenz)、咪草酯(imazamethabenz-methyl)、咪草啶酸(imazamox)、甲基咪草烟(imazapic)、灭草烟(imazapyr)、灭草啶(imazaquin)和咪草烟(imazethapyr),三唑并嘧啶类除草剂和磺酰苯胺类如啶嘧磺胺酸(cloransulam)、啶嘧磺胺盐(cloransulam-methyl)、啶嘧磺胺(diclosulam)、氟啶啶草(flumetsulam)、双氟磺草胺(florasulam)、啶草磺胺(metosulam)、五氟磺草胺(penoxsulam)、pyrimisulfan和啶磺草胺(pyroxulam),嘧啶基苯甲酸酯类如双嘧苯甲酸(bispyribac)、双嘧苯甲酸钠(bispyribac-sodium)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、环酯草醚(pyriftalid)、肟啶草(pyriminobac)、肟啶草(pyriminobac-methyl)、嘧硫苯甲酸(pyriithiobac)、嘧硫苯甲酸钠(pyriithiobac-sodium)、4-[[[2-(4,6-二甲氧基-2-嘧啶基)氧基]苯基]甲基]氨基]苯甲酸1-甲基乙基酯(CAS 420138-41-6)、4-[[[2-(4,6-二甲氧基-2-嘧啶基)氧基]苯基]甲基]氨基]苯甲酸丙基酯(CAS 420138-40-5)、N-(4-溴苯基)-2-[(4,6-二甲氧基-2-嘧啶基)氧基]苯甲胺(CAS 420138-01-8),磺酰氨基羰基三唑啉酮类除草剂如氟酮磺隆(flucarbazone)、氟酮磺隆钠(flucarbazone-

sodium)、丙苯磺隆(propoxycarbazone)、丙苯磺隆(propoxycarbazone-sodium)、thiencarbazone和thiencarbazone-methyl,以及氟酮磺草胺(triafalone);其中本发明的优选实施方案涉及包含至少一种咪唑啉酮类除草剂的那些组合物;

[0888] b3)选自如下的光合成抑制剂:胺唑草酮(amicarbazone),光合系统II抑制剂,例如1-(6-叔丁基嘧啶-4-基)-2-羟基-4-甲氧基-3-甲基-2H-吡咯-5-酮(CAS 1654744-66-7)、1-(5-叔丁基异噁唑-3-基)-2-羟基-4-甲氧基-3-甲基-2H-吡咯-5-酮(CAS 1637455-12-9)、1-(5-叔丁基异噁唑-3-基)-4-氯-2-羟基-3-甲基-2H-吡咯-5-酮(CAS 1637453-94-1)、1-(5-叔丁基-1-甲基-吡唑-3-基)-4-氯-2-羟基-3-甲基-2H-吡咯-5-酮(CAS 1654057-29-0)、1-(5-叔丁基-1-甲基-吡唑-3-基)-3-氯-2-羟基-4-甲基-2H-吡咯-5-酮(CAS 1654747-80-4)、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(CAS 2023785-78-4)、4-羟基-1,5-二甲基-3-[4-三氟甲基-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮(CAS 2023785-79-5)、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(CAS 1701416-69-4)、4-羟基-1-甲基-3-[4-三氟甲基-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮(CAS 1708087-22-2)、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(CAS 2023785-80-8)、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(CAS 1844836-64-1),三嗪类除草剂,包括氯代三嗪类、三嗪酮类、三嗪二酮类、甲硫基三嗪类和吡嗪酮类,如莠灭净(ametryn)、莠去津(atrazine)、杀草敏(chloridazone)、草净津(cyanazine)、敌草净(desmetryn)、戊草津(dimethametryn)、六嗪同(hexazinone)、赛克津(metribuzin)、扑灭通(prometon)、扑草净(prometryn)、扑灭津(propazine)、西玛津(simazine)、西草净(simetryn)、甲氧去草净(terbutryn)、特丁津(terbutylazin)、去草净(terbutryn)和草达津(trietazin);芳基脲类如氯溴隆(chlorobromuron)、绿麦隆(chlorotoluron)、枯草隆(chloroxuron)、丁噁隆(dimefuron)、敌草隆(diuron)、伏草隆(fluometuron)、异丙隆(isoproturon)、异恶隆(isouron)、利谷隆(linuron)、苯嗪草(metamitron)、噁唑隆(methabenzthiazuron)、色满隆(metobenzuron)、甲氧隆(metoxuron)、绿谷隆(monolinuron)、草不隆(neburon)、环草隆(siduron)、丁唑隆(tebuthiuron)和赛二唑素(thidiazuron),苯基氨基甲酸酯类如异苯敌草(desmedipham)、卡草灵(karbutilat)、苯敌草(phenmedipham)、乙苯敌草(phenmedipham-ethyl),腈类除草剂如杀草全(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)及其盐和酯、碘苯腈(ioxynil)及其盐和酯,尿嘧啶类如除草定(bromacil)、环草定(lenacil)和特草定(terbacil),以及噁草平(bentazon)和噁草平(bentazon-sodium),达草止(pyridate)、pyridafol、蔬草灭(pentachlor)和敌稗(propanil)以及光合系统I抑制剂如敌草快阳离子(diquat)、敌草快(diquat-dibromide)、对草快阳离子(paraquat)、对草快(paraquat-dichloride)和对草快(paraquat-dimethylsulfate)。其中本发明的优选实施方案涉及包含至少一种芳基脲类除草剂的那些组合物。其中本发明的优选实施方案同样涉及包含至少一种三嗪类除草剂的那些组合物。其中本发明的优选实施方案同样涉及包含至少一种腈类除草剂的那些组合物;

[0889] b4)选自如下的原卟啉原-IX氧化酶抑制剂:氟锁草醚(acifluorfen)、氟锁草醚(acifluorfen-sodium)、唑啉炔草(azafenidin)、bencarbazone、双苯嘧草酮

(benzfendizone)、治草醚(bifenox)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、氟酮唑草(carfentrazone)、氟酮唑草(carfentrazone-ethyl)、氯硝醚(chlomethoxyfen)、chlorphtalim、吡啶酮草酯(cinidon-ethyl)、异丙吡草酯(fluzolate)、氟吡嗪草酯(flufenpyr)、氟吡嗪草酯(flufenpyr-ethyl)、酰亚胺苯氧乙酸(flumiclorac)、酰亚胺苯氧乙酸戊酯(flumiclorac-pentyl)、氟噁嗪酮(flumioxazin)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen-ethyl)、达草氟(fluthiacet)、达草氟(fluthiacet-methyl)、氟黄胺草醚(fomesafen)、氟硝磺酰胺(halosafen)、乳氟禾草灵(lactofen)、炔丙噁唑草(oxadiargyl)、恶草灵(oxadiazon)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、戊噁唑草(pentoxazone)、氟唑草胺(profluzol)、双唑草腈(pyraclonil)、氟唑草酯(pyraflufen)、氟唑草酯(pyraflufen-ethyl)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、磺胺草唑(sulfentrazone)、噻二唑胺(thidiazimin)、tiafenacil、trifludimoxazin、[3-[2-氯-4-氟-5-(1-甲基-6-三氟甲基-2,4-二氧代-1,2,3,4-四氢嘧啶-3-基)苯氧基]-2-吡啶氧基]乙酸乙酯(CAS 353292-31-6;S-3100)、N-乙基-3-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯氧基)-5-甲基-1H-吡唑-1-甲酰胺(CAS 452098-92-9)、N-四氢糠基-3-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯氧基)-5-甲基-1H-吡唑-1-甲酰胺(CAS 915396-43-9)、N-乙基-3-(2-氯-6-氟-4-三氟甲基苯氧基)-5-甲基-1H-吡唑-1-甲酰胺(CAS 452099-05-7)、N-四氢糠基-3-(2-氯-6-氟-4-三氟甲基苯氧基)-5-甲基-1H-吡唑-1-甲酰胺(CAS 452100-03-7)、3-[7-氟-3-氧代-4-(丙-2-炔基)-3,4-二氢-2H-苯并[1,4]噁嗪-6-基]-1,5-二甲基-6-硫代-[1,3,5]三嗪烷(triazinan)-2,4-二酮(CAS 451484-50-7)、2-(2,2,7-三氟-3-氧代-4-丙-2-炔基-3,4-二氢-2H-苯并[1,4]噁嗪-6-基)-4,5,6,7-四氢异吡啶-1,3-二酮(CAS 1300118-96-0)、1-甲基-6-三氟甲基-3-(2,2,7-三氟-3-氧代-4-丙-2-炔基-3,4-二氢-2H-苯并[1,4]噁嗪-6-基)-1H-嘧啶-2,4-二酮(CAS 1304113-05-0)、(E)-4-[2-氯-5-(4-氯-5-二氟甲氧基-1H-甲基吡唑-3-基)-4-氟苯氧基]-3-甲氧基丁-2-烯酸甲酯(CAS 948893-00-3)和3-[7-氯-5-氟-2-三氟甲基-1H-苯并咪唑-4-基]-1-甲基-6-三氟甲基-1H-嘧啶-2,4-二酮(CAS 212754-02-4)；

[0890] b5) 选自如下的漂白剂除草剂:PDS抑制剂:氟丁酰草胺(beflubutamid)、吡氟草胺(diflufenican)、氟草同(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、呋草酮(flurtamone)、达草灭(norflurazon)、氟吡酰草胺(picolinafen)和4-(3-三氟甲基苯氧基)-2-(4-三氟甲基苯基)嘧啶(CAS 180608-33-7),HPPD抑制剂:苯并双环酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟吡草酮(bicyclopyrone)、异恶草酮(clomazone)、fenquinotrione、异噁氟草(isoxaflutole)、甲基磺草酮(mesotrione)、oxotrione(CAS 1486617-21-3)、pyrasulfotole、吡唑特(pyrazolynate)、苜草唑(pyrazoxyfen)、磺草酮(sulcotrione)、tefuryltrione、tembotrione、tolpyralate、托普拉威(topramezone),漂白剂,未知目标:苯草醚(aclonifen)、杀草强(amitrole)、flumeturon和2-氯-3-甲硫基-N-(1-甲基四唑-5-基)-4-三氟甲基苯甲酰胺(CAS 1361139-71-0)、2-(2,4-二氯苯基)甲基-4,4-二甲基-3-异噁唑烷酮(CAS 81777-95-9)和2-(2,5-二氯苯基)甲基-4,4-二甲基-3-异噁唑烷酮(CAS 81778-66-7)；

[0891] b6) 选自如下的EPSP合成酶抑制剂:草甘膦(glyphosate)、草甘膦异丙胺盐

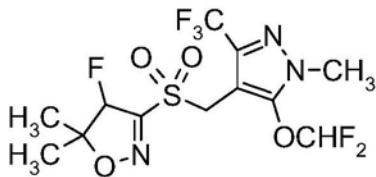
(glyphosate-isopropylammonium)、草甘膦钾和草硫膦(glyphosate-trimesium)(sulfosate)；

[0892] b7) 选自如下的谷氨酰胺合成酶抑制剂：双丙氨酰膦(bilanaphos(bialaphos))、双丙氨酰膦(bilanaphos-sodium)、草铵膦(glufosinate)、草铵膦(glufosinate-P)和草铵膦铵盐(glufosinate-ammonium)；

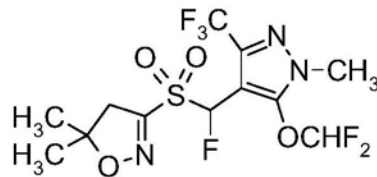
[0893] b8) 选自如下的DHP合成酶抑制剂：黄草灵(asulam)；

[0894] b9) 选自如下的有丝分裂抑制剂：K1组化合物：二硝基苯胺类如氟草胺(benfluralin)、地乐胺(butralin)、敌乐胺(dinitramine)、丁氟消草(ethalfluralin)、氟消草(fluchloralin)、黄草消(oryzalin)、胺硝草(pendimethalin)、氨基丙氟灵(prodiamine)和氟乐灵(trifluralin)，氨基磷酸酯类如胺草磷(amiprofos)、甲基胺草磷(amiprofos-methyl)和草胺磷(butamipfos)，苯甲酸类除草剂如敌草索(chlorthal)、敌草索(chlorthal-dimethyl)，吡啶类如氟硫草定(dithiopyr)和噻氟啶草(thiazopyr)，苯甲酰胺类如拿草特(propyzamide)和丙戊草胺(tebutam)，K2组化合物：长杀草(carbetamide)、氯苯胺灵(chlorpropham)、氟燕灵(flamprop)、氟燕灵(flamprop-isopropyl)、甲氟燕灵(flamprop-methyl)、强氟燕灵(flamprop-M-isopropyl)、麦草伏(flamprop-M-methyl)和苯胺灵(propham)；其中优选K1组化合物，尤其优选二硝基苯胺类；

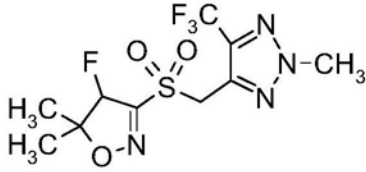
[0895] b10) 选自如下的VLCFA抑制剂：氯乙酰胺类如乙草胺(acetochlor)、甲草胺(alachlor)、amidochlor、丁草胺(butachlor)、克草胺(dimethachlor)、噻吩草胺(dimethenamid)、精噻吩草胺(dimethenamid-P)、吡草胺(metazachlor)、异丙甲草胺(metolachlor)、S-异丙甲草胺(metolachlor-S)、烯草胺(pethoxamid)、丙草胺(pretilachlor)、扑草胺(propachlor)、异丙草胺(propisochlor)和噻醚草胺(thenylchlor)，羟基乙酰苯胺类(oxyacetanilide)如氟噻草胺(flufenacet)和苯噻草胺(mefenacet)，乙酰苯胺类如草乃敌(diphenamid)、萘丙胺(naproanilide)、草萘胺(napropamide)和精草萘胺(napropamide-M)，四唑啉酮类如四唑啉草胺(fentrazamide)以及其他除草剂如莎稗磷(anilofos)、唑草胺(cafenstrole)、fenoxasulfone、ipfencarbazone、哌草磷(piperophos)、派罗克杀草砒(pyroxasulfone)及II.1、II.2、II.3、II.4、II.5、II.6、II.7、II.8和II.9的异噁唑啉化合物：



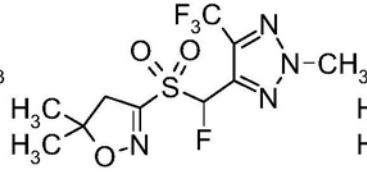
II.1



II.2



II.3

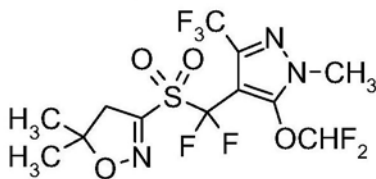


II.4

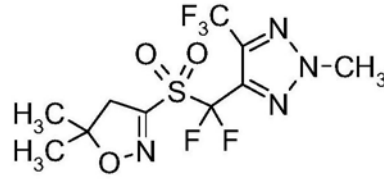


II.5

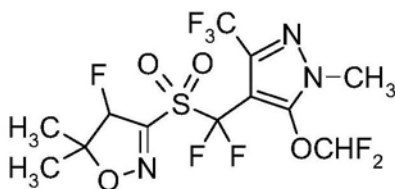
[0896]



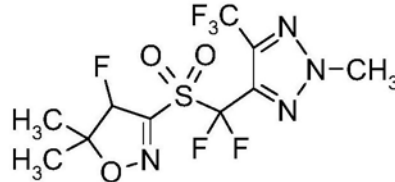
II.6



II.7



II.8



II.9

[0897] 式(II)的异噁唑啉化合物在本领域中是已知的,例如由WO 2006/024820、WO 2006/037945、WO 2007/071900和WO 2007/096576已知;

[0898] 在VLCFA抑制剂中,优选氯代乙酰胺类和羟基乙酰胺类;

[0899] b11) 选自如下的纤维素生物合成抑制剂:草克乐(chlorthiamid)、敌草腈(dichlobenil)、胺草啞(flupoxam)、茛嗪氟草胺、异恶草胺(isoxaben)、苯氧丙胺津(triaziflam)和1-环己基-5-五氟苯氧基-1<sup>4</sup>-[1,2,4,6]硫杂三嗪-3-基胺(CAS 175899-01-1);

[0900] b12) 选自如下的去偶剂除草剂:地乐酚(dinoseb)、地乐消酚(dinoterb)以及二硝甲酚(DNOC)及其盐;

[0901] b13) 选自如下的植物生长素除草剂:2,4-D及其盐和酯,如氯酰草膦(clacyfos), 2,4-DB及其盐和酯,环丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)及其盐和酯,氨草啞(aminopyralid)及其盐如氨草啞二甲铵盐(aminopyralid-dimethylammonium)、氨草啞异丙醇铵盐(aminopyralid-tris(2-hydroxy-propyl) ammonium)和其酯,草除灵(benazolin),草除灵(benazolin-ethyl),草灭平(chloramben)及其盐和酯,稗草胺(clomeprop),二氯皮考啞酸(clopyralid)及其盐和酯,麦草畏(dicamba)及其盐和酯,2,4-滴丙酸(dichlorprop)及其盐和酯,高2,4-滴丙酸(dichlorprop-P)及其盐和酯, flopyrauxifen, 氟草烟(fluroxypyr), 氟草烟(fluroxypyr-butometyl), 氟氯胺啞

(fluroxypyr-meptyl), 氟氯吡啶酯 (halauxifen) 及其盐和酯 (CAS 943832-60-8), MCPA 及其盐和酯, 2甲4氯乙硫酯 (MCPA-thioethyl), MCPB 及其盐和酯, 2甲4氯丙酸 (mecoprop) 及其盐和酯, 高2甲4氯丙酸 (mecoprop-P) 及其盐和酯, 毒莠定 (picloram) 及其盐和酯, 二氯喹啉酸 (quinclorac), 喹草酸 (quinmerac), TBA (2,3,6) 及其盐和酯, 绿草定 (triclopyr) 及其盐和酯, 氟氯吡啶酯 (florpyrauxifen), 氟氯吡啶酯 (florpyrauxifen-benzyl) (CAS 1390661-72-9) 和 4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基) 吡啶甲酸 (CAS 1629965-65-6);

[0902] b14) 选自如下的植物生长素输送抑制剂: 二氟吡隆 (diflufenzopyr)、二氟吡隆钠 (diflufenzopyr-sodium)、抑草生 (naptalam) 和抑草生 (naptalam-sodium);

[0903] b15) 选自如下的其他除草剂: 溴丁酰草胺 (bromobutide)、氯甲丹 (chlorflurenol)、氯甲丹 (chlorflurenol-methyl)、环庚草醚 (cinmethylin)、苜草隆 (cumyluron)、cyclopyrimorate (CAS 499223-49-3) 及其盐和酯、茅草枯 (dalapon)、棉隆 (dazomet)、苯敌快 (difenzoquat)、苯敌快 (difenzoquat-metilsulfate)、噻节因 (dimethipin)、甲肿钠 (DSMA)、香草隆 (dymron)、敌草腈 (endothal) 及其盐、乙苯酰草 (etobenzanid)、抑草丁 (flurenol)、抑草丁 (flurenol-butyl)、调啞醇 (flurprimidol)、膦胺素 (fosamine)、膦胺素 (fosamine-ammonium)、茛草酮 (indanofan)、抑芽丹 (maleic hydrazide)、氟草磺 (mefluidide)、威百亩 (metam)、methiozolin (CAS 403640-27-7)、叠氮甲烷 (methyl azide)、溴甲烷 (methyl bromide)、苯丙隆 (methyl-dymron)、碘甲烷 (methyl iodide)、甲肿一钠 (MSMA)、油酸 (oleic acid)、氯噁嗪草 (oxaziclomefone)、壬酸 (pelargonic acid)、稗草畏 (pyributicarb)、灭藻醌 (quinoclamine) 和灭草环 (tridiphane)。

[0904] 具有羧基的活性化合物B和C在本发明组合中可以如上所述以酸的形式、可农用盐形式或可农用衍生物的形式使用。

[0905] 在麦草畏的情况下, 合适的盐包括其中抗衡离子为可农用阳离子的那些。例如, 麦草畏的合适盐是麦草畏钠 (dicamba-sodium)、麦草畏钾 (dicamba-potassium)、麦草畏甲基铵 (dicamba-methylammonium)、麦草畏二甲基铵 (dicamba-dimethylammonium)、麦草畏异丙基铵 (dicamba-isopropylammonium)、麦草畏二甘醇胺 (dicamba-diglycolamine)、麦草畏乙醇胺 (dicamba-olamine)、麦草畏二乙醇胺 (dicamba-diollamine)、麦草畏三乙醇胺 (dicamba-trolamine)、麦草畏-N,N-二(3-氨基丙基) 甲基胺和麦草畏-二亚乙基三胺。合适酯的实例是麦草畏甲酯 (dicamba-methyl) 和麦草畏丁氧基乙酯 (dicamba-butoyl)。

[0906] 2,4-D的合适盐是2,4-D铵、2,4-D二甲基铵、2,4-D二乙基铵、2,4-D二乙醇铵 (2,4-D二乙醇胺)、2,4-D三乙醇铵、2,4-D异丙基铵、2,4-D三异丙醇铵、2,4-D庚基铵、2,4-D十二烷基铵、2,4-D十四烷基铵、2,4-D三乙基铵、2,4-D三(2-羟基丙基) 铵、2,4-D三异丙基铵、2,4-D三乙醇胺、2,4-D锂、2,4-D钠。2,4-D的合适酯的实例是2,4-D丁氧基乙酯 (2,4-D-butoyl)、2,4-D-2-丁氧基丙酯、2,4-D-3-丁氧基丙酯、2,4-D丁酯 (2,4-D-butyl)、2,4-D乙酯 (2,4-D-ethyl)、2,4-D乙基己基酯 (2,4-D-ethylhexyl)、2,4-D异丁酯 (2,4-D-isobutyl)、2,4-D异辛酯 (2,4-D-isoctyl)、2,4-D异丙酯 (2,4-D-isopropyl)、2,4-D甲基庚基酯 (2,4-D-meptyl)、2,4-D甲酯 (2,4-D-methyl)、2,4-D辛酯 (2,4-D-octyl)、2,4-D戊酯 (2,4-D-pentyl)、2,4-D丙酯 (2,4-D-propyl)、2,4-D四氢呋喃酯 (2,4-D-tefuryl) 和氯酰草

膦 (clacyfos)。

[0907] 2,4-DB的合适盐例如为2,4-DB钠、2,4-DB钾和2,4-DB二甲基铵。2,4-DB的合适酯例如为2,4-DB丁酯 (2,4-DB-butyl) 和2,4-DB异辛酯 (2,4-DB-isooctyl)。

[0908] 2,4-滴丙酸的合适盐例如为2,4-滴丙酸钠 (dichlorprop-sodium)、2,4-滴丙酸钾 (dichlorprop-potassium) 和2,4-滴丙酸二甲基铵 (dichlorprop-dimethylammonium)。2,4-滴丙酸的合适酯的实例是2,4-滴丙酸丁氧基乙酯 (dichlorprop-butotyl) 和2,4-滴丙酸异辛酯 (dichlorprop-isooctyl)。

[0909] MCPA的合适盐和酯包括MCPA丁氧基乙酯 (MCPA-butotyl)、MCPA丁酯 (MCPA-butyl)、MCPA二甲基铵、MCPA二乙醇胺 (MCPA-diolamine)、MCPA乙酯 (MCPA-ethyl)、MCPA硫代乙酯 (MCPA-thioethyl)、MCPA-2-乙基己基酯 (MCPA-2-ethylhexyl)、MCPA异丁酯 (MCPA-isobutyl)、MCPA异辛酯 (MCPA-isooctyl)、MCPA异丙酯 (MCPA-isopropyl)、MCPA异丙基铵、MCPA甲酯 (MCPA-methyl)、MCPA乙醇胺 (MCPA-olamine)、MCPA钾 (MCPA-potassium)、MCPA钠 (MCPA-sodium) 和MCPA三乙醇胺 (MCPA三乙醇胺)。

[0910] MCPB的合适盐是MCPB钠。MCPB的合适酯是MCPB乙酯 (MCPB-ethyl)。

[0911] 二氯皮考啉酸的合适盐是二氯皮考啉酸钾 (clopyralid-potassium)、二氯皮考啉酸乙醇铵和二氯皮考啉酸三异丙醇铵 (clopyralid-tri-(2-hydroxypropyl) ammonium)。二氯皮考啉酸的合适酯的实例是二氯皮考啉酸甲酯。

[0912] 氟草烟的合适酯的实例是氟氯胺啶和氟草烟2-丁氧基-1-甲基乙基酯 (fluroxypyr-2-butoxy-1-methylethyl), 其中优选氟氯胺啶。

[0913] 毒莠定的合适盐是毒莠定二甲基铵 (picloram-dimethylammonium)、毒莠定钾 (picloram-potassium)、毒莠定三异丙醇铵 (picloram-triisopropanolammonium)、毒莠定三异丙基铵 (picloram-triisopropylammonium) 和毒莠定三乙醇胺 (picloram-trolamine)。毒莠定的合适酯是毒莠定异辛酯 (picloram-isooctyl)。

[0914] 绿草定的合适盐是绿草定三乙基铵 (triclopyr-triethylammonium)。绿草定的合适酯例如是绿草定乙酯 (triclopyr-ethyl) 和绿草定丁氧基乙酯 (triclopyr-butotyl)。

[0915] 草灭平的合适盐和酯包括草灭平铵 (chloramben-ammonium)、草灭平二乙醇胺 (chloramben-diolamine)、草灭平甲酯 (chloramben-methyl)、草灭平甲基铵 (chloramben-methylammonium) 和草灭平钠 (chloramben-sodium)。2,3,6-TBA的合适盐和酯包括2,3,6-TBA二甲基铵、2,3,6-TBA锂、2,3,6-TBA钾和2,3,6-TBA钠。

[0916] 氨草啶的合适盐和酯包括氨草啶钾 (aminopyralid-potassium)、氨草啶二甲铵盐 (aminopyralid-dimethylammonium) 和氨草啶异丙醇铵盐 (aminopyralid-tris(2-hydroxypropyl) ammonium)。

[0917] 草甘膦的合适盐例如为草甘膦铵盐、草甘膦二铵盐 (glyphosate-diammonium)、草甘膦二甲铵 (glyphoste-dimethylammonium)、草甘膦异丙胺盐、草甘膦钾、草甘膦钠 (glyphosate-sodium)、草硫膦以及乙醇胺和二乙醇胺盐, 优选草甘膦二铵盐、草甘膦异丙胺盐和草硫膦 (sulfosate)。

[0918] 草铵膦的合适盐例如为草铵膦铵盐。

[0919] 草铵膦 (glufosinate-P) 的合适盐例如为草铵膦铵盐 (glufosinate-P-ammonium)。

[0920] 溴苯腈的合适盐和酯例如为溴苯腈丁酸酯(bromoxynil-butyrate)、溴苯腈庚酸酯(bromoxynil-heptanoate)、溴苯腈辛酸酯(bromoxynil-octanoate)、溴苯腈钾(bromoxynil-potassium)和溴苯腈钠(bromoxynil-sodium)。

[0921] 碘苯腈的合适盐和酯例如为碘苯腈辛酸酯(ioxonil-octanoate)、碘苯腈钾(ioxonil-potassium)和碘苯腈钠(ioxonil-sodium)。

[0922] 2甲4氯丙酸的合适盐和酯包括2甲4氯丙酸丁氧基乙酯(mecoprop-butotyl)、2甲4氯丙酸二甲铵(mecoprop-dimethylammonium)、2甲4氯丙酸二乙醇胺(mecoprop-diolumine)、mecoprop-ethadyl、2甲4氯丙酸2-乙基己基酯(mecoprop-2-ethylhexyl)、2甲4氯丙酸异辛酯(mecoprop-isoctyl)、2甲4氯丙酸甲酯(mecoprop-methyl)、2甲4氯丙酸钾(mecoprop-potassium)、2甲4氯丙酸钠(mecoprop-sodium)和2甲4氯丙酸三乙醇胺(mecoprop-trolamine)。

[0923] 高2甲4氯丙酸的合适盐例如为高2甲4氯丙酸丁氧基酯(mecoprop-P-butotyl)、高2甲4氯丙酸二甲基铵(mecoprop-P-dimethylammonium)、高2甲4氯丙酸2-乙基己基酯(mecoprop-P-2-ethylhexyl)、高2甲4氯丙酸异丁酯(mecoprop-P-isobutyl)、高2甲4氯丙酸钾和高2甲4氯丙酸钠。

[0924] 二氟吡隆的合适盐例如为二氟吡隆钠。

[0925] 抑草生的合适盐例如为抑草生钠(naptalam-sodium)。

[0926] 环丙嘧啶酸的合适盐和酯例如为环丙嘧啶酸二甲基铵、环丙嘧啶酸甲酯、环丙嘧啶酸三异丙醇铵、环丙嘧啶酸钠和环丙嘧啶酸钾。

[0927] 二氯喹啉酸的合适盐例如为二氯喹啉酸二甲基铵。

[0928] 喹草酸的合适盐例如为喹草酸二甲基铵。

[0929] 咪草啶酸的合适盐例如为咪草啶酸铵。

[0930] 甲基咪草烟的合适盐例如为甲基咪草烟铵和甲基咪草烟异丙基铵。

[0931] 灭草烟的合适盐例如为灭草烟铵和灭草烟异丙基铵。

[0932] 灭草喹的合适盐例如为灭草喹铵。

[0933] 咪草烟的合适盐例如为咪草烟铵和咪草烟异丙基铵。

[0934] 托普拉威的合适盐例如为托普拉威钠。

[0935] 特别优选的除草剂B是如上所定义的除草剂B;特别是除草剂B.1-B.202,尤其是下面在表B中列出的除草剂B.1-B.201:

[0936] 表B:

[0937]

	除草剂 B
B.1	烯草酮
B.2	炔草酯
B.3	噻草酮
B.4	氟氟草酯
B.5	噁唑禾草灵
B.6	高噁唑禾草灵
B.7	噁唑酰草胺
B.8	唑啉草酯
B.9	环苯草酮
B.10	稀禾定
B.11	醚脞草

	除草剂 B
B.12	肟草酮
B.13	禾草畏
B.14	乙炔草黄
B.15	草达灭
B.16	苄草丹
B.17	杀草丹
B.18	野麦畏
B.19	苄嘧黄隆
B.20	双嘧苯甲酸钠
B.21	唑嘧磺胺盐
B.22	绿黄隆

[0938]

	除草剂 B
B.23	氯嘧黄隆
B.24	环丙黄隆
B.25	唑嘧磺胺
B.26	双氟磺草胺
B.27	氟唑啉草
B.28	氟定黄隆
B.29	甲酰氟磺隆
B.30	咪草啉酸
B.31	咪草啉酸铵盐
B.32	甲基咪草烟
B.33	甲基咪草烟铵盐
B.34	甲基咪草烟异丙铵盐
B.35	灭草烟
B.36	灭草烟铵盐
B.37	灭草烟异丙铵盐
B.38	灭草啞
B.39	灭草啞铵盐
B.40	咪草烟
B.41	咪草烟铵盐
B.42	咪草烟异丙铵盐
B.43	啉咪黄隆
B.44	碘甲黄隆钠
B.45	iofensulfuron
B.46	iofensulfuron-sodium
B.47	甲基二磺隆
B.48	metazosulfuron
B.49	甲黄隆
B.50	唑草磺胺
B.51	烟嘧黄隆
B.52	五氟磺草胺
B.53	丙苯磺隆
B.54	吡嘧黄隆
B.55	嘧啉肟草醚
B.56	环酯草醚
B.57	啉磺草胺
B.58	propyrisulfuron
B.59	玉嘧黄隆
B.60	乙黄隆
B.61	thiencarbazone-methyl
B.62	噻黄隆
B.63	苯黄隆
B.64	三氟甲磺隆
B.65	氟酮磺草胺

	除草剂 B
B.66	莠灭净
B.67	莠去津
B.68	噻草平
B.69	溴苯腈
B.70	溴苯腈辛酸酯
B.71	溴苯腈庚酸酯
B.72	溴苯腈钾盐
B.73	敌草隆
B.74	伏草隆
B.75	六嗪同
B.76	异丙隆
B.77	利谷隆
B.78	苯嗪草
B.79	赛克津
B.80	敌稗
B.81	西玛津
B.82	特丁津
B.83	去草净
B.84	对草快
B.85	氟锁草醚
B.86	氟丙嘧草酯
B.87	氟酮唑草
B.88	氟噁嗪酮
B.89	氟黄胺草醚
B.90	炔丙噁唑草
B.91	乙氧氟草醚
B.92	氟唑草酯
B.93	氟唑草酯
B.94	苯嘧磺草胺
B.95	磺胺草啉
B.96	trifludimoxazin
B.97	[3-[2-氯-4-氟-5-(1-甲基-6-三氟甲基-2,4-二氧代-1,2,3,4-四氢嘧啶-3-基)苯氧基]-2-吡啶基氧基]乙酸乙酯 (CAS 353292-31-6)
B.98	苯并双环酮
B.99	氟吡草酮
B.100	异恶草酮
B.101	吡氟草胺
B.102	氟咯草酮
B.103	异噁氟草
B.104	甲基磺草酮
B.105	达草灭

[0939]

	除草剂 B
B.106	氟吡酰草胺
B.107	磺草酮
B.108	tefuryltrione
B.109	tembotrione
B.110	tolpyralate
B.111	托普拉威
B.112	托普拉威钠
B.113	杀草强
B.114	伏草隆
B.115	fenquinotrione
B.116	草甘膦
B.117	草甘膦铵盐
B.118	草甘膦二甲铵盐
B.119	草甘膦异丙胺盐
B.120	草硫膦(sulfosate)
B.121	草甘膦钾
B.122	草铵膦(glufosinate)
B.123	草铵膦铵盐(glufosinate-ammonium)
B.124	草铵膦(glufosinate-P)
B.125	草铵膦铵盐 (glufosinate-P-ammonium)
B.126	胺硝草
B.127	氟乐灵
B.128	乙草胺
B.129	丁草胺
B.130	唑草胺
B.131	精噻吩草胺
B.132	四唑酰草胺
B.133	氟噻草胺
B.134	苯噻草胺
B.135	吡草胺
B.136	异丙甲草胺
B.137	S-异丙甲草胺
B.138	丙草胺
B.139	fenoxasulfone
B.140	茚嗪氟草胺
B.141	异恶草胺
B.142	苯氧丙胺津
B.143	ipfencarbazone
B.144	派罗克杀草砒
B.145	2,4-D
B.146	2,4-D 异丁酯
B.147	2,4-D 二甲基铵

	除草剂 B
B.148	2,4-D-N,N,N-三甲基乙醇铵
B.149	氟草啶
B.150	氟草啶甲酯
B.151	氟草啶二甲铵盐
B.152	氟草啶异丙醇铵盐
B.153	二氟皮考啉酸
B.154	二氟皮考啉酸甲酯
B.155	二氟皮考啉酸乙醇铵
B.156	麦草畏
B.157	麦草畏丁氧基乙酯
B.158	麦草畏二甘醇胺
B.159	麦草畏二甲基铵
B.160	麦草畏二乙醇胺
B.161	麦草畏异丙铵盐
B.162	麦草畏钾
B.163	麦草畏钠
B.164	麦草畏三乙醇胺
B.165	麦草畏-N,N-二(3-氨基丙基)甲基胺
B.166	麦草畏-二亚乙基三胺
B.167	氟草烟
B.168	氟氟胺啶
B.169	氟氟吡啶酯
B.170	氟氟吡啶酯
B.171	MCPA
B.172	MCPA-2-乙基己基酯
B.173	MCPA 二甲基铵
B.174	二氟喹啉酸
B.175	二氟喹啉酸二甲基铵
B.176	喹草酸
B.177	喹草酸二甲基铵
B.178	氟氟吡啶酯(florpyrauxifen)
B.179	氟氟吡啶酯(florpyrauxifen-benzyl) (CAS 1390661-72-9)
B.180	环丙嘧啶酸
B.181	环丙嘧啶酸钾
B.182	环丙嘧啶酸甲酯
B.183	二氟吡隆
B.184	二氟吡隆钠
B.185	香草隆
B.186	茚草酮
B.187	氟噁嗪草
B.188	II.1
B.189	II.2

[0940]		除草剂 B		除草剂 B	
B.190	II.3	B.198	flopyrauxifen	B.199	oxotrione(CAS 1486617-21-3)
B.191	II.4	B.200	环庚草醚	B.201	2-氯-3-甲硫基-N-(1-甲基四唑-5-基)-4-三氟甲基苯甲酰胺(CAS 1361139-71-0)
B.192	II.5	B.202	2-(2,4-二氯苯基)甲基-4,4-二甲基-3-异噁唑烷酮(CAS 81777-95-9)		
B.193	II.6				
B.194	II.7				
B.195	II.8				
B.196	II.9				
B.197	4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-咪唑-6-基)吡啶甲酸(CAS 1629965-65-6)				

[0941] 此外,可能有用的是与安全剂组合施用式(I)的尿嘧啶吡啶类。安全剂是防止或降低对有用植物的损害但不对式(I)的尿嘧啶吡啶类对不想要的植物的除草作用具有显著影响的化合物。它们可以在播种之前施用(例如在种子处理时、在嫩枝或秧苗上)或以有用植物的出苗前施用或出苗后施用方式施用。安全剂和式(I)的尿嘧啶吡啶类以及任选地,除草剂B可以同时或依次施用。

[0942] 在本发明的另一实施方案中,本发明组合物包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶和至少一种安全剂C(组分C)。

[0943] 合适的安全剂例如是(喹啉-8-氧基)乙酸类、1-苯基-5-卤代烷基-1H-1,2,4-三唑-3-甲酸、1-苯基-4,5-二氢-5-烷基-1H-吡唑-3,5-二甲酸、4,5-二氢-5,5-二芳基-3-异噁唑甲酸、二氯乙酰胺类、 $\alpha$ -肟基苯基乙腈、苯乙酮肟类、4,6-二卤代-2-苯基嘧啶类、N-[[4-(氨基羰基)苯基]磺酰基]-2-苯甲酰胺类、1,8-萘二甲酸酐、2-卤代-4-卤代烷基-5-噻唑羧酸、硫代磷酸酯类和N-烷基-0-苯基氨基甲酸酯类及其可农用盐和其可农用衍生物如酰胺、酯和硫酯,条件是它们具有酸基。

[0944] 优选安全剂C的实例是解草酮(benoxacor)、喹氧乙酸(cloquintocet)、抑害腈(cyometrinil)、cyprosulfamide、抑害胺(dichlormid)、dicyclonon、dietholate、解草唑(fenclorazole)、解草啶(fenclorim)、解草安(flurazole)、肟草安(fluxofenim)、解草唑(furilazole)、双苯噁唑酸(isoxadifen)、吡咯二酸(mefenpyr)、mephenate、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(MON4660,CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-二氯乙酰基-1,3-噁唑烷(R-29148,CAS 52836-31-4)、metcamifen和BPCMS(CAS 54091-06-4);尤其优选解草酮(benoxacor)、喹氧乙酸(cloquintocet)、抑害腈(cyometrinil)、cyprosulfamide、抑害胺(dichlormid)、dicyclonon、dietholate、解草唑(fenclorazole)、解草啶(fenclorim)、解草安(flurazole)、肟草安(fluxofenim)、解草唑(furilazole)、双苯噁唑酸(isoxadifen)、吡咯二酸(mefenpyr)、mephenate、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(MON4660,CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-二氯乙酰基-1,3-噁唑烷(R-29148,CAS 52836-31-4)和metcamifen。

[0945] 作为组分C构成本发明组合物的成分的特别优选安全剂C是如上所定义的安全剂C,尤其是下表C所列安全剂C.1-C.17:

[0946] 表C

	<b>安全剂 C</b>
<b>C.1</b>	<b>解草酮(benoxacor)</b>
<b>C.2</b>	<b>喹氧乙酸(cloquintocet)</b>
<b>C.3</b>	<b>喹氧乙酸(cloquintocet-mexyl)</b>
<b>C.4</b>	<b>cyprosulfamide</b>
<b>C.5</b>	<b>抑害胺(dichlormid)</b>
<b>C.6</b>	<b>解草唑(fenclorazole)</b>
<b>C.7</b>	<b>解草唑乙酯</b>
<b>C.8</b>	<b>解草啉(fenclorim)</b>
<b>C.9</b>	<b>解草呋(furilazole)</b>
<b>C.10</b>	<b>双苯噁唑酸(isoxadifen)</b>
<b>C.11</b>	<b>双苯噁唑酸乙酯</b>
<b>C.12</b>	<b>吡咯二酸(mefenpyr)</b>
<b>C.13</b>	<b>吡咯二酸二乙酯</b>
<b>C.14</b>	<b>萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)</b>
<b>C.15</b>	<b>4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷 (CAS 71526-07-3)</b>
<b>C.16</b>	<b>2,2,5-三甲基-3-二氯乙酰基-1,3-噁唑烷(CAS 52836-31-4)</b>
<b>C.17</b>	<b>metcamifen</b>

[0947]

[0948] b1) -b15) 组的活性化合物B和活性化合物C是已知的除草剂和安全剂,例如参见 The Compendium of Pesticide Common Names (<http://www.alanwood.net/pesticides/>); Farm Chemicals Handbook 2000, 第86卷, Meister Publishing Company, 2000; B. Hock, C. Fedtke, R. R. Schmidt, Herbicide [除草剂], Georg Thieme Verlag, Stuttgart, 1995; W. H. Ahrens, Herbicide Handbook, 第7版, Weed Science Society of America, 1994 以及 K. K. Hatzios, Herbicide Handbook, 第7版增补, Weed Science Society of America, 1998. 2,2,5-三甲基-3-二氯乙酰基-1,3-噁唑烷 [CAS号52836-31-4] 也称为 R-29148. 4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷 [CAS 号71526-07-3] 也称为 AD-67 和 MON 4660。

[0949] 活性化合物的相应作用机理的归属基于现有知识。若几种作用机理适用于一种活性化合物,则该物质仅归属于一种作用机理。

[0950] 根据本发明的优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种除草剂B作为除草活性化合物B或组分B。

[0951] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少两种,优选正好两种相互不同的除草剂B作为除草活性化合物B或组分B。

[0952] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少三种,优选正好三种相互不同的除草剂B作为除草活性化合物B或组分B。

[0953] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少四种,优选正好四种相互不同的除草剂B作为除草活性化合物B或组分B。

[0954] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种安全剂C

作为安全组分C或组分C。

[0955] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种除草剂B作为组分B和至少一种,优选正好一种安全剂C作为组分C。

[0956] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少两种,优选正好两种相互不同的除草剂B和至少一种,优选正好一种安全剂C作为组分C。

[0957] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少三种,优选正好三种相互不同的除草剂B和至少一种,优选正好一种安全剂C作为组分C。

[0958] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种式(I)化合物,优选式(I.a)或(I.h)的化合物作为组分A和至少一种,优选正好一种除草剂B作为组分B。

[0959] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种式(I)化合物,优选式(I.a)或(I.h)的化合物作为组分A和至少两种,优选正好两种相互不同的除草剂B。

[0960] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种式(I)化合物,优选式(I.a)或(I.h)的化合物作为组分A和至少三种,优选正好三种相互不同的除草剂B。

[0961] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种式(I)化合物,优选式(I.a)或(I.h)的化合物作为组分A和至少四种,优选正好四种相互不同的除草剂B。

[0962] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种式(I)化合物,优选式(I.a)或(I.h)的化合物作为组分A和至少一种,优选正好一种安全剂C作为组分C。

[0963] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种式(I)化合物,优选式(I.a)或(I.h)的化合物作为组分A,至少一种,优选正好一种除草剂B作为组分B和至少一种,优选正好一种安全剂C作为组分C。

[0964] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种式(I)化合物,优选式(I.a)或(I.h)的化合物作为组分A,至少两种,优选正好两种相互不同的除草剂B和至少一种,优选正好一种安全剂C作为组分C。

[0965] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物包含至少一种,优选正好一种式(I)化合物,优选式(I.a)或(I.h)的化合物作为组分A,至少三种,优选正好三种相互不同的除草剂B和至少一种,优选正好一种安全剂C作为组分C。

[0966] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物除了式(I)的尿嘧啶吡啶,尤其是选自(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)和(I.h.367)的活性化合物外包含至少一种,尤其是正好一种选自b4)组,尤其是选自氟锁草醚、氟丙嘧草酯(butafencil)、氟酮唑草(carfenetrazone-ethyl)、氟噁嗪酮、氟黄胺草醚、炔丙噁唑草、乙氧氟草醚、氟唑草酯(pyraflufen)、氟唑草酯(pyraflufen-ethyl)、苯嘧磺草胺、磺胺草唑、trifludimoxazin、[3-[2-氯-4-氟-5-(1-甲基-6-三氟甲基-2,4-二氧化-1,2,3,4-四氢嘧啶-3-基)苯氧基]-

2-吡啶氧基]乙酸乙酯(CAS 353292-31-6)的除草活性化合物。

[0967] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物除了式(I)的尿嘧啶吡啶,尤其是选自(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)和(I.h.367)的活性化合物外包含至少一种,尤其是正好一种选自b6)组,尤其是选自草甘膦、草甘膦铵盐、草甘膦二甲铵、草甘膦异丙胺盐、草硫膦(sulfosate)和草甘膦钾的除草活性化合物。

[0968] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物除了式(I)的尿嘧啶吡啶,尤其是选自(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)和(I.h.367)的活性化合物外包含至少一种,尤其是正好一种选自b10)组,尤其是选自乙草胺、丁草胺、唑草胺、精噁吩草胺、四唑酰草胺、氟噻草胺、苯噻草胺、吡草胺、异丙甲草胺、S-异丙甲草胺、fenoxasulfone、ipfencarbazone和派罗克杀草砜的除草活性化合物。同样优选除了式(I)的尿嘧啶吡啶,尤其是选自(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)和(I.h.367)的活性化合物外包含至少一种,尤其是正好一种选自b10)组,尤其是选自如上所定义的式II.1、II.2、II.3、II.4、II.5、II.6、II.7、II.8和II.9的异噁唑啉化合物的除草活性化合物。

[0969] 根据本发明的另一优选实施方案,该组合物除了式(I)的尿嘧啶吡啶,尤其是选自(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)和(I.h.367)的活性化合物外包含至少一种,尤其是正好一种选自b13)组,尤其是选自2,4-D、2,4-D异丁酯、2,4-D二甲基铵、2,4-D-N,N,N-三甲基乙醇铵、环丙嘧啶酸、环丙嘧啶酸钾、环丙嘧啶酸甲酯、氨草啶、氨草啶甲酯、氨草啶二甲铵盐、氨草啶异丙醇铵盐、二氯皮考啉酸、二氯皮考啉酸甲酯、二氯皮考啉酸乙醇铵、麦草畏、麦草畏丁氧基乙酯、麦草畏二甘醇胺、麦草畏二甲基铵、麦草畏二乙醇胺、麦草畏异丙基铵、麦草畏钾、麦草畏钠、麦草畏三乙醇胺、麦草畏-N,N-二(3-氨基丙基)甲基胺、麦草畏-二亚乙基三胺、flopypyrauxifen、氟草烟、氟氯胺啶、氟氯吡啶酯(halauxifen)、氟氯吡啶酯(halauxifen-methyl)、MCPA、MCPA-2-乙基己基酯、MCPA二甲基铵、二氯喹啉酸、二氯喹啉酸二甲基铵、喹草酸、喹草酸二甲基铵、氯氟吡啶酯(florpyrauxifen)、氯氟吡啶酯(florpyrauxifen-benzyl)(CAS 1390661-72-9)和4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶甲酸的除草活性化合物。

[0970] 在这里和下文中,术语“二元组合物”包括包含一种或多种,例如1、2或3种式(I)的活性化合物和一种或多种,例如1、2或3种除草剂B或一种或多种安全剂C的组合物。

[0971] 相应地,术语“三元组合物”包括包含一种或多种,例如1、2或3种式(I)的活性化合物,一种或多种,例如1、2或3种除草剂B和一种或多种,例如1、2或3种安全剂C的组合物。

[0972] 在包含至少一种式(I)化合物作为组分A和至少一种除草剂B的二元组合物中,活性化合物A:B的重量比通常为1:1000-1000:1,优选1:500-500:1,尤其是1:250-250:1,特别

优选1:125-125:1。

[0973] 在包含至少一种式(I)化合物作为组分A和至少一种安全剂C的二元组合中,活性化合物A:C的重量比通常为1:1000-1000:1,优选1:500-500:1,尤其是1:250-250:1,特别优选1:75-75:1。

[0974] 在包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶作为组分A,至少一种除草剂B和至少一种安全剂C的三元组合中,组分A:B的相对重量比例通常为1:1000-1000:1,优选1:500-500:1,尤其是1:250-250:1,特别优选1:125-125:1,组分A:C的重量比通常为1:1000-1000:1,优选1:500-500:1,尤其是1:250-250:1,特别优选1:75-75:1,并且组分B:C的重量比通常为1:1000-1000:1,优选1:500-500:1,尤其是1:250-250:1,特别优选1:75-75:1。组分A+B与组分C的重量比优选为1:500-500:1,尤其是1:250-250:1,特别优选1:75-75:1。

[0975] 下述优选混合物中各组分的重量比在本文所给限度内,尤其在优选限度内。

[0976] 特别优选下述组合,其包含如所定义的式(I)的尿嘧啶吡啶类和如表1相应行所定义的物质;尤其优选包含作为仅有除草活性化合物的如所定义的式(I)的尿嘧啶吡啶类和如表1相应行所定义的物质;最优选包含作为仅有活性化合物的如所定义的式(I)的尿嘧啶吡啶类和表1相应行所定义的物质。

[0977] 特别优选组合1.1-1.3653,尤其是组合1.1-1.3635,其包含尿嘧啶吡啶(Ia.339)和在表1的相应行中定义的物质:

[0978] 表1(组合1.1-1.3635):

[0979]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1	B.1	--
1.2	B.2	--
1.3	B.3	--
1.4	B.4	--
1.5	B.5	--
1.6	B.6	--
1.7	B.7	--
1.8	B.8	--
1.9	B.9	--
1.10	B.10	--
1.11	B.11	--
1.12	B.12	--
1.13	B.13	--
1.14	B.14	--
1.15	B.15	--
1.16	B.16	--
1.17	B.17	--
1.18	B.18	--
1.19	B.19	--
1.20	B.20	--
1.21	B.21	--
1.22	B.22	--
1.23	B.23	--
1.24	B.24	--
1.25	B.25	--
1.26	B.26	--
1.27	B.27	--
1.28	B.28	--
1.29	B.29	--
1.30	B.30	--
1.31	B.31	--
1.32	B.32	--
1.33	B.33	--
1.34	B.34	--
1.35	B.35	--

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.36	B.36	--
1.37	B.37	--
1.38	B.38	--
1.39	B.39	--
1.40	B.40	--
1.41	B.41	--
1.42	B.42	--
1.43	B.43	--
1.44	B.44	--
1.45	B.45	--
1.46	B.46	--
1.47	B.47	--
1.48	B.48	--
1.49	B.49	--
1.50	B.50	--
1.51	B.51	--
1.52	B.52	--
1.53	B.53	--
1.54	B.54	--
1.55	B.55	--
1.56	B.56	--
1.57	B.57	--
1.58	B.58	--
1.59	B.59	--
1.60	B.60	--
1.61	B.61	--
1.62	B.62	--
1.63	B.63	--
1.64	B.64	--
1.65	B.65	--
1.66	B.66	--
1.67	B.67	--
1.68	B.68	--
1.69	B.69	--
1.70	B.70	--

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.71	B.71	--
1.72	B.72	--
1.73	B.73	--
1.74	B.74	--
1.75	B.75	--
1.76	B.76	--
1.77	B.77	--
1.78	B.78	--
1.79	B.79	--
1.80	B.80	--
1.81	B.81	--
1.82	B.82	--
1.83	B.83	--
1.84	B.84	--
1.85	B.85	--
1.86	B.86	--
1.87	B.87	--
1.88	B.88	--
1.89	B.89	--
1.90	B.90	--
1.91	B.91	--
1.92	B.92	--
1.93	B.93	--
1.94	B.94	--
1.95	B.95	--
1.96	B.96	--
1.97	B.97	--
1.98	B.98	--
1.99	B.99	--
1.100	B.100	--
1.101	B.101	--
1.102	B.102	--
1.103	B.103	--
1.104	B.104	--
1.105	B.105	--

[0980]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.106	B.106	--
1.107	B.107	--
1.108	B.108	--
1.109	B.109	--
1.110	B.110	--
1.111	B.111	--
1.112	B.112	--
1.113	B.113	--
1.114	B.114	--
1.115	B.115	--
1.116	B.116	--
1.117	B.117	--
1.118	B.118	--
1.119	B.119	--
1.120	B.120	--
1.121	B.121	--
1.122	B.122	--
1.123	B.123	--
1.124	B.124	--
1.125	B.125	--
1.126	B.126	--
1.127	B.127	--
1.128	B.128	--
1.129	B.129	--
1.130	B.130	--
1.131	B.131	--
1.132	B.132	--
1.133	B.133	--
1.134	B.134	--
1.135	B.135	--
1.136	B.136	--
1.137	B.137	--
1.138	B.138	--
1.139	B.139	--
1.140	B.140	--
1.141	B.141	--
1.142	B.142	--
1.143	B.143	--
1.144	B.144	--
1.145	B.145	--
1.146	B.146	--
1.147	B.147	--
1.148	B.148	--
1.149	B.149	--
1.150	B.150	--
1.151	B.151	--

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.152	B.152	--
1.153	B.153	--
1.154	B.154	--
1.155	B.155	--
1.156	B.156	--
1.157	B.157	--
1.158	B.158	--
1.159	B.159	--
1.160	B.160	--
1.161	B.161	--
1.162	B.162	--
1.163	B.163	--
1.164	B.164	--
1.165	B.165	--
1.166	B.166	--
1.167	B.167	--
1.168	B.168	--
1.169	B.169	--
1.170	B.170	--
1.171	B.171	--
1.172	B.172	--
1.173	B.173	--
1.174	B.174	--
1.175	B.175	--
1.176	B.176	--
1.177	B.177	--
1.178	B.178	--
1.179	B.179	--
1.180	B.180	--
1.181	B.181	--
1.182	B.182	--
1.183	B.183	--
1.184	B.184	--
1.185	B.185	--
1.186	B.186	--
1.187	B.187	--
1.188	B.188	--
1.189	B.189	--
1.190	B.190	--
1.191	B.191	--
1.192	B.192	--
1.193	B.193	--
1.194	B.194	--
1.195	B.195	--
1.196	B.196	--
1.197	B.197	--

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.198	B.198	--
1.199	B.199	--
1.200	B.200	--
1.201	B.201	--
1.202	B.1	C.1
1.203	B.2	C.1
1.204	B.3	C.1
1.205	B.4	C.1
1.206	B.5	C.1
1.207	B.6	C.1
1.208	B.7	C.1
1.209	B.8	C.1
1.210	B.9	C.1
1.211	B.10	C.1
1.212	B.11	C.1
1.213	B.12	C.1
1.214	B.13	C.1
1.215	B.14	C.1
1.216	B.15	C.1
1.217	B.16	C.1
1.218	B.17	C.1
1.219	B.18	C.1
1.220	B.19	C.1
1.221	B.20	C.1
1.222	B.21	C.1
1.223	B.22	C.1
1.224	B.23	C.1
1.225	B.24	C.1
1.226	B.25	C.1
1.227	B.26	C.1
1.228	B.27	C.1
1.229	B.28	C.1
1.230	B.29	C.1
1.231	B.30	C.1
1.232	B.31	C.1
1.233	B.32	C.1
1.234	B.33	C.1
1.235	B.34	C.1
1.236	B.35	C.1
1.237	B.36	C.1
1.238	B.37	C.1
1.239	B.38	C.1
1.240	B.39	C.1
1.241	B.40	C.1
1.242	B.41	C.1
1.243	B.42	C.1

[0981]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.244	B.43	C.1
1.245	B.44	C.1
1.246	B.45	C.1
1.247	B.46	C.1
1.248	B.47	C.1
1.249	B.48	C.1
1.250	B.49	C.1
1.251	B.50	C.1
1.252	B.51	C.1
1.253	B.52	C.1
1.254	B.53	C.1
1.255	B.54	C.1
1.256	B.55	C.1
1.257	B.56	C.1
1.258	B.57	C.1
1.259	B.58.	C.1
1.260	B.59	C.1
1.261	B.60	C.1
1.262	B.61	C.1
1.263	B.62	C.1
1.264	B.63	C.1
1.265	B.64	C.1
1.266	B.65	C.1
1.267	B.66	C.1
1.268	B.67	C.1
1.269	B.68	C.1
1.270	B.69	C.1
1.271	B.70	C.1
1.272	B.71	C.1
1.273	B.72	C.1
1.274	B.73	C.1
1.275	B.74	C.1
1.276	B.75	C.1
1.277	B.76	C.1
1.278	B.77	C.1
1.279	B.78	C.1
1.280	B.79	C.1
1.281	B.80	C.1
1.282	B.81	C.1
1.283	B.82	C.1
1.284	B.83	C.1
1.285	B.84	C.1
1.286	B.85	C.1
1.287	B.86	C.1
1.288	B.87	C.1
1.289	B.88	C.1

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.290	B.89	C.1
1.291	B.90	C.1
1.292	B.91	C.1
1.293	B.92	C.1
1.294	B.93	C.1
1.295	B.94	C.1
1.296	B.95	C.1
1.297	B.96	C.1
1.298	B.97	C.1
1.299	B.98	C.1
1.300	B.99	C.1
1.301	B.100	C.1
1.302	B.101	C.1
1.303	B.102	C.1
1.304	B.103	C.1
1.305	B.104	C.1
1.306	B.105	C.1
1.307	B.106	C.1
1.308	B.107	C.1
1.309	B.108	C.1
1.310	B.109	C.1
1.311	B.110	C.1
1.312	B.111	C.1
1.313	B.112	C.1
1.314	B.113	C.1
1.315	B.114	C.1
1.316	B.115	C.1
1.317	B.116	C.1
1.318	B.117	C.1
1.319	B.118	C.1
1.320	B.119	C.1
1.321	B.120	C.1
1.322	B.121	C.1
1.323	B.122	C.1
1.324	B.123	C.1
1.325	B.124	C.1
1.326	B.125	C.1
1.327	B.126	C.1
1.328	B.127	C.1
1.329	B.128	C.1
1.330	B.129	C.1
1.331	B.130	C.1
1.332	B.131	C.1
1.333	B.132	C.1
1.334	B.133	C.1
1.335	B.134	C.1

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.336	B.135	C.1
1.337	B.136	C.1
1.338	B.137	C.1
1.339	B.138	C.1
1.340	B.139	C.1
1.341	B.140	C.1
1.342	B.141	C.1
1.343	B.142	C.1
1.344	B.143	C.1
1.345	B.144	C.1
1.346	B.145	C.1
1.347	B.146	C.1
1.348	B.147	C.1
1.349	B.148	C.1
1.350	B.149	C.1
1.351	B.150	C.1
1.352	B.151	C.1
1.353	B.152	C.1
1.354	B.153	C.1
1.355	B.154	C.1
1.356	B.155	C.1
1.357	B.156	C.1
1.358	B.157	C.1
1.359	B.158	C.1
1.360	B.159	C.1
1.361	B.160	C.1
1.362	B.161	C.1
1.363	B.162	C.1
1.364	B.163	C.1
1.365	B.164	C.1
1.366	B.165	C.1
1.367	B.166	C.1
1.368	B.167	C.1
1.369	B.168	C.1
1.370	B.169	C.1
1.371	B.170	C.1
1.372	B.171	C.1
1.373	B.172	C.1
1.374	B.173	C.1
1.375	B.174	C.1
1.376	B.175	C.1
1.377	B.176	C.1
1.378	B.177	C.1
1.379	B.178	C.1
1.380	B.179	C.1
1.381	B.180	C.1

[0982]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.382	B.181	C.1
1.383	B.182	C.1
1.384	B.183	C.1
1.385	B.184	C.1
1.386	B.185	C.1
1.387	B.186	C.1
1.388	B.187	C.1
1.389	B.188	C.1
1.390	B.189	C.1
1.391	B.190	C.1
1.392	B.191	C.1
1.393	B.192	C.1
1.394	B.193	C.1
1.395	B.194	C.1
1.396	B.195	C.1
1.397	B.196	C.1
1.398	B.197	C.1
1.399	B.198	C.1
1.400	B.199	C.1
1.401	B.200	C.1
1.402	B.201	C.1
1.403	B.1	C.2
1.404	B.2	C.2
1.405	B.3	C.2
1.406	B.4	C.2
1.407	B.5	C.2
1.408	B.6	C.2
1.409	B.7	C.2
1.410	B.8	C.2
1.411	B.9	C.2
1.412	B.10	C.2
1.413	B.11	C.2
1.414	B.12	C.2
1.415	B.13	C.2
1.416	B.14	C.2
1.417	B.15	C.2
1.418	B.16	C.2
1.419	B.17	C.2
1.420	B.18	C.2
1.421	B.19	C.2
1.422	B.20	C.2
1.423	B.21	C.2
1.424	B.22	C.2
1.425	B.23	C.2
1.426	B.24	C.2
1.427	B.25	C.2

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.428	B.26	C.2
1.429	B.27	C.2
1.430	B.28	C.2
1.431	B.29	C.2
1.432	B.30	C.2
1.433	B.31	C.2
1.434	B.32	C.2
1.435	B.33	C.2
1.436	B.34	C.2
1.437	B.35	C.2
1.438	B.36	C.2
1.439	B.37	C.2
1.440	B.38	C.2
1.441	B.39	C.2
1.442	B.40	C.2
1.443	B.41	C.2
1.444	B.42	C.2
1.445	B.43	C.2
1.446	B.44	C.2
1.447	B.45	C.2
1.448	B.46	C.2
1.449	B.47	C.2
1.450	B.48	C.2
1.451	B.49	C.2
1.452	B.50	C.2
1.453	B.51	C.2
1.454	B.52	C.2
1.455	B.53	C.2
1.456	B.54	C.2
1.457	B.55	C.2
1.458	B.56	C.2
1.459	B.57	C.2
1.460	B.58	C.2
1.461	B.59	C.2
1.462	B.60	C.2
1.463	B.61	C.2
1.464	B.62	C.2
1.465	B.63	C.2
1.466	B.64	C.2
1.467	B.65	C.2
1.468	B.66	C.2
1.469	B.67	C.2
1.470	B.68	C.2
1.471	B.69	C.2
1.472	B.70	C.2
1.473	B.71	C.2

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.474	B.72	C.2
1.475	B.73	C.2
1.476	B.74	C.2
1.477	B.75	C.2
1.478	B.76	C.2
1.479	B.77	C.2
1.480	B.78	C.2
1.481	B.79	C.2
1.482	B.80	C.2
1.483	B.81	C.2
1.484	B.82	C.2
1.485	B.83	C.2
1.486	B.84	C.2
1.487	B.85	C.2
1.488	B.86	C.2
1.489	B.87	C.2
1.490	B.88	C.2
1.491	B.89	C.2
1.492	B.90	C.2
1.493	B.91	C.2
1.494	B.92	C.2
1.495	B.93	C.2
1.496	B.94	C.2
1.497	B.95	C.2
1.498	B.96	C.2
1.499	B.97	C.2
1.500	B.98	C.2
1.501	B.99	C.2
1.502	B.100	C.2
1.503	B.101	C.2
1.504	B.102	C.2
1.505	B.103	C.2
1.506	B.104	C.2
1.507	B.105	C.2
1.508	B.106	C.2
1.509	B.107	C.2
1.510	B.108	C.2
1.511	B.109	C.2
1.512	B.110	C.2
1.513	B.111	C.2
1.514	B.112	C.2
1.515	B.113	C.2
1.516	B.114	C.2
1.517	B.115	C.2
1.518	B.116	C.2
1.519	B.117	C.2

[0983]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.520	B.118	C.2
1.521	B.119	C.2
1.522	B.120	C.2
1.523	B.121	C.2
1.524	B.122	C.2
1.525	B.123	C.2
1.526	B.124	C.2
1.527	B.125	C.2
1.528	B.126	C.2
1.529	B.127	C.2
1.530	B.128	C.2
1.531	B.129	C.2
1.532	B.130	C.2
1.533	B.131	C.2
1.534	B.132	C.2
1.535	B.133	C.2
1.536	B.134	C.2
1.537	B.135	C.2
1.538	B.136	C.2
1.539	B.137	C.2
1.540	B.138	C.2
1.541	B.139	C.2
1.542	B.140	C.2
1.543	B.141	C.2
1.544	B.142	C.2
1.545	B.143	C.2
1.546	B.144	C.2
1.547	B.145	C.2
1.548	B.146	C.2
1.549	B.147	C.2
1.550	B.148	C.2
1.551	B.149	C.2
1.552	B.150	C.2
1.553	B.151	C.2
1.554	B.152	C.2
1.555	B.153	C.2
1.556	B.154	C.2
1.557	B.155	C.2
1.558	B.156	C.2
1.559	B.157	C.2
1.560	B.158	C.2
1.561	B.159	C.2
1.562	B.160	C.2
1.563	B.161	C.2
1.564	B.162	C.2
1.565	B.163	C.2

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.566	B.164	C.2
1.567	B.165	C.2
1.568	B.166	C.2
1.569	B.167	C.2
1.570	B.168	C.2
1.571	B.169	C.2
1.572	B.170	C.2
1.573	B.171	C.2
1.574	B.172	C.2
1.575	B.173	C.2
1.576	B.174	C.2
1.577	B.175	C.2
1.578	B.176	C.2
1.579	B.177	C.2
1.580	B.178	C.2
1.581	B.179	C.2
1.582	B.180	C.2
1.583	B.181	C.2
1.584	B.182	C.2
1.585	B.183	C.2
1.586	B.184	C.2
1.587	B.185	C.2
1.588	B.186	C.2
1.589	B.187	C.2
1.590	B.188	C.2
1.591	B.189	C.2
1.592	B.190	C.2
1.593	B.191	C.2
1.594	B.192	C.2
1.595	B.193	C.2
1.596	B.194	C.2
1.597	B.195	C.2
1.598	B.196	C.2
1.599	B.197	C.2
1.600	B.198	C.2
1.601	B.199	C.2
1.602	B.200	C.2
1.603	B.201	C.2
1.604	B.1	C.3
1.605	B.2	C.3
1.606	B.3	C.3
1.607	B.4	C.3
1.608	B.5	C.3
1.609	B.6	C.3
1.610	B.7	C.3
1.611	B.8	C.3

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.612	B.9	C.3
1.613	B.10	C.3
1.614	B.11	C.3
1.615	B.12	C.3
1.616	B.13	C.3
1.617	B.14	C.3
1.618	B.15	C.3
1.619	B.16	C.3
1.620	B.17	C.3
1.621	B.18	C.3
1.622	B.19	C.3
1.623	B.20	C.3
1.624	B.21	C.3
1.625	B.22	C.3
1.626	B.23	C.3
1.627	B.24	C.3
1.628	B.25	C.3
1.629	B.26	C.3
1.630	B.27	C.3
1.631	B.28	C.3
1.632	B.29	C.3
1.633	B.30	C.3
1.634	B.31	C.3
1.635	B.32	C.3
1.636	B.33	C.3
1.637	B.34	C.3
1.638	B.35	C.3
1.639	B.36	C.3
1.640	B.37	C.3
1.641	B.38	C.3
1.642	B.39	C.3
1.643	B.40	C.3
1.644	B.41	C.3
1.645	B.42	C.3
1.646	B.43	C.3
1.647	B.44	C.3
1.648	B.45	C.3
1.649	B.46	C.3
1.650	B.47	C.3
1.651	B.48	C.3
1.652	B.49	C.3
1.653	B.50	C.3
1.654	B.51	C.3
1.655	B.52	C.3
1.656	B.53	C.3
1.657	B.54	C.3

[0984]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.658	B.55	C.3
1.659	B.56	C.3
1.660	B.57	C.3
1.661	B.58.	C.3
1.662	B.59	C.3
1.663	B.60	C.3
1.664	B.61	C.3
1.665	B.62	C.3
1.666	B.63	C.3
1.667	B.64	C.3
1.668	B.65	C.3
1.669	B.66	C.3
1.670	B.67	C.3
1.671	B.68	C.3
1.672	B.69	C.3
1.673	B.70	C.3
1.674	B.71	C.3
1.675	B.72	C.3
1.676	B.73	C.3
1.677	B.74	C.3
1.678	B.75	C.3
1.679	B.76	C.3
1.680	B.77	C.3
1.681	B.78	C.3
1.682	B.79	C.3
1.683	B.80	C.3
1.684	B.81	C.3
1.685	B.82	C.3
1.686	B.83	C.3
1.687	B.84	C.3
1.688	B.85	C.3
1.689	B.86	C.3
1.690	B.87	C.3
1.691	B.88	C.3
1.692	B.89	C.3
1.693	B.90	C.3
1.694	B.91	C.3
1.695	B.92	C.3
1.696	B.93	C.3
1.697	B.94	C.3
1.698	B.95	C.3
1.699	B.96	C.3
1.700	B.97	C.3
1.701	B.98	C.3
1.702	B.99	C.3
1.703	B.100	C.3

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.704	B.101	C.3
1.705	B.102	C.3
1.706	B.103	C.3
1.707	B.104	C.3
1.708	B.105	C.3
1.709	B.106	C.3
1.710	B.107	C.3
1.711	B.108	C.3
1.712	B.109	C.3
1.713	B.110	C.3
1.714	B.111	C.3
1.715	B.112	C.3
1.716	B.113	C.3
1.717	B.114	C.3
1.718	B.115	C.3
1.719	B.116	C.3
1.720	B.117	C.3
1.721	B.118	C.3
1.722	B.119	C.3
1.723	B.120	C.3
1.724	B.121	C.3
1.725	B.122	C.3
1.726	B.123	C.3
1.727	B.124	C.3
1.728	B.125	C.3
1.729	B.126	C.3
1.730	B.127	C.3
1.731	B.128	C.3
1.732	B.129	C.3
1.733	B.130	C.3
1.734	B.131	C.3
1.735	B.132	C.3
1.736	B.133	C.3
1.737	B.134	C.3
1.738	B.135	C.3
1.739	B.136	C.3
1.740	B.137	C.3
1.741	B.138	C.3
1.742	B.139	C.3
1.743	B.140	C.3
1.744	B.141	C.3
1.745	B.142	C.3
1.746	B.143	C.3
1.747	B.144	C.3
1.748	B.145	C.3
1.749	B.146	C.3

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.750	B.147	C.3
1.751	B.148	C.3
1.752	B.149	C.3
1.753	B.150	C.3
1.754	B.151	C.3
1.755	B.152	C.3
1.756	B.153	C.3
1.757	B.154	C.3
1.758	B.155	C.3
1.759	B.156	C.3
1.760	B.157	C.3
1.761	B.158	C.3
1.762	B.159	C.3
1.763	B.160	C.3
1.764	B.161	C.3
1.765	B.162	C.3
1.766	B.163	C.3
1.767	B.164	C.3
1.768	B.165	C.3
1.769	B.166	C.3
1.770	B.167	C.3
1.771	B.168	C.3
1.772	B.169	C.3
1.773	B.170	C.3
1.774	B.171	C.3
1.775	B.172	C.3
1.776	B.173	C.3
1.777	B.174	C.3
1.778	B.175	C.3
1.779	B.176	C.3
1.780	B.177	C.3
1.781	B.178	C.3
1.782	B.179	C.3
1.783	B.180	C.3
1.784	B.181	C.3
1.785	B.182	C.3
1.786	B.183	C.3
1.787	B.184	C.3
1.788	B.185	C.3
1.789	B.186	C.3
1.790	B.187	C.3
1.791	B.188	C.3
1.792	B.189	C.3
1.793	B.190	C.3
1.794	B.191	C.3
1.795	B.192	C.3

[0985]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.796	B.193	C.3
1.797	B.194	C.3
1.798	B.195	C.3
1.799	B.196	C.3
1.800	B.197	C.3
1.801	B.198	C.3
1.802	B.199	C.3
1.803	B.200	C.3
1.804	B.201	C.3
1.805	B.1	C.4
1.806	B.2	C.4
1.807	B.3	C.4
1.808	B.4	C.4
1.809	B.5	C.4
1.810	B.6	C.4
1.811	B.7	C.4
1.812	B.8	C.4
1.813	B.9	C.4
1.814	B.10	C.4
1.815	B.11	C.4
1.816	B.12	C.4
1.817	B.13	C.4
1.818	B.14	C.4
1.819	B.15	C.4
1.820	B.16	C.4
1.821	B.17	C.4
1.822	B.18	C.4
1.823	B.19	C.4
1.824	B.20	C.4
1.825	B.21	C.4
1.826	B.22	C.4
1.827	B.23	C.4
1.828	B.24	C.4
1.829	B.25	C.4
1.830	B.26	C.4
1.831	B.27	C.4
1.832	B.28	C.4
1.833	B.29	C.4
1.834	B.30	C.4
1.835	B.31	C.4
1.836	B.32	C.4
1.837	B.33	C.4
1.838	B.34	C.4
1.839	B.35	C.4
1.840	B.36	C.4
1.841	B.37	C.4

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.842	B.38	C.4
1.843	B.39	C.4
1.844	B.40	C.4
1.845	B.41	C.4
1.846	B.42	C.4
1.847	B.43	C.4
1.848	B.44	C.4
1.849	B.45	C.4
1.850	B.46	C.4
1.851	B.47	C.4
1.852	B.48	C.4
1.853	B.49	C.4
1.854	B.50	C.4
1.855	B.51	C.4
1.856	B.52	C.4
1.857	B.53	C.4
1.858	B.54	C.4
1.859	B.55	C.4
1.860	B.56	C.4
1.861	B.57	C.4
1.862	B.58	C.4
1.863	B.59	C.4
1.864	B.60	C.4
1.865	B.61	C.4
1.866	B.62	C.4
1.867	B.63	C.4
1.868	B.64	C.4
1.869	B.65	C.4
1.870	B.66	C.4
1.871	B.67	C.4
1.872	B.68	C.4
1.873	B.69	C.4
1.874	B.70	C.4
1.875	B.71	C.4
1.876	B.72	C.4
1.877	B.73	C.4
1.878	B.74	C.4
1.879	B.75	C.4
1.880	B.76	C.4
1.881	B.77	C.4
1.882	B.78	C.4
1.883	B.79	C.4
1.884	B.80	C.4
1.885	B.81	C.4
1.886	B.82	C.4
1.887	B.83	C.4

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.888	B.84	C.4
1.889	B.85	C.4
1.890	B.86	C.4
1.891	B.87	C.4
1.892	B.88	C.4
1.893	B.89	C.4
1.894	B.90	C.4
1.895	B.91	C.4
1.896	B.92	C.4
1.897	B.93	C.4
1.898	B.94	C.4
1.899	B.95	C.4
1.900	B.96	C.4
1.901	B.97	C.4
1.902	B.98	C.4
1.903	B.99	C.4
1.904	B.100	C.4
1.905	B.101	C.4
1.906	B.102	C.4
1.907	B.103	C.4
1.908	B.104	C.4
1.909	B.105	C.4
1.910	B.106	C.4
1.911	B.107	C.4
1.912	B.108	C.4
1.913	B.109	C.4
1.914	B.110	C.4
1.915	B.111	C.4
1.916	B.112	C.4
1.917	B.113	C.4
1.918	B.114	C.4
1.919	B.115	C.4
1.920	B.116	C.4
1.921	B.117	C.4
1.922	B.118	C.4
1.923	B.119	C.4
1.924	B.120	C.4
1.925	B.121	C.4
1.926	B.122	C.4
1.927	B.123	C.4
1.928	B.124	C.4
1.929	B.125	C.4
1.930	B.126	C.4
1.931	B.127	C.4
1.932	B.128	C.4
1.933	B.129	C.4

[0986]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.934	B.130	C.4
1.935	B.131	C.4
1.936	B.132	C.4
1.937	B.133	C.4
1.938	B.134	C.4
1.939	B.135	C.4
1.940	B.136	C.4
1.941	B.137	C.4
1.942	B.138	C.4
1.943	B.139	C.4
1.944	B.140	C.4
1.945	B.141	C.4
1.946	B.142	C.4
1.947	B.143	C.4
1.948	B.144	C.4
1.949	B.145	C.4
1.950	B.146	C.4
1.951	B.147	C.4
1.952	B.148	C.4
1.953	B.149	C.4
1.954	B.150	C.4
1.955	B.151	C.4
1.956	B.152	C.4
1.957	B.153	C.4
1.958	B.154	C.4
1.959	B.155	C.4
1.960	B.156	C.4
1.961	B.157	C.4
1.962	B.158	C.4
1.963	B.159	C.4
1.964	B.160	C.4
1.965	B.161	C.4
1.966	B.162	C.4
1.967	B.163	C.4
1.968	B.164	C.4
1.969	B.165	C.4
1.970	B.166	C.4
1.971	B.167	C.4
1.972	B.168	C.4
1.973	B.169	C.4
1.974	B.170	C.4
1.975	B.171	C.4
1.976	B.172	C.4
1.977	B.173	C.4
1.978	B.174	C.4
1.979	B.175	C.4

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.980	B.176	C.4
1.981	B.177	C.4
1.982	B.178	C.4
1.983	B.179	C.4
1.984	B.180	C.4
1.985	B.181	C.4
1.986	B.182	C.4
1.987	B.183	C.4
1.988	B.184	C.4
1.989	B.185	C.4
1.990	B.186	C.4
1.991	B.187	C.4
1.992	B.188	C.4
1.993	B.189	C.4
1.994	B.190	C.4
1.995	B.191	C.4
1.996	B.192	C.4
1.997	B.193	C.4
1.998	B.194	C.4
1.999	B.195	C.4
1.1000	B.196	C.4
1.1001	B.197	C.4
1.1002	B.198	C.4
1.1003	B.199	C.4
1.1004	B.200	C.4
1.1005	B.201	C.4
1.1006	B.1	C.5
1.1007	B.2	C.5
1.1008	B.3	C.5
1.1009	B.4	C.5
1.1010	B.5	C.5
1.1011	B.6	C.5
1.1012	B.7	C.5
1.1013	B.8	C.5
1.1014	B.9	C.5
1.1015	B.10	C.5
1.1016	B.11	C.5
1.1017	B.12	C.5
1.1018	B.13	C.5
1.1019	B.14	C.5
1.1020	B.15	C.5
1.1021	B.16	C.5
1.1022	B.17	C.5
1.1023	B.18	C.5
1.1024	B.19	C.5
1.1025	B.20	C.5

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1026	B.21	C.5
1.1027	B.22	C.5
1.1028	B.23	C.5
1.1029	B.24	C.5
1.1030	B.25	C.5
1.1031	B.26	C.5
1.1032	B.27	C.5
1.1033	B.28	C.5
1.1034	B.29	C.5
1.1035	B.30	C.5
1.1036	B.31	C.5
1.1037	B.32	C.5
1.1038	B.33	C.5
1.1039	B.34	C.5
1.1040	B.35	C.5
1.1041	B.36	C.5
1.1042	B.37	C.5
1.1043	B.38	C.5
1.1044	B.39	C.5
1.1045	B.40	C.5
1.1046	B.41	C.5
1.1047	B.42	C.5
1.1048	B.43	C.5
1.1049	B.44	C.5
1.1050	B.45	C.5
1.1051	B.46	C.5
1.1052	B.47	C.5
1.1053	B.48	C.5
1.1054	B.49	C.5
1.1055	B.50	C.5
1.1056	B.51	C.5
1.1057	B.52	C.5
1.1058	B.53	C.5
1.1059	B.54	C.5
1.1060	B.55	C.5
1.1061	B.56	C.5
1.1062	B.57	C.5
1.1063	B.58	C.5
1.1064	B.59	C.5
1.1065	B.60	C.5
1.1066	B.61	C.5
1.1067	B.62	C.5
1.1068	B.63	C.5
1.1069	B.64	C.5
1.1070	B.65	C.5
1.1071	B.66	C.5

[0987]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1072	B.67	C.5
1.1073	B.68	C.5
1.1074	B.69	C.5
1.1075	B.70	C.5
1.1076	B.71	C.5
1.1077	B.72	C.5
1.1078	B.73	C.5
1.1079	B.74	C.5
1.1080	B.75	C.5
1.1081	B.76	C.5
1.1082	B.77	C.5
1.1083	B.78	C.5
1.1084	B.79	C.5
1.1085	B.80	C.5
1.1086	B.81	C.5
1.1087	B.82	C.5
1.1088	B.83	C.5
1.1089	B.84	C.5
1.1090	B.85	C.5
1.1091	B.86	C.5
1.1092	B.87	C.5
1.1093	B.88	C.5
1.1094	B.89	C.5
1.1095	B.90	C.5
1.1096	B.91	C.5
1.1097	B.92	C.5
1.1098	B.93	C.5
1.1099	B.94	C.5
1.1100	B.95	C.5
1.1101	B.96	C.5
1.1102	B.97	C.5
1.1103	B.98	C.5
1.1104	B.99	C.5
1.1105	B.100	C.5
1.1106	B.101	C.5
1.1107	B.102	C.5
1.1108	B.103	C.5
1.1109	B.104	C.5
1.1110	B.105	C.5
1.1111	B.106	C.5
1.1112	B.107	C.5
1.1113	B.108	C.5
1.1114	B.109	C.5
1.1115	B.110	C.5
1.1116	B.111	C.5
1.1117	B.112	C.5

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1118	B.113	C.5
1.1119	B.114	C.5
1.1120	B.115	C.5
1.1121	B.116	C.5
1.1122	B.117	C.5
1.1123	B.118	C.5
1.1124	B.119	C.5
1.1125	B.120	C.5
1.1126	B.121	C.5
1.1127	B.122	C.5
1.1128	B.123	C.5
1.1129	B.124	C.5
1.1130	B.125	C.5
1.1131	B.126	C.5
1.1132	B.127	C.5
1.1133	B.128	C.5
1.1134	B.129	C.5
1.1135	B.130	C.5
1.1136	B.131	C.5
1.1137	B.132	C.5
1.1138	B.133	C.5
1.1139	B.134	C.5
1.1140	B.135	C.5
1.1141	B.136	C.5
1.1142	B.137	C.5
1.1143	B.138	C.5
1.1144	B.139	C.5
1.1145	B.140	C.5
1.1146	B.141	C.5
1.1147	B.142	C.5
1.1148	B.143	C.5
1.1149	B.144	C.5
1.1150	B.145	C.5
1.1151	B.146	C.5
1.1152	B.147	C.5
1.1153	B.148	C.5
1.1154	B.149	C.5
1.1155	B.150	C.5
1.1156	B.151	C.5
1.1157	B.152	C.5
1.1158	B.153	C.5
1.1159	B.154	C.5
1.1160	B.155	C.5
1.1161	B.156	C.5
1.1162	B.157	C.5
1.1163	B.158	C.5

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1164	B.159	C.5
1.1165	B.160	C.5
1.1166	B.161	C.5
1.1167	B.162	C.5
1.1168	B.163	C.5
1.1169	B.164	C.5
1.1170	B.165	C.5
1.1171	B.166	C.5
1.1172	B.167	C.5
1.1173	B.168	C.5
1.1174	B.169	C.5
1.1175	B.170	C.5
1.1176	B.171	C.5
1.1177	B.172	C.5
1.1178	B.173	C.5
1.1179	B.174	C.5
1.1180	B.175	C.5
1.1181	B.176	C.5
1.1182	B.177	C.5
1.1183	B.178	C.5
1.1184	B.179	C.5
1.1185	B.180	C.5
1.1186	B.181	C.5
1.1187	B.182	C.5
1.1188	B.183	C.5
1.1189	B.184	C.5
1.1190	B.185	C.5
1.1191	B.186	C.5
1.1192	B.187	C.5
1.1193	B.188	C.5
1.1194	B.189	C.5
1.1195	B.190	C.5
1.1196	B.191	C.5
1.1197	B.192	C.5
1.1198	B.193	C.5
1.1199	B.194	C.5
1.1200	B.195	C.5
1.1201	B.196	C.5
1.1202	B.197	C.5
1.1203	B.198	C.5
1.1204	B.199	C.5
1.1205	B.200	C.5
1.1206	B.201	C.5
1.1207	B.1	C.6
1.1208	B.2	C.6
1.1209	B.3	C.6

[0988]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1210	B.4	C.6
1.1211	B.5	C.6
1.1212	B.6	C.6
1.1213	B.7	C.6
1.1214	B.8	C.6
1.1215	B.9	C.6
1.1216	B.10	C.6
1.1217	B.11	C.6
1.1218	B.12	C.6
1.1219	B.13	C.6
1.1220	B.14	C.6
1.1221	B.15	C.6
1.1222	B.16	C.6
1.1223	B.17	C.6
1.1224	B.18	C.6
1.1225	B.19	C.6
1.1226	B.20	C.6
1.1227	B.21	C.6
1.1228	B.22	C.6
1.1229	B.23	C.6
1.1230	B.24	C.6
1.1231	B.25	C.6
1.1232	B.26	C.6
1.1233	B.27	C.6
1.1234	B.28	C.6
1.1235	B.29	C.6
1.1236	B.30	C.6
1.1237	B.31	C.6
1.1238	B.32	C.6
1.1239	B.33	C.6
1.1240	B.34	C.6
1.1241	B.35	C.6
1.1242	B.36	C.6
1.1243	B.37	C.6
1.1244	B.38	C.6
1.1245	B.39	C.6
1.1246	B.40	C.6
1.1247	B.41	C.6
1.1248	B.42	C.6
1.1249	B.43	C.6
1.1250	B.44	C.6
1.1251	B.45	C.6
1.1252	B.46	C.6
1.1253	B.47	C.6
1.1254	B.48	C.6
1.1255	B.49	C.6

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1256	B.50	C.6
1.1257	B.51	C.6
1.1258	B.52	C.6
1.1259	B.53	C.6
1.1260	B.54	C.6
1.1261	B.55	C.6
1.1262	B.56	C.6
1.1263	B.57	C.6
1.1264	B.58	C.6
1.1265	B.59	C.6
1.1266	B.60	C.6
1.1267	B.61	C.6
1.1268	B.62	C.6
1.1269	B.63	C.6
1.1270	B.64	C.6
1.1271	B.65	C.6
1.1272	B.66	C.6
1.1273	B.67	C.6
1.1274	B.68	C.6
1.1275	B.69	C.6
1.1276	B.70	C.6
1.1277	B.71	C.6
1.1278	B.72	C.6
1.1279	B.73	C.6
1.1280	B.74	C.6
1.1281	B.75	C.6
1.1282	B.76	C.6
1.1283	B.77	C.6
1.1284	B.78	C.6
1.1285	B.79	C.6
1.1286	B.80	C.6
1.1287	B.81	C.6
1.1288	B.82	C.6
1.1289	B.83	C.6
1.1290	B.84	C.6
1.1291	B.85	C.6
1.1292	B.86	C.6
1.1293	B.87	C.6
1.1294	B.88	C.6
1.1295	B.89	C.6
1.1296	B.90	C.6
1.1297	B.91	C.6
1.1298	B.92	C.6
1.1299	B.93	C.6
1.1300	B.94	C.6
1.1301	B.95	C.6

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1302	B.96	C.6
1.1303	B.97	C.6
1.1304	B.98	C.6
1.1305	B.99	C.6
1.1306	B.100	C.6
1.1307	B.101	C.6
1.1308	B.102	C.6
1.1309	B.103	C.6
1.1310	B.104	C.6
1.1311	B.105	C.6
1.1312	B.106	C.6
1.1313	B.107	C.6
1.1314	B.108	C.6
1.1315	B.109	C.6
1.1316	B.110	C.6
1.1317	B.111	C.6
1.1318	B.112	C.6
1.1319	B.113	C.6
1.1320	B.114	C.6
1.1321	B.115	C.6
1.1322	B.116	C.6
1.1323	B.117	C.6
1.1324	B.118	C.6
1.1325	B.119	C.6
1.1326	B.120	C.6
1.1327	B.121	C.6
1.1328	B.122	C.6
1.1329	B.123	C.6
1.1330	B.124	C.6
1.1331	B.125	C.6
1.1332	B.126	C.6
1.1333	B.127	C.6
1.1334	B.128	C.6
1.1335	B.129	C.6
1.1336	B.130	C.6
1.1337	B.131	C.6
1.1338	B.132	C.6
1.1339	B.133	C.6
1.1340	B.134	C.6
1.1341	B.135	C.6
1.1342	B.136	C.6
1.1343	B.137	C.6
1.1344	B.138	C.6
1.1345	B.139	C.6
1.1346	B.140	C.6
1.1347	B.141	C.6

[0989]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1348	B.142	C.6
1.1349	B.143	C.6
1.1350	B.144	C.6
1.1351	B.145	C.6
1.1352	B.146	C.6
1.1353	B.147	C.6
1.1354	B.148	C.6
1.1355	B.149	C.6
1.1356	B.150	C.6
1.1357	B.151	C.6
1.1358	B.152	C.6
1.1359	B.153	C.6
1.1360	B.154	C.6
1.1361	B.155	C.6
1.1362	B.156	C.6
1.1363	B.157	C.6
1.1364	B.158	C.6
1.1365	B.159	C.6
1.1366	B.160	C.6
1.1367	B.161	C.6
1.1368	B.162	C.6
1.1369	B.163	C.6
1.1370	B.164	C.6
1.1371	B.165	C.6
1.1372	B.166	C.6
1.1373	B.167	C.6
1.1374	B.168	C.6
1.1375	B.169	C.6
1.1376	B.170	C.6
1.1377	B.171	C.6
1.1378	B.172	C.6
1.1379	B.173	C.6
1.1380	B.174	C.6
1.1381	B.175	C.6
1.1382	B.176	C.6
1.1383	B.177	C.6
1.1384	B.178	C.6
1.1385	B.179	C.6
1.1386	B.180	C.6
1.1387	B.181	C.6
1.1388	B.182	C.6
1.1389	B.183	C.6
1.1390	B.184	C.6
1.1391	B.185	C.6
1.1392	B.186	C.6
1.1393	B.187	C.6

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1394	B.188	C.6
1.1395	B.189	C.6
1.1396	B.190	C.6
1.1397	B.191	C.6
1.1398	B.192	C.6
1.1399	B.193	C.6
1.1400	B.194	C.6
1.1401	B.195	C.6
1.1402	B.196	C.6
1.1403	B.197	C.6
1.1404	B.198	C.6
1.1405	B.199	C.6
1.1406	B.200	C.6
1.1407	B.201	C.6
1.1408	B.1	C.7
1.1409	B.2	C.7
1.1410	B.3	C.7
1.1411	B.4	C.7
1.1412	B.5	C.7
1.1413	B.6	C.7
1.1414	B.7	C.7
1.1415	B.8	C.7
1.1416	B.9	C.7
1.1417	B.10	C.7
1.1418	B.11	C.7
1.1419	B.12	C.7
1.1420	B.13	C.7
1.1421	B.14	C.7
1.1422	B.15	C.7
1.1423	B.16	C.7
1.1424	B.17	C.7
1.1425	B.18	C.7
1.1426	B.19	C.7
1.1427	B.20	C.7
1.1428	B.21	C.7
1.1429	B.22	C.7
1.1430	B.23	C.7
1.1431	B.24	C.7
1.1432	B.25	C.7
1.1433	B.26	C.7
1.1434	B.27	C.7
1.1435	B.28	C.7
1.1436	B.29	C.7
1.1437	B.30	C.7
1.1438	B.31	C.7
1.1439	B.32	C.7

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1440	B.33	C.7
1.1441	B.34	C.7
1.1442	B.35	C.7
1.1443	B.36	C.7
1.1444	B.37	C.7
1.1445	B.38	C.7
1.1446	B.39	C.7
1.1447	B.40	C.7
1.1448	B.41	C.7
1.1449	B.42	C.7
1.1450	B.43	C.7
1.1451	B.44	C.7
1.1452	B.45	C.7
1.1453	B.46	C.7
1.1454	B.47	C.7
1.1455	B.48	C.7
1.1456	B.49	C.7
1.1457	B.50	C.7
1.1458	B.51	C.7
1.1459	B.52	C.7
1.1460	B.53	C.7
1.1461	B.54	C.7
1.1462	B.55	C.7
1.1463	B.56	C.7
1.1464	B.57	C.7
1.1465	B.58	C.7
1.1466	B.59	C.7
1.1467	B.60	C.7
1.1468	B.61	C.7
1.1469	B.62	C.7
1.1470	B.63	C.7
1.1471	B.64	C.7
1.1472	B.65	C.7
1.1473	B.66	C.7
1.1474	B.67	C.7
1.1475	B.68	C.7
1.1476	B.69	C.7
1.1477	B.70	C.7
1.1478	B.71	C.7
1.1479	B.72	C.7
1.1480	B.73	C.7
1.1481	B.74	C.7
1.1482	B.75	C.7
1.1483	B.76	C.7
1.1484	B.77	C.7
1.1485	B.78	C.7

[0990]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1486	B.79	C.7
1.1487	B.80	C.7
1.1488	B.81	C.7
1.1489	B.82	C.7
1.1490	B.83	C.7
1.1491	B.84	C.7
1.1492	B.85	C.7
1.1493	B.86	C.7
1.1494	B.87	C.7
1.1495	B.88	C.7
1.1496	B.89	C.7
1.1497	B.90	C.7
1.1498	B.91	C.7
1.1499	B.92	C.7
1.1500	B.93	C.7
1.1501	B.94	C.7
1.1502	B.95	C.7
1.1503	B.96	C.7
1.1504	B.97	C.7
1.1505	B.98	C.7
1.1506	B.99	C.7
1.1507	B.100	C.7
1.1508	B.101	C.7
1.1509	B.102	C.7
1.1510	B.103	C.7
1.1511	B.104	C.7
1.1512	B.105	C.7
1.1513	B.106	C.7
1.1514	B.107	C.7
1.1515	B.108	C.7
1.1516	B.109	C.7
1.1517	B.110	C.7
1.1518	B.111	C.7
1.1519	B.112	C.7
1.1520	B.113	C.7
1.1521	B.114	C.7
1.1522	B.115	C.7
1.1523	B.116	C.7
1.1524	B.117	C.7
1.1525	B.118	C.7
1.1526	B.119	C.7
1.1527	B.120	C.7
1.1528	B.121	C.7
1.1529	B.122	C.7
1.1530	B.123	C.7
1.1531	B.124	C.7

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1532	B.125	C.7
1.1533	B.126	C.7
1.1534	B.127	C.7
1.1535	B.128	C.7
1.1536	B.129	C.7
1.1537	B.130	C.7
1.1538	B.131	C.7
1.1539	B.132	C.7
1.1540	B.133	C.7
1.1541	B.134	C.7
1.1542	B.135	C.7
1.1543	B.136	C.7
1.1544	B.137	C.7
1.1545	B.138	C.7
1.1546	B.139	C.7
1.1547	B.140	C.7
1.1548	B.141	C.7
1.1549	B.142	C.7
1.1550	B.143	C.7
1.1551	B.144	C.7
1.1552	B.145	C.7
1.1553	B.146	C.7
1.1554	B.147	C.7
1.1555	B.148	C.7
1.1556	B.149	C.7
1.1557	B.150	C.7
1.1558	B.151	C.7
1.1559	B.152	C.7
1.1560	B.153	C.7
1.1561	B.154	C.7
1.1562	B.155	C.7
1.1563	B.156	C.7
1.1564	B.157	C.7
1.1565	B.158	C.7
1.1566	B.159	C.7
1.1567	B.160	C.7
1.1568	B.161	C.7
1.1569	B.162	C.7
1.1570	B.163	C.7
1.1571	B.164	C.7
1.1572	B.165	C.7
1.1573	B.166	C.7
1.1574	B.167	C.7
1.1575	B.168	C.7
1.1576	B.169	C.7
1.1577	B.170	C.7

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1578	B.171	C.7
1.1579	B.172	C.7
1.1580	B.173	C.7
1.1581	B.174	C.7
1.1582	B.175	C.7
1.1583	B.176	C.7
1.1584	B.177	C.7
1.1585	B.178	C.7
1.1586	B.179	C.7
1.1587	B.180	C.7
1.1588	B.181	C.7
1.1589	B.182	C.7
1.1590	B.183	C.7
1.1591	B.184	C.7
1.1592	B.185	C.7
1.1593	B.186	C.7
1.1594	B.187	C.7
1.1595	B.188	C.7
1.1596	B.189	C.7
1.1597	B.190	C.7
1.1598	B.191	C.7
1.1599	B.192	C.7
1.1600	B.193	C.7
1.1601	B.194	C.7
1.1602	B.195	C.7
1.1603	B.196	C.7
1.1604	B.197	C.7
1.1605	B.198	C.7
1.1606	B.199	C.7
1.1607	B.200	C.7
1.1608	B.201	C.7
1.1609	B.1	C.8
1.1610	B.2	C.8
1.1611	B.3	C.8
1.1612	B.4	C.8
1.1613	B.5	C.8
1.1614	B.6	C.8
1.1615	B.7	C.8
1.1616	B.8	C.8
1.1617	B.9	C.8
1.1618	B.10	C.8
1.1619	B.11	C.8
1.1620	B.12	C.8
1.1621	B.13	C.8
1.1622	B.14	C.8
1.1623	B.15	C.8

[0991]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1624	B.16	C.8
1.1625	B.17	C.8
1.1626	B.18	C.8
1.1627	B.19	C.8
1.1628	B.20	C.8
1.1629	B.21	C.8
1.1630	B.22	C.8
1.1631	B.23	C.8
1.1632	B.24	C.8
1.1633	B.25	C.8
1.1634	B.26	C.8
1.1635	B.27	C.8
1.1636	B.28	C.8
1.1637	B.29	C.8
1.1638	B.30	C.8
1.1639	B.31	C.8
1.1640	B.32	C.8
1.1641	B.33	C.8
1.1642	B.34	C.8
1.1643	B.35	C.8
1.1644	B.36	C.8
1.1645	B.37	C.8
1.1646	B.38	C.8
1.1647	B.39	C.8
1.1648	B.40	C.8
1.1649	B.41	C.8
1.1650	B.42	C.8
1.1651	B.43	C.8
1.1652	B.44	C.8
1.1653	B.45	C.8
1.1654	B.46	C.8
1.1655	B.47	C.8
1.1656	B.48	C.8
1.1657	B.49	C.8
1.1658	B.50	C.8
1.1659	B.51	C.8
1.1660	B.52	C.8
1.1661	B.53	C.8
1.1662	B.54	C.8
1.1663	B.55	C.8
1.1664	B.56	C.8
1.1665	B.57	C.8
1.1666	B.58	C.8
1.1667	B.59	C.8
1.1668	B.60	C.8
1.1669	B.61	C.8

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1670	B.62	C.8
1.1671	B.63	C.8
1.1672	B.64	C.8
1.1673	B.65	C.8
1.1674	B.66	C.8
1.1675	B.67	C.8
1.1676	B.68	C.8
1.1677	B.69	C.8
1.1678	B.70	C.8
1.1679	B.71	C.8
1.1680	B.72	C.8
1.1681	B.73	C.8
1.1682	B.74	C.8
1.1683	B.75	C.8
1.1684	B.76	C.8
1.1685	B.77	C.8
1.1686	B.78	C.8
1.1687	B.79	C.8
1.1688	B.80	C.8
1.1689	B.81	C.8
1.1690	B.82	C.8
1.1691	B.83	C.8
1.1692	B.84	C.8
1.1693	B.85	C.8
1.1694	B.86	C.8
1.1695	B.87	C.8
1.1696	B.88	C.8
1.1697	B.89	C.8
1.1698	B.90	C.8
1.1699	B.91	C.8
1.1700	B.92	C.8
1.1701	B.93	C.8
1.1702	B.94	C.8
1.1703	B.95	C.8
1.1704	B.96	C.8
1.1705	B.97	C.8
1.1706	B.98	C.8
1.1707	B.99	C.8
1.1708	B.100	C.8
1.1709	B.101	C.8
1.1710	B.102	C.8
1.1711	B.103	C.8
1.1712	B.104	C.8
1.1713	B.105	C.8
1.1714	B.106	C.8
1.1715	B.107	C.8

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1716	B.108	C.8
1.1717	B.109	C.8
1.1718	B.110	C.8
1.1719	B.111	C.8
1.1720	B.112	C.8
1.1721	B.113	C.8
1.1722	B.114	C.8
1.1723	B.115	C.8
1.1724	B.116	C.8
1.1725	B.117	C.8
1.1726	B.118	C.8
1.1727	B.119	C.8
1.1728	B.120	C.8
1.1729	B.121	C.8
1.1730	B.122	C.8
1.1731	B.123	C.8
1.1732	B.124	C.8
1.1733	B.125	C.8
1.1734	B.126	C.8
1.1735	B.127	C.8
1.1736	B.128	C.8
1.1737	B.129	C.8
1.1738	B.130	C.8
1.1739	B.131	C.8
1.1740	B.132	C.8
1.1741	B.133	C.8
1.1742	B.134	C.8
1.1743	B.135	C.8
1.1744	B.136	C.8
1.1745	B.137	C.8
1.1746	B.138	C.8
1.1747	B.139	C.8
1.1748	B.140	C.8
1.1749	B.141	C.8
1.1750	B.142	C.8
1.1751	B.143	C.8
1.1752	B.144	C.8
1.1753	B.145	C.8
1.1754	B.146	C.8
1.1755	B.147	C.8
1.1756	B.148	C.8
1.1757	B.149	C.8
1.1758	B.150	C.8
1.1759	B.151	C.8
1.1760	B.152	C.8
1.1761	B.153	C.8

[0992]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1762	B.154	C.8
1.1763	B.155	C.8
1.1764	B.156	C.8
1.1765	B.157	C.8
1.1766	B.158	C.8
1.1767	B.159	C.8
1.1768	B.160	C.8
1.1769	B.161	C.8
1.1770	B.162	C.8
1.1771	B.163	C.8
1.1772	B.164	C.8
1.1773	B.165	C.8
1.1774	B.166	C.8
1.1775	B.167	C.8
1.1776	B.168	C.8
1.1777	B.169	C.8
1.1778	B.170	C.8
1.1779	B.171	C.8
1.1780	B.172	C.8
1.1781	B.173	C.8
1.1782	B.174	C.8
1.1783	B.175	C.8
1.1784	B.176	C.8
1.1785	B.177	C.8
1.1786	B.178	C.8
1.1787	B.179	C.8
1.1788	B.180	C.8
1.1789	B.181	C.8
1.1790	B.182	C.8
1.1791	B.183	C.8
1.1792	B.184	C.8
1.1793	B.185	C.8
1.1794	B.186	C.8
1.1795	B.187	C.8
1.1796	B.188	C.8
1.1797	B.189	C.8
1.1798	B.190	C.8
1.1799	B.191	C.8
1.1800	B.192	C.8
1.1801	B.193	C.8
1.1802	B.194	C.8
1.1803	B.195	C.8
1.1804	B.196	C.8
1.1805	B.197	C.8
1.1806	B.198	C.8
1.1807	B.199	C.8

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1808	B.200	C.8
1.1809	B.201	C.8
1.1810	B.1	C.9
1.1811	B.2	C.9
1.1812	B.3	C.9
1.1813	B.4	C.9
1.1814	B.5	C.9
1.1815	B.6	C.9
1.1816	B.7	C.9
1.1817	B.8	C.9
1.1818	B.9	C.9
1.1819	B.10	C.9
1.1820	B.11	C.9
1.1821	B.12	C.9
1.1822	B.13	C.9
1.1823	B.14	C.9
1.1824	B.15	C.9
1.1825	B.16	C.9
1.1826	B.17	C.9
1.1827	B.18	C.9
1.1828	B.19	C.9
1.1829	B.20	C.9
1.1830	B.21	C.9
1.1831	B.22	C.9
1.1832	B.23	C.9
1.1833	B.24	C.9
1.1834	B.25	C.9
1.1835	B.26	C.9
1.1836	B.27	C.9
1.1837	B.28	C.9
1.1838	B.29	C.9
1.1839	B.30	C.9
1.1840	B.31	C.9
1.1841	B.32	C.9
1.1842	B.33	C.9
1.1843	B.34	C.9
1.1844	B.35	C.9
1.1845	B.36	C.9
1.1846	B.37	C.9
1.1847	B.38	C.9
1.1848	B.39	C.9
1.1849	B.40	C.9
1.1850	B.41	C.9
1.1851	B.42	C.9
1.1852	B.43	C.9
1.1853	B.44	C.9

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1854	B.45	C.9
1.1855	B.46	C.9
1.1856	B.47	C.9
1.1857	B.48	C.9
1.1858	B.49	C.9
1.1859	B.50	C.9
1.1860	B.51	C.9
1.1861	B.52	C.9
1.1862	B.53	C.9
1.1863	B.54	C.9
1.1864	B.55	C.9
1.1865	B.56	C.9
1.1866	B.57	C.9
1.1867	B.58	C.9
1.1868	B.59	C.9
1.1869	B.60	C.9
1.1870	B.61	C.9
1.1871	B.62	C.9
1.1872	B.63	C.9
1.1873	B.64	C.9
1.1874	B.65	C.9
1.1875	B.66	C.9
1.1876	B.67	C.9
1.1877	B.68	C.9
1.1878	B.69	C.9
1.1879	B.70	C.9
1.1880	B.71	C.9
1.1881	B.72	C.9
1.1882	B.73	C.9
1.1883	B.74	C.9
1.1884	B.75	C.9
1.1885	B.76	C.9
1.1886	B.77	C.9
1.1887	B.78	C.9
1.1888	B.79	C.9
1.1889	B.80	C.9
1.1890	B.81	C.9
1.1891	B.82	C.9
1.1892	B.83	C.9
1.1893	B.84	C.9
1.1894	B.85	C.9
1.1895	B.86	C.9
1.1896	B.87	C.9
1.1897	B.88	C.9
1.1898	B.89	C.9
1.1899	B.90	C.9

[0993]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1900	B.91	C.9
1.1901	B.92	C.9
1.1902	B.93	C.9
1.1903	B.94	C.9
1.1904	B.95	C.9
1.1905	B.96	C.9
1.1906	B.97	C.9
1.1907	B.98	C.9
1.1908	B.99	C.9
1.1909	B.100	C.9
1.1910	B.101	C.9
1.1911	B.102	C.9
1.1912	B.103	C.9
1.1913	B.104	C.9
1.1914	B.105	C.9
1.1915	B.106	C.9
1.1916	B.107	C.9
1.1917	B.108	C.9
1.1918	B.109	C.9
1.1919	B.110	C.9
1.1920	B.111	C.9
1.1921	B.112	C.9
1.1922	B.113	C.9
1.1923	B.114	C.9
1.1924	B.115	C.9
1.1925	B.116	C.9
1.1926	B.117	C.9
1.1927	B.118	C.9
1.1928	B.119	C.9
1.1929	B.120	C.9
1.1930	B.121	C.9
1.1931	B.122	C.9
1.1932	B.123	C.9
1.1933	B.124	C.9
1.1934	B.125	C.9
1.1935	B.126	C.9
1.1936	B.127	C.9
1.1937	B.128	C.9
1.1938	B.129	C.9
1.1939	B.130	C.9
1.1940	B.131	C.9
1.1941	B.132	C.9
1.1942	B.133	C.9
1.1943	B.134	C.9
1.1944	B.135	C.9
1.1945	B.136	C.9

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1946	B.137	C.9
1.1947	B.138	C.9
1.1948	B.139	C.9
1.1949	B.140	C.9
1.1950	B.141	C.9
1.1951	B.142	C.9
1.1952	B.143	C.9
1.1953	B.144	C.9
1.1954	B.145	C.9
1.1955	B.146	C.9
1.1956	B.147	C.9
1.1957	B.148	C.9
1.1958	B.149	C.9
1.1959	B.150	C.9
1.1960	B.151	C.9
1.1961	B.152	C.9
1.1962	B.153	C.9
1.1963	B.154	C.9
1.1964	B.155	C.9
1.1965	B.156	C.9
1.1966	B.157	C.9
1.1967	B.158	C.9
1.1968	B.159	C.9
1.1969	B.160	C.9
1.1970	B.161	C.9
1.1971	B.162	C.9
1.1972	B.163	C.9
1.1973	B.164	C.9
1.1974	B.165	C.9
1.1975	B.166	C.9
1.1976	B.167	C.9
1.1977	B.168	C.9
1.1978	B.169	C.9
1.1979	B.170	C.9
1.1980	B.171	C.9
1.1981	B.172	C.9
1.1982	B.173	C.9
1.1983	B.174	C.9
1.1984	B.175	C.9
1.1985	B.176	C.9
1.1986	B.177	C.9
1.1987	B.178	C.9
1.1988	B.179	C.9
1.1989	B.180	C.9
1.1990	B.181	C.9
1.1991	B.182	C.9

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.1992	B.183	C.9
1.1993	B.184	C.9
1.1994	B.185	C.9
1.1995	B.186	C.9
1.1996	B.187	C.9
1.1997	B.188	C.9
1.1998	B.189	C.9
1.1999	B.190	C.9
1.2000	B.191	C.9
1.2001	B.192	C.9
1.2002	B.193	C.9
1.2003	B.194	C.9
1.2004	B.195	C.9
1.2005	B.196	C.9
1.2006	B.197	C.9
1.2007	B.198	C.9
1.2008	B.199	C.9
1.2009	B.200	C.9
1.2010	B.201	C.9
1.2011	B.1	C.10
1.2012	B.2	C.10
1.2013	B.3	C.10
1.2014	B.4	C.10
1.2015	B.5	C.10
1.2016	B.6	C.10
1.2017	B.7	C.10
1.2018	B.8	C.10
1.2019	B.9	C.10
1.2020	B.10	C.10
1.2021	B.11	C.10
1.2022	B.12	C.10
1.2023	B.13	C.10
1.2024	B.14	C.10
1.2025	B.15	C.10
1.2026	B.16	C.10
1.2027	B.17	C.10
1.2028	B.18	C.10
1.2029	B.19	C.10
1.2030	B.20	C.10
1.2031	B.21	C.10
1.2032	B.22	C.10
1.2033	B.23	C.10
1.2034	B.24	C.10
1.2035	B.25	C.10
1.2036	B.26	C.10
1.2037	B.27	C.10

[0994]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2038	B.28	C.10
1.2039	B.29	C.10
1.2040	B.30	C.10
1.2041	B.31	C.10
1.2042	B.32	C.10
1.2043	B.33	C.10
1.2044	B.34	C.10
1.2045	B.35	C.10
1.2046	B.36	C.10
1.2047	B.37	C.10
1.2048	B.38	C.10
1.2049	B.39	C.10
1.2050	B.40	C.10
1.2051	B.41	C.10
1.2052	B.42	C.10
1.2053	B.43	C.10
1.2054	B.44	C.10
1.2055	B.45	C.10
1.2056	B.46	C.10
1.2057	B.47	C.10
1.2058	B.48	C.10
1.2059	B.49	C.10
1.2060	B.50	C.10
1.2061	B.51	C.10
1.2062	B.52	C.10
1.2063	B.53	C.10
1.2064	B.54	C.10
1.2065	B.55	C.10
1.2066	B.56	C.10
1.2067	B.57	C.10
1.2068	B.58	C.10
1.2069	B.59	C.10
1.2070	B.60	C.10
1.2071	B.61	C.10
1.2072	B.62	C.10
1.2073	B.63	C.10
1.2074	B.64	C.10
1.2075	B.65	C.10
1.2076	B.66	C.10
1.2077	B.67	C.10
1.2078	B.68	C.10
1.2079	B.69	C.10
1.2080	B.70	C.10
1.2081	B.71	C.10
1.2082	B.72	C.10
1.2083	B.73	C.10

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2084	B.74	C.10
1.2085	B.75	C.10
1.2086	B.76	C.10
1.2087	B.77	C.10
1.2088	B.78	C.10
1.2089	B.79	C.10
1.2090	B.80	C.10
1.2091	B.81	C.10
1.2092	B.82	C.10
1.2093	B.83	C.10
1.2094	B.84	C.10
1.2095	B.85	C.10
1.2096	B.86	C.10
1.2097	B.87	C.10
1.2098	B.88	C.10
1.2099	B.89	C.10
1.2100	B.90	C.10
1.2101	B.91	C.10
1.2102	B.92	C.10
1.2103	B.93	C.10
1.2104	B.94	C.10
1.2105	B.95	C.10
1.2106	B.96	C.10
1.2107	B.97	C.10
1.2108	B.98	C.10
1.2109	B.99	C.10
1.2110	B.100	C.10
1.2111	B.101	C.10
1.2112	B.102	C.10
1.2113	B.103	C.10
1.2114	B.104	C.10
1.2115	B.105	C.10
1.2116	B.106	C.10
1.2117	B.107	C.10
1.2118	B.108	C.10
1.2119	B.109	C.10
1.2120	B.110	C.10
1.2121	B.111	C.10
1.2122	B.112	C.10
1.2123	B.113	C.10
1.2124	B.114	C.10
1.2125	B.115	C.10
1.2126	B.116	C.10
1.2127	B.117	C.10
1.2128	B.118	C.10
1.2129	B.119	C.10

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2130	B.120	C.10
1.2131	B.121	C.10
1.2132	B.122	C.10
1.2133	B.123	C.10
1.2134	B.124	C.10
1.2135	B.125	C.10
1.2136	B.126	C.10
1.2137	B.127	C.10
1.2138	B.128	C.10
1.2139	B.129	C.10
1.2140	B.130	C.10
1.2141	B.131	C.10
1.2142	B.132	C.10
1.2143	B.133	C.10
1.2144	B.134	C.10
1.2145	B.135	C.10
1.2146	B.136	C.10
1.2147	B.137	C.10
1.2148	B.138	C.10
1.2149	B.139	C.10
1.2150	B.140	C.10
1.2151	B.141	C.10
1.2152	B.142	C.10
1.2153	B.143	C.10
1.2154	B.144	C.10
1.2155	B.145	C.10
1.2156	B.146	C.10
1.2157	B.147	C.10
1.2158	B.148	C.10
1.2159	B.149	C.10
1.2160	B.150	C.10
1.2161	B.151	C.10
1.2162	B.152	C.10
1.2163	B.153	C.10
1.2164	B.154	C.10
1.2165	B.155	C.10
1.2166	B.156	C.10
1.2167	B.157	C.10
1.2168	B.158	C.10
1.2169	B.159	C.10
1.2170	B.160	C.10
1.2171	B.161	C.10
1.2172	B.162	C.10
1.2173	B.163	C.10
1.2174	B.164	C.10
1.2175	B.165	C.10

[0995]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2176	B.166	C.10
1.2177	B.167	C.10
1.2178	B.168	C.10
1.2179	B.169	C.10
1.2180	B.170	C.10
1.2181	B.171	C.10
1.2182	B.172	C.10
1.2183	B.173	C.10
1.2184	B.174	C.10
1.2185	B.175	C.10
1.2186	B.176	C.10
1.2187	B.177	C.10
1.2188	B.178	C.10
1.2189	B.179	C.10
1.2190	B.180	C.10
1.2191	B.181	C.10
1.2192	B.182	C.10
1.2193	B.183	C.10
1.2194	B.184	C.10
1.2195	B.185	C.10
1.2196	B.186	C.10
1.2197	B.187	C.10
1.2198	B.188	C.10
1.2199	B.189	C.10
1.2200	B.190	C.10
1.2201	B.191	C.10
1.2202	B.192	C.10
1.2203	B.193	C.10
1.2204	B.194	C.10
1.2205	B.195	C.10
1.2206	B.196	C.10
1.2207	B.197	C.10
1.2208	B.198	C.10
1.2209	B.199	C.10
1.2210	B.200	C.10
1.2211	B.201	C.10
1.2212	B.1	C.11
1.2213	B.2	C.11
1.2214	B.3	C.11
1.2215	B.4	C.11
1.2216	B.5	C.11
1.2217	B.6	C.11
1.2218	B.7	C.11
1.2219	B.8	C.11
1.2220	B.9	C.11
1.2221	B.10	C.11

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2222	B.11	C.11
1.2223	B.12	C.11
1.2224	B.13	C.11
1.2225	B.14	C.11
1.2226	B.15	C.11
1.2227	B.16	C.11
1.2228	B.17	C.11
1.2229	B.18	C.11
1.2230	B.19	C.11
1.2231	B.20	C.11
1.2232	B.21	C.11
1.2233	B.22	C.11
1.2234	B.23	C.11
1.2235	B.24	C.11
1.2236	B.25	C.11
1.2237	B.26	C.11
1.2238	B.27	C.11
1.2239	B.28	C.11
1.2240	B.29	C.11
1.2241	B.30	C.11
1.2242	B.31	C.11
1.2243	B.32	C.11
1.2244	B.33	C.11
1.2245	B.34	C.11
1.2246	B.35	C.11
1.2247	B.36	C.11
1.2248	B.37	C.11
1.2249	B.38	C.11
1.2250	B.39	C.11
1.2251	B.40	C.11
1.2252	B.41	C.11
1.2253	B.42	C.11
1.2254	B.43	C.11
1.2255	B.44	C.11
1.2256	B.45	C.11
1.2257	B.46	C.11
1.2258	B.47	C.11
1.2259	B.48	C.11
1.2260	B.49	C.11
1.2261	B.50	C.11
1.2262	B.51	C.11
1.2263	B.52	C.11
1.2264	B.53	C.11
1.2265	B.54	C.11
1.2266	B.55	C.11
1.2267	B.56	C.11

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2268	B.57	C.11
1.2269	B.58	C.11
1.2270	B.59	C.11
1.2271	B.60	C.11
1.2272	B.61	C.11
1.2273	B.62	C.11
1.2274	B.63	C.11
1.2275	B.64	C.11
1.2276	B.65	C.11
1.2277	B.66	C.11
1.2278	B.67	C.11
1.2279	B.68	C.11
1.2280	B.69	C.11
1.2281	B.70	C.11
1.2282	B.71	C.11
1.2283	B.72	C.11
1.2284	B.73	C.11
1.2285	B.74	C.11
1.2286	B.75	C.11
1.2287	B.76	C.11
1.2288	B.77	C.11
1.2289	B.78	C.11
1.2290	B.79	C.11
1.2291	B.80	C.11
1.2292	B.81	C.11
1.2293	B.82	C.11
1.2294	B.83	C.11
1.2295	B.84	C.11
1.2296	B.85	C.11
1.2297	B.86	C.11
1.2298	B.87	C.11
1.2299	B.88	C.11
1.2300	B.89	C.11
1.2301	B.90	C.11
1.2302	B.91	C.11
1.2303	B.92	C.11
1.2304	B.93	C.11
1.2305	B.94	C.11
1.2306	B.95	C.11
1.2307	B.96	C.11
1.2308	B.97	C.11
1.2309	B.98	C.11
1.2310	B.99	C.11
1.2311	B.100	C.11
1.2312	B.101	C.11
1.2313	B.102	C.11

[0996]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2314	B.103	C.11
1.2315	B.104	C.11
1.2316	B.105	C.11
1.2317	B.106	C.11
1.2318	B.107	C.11
1.2319	B.108	C.11
1.2320	B.109	C.11
1.2321	B.110	C.11
1.2322	B.111	C.11
1.2323	B.112	C.11
1.2324	B.113	C.11
1.2325	B.114	C.11
1.2326	B.115	C.11
1.2327	B.116	C.11
1.2328	B.117	C.11
1.2329	B.118	C.11
1.2330	B.119	C.11
1.2331	B.120	C.11
1.2332	B.121	C.11
1.2333	B.122	C.11
1.2334	B.123	C.11
1.2335	B.124	C.11
1.2336	B.125	C.11
1.2337	B.126	C.11
1.2338	B.127	C.11
1.2339	B.128	C.11
1.2340	B.129	C.11
1.2341	B.130	C.11
1.2342	B.131	C.11
1.2343	B.132	C.11
1.2344	B.133	C.11
1.2345	B.134	C.11
1.2346	B.135	C.11
1.2347	B.136	C.11
1.2348	B.137	C.11
1.2349	B.138	C.11
1.2350	B.139	C.11
1.2351	B.140	C.11
1.2352	B.141	C.11
1.2353	B.142	C.11
1.2354	B.143	C.11
1.2355	B.144	C.11
1.2356	B.145	C.11
1.2357	B.146	C.11
1.2358	B.147	C.11
1.2359	B.148	C.11

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2360	B.149	C.11
1.2361	B.150	C.11
1.2362	B.151	C.11
1.2363	B.152	C.11
1.2364	B.153	C.11
1.2365	B.154	C.11
1.2366	B.155	C.11
1.2367	B.156	C.11
1.2368	B.157	C.11
1.2369	B.158	C.11
1.2370	B.159	C.11
1.2371	B.160	C.11
1.2372	B.161	C.11
1.2373	B.162	C.11
1.2374	B.163	C.11
1.2375	B.164	C.11
1.2376	B.165	C.11
1.2377	B.166	C.11
1.2378	B.167	C.11
1.2379	B.168	C.11
1.2380	B.169	C.11
1.2381	B.170	C.11
1.2382	B.171	C.11
1.2383	B.172	C.11
1.2384	B.173	C.11
1.2385	B.174	C.11
1.2386	B.175	C.11
1.2387	B.176	C.11
1.2388	B.177	C.11
1.2389	B.178	C.11
1.2390	B.179	C.11
1.2391	B.180	C.11
1.2392	B.181	C.11
1.2393	B.182	C.11
1.2394	B.183	C.11
1.2395	B.184	C.11
1.2396	B.185	C.11
1.2397	B.186	C.11
1.2398	B.187	C.11
1.2399	B.188	C.11
1.2400	B.189	C.11
1.2401	B.190	C.11
1.2402	B.191	C.11
1.2403	B.192	C.11
1.2404	B.193	C.11
1.2405	B.194	C.11

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2406	B.195	C.11
1.2407	B.196	C.11
1.2408	B.197	C.11
1.2409	B.198	C.11
1.2410	B.199	C.11
1.2411	B.200	C.11
1.2412	B.201	C.11
1.2413	B.1	C.12
1.2414	B.2	C.12
1.2415	B.3	C.12
1.2416	B.4	C.12
1.2417	B.5	C.12
1.2418	B.6	C.12
1.2419	B.7	C.12
1.2420	B.8	C.12
1.2421	B.9	C.12
1.2422	B.10	C.12
1.2423	B.11	C.12
1.2424	B.12	C.12
1.2425	B.13	C.12
1.2426	B.14	C.12
1.2427	B.15	C.12
1.2428	B.16	C.12
1.2429	B.17	C.12
1.2430	B.18	C.12
1.2431	B.19	C.12
1.2432	B.20	C.12
1.2433	B.21	C.12
1.2434	B.22	C.12
1.2435	B.23	C.12
1.2436	B.24	C.12
1.2437	B.25	C.12
1.2438	B.26	C.12
1.2439	B.27	C.12
1.2440	B.28	C.12
1.2441	B.29	C.12
1.2442	B.30	C.12
1.2443	B.31	C.12
1.2444	B.32	C.12
1.2445	B.33	C.12
1.2446	B.34	C.12
1.2447	B.35	C.12
1.2448	B.36	C.12
1.2449	B.37	C.12
1.2450	B.38	C.12
1.2451	B.39	C.12

[0997]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2452	B.40	C.12
1.2453	B.41	C.12
1.2454	B.42	C.12
1.2455	B.43	C.12
1.2456	B.44	C.12
1.2457	B.45	C.12
1.2458	B.46	C.12
1.2459	B.47	C.12
1.2460	B.48	C.12
1.2461	B.49	C.12
1.2462	B.50	C.12
1.2463	B.51	C.12
1.2464	B.52	C.12
1.2465	B.53	C.12
1.2466	B.54	C.12
1.2467	B.55	C.12
1.2468	B.56	C.12
1.2469	B.57	C.12
1.2470	B.58.	C.12
1.2471	B.59	C.12
1.2472	B.60	C.12
1.2473	B.61	C.12
1.2474	B.62	C.12
1.2475	B.63	C.12
1.2476	B.64	C.12
1.2477	B.65	C.12
1.2478	B.66	C.12
1.2479	B.67	C.12
1.2480	B.68	C.12
1.2481	B.69	C.12
1.2482	B.70	C.12
1.2483	B.71	C.12
1.2484	B.72	C.12
1.2485	B.73	C.12
1.2486	B.74	C.12
1.2487	B.75	C.12
1.2488	B.76	C.12
1.2489	B.77	C.12
1.2490	B.78	C.12
1.2491	B.79	C.12
1.2492	B.80	C.12
1.2493	B.81	C.12
1.2494	B.82	C.12
1.2495	B.83	C.12
1.2496	B.84	C.12
1.2497	B.85	C.12

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2498	B.86	C.12
1.2499	B.87	C.12
1.2500	B.88	C.12
1.2501	B.89	C.12
1.2502	B.90	C.12
1.2503	B.91	C.12
1.2504	B.92	C.12
1.2505	B.93	C.12
1.2506	B.94	C.12
1.2507	B.95	C.12
1.2508	B.96	C.12
1.2509	B.97	C.12
1.2510	B.98	C.12
1.2511	B.99	C.12
1.2512	B.100	C.12
1.2513	B.101	C.12
1.2514	B.102	C.12
1.2515	B.103	C.12
1.2516	B.104	C.12
1.2517	B.105	C.12
1.2518	B.106	C.12
1.2519	B.107	C.12
1.2520	B.108	C.12
1.2521	B.109	C.12
1.2522	B.110	C.12
1.2523	B.111	C.12
1.2524	B.112	C.12
1.2525	B.113	C.12
1.2526	B.114	C.12
1.2527	B.115	C.12
1.2528	B.116	C.12
1.2529	B.117	C.12
1.2530	B.118	C.12
1.2531	B.119	C.12
1.2532	B.120	C.12
1.2533	B.121	C.12
1.2534	B.122	C.12
1.2535	B.123	C.12
1.2536	B.124	C.12
1.2537	B.125	C.12
1.2538	B.126	C.12
1.2539	B.127	C.12
1.2540	B.128	C.12
1.2541	B.129	C.12
1.2542	B.130	C.12
1.2543	B.131	C.12

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2544	B.132	C.12
1.2545	B.133	C.12
1.2546	B.134	C.12
1.2547	B.135	C.12
1.2548	B.136	C.12
1.2549	B.137	C.12
1.2550	B.138	C.12
1.2551	B.139	C.12
1.2552	B.140	C.12
1.2553	B.141	C.12
1.2554	B.142	C.12
1.2555	B.143	C.12
1.2556	B.144	C.12
1.2557	B.145	C.12
1.2558	B.146	C.12
1.2559	B.147	C.12
1.2560	B.148	C.12
1.2561	B.149	C.12
1.2562	B.150	C.12
1.2563	B.151	C.12
1.2564	B.152	C.12
1.2565	B.153	C.12
1.2566	B.154	C.12
1.2567	B.155	C.12
1.2568	B.156	C.12
1.2569	B.157	C.12
1.2570	B.158	C.12
1.2571	B.159	C.12
1.2572	B.160	C.12
1.2573	B.161	C.12
1.2574	B.162	C.12
1.2575	B.163	C.12
1.2576	B.164	C.12
1.2577	B.165	C.12
1.2578	B.166	C.12
1.2579	B.167	C.12
1.2580	B.168	C.12
1.2581	B.169	C.12
1.2582	B.170	C.12
1.2583	B.171	C.12
1.2584	B.172	C.12
1.2585	B.173	C.12
1.2586	B.174	C.12
1.2587	B.175	C.12
1.2588	B.176	C.12
1.2589	B.177	C.12

[0998]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2590	B.178	C.12
1.2591	B.179	C.12
1.2592	B.180	C.12
1.2593	B.181	C.12
1.2594	B.182	C.12
1.2595	B.183	C.12
1.2596	B.184	C.12
1.2597	B.185	C.12
1.2598	B.186	C.12
1.2599	B.187	C.12
1.2600	B.188	C.12
1.2601	B.189	C.12
1.2602	B.190	C.12
1.2603	B.191	C.12
1.2604	B.192	C.12
1.2605	B.193	C.12
1.2606	B.194	C.12
1.2607	B.195	C.12
1.2608	B.196	C.12
1.2609	B.197	C.12
1.2610	B.198	C.12
1.2611	B.199	C.12
1.2612	B.200	C.12
1.2613	B.201	C.12
1.2614	B.1	C.13
1.2615	B.2	C.13
1.2616	B.3	C.13
1.2617	B.4	C.13
1.2618	B.5	C.13
1.2619	B.6	C.13
1.2620	B.7	C.13
1.2621	B.8	C.13
1.2622	B.9	C.13
1.2623	B.10	C.13
1.2624	B.11	C.13
1.2625	B.12	C.13
1.2626	B.13	C.13
1.2627	B.14	C.13
1.2628	B.15	C.13
1.2629	B.16	C.13
1.2630	B.17	C.13
1.2631	B.18	C.13
1.2632	B.19	C.13
1.2633	B.20	C.13
1.2634	B.21	C.13
1.2635	B.22	C.13

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2636	B.23	C.13
1.2637	B.24	C.13
1.2638	B.25	C.13
1.2639	B.26	C.13
1.2640	B.27	C.13
1.2641	B.28	C.13
1.2642	B.29	C.13
1.2643	B.30	C.13
1.2644	B.31	C.13
1.2645	B.32	C.13
1.2646	B.33	C.13
1.2647	B.34	C.13
1.2648	B.35	C.13
1.2649	B.36	C.13
1.2650	B.37	C.13
1.2651	B.38	C.13
1.2652	B.39	C.13
1.2653	B.40	C.13
1.2654	B.41	C.13
1.2655	B.42	C.13
1.2656	B.43	C.13
1.2657	B.44	C.13
1.2658	B.45	C.13
1.2659	B.46	C.13
1.2660	B.47	C.13
1.2661	B.48	C.13
1.2662	B.49	C.13
1.2663	B.50	C.13
1.2664	B.51	C.13
1.2665	B.52	C.13
1.2666	B.53	C.13
1.2667	B.54	C.13
1.2668	B.55	C.13
1.2669	B.56	C.13
1.2670	B.57	C.13
1.2671	B.58	C.13
1.2672	B.59	C.13
1.2673	B.60	C.13
1.2674	B.61	C.13
1.2675	B.62	C.13
1.2676	B.63	C.13
1.2677	B.64	C.13
1.2678	B.65	C.13
1.2679	B.66	C.13
1.2680	B.67	C.13
1.2681	B.68	C.13

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2682	B.69	C.13
1.2683	B.70	C.13
1.2684	B.71	C.13
1.2685	B.72	C.13
1.2686	B.73	C.13
1.2687	B.74	C.13
1.2688	B.75	C.13
1.2689	B.76	C.13
1.2690	B.77	C.13
1.2691	B.78	C.13
1.2692	B.79	C.13
1.2693	B.80	C.13
1.2694	B.81	C.13
1.2695	B.82	C.13
1.2696	B.83	C.13
1.2697	B.84	C.13
1.2698	B.85	C.13
1.2699	B.86	C.13
1.2700	B.87	C.13
1.2701	B.88	C.13
1.2702	B.89	C.13
1.2703	B.90	C.13
1.2704	B.91	C.13
1.2705	B.92	C.13
1.2706	B.93	C.13
1.2707	B.94	C.13
1.2708	B.95	C.13
1.2709	B.96	C.13
1.2710	B.97	C.13
1.2711	B.98	C.13
1.2712	B.99	C.13
1.2713	B.100	C.13
1.2714	B.101	C.13
1.2715	B.102	C.13
1.2716	B.103	C.13
1.2717	B.104	C.13
1.2718	B.105	C.13
1.2719	B.106	C.13
1.2720	B.107	C.13
1.2721	B.108	C.13
1.2722	B.109	C.13
1.2723	B.110	C.13
1.2724	B.111	C.13
1.2725	B.112	C.13
1.2726	B.113	C.13
1.2727	B.114	C.13

[0999]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2728	B.115	C.13
1.2729	B.116	C.13
1.2730	B.117	C.13
1.2731	B.118	C.13
1.2732	B.119	C.13
1.2733	B.120	C.13
1.2734	B.121	C.13
1.2735	B.122	C.13
1.2736	B.123	C.13
1.2737	B.124	C.13
1.2738	B.125	C.13
1.2739	B.126	C.13
1.2740	B.127	C.13
1.2741	B.128	C.13
1.2742	B.129	C.13
1.2743	B.130	C.13
1.2744	B.131	C.13
1.2745	B.132	C.13
1.2746	B.133	C.13
1.2747	B.134	C.13
1.2748	B.135	C.13
1.2749	B.136	C.13
1.2750	B.137	C.13
1.2751	B.138	C.13
1.2752	B.139	C.13
1.2753	B.140	C.13
1.2754	B.141	C.13
1.2755	B.142	C.13
1.2756	B.143	C.13
1.2757	B.144	C.13
1.2758	B.145	C.13
1.2759	B.146	C.13
1.2760	B.147	C.13
1.2761	B.148	C.13
1.2762	B.149	C.13
1.2763	B.150	C.13
1.2764	B.151	C.13
1.2765	B.152	C.13
1.2766	B.153	C.13
1.2767	B.154	C.13
1.2768	B.155	C.13
1.2769	B.156	C.13
1.2770	B.157	C.13
1.2771	B.158	C.13
1.2772	B.159	C.13
1.2773	B.160	C.13

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2774	B.161	C.13
1.2775	B.162	C.13
1.2776	B.163	C.13
1.2777	B.164	C.13
1.2778	B.165	C.13
1.2779	B.166	C.13
1.2780	B.167	C.13
1.2781	B.168	C.13
1.2782	B.169	C.13
1.2783	B.170	C.13
1.2784	B.171	C.13
1.2785	B.172	C.13
1.2786	B.173	C.13
1.2787	B.174	C.13
1.2788	B.175	C.13
1.2789	B.176	C.13
1.2790	B.177	C.13
1.2791	B.178	C.13
1.2792	B.179	C.13
1.2793	B.180	C.13
1.2794	B.181	C.13
1.2795	B.182	C.13
1.2796	B.183	C.13
1.2797	B.184	C.13
1.2798	B.185	C.13
1.2799	B.186	C.13
1.2800	B.187	C.13
1.2801	B.188	C.13
1.2802	B.189	C.13
1.2803	B.190	C.13
1.2804	B.191	C.13
1.2805	B.192	C.13
1.2806	B.193	C.13
1.2807	B.194	C.13
1.2808	B.195	C.13
1.2809	B.196	C.13
1.2810	B.197	C.13
1.2811	B.198	C.13
1.2812	B.199	C.13
1.2813	B.200	C.13
1.2814	B.201	C.13
1.2815	B.1	C.14
1.2816	B.2	C.14
1.2817	B.3	C.14
1.2818	B.4	C.14
1.2819	B.5	C.14

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2820	B.6	C.14
1.2821	B.7	C.14
1.2822	B.8	C.14
1.2823	B.9	C.14
1.2824	B.10	C.14
1.2825	B.11	C.14
1.2826	B.12	C.14
1.2827	B.13	C.14
1.2828	B.14	C.14
1.2829	B.15	C.14
1.2830	B.16	C.14
1.2831	B.17	C.14
1.2832	B.18	C.14
1.2833	B.19	C.14
1.2834	B.20	C.14
1.2835	B.21	C.14
1.2836	B.22	C.14
1.2837	B.23	C.14
1.2838	B.24	C.14
1.2839	B.25	C.14
1.2840	B.26	C.14
1.2841	B.27	C.14
1.2842	B.28	C.14
1.2843	B.29	C.14
1.2844	B.30	C.14
1.2845	B.31	C.14
1.2846	B.32	C.14
1.2847	B.33	C.14
1.2848	B.34	C.14
1.2849	B.35	C.14
1.2850	B.36	C.14
1.2851	B.37	C.14
1.2852	B.38	C.14
1.2853	B.39	C.14
1.2854	B.40	C.14
1.2855	B.41	C.14
1.2856	B.42	C.14
1.2857	B.43	C.14
1.2858	B.44	C.14
1.2859	B.45	C.14
1.2860	B.46	C.14
1.2861	B.47	C.14
1.2862	B.48	C.14
1.2863	B.49	C.14
1.2864	B.50	C.14
1.2865	B.51	C.14

[1000]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2866	B.52	C.14
1.2867	B.53	C.14
1.2868	B.54	C.14
1.2869	B.55	C.14
1.2870	B.56	C.14
1.2871	B.57	C.14
1.2872	B.58.	C.14
1.2873	B.59	C.14
1.2874	B.60	C.14
1.2875	B.61	C.14
1.2876	B.62	C.14
1.2877	B.63	C.14
1.2878	B.64	C.14
1.2879	B.65	C.14
1.2880	B.66	C.14
1.2881	B.67	C.14
1.2882	B.68	C.14
1.2883	B.69	C.14
1.2884	B.70	C.14
1.2885	B.71	C.14
1.2886	B.72	C.14
1.2887	B.73	C.14
1.2888	B.74	C.14
1.2889	B.75	C.14
1.2890	B.76	C.14
1.2891	B.77	C.14
1.2892	B.78	C.14
1.2893	B.79	C.14
1.2894	B.80	C.14
1.2895	B.81	C.14
1.2896	B.82	C.14
1.2897	B.83	C.14
1.2898	B.84	C.14
1.2899	B.85	C.14
1.2900	B.86	C.14
1.2901	B.87	C.14
1.2902	B.88	C.14
1.2903	B.89	C.14
1.2904	B.90	C.14
1.2905	B.91	C.14
1.2906	B.92	C.14
1.2907	B.93	C.14
1.2908	B.94	C.14
1.2909	B.95	C.14
1.2910	B.96	C.14
1.2911	B.97	C.14

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2912	B.98	C.14
1.2913	B.99	C.14
1.2914	B.100	C.14
1.2915	B.101	C.14
1.2916	B.102	C.14
1.2917	B.103	C.14
1.2918	B.104	C.14
1.2919	B.105	C.14
1.2920	B.106	C.14
1.2921	B.107	C.14
1.2922	B.108	C.14
1.2923	B.109	C.14
1.2924	B.110	C.14
1.2925	B.111	C.14
1.2926	B.112	C.14
1.2927	B.113	C.14
1.2928	B.114	C.14
1.2929	B.115	C.14
1.2930	B.116	C.14
1.2931	B.117	C.14
1.2932	B.118	C.14
1.2933	B.119	C.14
1.2934	B.120	C.14
1.2935	B.121	C.14
1.2936	B.122	C.14
1.2937	B.123	C.14
1.2938	B.124	C.14
1.2939	B.125	C.14
1.2940	B.126	C.14
1.2941	B.127	C.14
1.2942	B.128	C.14
1.2943	B.129	C.14
1.2944	B.130	C.14
1.2945	B.131	C.14
1.2946	B.132	C.14
1.2947	B.133	C.14
1.2948	B.134	C.14
1.2949	B.135	C.14
1.2950	B.136	C.14
1.2951	B.137	C.14
1.2952	B.138	C.14
1.2953	B.139	C.14
1.2954	B.140	C.14
1.2955	B.141	C.14
1.2956	B.142	C.14
1.2957	B.143	C.14

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.2958	B.144	C.14
1.2959	B.145	C.14
1.2960	B.146	C.14
1.2961	B.147	C.14
1.2962	B.148	C.14
1.2963	B.149	C.14
1.2964	B.150	C.14
1.2965	B.151	C.14
1.2966	B.152	C.14
1.2967	B.153	C.14
1.2968	B.154	C.14
1.2969	B.155	C.14
1.2970	B.156	C.14
1.2971	B.157	C.14
1.2972	B.158	C.14
1.2973	B.159	C.14
1.2974	B.160	C.14
1.2975	B.161	C.14
1.2976	B.162	C.14
1.2977	B.163	C.14
1.2978	B.164	C.14
1.2979	B.165	C.14
1.2980	B.166	C.14
1.2981	B.167	C.14
1.2982	B.168	C.14
1.2983	B.169	C.14
1.2984	B.170	C.14
1.2985	B.171	C.14
1.2986	B.172	C.14
1.2987	B.173	C.14
1.2988	B.174	C.14
1.2989	B.175	C.14
1.2990	B.176	C.14
1.2991	B.177	C.14
1.2992	B.178	C.14
1.2993	B.179	C.14
1.2994	B.180	C.14
1.2995	B.181	C.14
1.2996	B.182	C.14
1.2997	B.183	C.14
1.2998	B.184	C.14
1.2999	B.185	C.14
1.3000	B.186	C.14
1.3001	B.187	C.14
1.3002	B.188	C.14
1.3003	B.189	C.14

[1001]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3004	B.190	C.14
1.3005	B.191	C.14
1.3006	B.192	C.14
1.3007	B.193	C.14
1.3008	B.194	C.14
1.3009	B.195	C.14
1.3010	B.196	C.14
1.3011	B.197	C.14
1.3012	B.198	C.14
1.3013	B.199	C.14
1.3014	B.200	C.14
1.3015	B.201	C.14
1.3016	B.1	C.15
1.3017	B.2	C.15
1.3018	B.3	C.15
1.3019	B.4	C.15
1.3020	B.5	C.15
1.3021	B.6	C.15
1.3022	B.7	C.15
1.3023	B.8	C.15
1.3024	B.9	C.15
1.3025	B.10	C.15
1.3026	B.11	C.15
1.3027	B.12	C.15
1.3028	B.13	C.15
1.3029	B.14	C.15
1.3030	B.15	C.15
1.3031	B.16	C.15
1.3032	B.17	C.15
1.3033	B.18	C.15
1.3034	B.19	C.15
1.3035	B.20	C.15
1.3036	B.21	C.15
1.3037	B.22	C.15
1.3038	B.23	C.15
1.3039	B.24	C.15
1.3040	B.25	C.15
1.3041	B.26	C.15
1.3042	B.27	C.15
1.3043	B.28	C.15
1.3044	B.29	C.15
1.3045	B.30	C.15
1.3046	B.31	C.15
1.3047	B.32	C.15
1.3048	B.33	C.15
1.3049	B.34	C.15

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3050	B.35	C.15
1.3051	B.36	C.15
1.3052	B.37	C.15
1.3053	B.38	C.15
1.3054	B.39	C.15
1.3055	B.40	C.15
1.3056	B.41	C.15
1.3057	B.42	C.15
1.3058	B.43	C.15
1.3059	B.44	C.15
1.3060	B.45	C.15
1.3061	B.46	C.15
1.3062	B.47	C.15
1.3063	B.48	C.15
1.3064	B.49	C.15
1.3065	B.50	C.15
1.3066	B.51	C.15
1.3067	B.52	C.15
1.3068	B.53	C.15
1.3069	B.54	C.15
1.3070	B.55	C.15
1.3071	B.56	C.15
1.3072	B.57	C.15
1.3073	B.58.	C.15
1.3074	B.59	C.15
1.3075	B.60	C.15
1.3076	B.61	C.15
1.3077	B.62	C.15
1.3078	B.63	C.15
1.3079	B.64	C.15
1.3080	B.65	C.15
1.3081	B.66	C.15
1.3082	B.67	C.15
1.3083	B.68	C.15
1.3084	B.69	C.15
1.3085	B.70	C.15
1.3086	B.71	C.15
1.3087	B.72	C.15
1.3088	B.73	C.15
1.3089	B.74	C.15
1.3090	B.75	C.15
1.3091	B.76	C.15
1.3092	B.77	C.15
1.3093	B.78	C.15
1.3094	B.79	C.15
1.3095	B.80	C.15

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3096	B.81	C.15
1.3097	B.82	C.15
1.3098	B.83	C.15
1.3099	B.84	C.15
1.3100	B.85	C.15
1.3101	B.86	C.15
1.3102	B.87	C.15
1.3103	B.88	C.15
1.3104	B.89	C.15
1.3105	B.90	C.15
1.3106	B.91	C.15
1.3107	B.92	C.15
1.3108	B.93	C.15
1.3109	B.94	C.15
1.3110	B.95	C.15
1.3111	B.96	C.15
1.3112	B.97	C.15
1.3113	B.98	C.15
1.3114	B.99	C.15
1.3115	B.100	C.15
1.3116	B.101	C.15
1.3117	B.102	C.15
1.3118	B.103	C.15
1.3119	B.104	C.15
1.3120	B.105	C.15
1.3121	B.106	C.15
1.3122	B.107	C.15
1.3123	B.108	C.15
1.3124	B.109	C.15
1.3125	B.110	C.15
1.3126	B.111	C.15
1.3127	B.112	C.15
1.3128	B.113	C.15
1.3129	B.114	C.15
1.3130	B.115	C.15
1.3131	B.116	C.15
1.3132	B.117	C.15
1.3133	B.118	C.15
1.3134	B.119	C.15
1.3135	B.120	C.15
1.3136	B.121	C.15
1.3137	B.122	C.15
1.3138	B.123	C.15
1.3139	B.124	C.15
1.3140	B.125	C.15
1.3141	B.126	C.15

[1002]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3142	B.127	C.15
1.3143	B.128	C.15
1.3144	B.129	C.15
1.3145	B.130	C.15
1.3146	B.131	C.15
1.3147	B.132	C.15
1.3148	B.133	C.15
1.3149	B.134	C.15
1.3150	B.135	C.15
1.3151	B.136	C.15
1.3152	B.137	C.15
1.3153	B.138	C.15
1.3154	B.139	C.15
1.3155	B.140	C.15
1.3156	B.141	C.15
1.3157	B.142	C.15
1.3158	B.143	C.15
1.3159	B.144	C.15
1.3160	B.145	C.15
1.3161	B.146	C.15
1.3162	B.147	C.15
1.3163	B.148	C.15
1.3164	B.149	C.15
1.3165	B.150	C.15
1.3166	B.151	C.15
1.3167	B.152	C.15
1.3168	B.153	C.15
1.3169	B.154	C.15
1.3170	B.155	C.15
1.3171	B.156	C.15
1.3172	B.157	C.15
1.3173	B.158	C.15
1.3174	B.159	C.15
1.3175	B.160	C.15
1.3176	B.161	C.15
1.3177	B.162	C.15
1.3178	B.163	C.15
1.3179	B.164	C.15
1.3180	B.165	C.15
1.3181	B.166	C.15
1.3182	B.167	C.15
1.3183	B.168	C.15
1.3184	B.169	C.15
1.3185	B.170	C.15
1.3186	B.171	C.15
1.3187	B.172	C.15

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3188	B.173	C.15
1.3189	B.174	C.15
1.3190	B.175	C.15
1.3191	B.176	C.15
1.3192	B.177	C.15
1.3193	B.178	C.15
1.3194	B.179	C.15
1.3195	B.180	C.15
1.3196	B.181	C.15
1.3197	B.182	C.15
1.3198	B.183	C.15
1.3199	B.184	C.15
1.3200	B.185	C.15
1.3201	B.186	C.15
1.3202	B.187	C.15
1.3203	B.188	C.15
1.3204	B.189	C.15
1.3205	B.190	C.15
1.3206	B.191	C.15
1.3207	B.192	C.15
1.3208	B.193	C.15
1.3209	B.194	C.15
1.3210	B.195	C.15
1.3211	B.196	C.15
1.3212	B.197	C.15
1.3213	B.198	C.15
1.3214	B.199	C.15
1.3215	B.200	C.15
1.3216	B.201	C.15
1.3217	B.1	C.16
1.3218	B.2	C.16
1.3219	B.3	C.16
1.3220	B.4	C.16
1.3221	B.5	C.16
1.3222	B.6	C.16
1.3223	B.7	C.16
1.3224	B.8	C.16
1.3225	B.9	C.16
1.3226	B.10	C.16
1.3227	B.11	C.16
1.3228	B.12	C.16
1.3229	B.13	C.16
1.3230	B.14	C.16
1.3231	B.15	C.16
1.3232	B.16	C.16
1.3233	B.17	C.16

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3234	B.18	C.16
1.3235	B.19	C.16
1.3236	B.20	C.16
1.3237	B.21	C.16
1.3238	B.22	C.16
1.3239	B.23	C.16
1.3240	B.24	C.16
1.3241	B.25	C.16
1.3242	B.26	C.16
1.3243	B.27	C.16
1.3244	B.28	C.16
1.3245	B.29	C.16
1.3246	B.30	C.16
1.3247	B.31	C.16
1.3248	B.32	C.16
1.3249	B.33	C.16
1.3250	B.34	C.16
1.3251	B.35	C.16
1.3252	B.36	C.16
1.3253	B.37	C.16
1.3254	B.38	C.16
1.3255	B.39	C.16
1.3256	B.40	C.16
1.3257	B.41	C.16
1.3258	B.42	C.16
1.3259	B.43	C.16
1.3260	B.44	C.16
1.3261	B.45	C.16
1.3262	B.46	C.16
1.3263	B.47	C.16
1.3264	B.48	C.16
1.3265	B.49	C.16
1.3266	B.50	C.16
1.3267	B.51	C.16
1.3268	B.52	C.16
1.3269	B.53	C.16
1.3270	B.54	C.16
1.3271	B.55	C.16
1.3272	B.56	C.16
1.3273	B.57	C.16
1.3274	B.58	C.16
1.3275	B.59	C.16
1.3276	B.60	C.16
1.3277	B.61	C.16
1.3278	B.62	C.16
1.3279	B.63	C.16

[1003]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3280	B.64	C.16
1.3281	B.65	C.16
1.3282	B.66	C.16
1.3283	B.67	C.16
1.3284	B.68	C.16
1.3285	B.69	C.16
1.3286	B.70	C.16
1.3287	B.71	C.16
1.3288	B.72	C.16
1.3289	B.73	C.16
1.3290	B.74	C.16
1.3291	B.75	C.16
1.3292	B.76	C.16
1.3293	B.77	C.16
1.3294	B.78	C.16
1.3295	B.79	C.16
1.3296	B.80	C.16
1.3297	B.81	C.16
1.3298	B.82	C.16
1.3299	B.83	C.16
1.3300	B.84	C.16
1.3301	B.85	C.16
1.3302	B.86	C.16
1.3303	B.87	C.16
1.3304	B.88	C.16
1.3305	B.89	C.16
1.3306	B.90	C.16
1.3307	B.91	C.16
1.3308	B.92	C.16
1.3309	B.93	C.16
1.3310	B.94	C.16
1.3311	B.95	C.16
1.3312	B.96	C.16
1.3313	B.97	C.16
1.3314	B.98	C.16
1.3315	B.99	C.16
1.3316	B.100	C.16
1.3317	B.101	C.16
1.3318	B.102	C.16
1.3319	B.103	C.16
1.3320	B.104	C.16
1.3321	B.105	C.16
1.3322	B.106	C.16
1.3323	B.107	C.16
1.3324	B.108	C.16
1.3325	B.109	C.16

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3326	B.110	C.16
1.3327	B.111	C.16
1.3328	B.112	C.16
1.3329	B.113	C.16
1.3330	B.114	C.16
1.3331	B.115	C.16
1.3332	B.116	C.16
1.3333	B.117	C.16
1.3334	B.118	C.16
1.3335	B.119	C.16
1.3336	B.120	C.16
1.3337	B.121	C.16
1.3338	B.122	C.16
1.3339	B.123	C.16
1.3340	B.124	C.16
1.3341	B.125	C.16
1.3342	B.126	C.16
1.3343	B.127	C.16
1.3344	B.128	C.16
1.3345	B.129	C.16
1.3346	B.130	C.16
1.3347	B.131	C.16
1.3348	B.132	C.16
1.3349	B.133	C.16
1.3350	B.134	C.16
1.3351	B.135	C.16
1.3352	B.136	C.16
1.3353	B.137	C.16
1.3354	B.138	C.16
1.3355	B.139	C.16
1.3356	B.140	C.16
1.3357	B.141	C.16
1.3358	B.142	C.16
1.3359	B.143	C.16
1.3360	B.144	C.16
1.3361	B.145	C.16
1.3362	B.146	C.16
1.3363	B.147	C.16
1.3364	B.148	C.16
1.3365	B.149	C.16
1.3366	B.150	C.16
1.3367	B.151	C.16
1.3368	B.152	C.16
1.3369	B.153	C.16
1.3370	B.154	C.16
1.3371	B.155	C.16

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3372	B.156	C.16
1.3373	B.157	C.16
1.3374	B.158	C.16
1.3375	B.159	C.16
1.3376	B.160	C.16
1.3377	B.161	C.16
1.3378	B.162	C.16
1.3379	B.163	C.16
1.3380	B.164	C.16
1.3381	B.165	C.16
1.3382	B.166	C.16
1.3383	B.167	C.16
1.3384	B.168	C.16
1.3385	B.169	C.16
1.3386	B.170	C.16
1.3387	B.171	C.16
1.3388	B.172	C.16
1.3389	B.173	C.16
1.3390	B.174	C.16
1.3391	B.175	C.16
1.3392	B.176	C.16
1.3393	B.177	C.16
1.3394	B.178	C.16
1.3395	B.179	C.16
1.3396	B.180	C.16
1.3397	B.181	C.16
1.3398	B.182	C.16
1.3399	B.183	C.16
1.3400	B.184	C.16
1.3401	B.185	C.16
1.3402	B.186	C.16
1.3403	B.187	C.16
1.3404	B.188	C.16
1.3405	B.189	C.16
1.3406	B.190	C.16
1.3407	B.191	C.16
1.3408	B.192	C.16
1.3409	B.193	C.16
1.3410	B.194	C.16
1.3411	B.195	C.16
1.3412	B.196	C.16
1.3413	B.197	C.16
1.3414	B.198	C.16
1.3415	B.199	C.16
1.3416	B.200	C.16
1.3417	B.201	C.16

[1004]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3418	B.1	C.17
1.3419	B.2	C.17
1.3420	B.3	C.17
1.3421	B.4	C.17
1.3422	B.5	C.17
1.3423	B.6	C.17
1.3424	B.7	C.17
1.3425	B.8	C.17
1.3426	B.9	C.17
1.3427	B.10	C.17
1.3428	B.11	C.17
1.3429	B.12	C.17
1.3430	B.13	C.17
1.3431	B.14	C.17
1.3432	B.15	C.17
1.3433	B.16	C.17
1.3434	B.17	C.17
1.3435	B.18	C.17
1.3436	B.19	C.17
1.3437	B.20	C.17
1.3438	B.21	C.17
1.3439	B.22	C.17
1.3440	B.23	C.17
1.3441	B.24	C.17
1.3442	B.25	C.17
1.3443	B.26	C.17
1.3444	B.27	C.17
1.3445	B.28	C.17
1.3446	B.29	C.17
1.3447	B.30	C.17
1.3448	B.31	C.17
1.3449	B.32	C.17
1.3450	B.33	C.17
1.3451	B.34	C.17
1.3452	B.35	C.17
1.3453	B.36	C.17
1.3454	B.37	C.17
1.3455	B.38	C.17
1.3456	B.39	C.17
1.3457	B.40	C.17
1.3458	B.41	C.17
1.3459	B.42	C.17
1.3460	B.43	C.17
1.3461	B.44	C.17
1.3462	B.45	C.17
1.3463	B.46	C.17

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3464	B.47	C.17
1.3465	B.48	C.17
1.3466	B.49	C.17
1.3467	B.50	C.17
1.3468	B.51	C.17
1.3469	B.52	C.17
1.3470	B.53	C.17
1.3471	B.54	C.17
1.3472	B.55	C.17
1.3473	B.56	C.17
1.3474	B.57	C.17
1.3475	B.58	C.17
1.3476	B.59	C.17
1.3477	B.60	C.17
1.3478	B.61	C.17
1.3479	B.62	C.17
1.3480	B.63	C.17
1.3481	B.64	C.17
1.3482	B.65	C.17
1.3483	B.66	C.17
1.3484	B.67	C.17
1.3485	B.68	C.17
1.3486	B.69	C.17
1.3487	B.70	C.17
1.3488	B.71	C.17
1.3489	B.72	C.17
1.3490	B.73	C.17
1.3491	B.74	C.17
1.3492	B.75	C.17
1.3493	B.76	C.17
1.3494	B.77	C.17
1.3495	B.78	C.17
1.3496	B.79	C.17
1.3497	B.80	C.17
1.3498	B.81	C.17
1.3499	B.82	C.17
1.3500	B.83	C.17
1.3501	B.84	C.17
1.3502	B.85	C.17
1.3503	B.86	C.17
1.3504	B.87	C.17
1.3505	B.88	C.17
1.3506	B.89	C.17
1.3507	B.90	C.17
1.3508	B.91	C.17
1.3509	B.92	C.17

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3510	B.93	C.17
1.3511	B.94	C.17
1.3512	B.95	C.17
1.3513	B.96	C.17
1.3514	B.97	C.17
1.3515	B.98	C.17
1.3516	B.99	C.17
1.3517	B.100	C.17
1.3518	B.101	C.17
1.3519	B.102	C.17
1.3520	B.103	C.17
1.3521	B.104	C.17
1.3522	B.105	C.17
1.3523	B.106	C.17
1.3524	B.107	C.17
1.3525	B.108	C.17
1.3526	B.109	C.17
1.3527	B.110	C.17
1.3528	B.111	C.17
1.3529	B.112	C.17
1.3530	B.113	C.17
1.3531	B.114	C.17
1.3532	B.115	C.17
1.3533	B.116	C.17
1.3534	B.117	C.17
1.3535	B.118	C.17
1.3536	B.119	C.17
1.3537	B.120	C.17
1.3538	B.121	C.17
1.3539	B.122	C.17
1.3540	B.123	C.17
1.3541	B.124	C.17
1.3542	B.125	C.17
1.3543	B.126	C.17
1.3544	B.127	C.17
1.3545	B.128	C.17
1.3546	B.129	C.17
1.3547	B.130	C.17
1.3548	B.131	C.17
1.3549	B.132	C.17
1.3550	B.133	C.17
1.3551	B.134	C.17
1.3552	B.135	C.17
1.3553	B.136	C.17
1.3554	B.137	C.17
1.3555	B.138	C.17

[1005]

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3556	B.139	C.17
1.3557	B.140	C.17
1.3558	B.141	C.17
1.3559	B.142	C.17
1.3560	B.143	C.17
1.3561	B.144	C.17
1.3562	B.145	C.17
1.3563	B.146	C.17
1.3564	B.147	C.17
1.3565	B.148	C.17
1.3566	B.149	C.17
1.3567	B.150	C.17
1.3568	B.151	C.17
1.3569	B.152	C.17
1.3570	B.153	C.17
1.3571	B.154	C.17
1.3572	B.155	C.17
1.3573	B.156	C.17
1.3574	B.157	C.17
1.3575	B.158	C.17
1.3576	B.159	C.17
1.3577	B.160	C.17
1.3578	B.161	C.17
1.3579	B.162	C.17
1.3580	B.163	C.17
1.3581	B.164	C.17
1.3582	B.165	C.17
1.3583	B.166	C.17
1.3584	B.167	C.17
1.3585	B.168	C.17
1.3586	B.169	C.17
1.3587	B.170	C.17
1.3588	B.171	C.17

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3589	B.172	C.17
1.3590	B.173	C.17
1.3591	B.174	C.17
1.3592	B.175	C.17
1.3593	B.176	C.17
1.3594	B.177	C.17
1.3595	B.178	C.17
1.3596	B.179	C.17
1.3597	B.180	C.17
1.3598	B.181	C.17
1.3599	B.182	C.17
1.3600	B.183	C.17
1.3601	B.184	C.17
1.3602	B.185	C.17
1.3603	B.186	C.17
1.3604	B.187	C.17
1.3605	B.188	C.17
1.3606	B.189	C.17
1.3607	B.190	C.17
1.3608	B.191	C.17
1.3609	B.192	C.17
1.3610	B.193	C.17
1.3611	B.194	C.17
1.3612	B.195	C.17
1.3613	B.196	C.17
1.3614	B.197	C.17
1.3615	B.198	C.17
1.3616	B.199	C.17
1.3617	B.200	C.17
1.3618	B.201	C.17
1.3619	--	C.1
1.3620	--	C.2
1.3621	--	C.3

组合物 编号	除 草 剂 B	安 全 剂 C
1.3622	--	C.4
1.3623	--	C.5
1.3624	--	C.6
1.3625	--	C.7
1.3626	--	C.8
1.3627	--	C.9
1.3628	--	C.10
1.3629	--	C.11
1.3630	--	C.12
1.3631	--	C.13
1.3632	--	C.14
1.3633	--	C.15
1.3634	--	C.16
1.3635	--	C.17
1.3636	B.202	--
1.3637	B.202	C.1
1.3638	B.202	C.2
1.3639	B.202	C.3
1.3640	B.202	C.4
1.3641	B.202	C.5
1.3642	B.202	C.6
1.3643	B.202	C.7
1.3644	B.202	C.8
1.3645	B.202	C.9
1.3646	B.202	C.10
1.3647	B.202	C.11
1.3648	B.202	C.12
1.3649	B.202	C.13
1.3650	B.202	C.14
1.3651	B.202	C.15
1.3652	B.202	C.16
1.3653	B.202	C.17

[1006] 各单一组合物的具体编号按如下推导：

[1007] 组合物1.200例如包含尿嘧啶吡啶I.a.339和环庚草醚(B.200)(见表1,条目1.200;以及表B,条目B.200)。

[1008] 组合物2.200例如包含尿嘧啶吡啶I.a.109(见下面对组合物2.1-2.3653,优选2.1-2.3635的定义)和环庚草醚(B.200)(见表1,条目1.200;以及表B,条目B.200)。

[1009] 组合物7.200例如包含包含灭草烟(B.35)(见下面对组合物7.1-7.3653,优选7.1-7.3635的定义)、尿嘧啶吡啶I.a.339和环庚草醚(B.200)(见表1,条目1.200;以及表B,条目B.200)。

[1010] 还尤其优选组合物2.1-2.3653,更优选2.1.-2.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.a.109)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1011] 还尤其优选组合物3.1-3.3653,更优选3.1.-3.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.2作为另外的除草剂B。

- [1012] 还尤其优选组合物4.1-4.3653,更优选4.1.-4.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.8作为另外的除草剂B。
- [1013] 还尤其优选组合物5.1-5.3653,更优选5.1.-5.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.30作为另外的除草剂B。
- [1014] 还尤其优选组合物6.1-6.3653,更优选6.1.-6.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.32作为另外的除草剂B。
- [1015] 还尤其优选组合物7.1-7.3653,更优选7.1.-7.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.35作为另外的除草剂B。
- [1016] 还尤其优选组合物8.1-8.3653,更优选8.1.-8.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.38作为另外的除草剂B。
- [1017] 还尤其优选组合物9.1-9.3653,更优选9.1.-9.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.40作为另外的除草剂B。
- [1018] 还尤其优选组合物10.1-10.3653,更优选10.1.-10.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.51作为另外的除草剂B。
- [1019] 还尤其优选组合物11.1-11.3653,更优选11.1.-11.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.55作为另外的除草剂B。
- [1020] 还尤其优选组合物12.1-12.3653,更优选12.1.-12.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.56作为另外的除草剂B。
- [1021] 还尤其优选组合物13.1-13.3653,更优选13.1.-13.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.64作为另外的除草剂B。
- [1022] 还尤其优选组合物14.1-14.3653,更优选14.1.-14.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.66作为另外的除草剂B。
- [1023] 还尤其优选组合物15.1-15.3653,更优选15.1.-15.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.67作为另外的除草剂B。
- [1024] 还尤其优选组合物16.1-16.3653,更优选16.1.-16.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.68作为另外的除草剂B。
- [1025] 还尤其优选组合物17.1-17.3653,更优选17.1.-17.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.69作为另外的除草剂B。
- [1026] 还尤其优选组合物18.1-18.3653,更优选18.1.-18.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.73作为另外的除草剂B。
- [1027] 还尤其优选组合物19.1-19.3653,更优选19.1.-19.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.76作为另外的除草剂B。
- [1028] 还尤其优选组合物20.1-20.3653,更优选20.1.-20.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.81作为另外的除草剂B。
- [1029] 还尤其优选组合物21.1-21.3653,更优选21.1.-21.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.82作为另外的除草剂B。
- [1030] 还尤其优选组合物22.1-22.3653,更优选22.1.-22.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.85作为另外的除草剂B。
- [1031] 还尤其优选组合物23.1-23.3653,更优选23.1.-23.3635,其与相应组合物1.1-

- 1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.88作为另外的除草剂B。
- [1032] 还尤其优选组合物24.1-24.3653,更优选24.1.-24.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.89作为另外的除草剂B。
- [1033] 还尤其优选组合物25.1-25.3653,更优选25.1.-25.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.94作为另外的除草剂B。
- [1034] 还尤其优选组合物26.1-26.3653,更优选26.1.-26.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.95作为另外的除草剂B。
- [1035] 还尤其优选组合物27.1-27.3653,更优选27.1.-27.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.98作为另外的除草剂B。
- [1036] 还尤其优选组合物28.1-28.3653,更优选28.1.-28.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.100作为另外的除草剂B。
- [1037] 还尤其优选组合物29.1-29.3653,更优选29.1.-29.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.103作为另外的除草剂B。
- [1038] 还尤其优选组合物30.1-30.3653,更优选30.1.-30.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.103和B.67作为另外的除草剂B。
- [1039] 还尤其优选组合物31.1-31.3653,更优选31.1.-31.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.103和B.76作为另外的除草剂B。
- [1040] 还尤其优选组合物32.1-32.3653,更优选32.1.-32.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.103和B.82作为另外的除草剂B。
- [1041] 还尤其优选组合物33.1-33.3653,更优选33.1.-33.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.104作为另外的除草剂B。
- [1042] 还尤其优选组合物34.1-34.3653,更优选34.1.-34.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.104和B.67作为另外的除草剂B。
- [1043] 还尤其优选组合物35.1-35.3653,更优选35.1.-35.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.104和B.76作为另外的除草剂B。
- [1044] 还尤其优选组合物36.1-36.3653,更优选36.1.-36.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.104和B.82作为另外的除草剂B。
- [1045] 还尤其优选组合物37.1-37.3653,更优选37.1.-37.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.106作为另外的除草剂B。
- [1046] 还尤其优选组合物38.1-38.3653,更优选38.1.-38.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.107作为另外的除草剂B。
- [1047] 还尤其优选组合物39.1-39.3653,更优选39.1.-39.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.107和B.67作为另外的除草剂B。
- [1048] 还尤其优选组合物40.1-40.3653,更优选40.1.-40.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.107和B.76作为另外的除草剂B。
- [1049] 还尤其优选组合物41.1-41.3653,更优选41.1.-41.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.107和B.82作为另外的除草剂B。
- [1050] 还尤其优选组合物42.1-42.3653,更优选42.1.-42.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.109作为另外的除草剂B。

- [1051] 还尤其优选组合物43.1-43.3653,更优选43.1.-43.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.111作为另外的除草剂B。
- [1052] 还尤其优选组合物44.1-44.3653,更优选44.1.-44.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.111和B.67作为另外的除草剂B。
- [1053] 还尤其优选组合物45.1-45.3653,更优选45.1.-45.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.111和B.76作为另外的除草剂B。
- [1054] 还尤其优选组合物46.1-46.3653,更优选46.1.-46.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.111和B.82作为另外的除草剂B。
- [1055] 还尤其优选组合物47.1-47.3653,更优选47.1.-47.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.116作为另外的除草剂B。
- [1056] 还尤其优选组合物48.1-48.3653,更优选48.1.-48.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.116和B.67作为另外的除草剂B。
- [1057] 还尤其优选组合物49.1-49.3653,更优选49.1.-49.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.116和B.94作为另外的除草剂B。
- [1058] 还尤其优选组合物50.1-50.3653,更优选50.1.-50.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.116和B.103作为另外的除草剂B。
- [1059] 还尤其优选组合物51.1-51.3653,更优选51.1.-51.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.116和B.128作为另外的除草剂B。
- [1060] 还尤其优选组合物52.1-52.3653,更优选52.1.-52.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.116和B.104作为另外的除草剂B。
- [1061] 还尤其优选组合物53.1-53.3653,更优选53.1.-53.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.116和B.107作为另外的除草剂B。
- [1062] 还尤其优选组合物54.1-54.3653,更优选54.1.-54.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.116和B.111作为另外的除草剂B。
- [1063] 还尤其优选组合物55.1-55.3653,更优选55.1.-55.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.122作为另外的除草剂B。
- [1064] 还尤其优选组合物56.1-56.3653,更优选56.1.-56.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.126作为另外的除草剂B。
- [1065] 还尤其优选组合物57.1-57.3653,更优选57.1.-57.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.128作为另外的除草剂B。
- [1066] 还尤其优选组合物58.1-58.3653,更优选58.1.-58.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.131作为另外的除草剂B。
- [1067] 还尤其优选组合物59.1-59.3653,更优选59.1.-59.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.132作为另外的除草剂B。
- [1068] 还尤其优选组合物60.1-60.3653,更优选60.1.-60.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.133作为另外的除草剂B。
- [1069] 还尤其优选组合物61.1-61.3653,更优选61.1.-61.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.135作为另外的除草剂B。
- [1070] 还尤其优选组合物62.1-62.3653,更优选62.1.-62.3635,其与相应组合物1.1-

- 1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.137作为另外的除草剂B。
- [1071] 还尤其优选组合物63.1-63.3653,更优选63.1.-63.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.138作为另外的除草剂B。
- [1072] 还尤其优选组合物64.1-64.3653,更优选64.1.-64.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.140作为另外的除草剂B。
- [1073] 还尤其优选组合物65.1-65.3653,更优选65.1.-65.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.145作为另外的除草剂B。
- [1074] 还尤其优选组合物66.1-66.3653,更优选66.1.-66.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.153作为另外的除草剂B。
- [1075] 还尤其优选组合物67.1-67.3653,更优选67.1.-67.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.156作为另外的除草剂B。
- [1076] 还尤其优选组合物68.1-68.3653,更优选68.1.-68.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.171作为另外的除草剂B。
- [1077] 还尤其优选组合物69.1-69.3653,更优选69.1.-69.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们额外包含B.174作为另外的除草剂B。
- [1078] 还尤其优选组合物70.1-70.3653,更优选70.1.-70.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.a.115)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。
- [1079] 还尤其优选组合物71.1-71.3653,更优选71.1.-71.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.a.255)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。
- [1080] 还尤其优选组合物72.1-72.3653,更优选72.1.-72.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.a.277)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。
- [1081] 还尤其优选组合物73.1-73.3653,更优选73.1.-73.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.a.283)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。
- [1082] 还尤其优选组合物74.1-74.3653,更优选74.1.-74.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.a.87)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。
- [1083] 还尤其优选组合物75.1-75.3653,更优选75.1.-75.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.a.361)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。
- [1084] 还尤其优选组合物76.1-76.3653,更优选76.1.-76.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.a.367)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。
- [1085] 还尤其优选组合物77.1-77.3653,更优选77.1.-77.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.87)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1086] 还尤其优选组合物78.1-78.3653,更优选78.1.-78.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.109)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1087] 还尤其优选组合物79.1-79.3653,更优选79.1.-79.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.115)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1088] 还尤其优选组合物80.1-80.3653,更优选80.1.-80.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.255)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1089] 还尤其优选组合物81.1-81.3653,更优选81.1.-81.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.277)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1090] 还尤其优选组合物82.1-82.3653,更优选82.1.-82.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.283)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1091] 还尤其优选组合物83.1-83.3653,更优选83.1.-83.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1092] 还尤其优选组合物84.1-84.3653,更优选84.1.-84.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.361)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1093] 还尤其优选组合物85.1-85.3653,更优选85.1.-85.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.367)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A。

[1094] 还尤其优选组合物86.1-86.3653,更优选86.1.-86.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.2作为另外的除草剂B。

[1095] 还尤其优选组合物87.1-87.3653,更优选87.1.-87.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.8作为另外的除草剂B。

[1096] 还尤其优选组合物88.1-88.3653,更优选88.1.-88.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.30作为另外的除草剂B。

[1097] 还尤其优选组合物89.1-89.3653,更优选89.1.-89.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.32作为另外的除草剂B。

[1098] 还尤其优选组合物90.1-90.3653,更优选90.1.-90.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.35作为另外的除草剂B。

[1099] 还尤其优选组合物91.1-91.3653,更优选91.1.-91.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.38作为另外的除草剂B。

[1100] 还尤其优选组合物92.1-92.3653,更优选92.1.-92.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.40作为另外的除草剂B。

[1101] 还尤其优选组合物93.1-93.3653,更优选93.1.-93.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.51作为另外的除草剂B。

[1102] 还尤其优选组合物94.1-94.3653,更优选94.1.-94.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.55作为另外的除草剂B。

[1103] 还尤其优选组合物95.1-95.3653,更优选95.1.-95.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.56作为另外的除草剂B。

[1104] 还尤其优选组合物96.1-96.3653,更优选96.1.-96.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.64作为另外的除草剂B。

[1105] 还尤其优选组合物97.1-97.3653,更优选97.1.-97.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.66作为另外的除草剂B。

[1106] 还尤其优选组合物98.1-98.3653,更优选98.1.-98.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.67作为另外的除草剂B。

[1107] 还尤其优选组合物99.1-99.3653,更优选99.1.-99.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.68作为另外的除草剂B。

[1108] 还尤其优选组合物100.1-100.3653,更优选100.1.-100.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.69作为另外的除草剂B。

[1109] 还尤其优选组合物101.1-101.3653,更优选101.1.-101.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.73作为另外的除草剂B。

[1110] 还尤其优选组合物102.1-102.3653,更优选102.1.-102.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.76作为另外的除草剂B。

[1111] 还尤其优选组合物103.1-103.3653,更优选103.1.-103.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.81作为另外的除草剂B。

[1112] 还尤其优选组合104.1-104.3653,更优选104.1.-104.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.82作为另外的除草剂B。

[1113] 还尤其优选组合105.1-105.3653,更优选105.1.-105.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.85作为另外的除草剂B。

[1114] 还尤其优选组合106.1-106.3653,更优选106.1.-106.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.88作为另外的除草剂B。

[1115] 还尤其优选组合107.1-107.3653,更优选107.1.-107.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.89作为另外的除草剂B。

[1116] 还尤其优选组合108.1-108.3653,更优选108.1.-108.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.94作为另外的除草剂B。

[1117] 还尤其优选组合109.1-109.3653,更优选109.1.-109.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.95作为另外的除草剂B。

[1118] 还尤其优选组合110.1-110.3653,更优选110.1.-110.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.98作为另外的除草剂B。

[1119] 还尤其优选组合111.1-111.3653,更优选111.1.-111.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.100作为另外的除草剂B。

[1120] 还尤其优选组合112.1-112.3653,更优选112.1.-112.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.103作为另外的除草剂B。

[1121] 还尤其优选组合113.1-113.3653,更优选113.1.-113.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.103和B.67作为另外的除草剂B。

[1122] 还尤其优选组合114.1-114.3653,更优选114.1.-114.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.103和B.76作为另外的除草剂B。

[1123] 还尤其优选组合115.1-115.3653,更优选115.1.-115.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.103和B.82作为另外的除草剂B。

[1124] 还尤其优选组合116.1-116.3653,更优选116.1.-116.3635,其与相应组合1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.104作为另外的除草剂B。

[1125] 还尤其优选组合物117.1-117.3653,更优选117.1.-117.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.104和B.67作为另外的除草剂B。

[1126] 还尤其优选组合物118.1-118.3653,更优选118.1.-118.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.104和B.76作为另外的除草剂B。

[1127] 还尤其优选组合物119.1-119.3653,更优选119.1.-119.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.104和B.82作为另外的除草剂B。

[1128] 还尤其优选组合物120.1-120.3653,更优选120.1.-120.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.106作为另外的除草剂B。

[1129] 还尤其优选组合物121.1-121.3653,更优选121.1.-121.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.107作为另外的除草剂B。

[1130] 还尤其优选组合物122.1-122.3653,更优选122.1.-122.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.107和B.67作为另外的除草剂B。

[1131] 还尤其优选组合物123.1-123.3653,更优选123.1.-123.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.107和B.76作为另外的除草剂B。

[1132] 还尤其优选组合物124.1-124.3653,更优选124.1.-124.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.107和B.82作为另外的除草剂B。

[1133] 还尤其优选组合物125.1-125.3653,更优选125.1.-125.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.109作为另外的除草剂B。

[1134] 还尤其优选组合物126.1-126.3653,更优选126.1.-126.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.111作为另外的除草剂B。

[1135] 还尤其优选组合物127.1-127.3653,更优选127.1.-127.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.111和B.67作为另外的除草剂B。

[1136] 还尤其优选组合物128.1-128.3653,更优选128.1.-128.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.111和B.76作为另外的除草剂B。

[1137] 还尤其优选组合物129.1-129.3653,更优选129.1.-129.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.111和B.82作为另外的除草剂B。

[1138] 还尤其优选组合物130.1-130.3653,更优选130.1.-130.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.116作为另外的除草剂B。

[1139] 还尤其优选组合物131.1-131.3653,更优选131.1.-131.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.116和B.67作为另外的除草剂B。

[1140] 还尤其优选组合物132.1-132.3653,更优选132.1.-132.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.116和B.94作为另外的除草剂B。

[1141] 还尤其优选组合物133.1-133.3653,更优选133.1.-133.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.116和B.103作为另外的除草剂B。

[1142] 还尤其优选组合物134.1-134.3653,更优选134.1.-134.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.116和B.128作为另外的除草剂B。

[1143] 还尤其优选组合物135.1-135.3653,更优选135.1.-135.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.116和B.104作为另外的除草剂B。

[1144] 还尤其优选组合物136.1-136.3653,更优选136.1.-136.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.116和B.107作为另外的除草剂B。

[1145] 还尤其优选组合物137.1-137.3653,更优选137.1.-137.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.116和B.111作为另外的除草剂B。

[1146] 还尤其优选组合物138.1-138.3653,更优选138.1.-138.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.122作为另外的除草剂B。

[1147] 还尤其优选组合物139.1-139.3653,更优选139.1.-139.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.126作为另外的除草剂B。

[1148] 还尤其优选组合物140.1-140.3653,更优选140.1.-140.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.128作为另外的除草剂B。

[1149] 还尤其优选组合物141.1-141.3653,更优选141.1.-141.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.131作为另外的除草剂B。

[1150] 还尤其优选组合物142.1-142.3653,更优选142.1.-142.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.132作为另外的除草剂B。

[1151] 还尤其优选组合物143.1-143.3653,更优选143.1.-143.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.133作为另外的除草剂B。

[1152] 还尤其优选组合物144.1-144.3653,更优选144.1.-144.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.135作为另外的除草剂B。

[1153] 还尤其优选组合物145.1-145.3653,更优选145.1.-145.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.137作为另外的除草剂B。

[1154] 还尤其优选组合物146.1-146.3653,更优选146.1.-146.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.138作为另外的除草剂B。

[1155] 还尤其优选组合物147.1-147.3653,更优选147.1.-147.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.140作为另外的除草剂B。

[1156] 还尤其优选组合物148.1-148.3653,更优选148.1.-148.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.145作为另外的除草剂B。

[1157] 还尤其优选组合物149.1-149.3653,更优选149.1.-149.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.153作为另外的除草剂B。

[1158] 还尤其优选组合物150.1-150.3653,更优选150.1.-150.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.156作为另外的除草剂B。

[1159] 还尤其优选组合物151.1-151.3653,更优选151.1.-151.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.171作为另外的除草剂B。

[1160] 还尤其优选组合物152.1-152.3653,更优选152.1.-152.3635,其与相应组合物1.1-1.3653,更优选1.1-1.3635的不同仅在于它们包含式(I.h.339)的尿嘧啶吡啶作为活性化合物A并且额外包含B.174作为另外的除草剂B。

[1161] 本发明还涉及包含至少一种助剂和至少一种本发明式(I)的尿嘧啶吡啶的农业化学组合物。

[1162] 农业化学组合物包含农药有效量的式(I)的尿嘧啶吡啶。术语“有效量”表示足以控制不想要的植物,尤其是在栽培植物中控制不想要的植物且不会对被处理植物产生显著损害的组合物或化合物I的量。该量可以在宽范围内变化且取决于各种因素如待控制的植物、被处理的栽培植物或材料、气候条件以及所用式(I)的具体尿嘧啶吡啶。

[1163] 式(I)的尿嘧啶吡啶类、其N-氧化物、盐或衍生物可以转化成农业化学组合物常用的类型,例如溶液、乳液、悬浮液、粉剂、粉末、糊、颗粒、模压品、胶囊及其混合物。农业化学组合物类型的实例是悬浮液(例如SC、OD、FS),可乳化浓缩物(例如EC),乳液(例如EW、EO、

ES、ME), 胶囊(例如CS、ZC), 糊, 锭剂, 可湿性粉末或粉剂(例如WP、SP、WS、DP、DS), 模压品(例如BR、TB、DT), 颗粒(例如WG、SG、GR、FG、GG、MG), 杀虫制品(例如LN) 以及处理植物繁殖材料如种子的凝胶配制剂(例如GF)。这些和其他农业化学组合物类型在“Catalogue of pesticide formulation types and international coding system”, Technical Monograph, 第2期, 2008年5月第6版, CropLife International中有定义。

[1164] 农业化学组合物如Mollet和Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; 或Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005所述以已知方式制备。

[1165] 合适的助剂是溶剂, 液体载体, 固体载体或填料, 表面活性剂, 分散剂, 乳化剂, 润湿剂, 辅助剂, 加溶剂, 渗透促进剂, 保护性胶体, 粘附剂, 增稠剂, 保湿剂, 驱除剂, 引诱剂, 进食刺激剂, 相容剂, 杀菌剂, 防冻剂, 消泡剂, 着色剂, 增粘剂和粘合剂。

[1166] 合适的溶剂和液体载体是水和有机溶剂, 如中到高沸点的矿物油馏分, 例如煤油、柴油; 植物或动物来源的油; 脂族、环状和芳族烃类, 例如甲苯、石蜡、四氢萘、烷基化萘; 醇类, 如乙醇、丙醇、丁醇、苄醇、环己醇; 二醇类; DMSO; 酮类, 例如环己酮; 酯类, 例如乳酸酯、碳酸酯、脂肪酸酯、 $\gamma$ -丁内酯; 脂肪酸; 磷酸酯; 胺类; 酰胺类, 例如N-甲基吡咯烷酮, 脂肪酸二甲基酰胺; 以及它们的混合物。

[1167] 合适的固体载体或填料是矿土, 例如硅酸盐、硅胶、滑石、高岭土、石灰石、石灰、白垩、粘土、白云石、硅藻土、膨润土、硫酸钙、硫酸镁、氧化镁; 多糖, 例如纤维素、淀粉; 肥料, 例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲类; 植物来源的产品, 例如谷粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉, 以及它们的混合物。

[1168] 合适的表面活性剂是表面活性化合物, 如阴离子、阳离子、非离子和两性表面活性剂, 嵌段聚合物, 聚电解质, 以及它们的混合物。该类表面活性剂可以用作乳化剂、分散剂、加溶剂、润湿剂、渗透促进剂、保护性胶体或辅助剂。表面活性剂的实例列于McCutcheon's, 第1卷: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. 或North American Ed.) 中。

[1169] 合适的阴离子表面活性剂是磺酸、硫酸、磷酸、羧酸的碱金属、碱土金属或铵盐以及它们的混合物。磺酸盐的实例是烷基芳基磺酸盐、二苯基磺酸盐、 $\alpha$ -烯炔磺酸盐、木素磺酸盐、脂肪酸和油的磺酸盐、乙氧基化烷基酚的磺酸盐、烷氧基化芳基酚的磺酸盐、缩合萘的磺酸盐、十二烷基-和十三烷基苯的磺酸盐、萘和烷基萘的磺酸盐、磺基琥珀酸盐或磺基琥珀酰胺酸盐。硫酸盐的实例是脂肪酸和油的硫酸盐、乙氧基化烷基酚的硫酸盐、醇的硫酸盐、乙氧基化醇的硫酸盐或脂肪酸酯的硫酸盐。磷酸盐的实例是磷酸盐酯。羧酸盐的实例是烷基羧酸盐以及羧化醇或烷基酚乙氧基化物。

[1170] 合适的非离子表面活性剂是烷氧基化物, N-取代的脂肪酸酰胺, 胺氧化物, 酯类, 糖基表面活性剂, 聚合物表面活性剂及其混合物。烷氧基化物的实例是诸如已经被1-50当量烷氧基化的醇、烷基酚、胺、酰胺、芳基酚、脂肪酸或脂肪酸酯的化合物。可以将氧化乙烯和/或氧化丙烯用于烷氧基化, 优选氧化乙烯。N-取代的脂肪酸酰胺的实例是脂肪酸葡萄糖酰胺或脂肪酸链烷醇酰胺。酯类的实例是脂肪酸酯, 甘油酯或甘油单酯。糖基表面活性剂的实例是脱水山梨醇、乙氧基化脱水山梨醇、蔗糖和葡萄糖酯或烷基聚葡萄糖苷。聚合物表面活性剂的实例是乙炔基吡咯烷酮、乙烯醇或乙酸乙烯酯的均聚物或共聚物。

[1171] 合适的阳离子表面活性剂是季型表面活性剂,例如具有1或2个疏水性基团的季铵化合物,或长链伯胺的盐。合适的两性表面活性剂是烷基甜菜碱和咪唑啉类。合适的嵌段聚合物是包含聚氧乙烯和聚氧丙烯的嵌段的A-B或A-B-A类型嵌段聚合物,或包含链烷醇、聚氧乙烯和聚氧丙烯的A-B-C类型嵌段聚合物。合适的聚电解质是聚酸或聚碱。聚酸的实例是聚丙烯酸的碱金属盐或聚酸梳状聚合物。聚碱的实例是聚乙烯基胺或聚乙烯胺。

[1172] 合适的辅助剂是本身具有可忽略的农药活性或者本身甚至没有农药活性且改善式(I)的尿嘧啶吡啶类对目标物的生物学性能的化合物。实例是表面活性剂,矿物油或植物油以及其他助剂。其他实例由Knowles,Adjuvants and additives,Agrow Reports DS256,T&F Informa UK,2006,第5章列出。

[1173] 合适的增稠剂是多糖(例如黄原胶、羧甲基纤维素)、无机粘土(有机改性或未改性的)、聚羧酸盐和硅酸盐。

[1174] 合适的杀菌剂是拌棉醇(bronopol)和异噻唑啉酮衍生物如烷基异噻唑啉酮和苯并异噻唑啉酮。

[1175] 合适的防冻剂是乙二醇、丙二醇、尿素和甘油。

[1176] 合适的消泡剂是聚硅氧烷、长链醇和脂肪酸盐。

[1177] 合适的着色剂(例如着红色、蓝色或绿色)是低水溶性颜料和水溶性染料。实例是无机着色剂(例如氧化铁、氧化钛、六氰合铁酸铁)和有机着色剂(例如茜素着色剂、偶氮着色剂和酞菁着色剂)。

[1178] 合适的增粘剂或粘合剂是聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、聚丙烯酸酯、生物蜡或合成蜡以及纤维素醚。

[1179] 农业化学组合物类型及其制备的实例为:

[1180] i) 水溶性浓缩物(SL,LS)

[1181] 将10-60重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物和5-15重量%润湿剂(例如醇烷氧基化物)溶于加至100重量%的水和/或水溶性溶剂(例如醇)中。活性物质在用水稀释时溶解。

[1182] ii) 分散性浓缩物(DC)

[1183] 将5-25重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物和1-10重量%分散剂(例如聚乙烯吡咯烷酮)溶于加至100重量%的有机溶剂(例如环己酮)中。用水稀释得到分散体。

[1184] iii) 可乳化浓缩物(EC)

[1185] 将15-70重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物和5-10重量%乳化剂(例如十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物)溶于加至100重量%的水不溶性有机溶剂(例如芳族烃)中。用水稀释得到乳液。

[1186] iv) 乳液(EW,E0,ES)

[1187] 将5-40重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合

物和1-10重量%乳化剂(例如十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物)溶于20-40重量%水不溶性有机溶剂(例如芳族烃)中。借助乳化机将该混合物引入加至100重量%的水中并制成均相乳液。用水稀释得到乳液。

[1188] v) 悬浮液(SC,OD,FS)

[1189] 在搅拌的球磨机中将20-60重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物在加入2-10重量%分散剂和润湿剂(例如木素磺酸钠和醇乙氧基化物)、0.1-2重量%增稠剂(例如黄原胶)和加至100重量%的水下粉碎,得到细碎活性物质悬浮液。用水稀释得到稳定的活性物质悬浮液。对于FS类型组合物加入至多40重量%粘合剂(例如聚乙烯醇)。

[1190] vi) 水分散性颗粒和水溶性颗粒(WG,SG)

[1191] 在加入加至100重量%的分散剂和润湿剂(例如木素磺酸钠和醇乙氧基化物)下精细研磨50-80重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物并借助工业装置(例如挤出机、喷雾塔、流化床)将其制成水分散性或水溶性颗粒。用水稀释得到稳定的活性物质分散体或溶液。

[1192] vii) 水分散性粉末和水溶性粉末(WP,SP,WS)

[1193] 将50-80重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物在加入1-5重量%分散剂(例如木素磺酸钠)、1-3重量%润湿剂(例如醇乙氧基化物)和加至100重量%的固体载体(例如硅胶)下在转子-定子磨机中研磨。用水稀释得到稳定的活性物质分散体或溶液。

[1194] viii) 凝胶(GW,GF)

[1195] 在搅拌的球磨机中在加入3-10重量%分散剂(例如木素磺酸钠)、1-5重量%增稠剂(例如羧甲基纤维素)和加至100重量%的水下粉碎5-25重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物,得到活性物质的精细悬浮液。用水稀释得到稳定的活性物质悬浮液。

[1196] iv) 微乳液(ME)

[1197] 将5-20重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物加入5-30重量%有机溶剂共混物(例如脂肪酸二甲基酰胺和环己酮)、10-25重量%表面活性剂共混物(例如醇乙氧基化物和芳基酚乙氧基化物)和加至100重量%的水中。将该混合物搅拌1小时,以自发产生热力学稳定的微乳液。

[1198] iv) 微胶囊(CS)

[1199] 将包含5-50重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物、0-40重量%水不溶性有机溶剂(例如芳族烃)、2-15重量%丙烯酸系单体(例如甲基丙烯酸甲酯、甲基丙烯酸和二-或三丙烯酸酯)的油相分散到保护性胶体(例如聚乙烯醇)的

水溶液中。由自由基引发剂引发的自由基聚合导致形成聚(甲基)丙烯酸酯微胶囊。或者将包含5-50重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶、0-40重量%水不溶性有机溶剂(例如芳族烃)和异氰酸酯单体(例如二苯基甲烷-4,4'-二异氰酸酯)的油相分散到保护性胶体(例如聚乙烯醇)的水溶液中。加入多胺(例如六亚甲基二胺)导致形成聚脲微胶囊。单体量为1-10重量%。重量%涉及整个CS组合物。

[1200] ix) 可撒粉粉末(DP,DS)

[1201] 将1-10重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物细碎研磨并与加至100重量%的固体载体(例如细碎高岭土)充分混合。

[1202] x) 颗粒(GR,FG)

[1203] 将0.5-30重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物细碎研磨并结合加至100重量%的固体载体(例如硅酸盐)。通过挤出、喷雾干燥或流化床实现造粒。

[1204] xi) 超低容量液体(UL)

[1205] 将1-50重量%本发明式(I)的尿嘧啶吡啶或包含至少一种式(I)的尿嘧啶吡啶(组分A)以及至少一种选自除草化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物的除草组合物溶于加至100重量%的有机溶剂(例如芳族烃)中。

[1206] 农业化学组合物类型i)-xi)可以任选包含其他助剂,如0.1-1重量%杀菌剂,5-15重量%防冻剂,0.1-1重量%消泡剂和0.1-1重量%着色剂。

[1207] 农业化学组合物和/或除草组合物通常包含0.01-95重量%,优选0.1-90重量%,尤其是0.5-75重量%式(I)的尿嘧啶吡啶类。式(I)的尿嘧啶吡啶类以90-100%,优选95-100%的纯度(根据NMR光谱)使用。

[1208] 为了处理植物繁殖材料,尤其是种子,通常使用种子处理用溶液(LS),悬浮乳液(SE),可流动浓缩物(FS),干处理用粉末(DS),淤浆处理用水分散性粉末(WS),水溶性粉末(SS),乳液(ES),可乳化浓缩物(EC)和凝胶(GF)。所述农业化学组合物在稀释2-10倍后在即用制剂中给出0.01-60重量%,优选0.1-40重量%的活性物质浓度。施用可以在播种之前或期间进行。

[1209] 式(I)的尿嘧啶吡啶类、其农业化学组合物和/或除草组合物在植物繁殖材料,尤其是种子上的施用方法包括繁殖材料的拌种、包衣、造粒、撒粉、浸泡和犁沟内施用方法。优选通过不诱发萌发的方法,例如通过拌种、造粒、包衣和撒粉将式(I)的尿嘧啶吡啶类、其农业化学组合物和/或除草组合物分别施用于植物繁殖材料上。

[1210] 可以向式(I)的尿嘧啶吡啶类、包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物中作为预混物加入或者合适的话在紧临使用前加入(桶混合)各种类型的油、润湿剂、辅助剂、肥料或微营养素和其他农药(例如除草剂、杀虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、安全剂)。这些试剂可以以1:100-100:1,优选1:10-10:1的重量比与本发明的农业化学组合物混合。

[1211] 用户通常将本发明式(I)的尿嘧啶吡啶类、包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物用于前剂量装置、小背包喷雾器、喷雾罐、喷雾飞机或灌溉系统。通常将该农业化学组合物用水、缓冲剂和其他助剂配制至所需施用浓度,从而得到即用喷雾液或本发明农

业化学组合物。每公顷农业利用区通常施用20-2000升,优选50-400升即用喷雾液。

[1212] 根据一个实施方案,用户可以在喷雾罐中混合本发明农业化学组合物的各组分或部分预混的组分,例如包含式(I)的尿嘧啶吡啶类以及任选地,选自B和/或C)组的活性物质的组分并且合适的话可以加入其他助剂和添加剂。

[1213] 在另一实施方案中,用户可以自己在喷雾罐中混合本发明农业化学组合物的各组分,例如成套包装的各部分或二元或三元混合物的各部分并且合适的话可以加入其他助剂。

[1214] 在另一实施方案中,可以联合(例如在桶混合之后)或依次施用本发明农业化学组合物的各组分或部分预混的组分,例如包含式(I)的尿嘧啶吡啶类以及任选地,选自B和/或C)组的活性物质的组分。

[1215] 式(I)的尿嘧啶吡啶类适合作为除草剂。它们适合直接、作为适当配制的组合物(农业化学组合物)或者作为与至少一种选自除草活性化合物B(组分B)和安全剂C(组分C)的其他化合物组合的除草组合物。

[1216] 式(I)的尿嘧啶吡啶类或者包含式(I)的尿嘧啶吡啶类的农业化学组合物和/或除草组合物非常有效地防治非作物区域的植物生长,尤其是在高施用率下。它们在作物如小麦、稻、玉米、大豆和棉花中作用于阔叶杂草和禾本科杂草而不对农作物引起任何显著的损害。该效果主要在低施用率下观察到。

[1217] 式(I)的尿嘧啶吡啶类或包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物主要通过喷雾叶子而施用于植物上。这里可以使用例如水作为载体通过常规喷雾技术使用约100-1000l/ha(例如300-400l/ha)的喷雾液量进行施用。式(I)的尿嘧啶吡啶类或包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物还可以通过低容量或超低容量方法或以微颗粒形式施用。

[1218] 式(I)的尿嘧啶吡啶类或包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物的施用可以在不希望的植物出苗之前、之中和/或之后,优选之中和/或之后进行。

[1219] 式(I)的尿嘧啶吡啶类或包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物可以在出苗前、出苗后或者在种植前施用,或者与农作物的种子一起施用。还可以通过施用用式(I)的尿嘧啶吡啶类或包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物预处理的农作物的种子而施用式(I)的尿嘧啶吡啶类或包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物。若活性成分不能被某些农作物良好地耐受,则可以使用其中借助喷雾设备喷雾除草组合物以使它们尽可能不接触敏感农作物的叶子,而使活性化合物到达生长在下面的不希望的植物的叶子或裸露的土壤表面的施用技术(后引导,最后耕作程序)。

[1220] 在另一实施方案中,可以通过处理种子而施用式(I)的尿嘧啶吡啶类或包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物。种子的处理基本包括所有本领域技术人员熟知的基于式(I)的尿嘧啶吡啶类或由其制备的农业化学组合物和/或除草组合物的程序(拌种、种子包衣、种子撒粉、种子浸泡、种子包膜、种子多层包衣、种子包壳、种子浸滴和种子造粒)。此时可以加以稀释或不加稀释地施用除草组合物。

[1221] 术语“种子”包括所有类型的种子,如玉米、种子、果实、块茎、秧苗和类似形式。这里优选术语种子描述的是玉米和种子。所用种子可以是上述有用植物的种子,但还可以是转基因植物或通过常规育种方法得到的植物的种子。

[1222] 当用于植物保护中时,不含配制助剂的活性物质,即式(I)的尿嘧啶吡啶类、组分B

和合适的话组分C的施用量取决于所需效果的种类为0.001-2kg/ha,优选0.005-2kg/ha,更优选0.05-1.5kg/ha,尤其是0.1-1kg/ha。

[1223] 在本发明的另一实施方案中,式(I)的尿嘧啶吡啶类、组分B和合适的话组分C的施用率为0.001-3kg/ha,优选0.005-2.5kg/ha,尤其是0.01-2kg/ha活性物质(a.s.)。

[1224] 在本发明的另一优选实施方案中,本发明式(I)的尿嘧啶吡啶类的施用率(式(I)的尿嘧啶吡啶类的总量)取决于防治目标、季节、目标植物和生长阶段为0.1-3000g/ha,优选1-1000g/ha。

[1225] 在本发明的另一优选实施方案中,式(I)的尿嘧啶吡啶类的施用率为0.1-5000g/ha,优选0.5-2500g/ha或2.5-2000g/ha。

[1226] 在本发明的另一优选实施方案中,式(I)的尿嘧啶吡啶类的施用率为0.1-1000g/ha,优选0.5-750g/ha,更优选2.5-500g/ha。

[1227] 所要求的除草化合物B的施用率通常为0.0005-2.5kg/ha,优选0.005-2kg/ha或0.01-1.5kg/ha a.s.。

[1228] 所要求的安全剂C的施用率通常为0.0005-2.5kg/ha,优选0.005-2kg/ha或0.01-1.5kg/ha a.s.。

[1229] 在植物繁殖材料如种子例如通过撒粉、包衣或浸润种子的处理中,通常要求的活性物质质量为0.1-1000g,优选1-1000g,更优选1-100g,最优选5-100g/100kg植物繁殖材料(优选种子)。

[1230] 在本发明的另一实施方案中,为了处理种子,活性物质,即式(I)的尿嘧啶吡啶类、组分B和合适的话组分C的施用量通常为0.001-10kg/100kg种子。

[1231] 当用于保护材料或储存产品时,活性物质的施用量取决于施用区域的种类和所需效果。在材料保护中通常施用的量为0.001g-2kg,优选0.005g-1kg活性物质/立方米被处理材料。

[1232] 在本发明除草组合物的情况下,式(I)的尿嘧啶吡啶类和其他组分B和/或组分C是联合还是分开配制和施用并不重要。

[1233] 在分开施用的情况下,施用以何种顺序进行不太重要。唯一必要的是式(I)的尿嘧啶吡啶类和其他组分B和/或组分C在允许这些活性成分同时作用于植物的时间范围内,优选在至多14天,尤其是至多7天的时间范围内施用。

[1234] 取决于所述施用方法,式(I)的尿嘧啶吡啶类或者包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物可以额外用于许多其他农作物以消除不希望的植物。合适的作物实例如下:洋葱(*Allium cepa*)、凤梨(*Ananas comosus*)、落花生(*Arachis hypogaea*)、石刁柏(*Asparagus officinalis*)、燕麦(*Avena sativa*)、甜菜(*Beta vulgaris spec.altissima*)、甜菜(*Beta vulgaris spec.rapa*)、欧洲油菜(*Brassica napus var.napus*)、芜菁甘蓝(*Brassica napus var.napobrassica*)、芜菁(*Brassica rapa var.silvestris*)、羽衣甘蓝(*Brassica oleracea*)、黑芥(*Brassica nigra*)、大叶茶(*Camellia sinensis*)、红花(*Carthamus tinctorius*)、美国山核桃(*Carya illinoensis*)、柠檬(*Citrus limon*)、甜橙(*Citrus sinensis*)、小果咖啡(*Coffea arabica*) (中果咖啡(*Coffea canephora*)、大果咖啡(*Coffea liberica*))、黄瓜(*Cucumis sativus*)、狗牙根(*Cynodon dactylon*)、胡萝卜(*Daucus carota*)、油棕(*Elaeis*

guineensis)、欧洲草莓(*Fragaria vesca*)、大豆(*Glycine max*)、陆地棉(*Gossypium hirsutum*) (树棉(*Gossypium arboreum*)、草棉(*Gossypium herbaceum*)、*Gossypium vitifolium*)、向日葵(*Helianthus annuus*)、*Hevea brasiliensis*、大麦(*Hordeum vulgare*)、啤酒花(*Humulus lupulus*)、甘薯(*Ipomoea batatas*)、核桃(*Juglans regia*)、兵豆(*Lens culinaris*)、亚麻(*Linum usitatissimum*)、番茄(*Lycopersicon lycopersicum*)、苹果属(*Malus spec.*)、木薯(*Manihot esculenta*)、紫苜蓿(*Medicago sativa*)、芭蕉属(*Musa spec.*)、烟草(*Nicotiana tabacum*) (黄花烟草(*N.rustica*))、油橄榄(*Olea europaea*)、稻(*Oryza sativa*)、金甲豆(*Phaseolus lunatus*)、菜豆(*Phaseolus vulgaris*)、欧洲云杉(*Picea abies*)、松属(*Pinus spec.*)、开心果(*Pistacia vera*)、*Pisum sativum*、欧洲甜樱桃(*Prunus avium*)、*Prunus persica*、西洋梨(*Pyrus communis*)、杏(*Prunus armeniaca*)、欧洲酸樱桃(*Prunus cerasus*)、扁桃(*Prunus dulcis*)和欧洲李(*Prunus domestica*)、*Ribes sylvestre*、蓖麻(*Ricinus communis*)、甘蔗(*Saccharum officinarum*)、黑麦(*Secale cereale*)、白芥(*Sinapis alba*)、马铃薯(*Solanum tuberosum*)、两色蜀黍(*Sorghum bicolor*) (高粱(*S.vulgare*))、可可树(*Theobroma cacao*)、红车轴草(*Trifolium pratense*)、普通小麦(*Triticum aestivum*)、小黑麦(*Triticale*)、硬粒小麦(*Triticum durum*)、蚕豆(*Vicia faba*)、葡萄(*Vitis vinifera*)和玉蜀黍(*Zea mays*)。

[1235] 优选的作物是落花生(*Arachis hypogaea*)、甜菜(*Beta vulgaris spec.altissima*)、欧洲油菜(*Brassica napus var.napus*)、羽衣甘蓝(*Brassica oleracea*)、柠檬(*Citrus limon*)、甜橙(*Citrus sinensis*)、小果咖啡(*Coffea arabica*) (中果咖啡(*Coffea canephora*)、大果咖啡(*Coffea liberica*))、狗牙根(*Cynodon dactylon*)、大豆(*Glycine max*)、陆地棉(*Gossypium hirsutum*) (树棉(*Gossypium arboreum*)、草棉(*Gossypium herbaceum*)、*Gossypium vitifolium*)、向日葵(*Helianthus annuus*)、大麦(*Hordeum vulgare*)、核桃(*Juglans regia*)、兵豆(*Lens culinaris*)、亚麻(*Linum usitatissimum*)、番茄(*Lycopersicon lycopersicum*)、苹果属(*Malus spec.*)、紫苜蓿(*Medicago sativa*)、烟草(*Nicotiana tabacum*) (黄花烟草(*N.rustica*))、油橄榄(*Olea europaea*)、稻(*Oryza sativa*)、金甲豆(*Phaseolus lunatus*)、菜豆(*Phaseolus vulgaris*)、开心果(*Pistacia vera*)、*Pisum sativum*、扁桃(*Prunus dulcis*)、甘蔗(*Saccharum officinarum*)、黑麦(*Secale cereale*)、马铃薯(*Solanum tuberosum*)、两色蜀黍(*Sorghum bicolor*) (高粱(*S.vulgare*))、小黑麦(*Triticale*)、普通小麦(*Triticum aestivum*)、硬粒小麦(*Triticum durum*)、蚕豆(*Vicia faba*)、葡萄(*Vitis vinifera*)和玉蜀黍(*Zea mays*)。

[1236] 尤其优选的作物是禾谷类作物、玉米、大豆、稻、油籽油菜、棉花、土豆、花生或多年生作物。

[1237] 本发明式(I)的尿嘧啶吡啶类或者包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物还可以用于基因修饰植物中。术语“基因修饰植物”应理解为如下植物,其基因材料通过使用重组DNA技术修饰而包括对所述植物品种的基因组而言非天生的DNA的插入序列或呈现对所述品种的基因组而言天生的DNA的删减,其中修饰不易单独通过杂交、突变或自然重组得到。特殊的基因修饰植物通常是通过自然育种或繁殖方法由其基因组为通过利用重组

DNA技术直接处理的基因组的传代植物遗传获得其基因修饰的植物。通常将一个或多个基因整合到基因修饰植物的基因材料中以改善植物的某些性能。这类基因修饰还包括但不限于蛋白质、寡肽或多肽的靶向翻译后修饰,例如通过在其中引入允许、降低或促进糖基化或聚合物加成如异戊二烯化、乙酰化或法呢基化或PEG结构部分连接的氨基酸突变。

[1238] 通过育种、诱变或基因工程修饰的植物例如因常规育种或基因工程方法而耐受特殊类别除草剂的施用,这些除草剂如为植物生长素除草剂如麦草畏(dicamba)或2,4-D;漂白剂除草剂如羟基苯基丙酮酸二加氧酶(HPPD)抑制剂或八氢番茄红素去饱和酶(PDS)抑制剂;乙酰乳酸合成酶(ALS)抑制剂,例如磺酰脲类或咪唑啉酮类;烯醇丙酮酰莽草酸3-磷酸合成酶(EPSPS)抑制剂,例如草甘膦(glyphosate);谷氨酰胺合成酶(GS)抑制剂,例如草铵膦(glufosinate);原卟啉原-IX氧化酶抑制剂;类脂生物合成抑制剂如乙酰基CoA羧化酶(ACCase)抑制剂;或oxynil(即溴苯腈(bromoxynil)或碘苯腈(ioxynil)除草剂;此外,植物已经通过多次基因修饰而耐受多种类别除草剂,如耐受草甘膦和草铵膦二者或耐受草甘膦和选自ALS抑制剂、HPPD抑制剂、植物生长素抑制剂或ACCase抑制剂的另另一类别除草剂二者。这些除草剂耐受性技术例如描述于Pest Management Science 61,2005,246;61,2005,258;61,2005,277;61,2005,269;61,2005,286;64,2008,326;64,2008,332;Weed Science 57,2009,108;Australian Journal of Agricultural Research 58,2007,708;Science 316,2007,1185;以及其中引用的文献中。几种栽培植物已经通过基因突变和常规育种方法耐受除草剂,例如耐受咪唑啉酮类如咪草啶酸(imazamox)的**Clearfield**<sup>®</sup>夏播油菜(Canola,德国BASF SE)或耐受磺酰脲类,例如苯黄隆(tribenuron)的**ExpressSun**<sup>®</sup>向日葵(DuPont,USA)。已经使用基因工程方法来赋予栽培植物如大豆、棉花、玉米、甜菜和油菜对除草剂如草甘膦、咪唑啉酮类和草铵膦的耐受性,它们中的一些正在开发或者可以以牌号或商标名**RoundupReady**<sup>®</sup>(耐受草甘膦,Monsanto,U.S.A.)、**Cultivance**<sup>®</sup>(耐受咪唑啉酮,德国BASF SE)和**LibertyLink**<sup>®</sup>(耐受草铵膦,德国Bayer CropScience)市购。

[1239] 此外,还包括通过使用重组DNA技术而能够合成一种或多种杀虫蛋白,尤其是由芽孢杆菌属(Bacillus)细菌,特别是苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis)已知的那些的植物,所述杀虫蛋白如为 $\delta$ -内毒素,例如CryIA(b),CryIA(c),CryIF,CryIF(a2),CryIIA(b),CryIIIA,CryIIIB(b1)或Cry9c;无性杀虫蛋白(VIP),例如VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A;线虫定居细菌的杀虫蛋白,例如发光杆菌属(Photobacterium)或致病杆菌属(Xenorhabdus);动物产生的毒素如蝎子毒素、蜘蛛毒素、黄蜂毒素或其他昆虫特异性神经毒素;真菌产生的毒素,例如链霉菌属(Streptomyces)毒素;植物凝集素,例如豌豆或大麦凝集素;凝集素;蛋白酶抑制剂,例如胰蛋白酶抑制剂,丝氨酸蛋白酶抑制剂,patatin,半胱氨酸蛋白酶抑制剂或木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),例如蓖麻蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、丝瓜籽蛋白、皂草素或异株腹泻毒蛋白(bryodin);类固醇代谢酶,例如3-羟基类固醇氧化酶、蜕皮甾类-IDP糖基转移酶、胆固醇氧化酶、蜕皮激素抑制剂或HMG-CoA还原酶;离子通道阻断剂,例如钠通道或钙通道阻断剂;保幼激素酯酶;利尿激素受体(helicokinin受体);萜合成酶,联苯合成酶,壳多糖酶或葡聚糖酶。在本发明上下文中,这些杀虫蛋白或毒素还具体理解为包括前毒素、杂合蛋白、截短的或其他方面改性的蛋白。杂合蛋白的特征在于蛋白域

的新型组合(例如参见WO 02/015701)。该类毒素或能够合成这些毒素的基因修饰植物的其他实例公开于EP-A 374753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/18810和WO 03/52073中。生产这些基因修饰植物的方法对本领域熟练技术人员是已知的且例如公开于上述出版物中。这些含于基因修饰植物中的杀虫蛋白赋予产生这些蛋白的植物以对所有分类学上为节肢动物的害虫,尤其是甲虫(鞘翅目(Coleoptera))、双翅目昆虫(双翅目(Diptera))和蛾(鳞翅目(Lepidoptera))以及线虫(线虫纲(Nematoda))的耐受性。能够合成一种或多种杀虫蛋白的基因修饰植物例如描述于上述出版物中,它们中的一些可市购,例如**YieldGard**<sup>®</sup>(产生毒素Cry1Ab的玉米品种),**YieldGard**<sup>®</sup> Plus(产生毒素Cry1Ab和Cry3Bb1的玉米品种),**Starlink**<sup>®</sup>(产生毒素Cry9c的玉米品种),**Herculex**<sup>®</sup>RW(产生毒素Cry34Ab1、Cry35Ab1和酶磷丝菌素-N-乙酰转移酶[PAT]的玉米品种);**NuCOTN**<sup>®</sup> 33B(产生毒素Cry1Ac的棉花品种),**Bollgard**<sup>®</sup> I(产生毒素Cry1Ac的棉花品种),**Bollgard**<sup>®</sup> II(产生毒素Cry1Ac和Cry2Ab2的棉花品种);**VIPCOT**<sup>®</sup>(产生VIP毒素的棉花品种);**NewLeaf**<sup>®</sup>(产生毒素Cry3A的土豆品种);**Bt-Xtra**<sup>®</sup>,**NatureGard**<sup>®</sup>,**KnockOut**<sup>®</sup>,**BiteGard**<sup>®</sup>,**Protecta**<sup>®</sup>,Bt11(例如**Agrisure**<sup>®</sup>CB)和法国Syngenta Seeds SAS的Bt176(产生毒素Cry1Ab和PAT酶的玉米品种),法国Syngenta Seeds SAS的MIR604(产生毒素Cry3A的修饰译本的玉米品种,参见WO 03/018810),比利时Monsanto Europe S.A.的MON 863(产生毒素Cry3Bb1的玉米品种),比利时Monsanto Europe S.A.的IPC 531(产生毒素Cry1Ac的修饰译本的棉花品种)和比利时Pioneer Overseas Corporation的1507(产生毒素Cry1F和PAT酶的玉米品种)。

[1240] 此外,还包括通过使用重组DNA技术能够合成一种或多种对细菌、病毒或真菌病原体的抗性或耐受性增强的蛋白质的植物。该类蛋白的实例是所谓的“与发病机理相关的蛋白”(PR蛋白,例如参见EP-A 392 225),植物病害抗性基因(例如表达针对来自墨西哥野生土豆Solanum bulbocastanum的致病疫霉(Phytophthora infestans)起作用的抗性基因的土豆品种)或T4溶菌酶(例如能够合成对细菌如Erwinia amylovora具有增强的抗性的这些蛋白的土豆品种)。生产这些基因修饰植物的方法对本领域熟练技术人员是已知的且例如公开于上述出版物中。

[1241] 此外,还包括通过使用重组DNA技术能够合成一种或多种蛋白以提高产量(例如生物物质产生、谷粒产量、淀粉含量、油含量或蛋白质含量),对干旱、盐或其他生长限制性环境因素的耐受性或对害虫以及真菌、细菌和病毒病原体的耐受性的植物。

[1242] 此外,还包括通过使用重组DNA技术而含有改变量的成分含量或新成分含量以尤其改善人类或动物营养的植物,例如产生促进健康的长链 $\omega$ -3脂肪酸或不饱和 $\omega$ -9脂肪酸的油料作物(例如**Nexera**<sup>®</sup>油菜,加拿大DOW Agro Sciences)。

[1243] 此外,还包括通过使用重组DNA技术而含有改变量的成分含量或新成分含量以尤其改善原料生产的植物,例如产生增加量的支链淀粉的土豆(例如**Amflora**<sup>®</sup>土豆,德国BASF SE)。

[1244] 此外,已经发现本发明式(I)的尿嘧啶吡啶类或者包含它们的农业化学组合物和/或除草组合物还适于植物部分的脱叶和/或干燥,对此合适的是农作物如棉花、土豆、油菜籽油菜、向日葵、大豆、蚕豆、禾谷类(例如小麦、大麦、高粱、小米、燕麦、黑麦和小黑麦)、玉米和小扁豆;优选棉花、土豆、油菜籽油菜、向日葵、大豆或蚕豆,尤其是棉花。就此而言,已经发现用于植物干燥和/或脱叶的农业化学组合物和/或除草组合物、制备这些农业化学组合物和/或除草组合物的方法以及使用式(I)的尿嘧啶吡啶类使植物干燥和/或脱叶的方法。

[1245] 作为干燥剂,式(I)的尿嘧啶吡啶类特别适于干燥农作物如土豆、油菜籽油菜、向日葵和大豆以及还有禾谷类(例如小麦、大麦、高粱、小米、燕麦、黑麦和小黑麦)、玉米和小扁豆的地上部分。这使得这些重要农作物的完全机械化收获成为可能。

[1246] 还具有经济意义的是促进柑橘类水果、橄榄和其他物种和品种的仁果、核果和坚果的收获,这通过在一定时间期限内集中裂开或降低对树的粘附而成为可能。相同的机理,即促进果实部分或叶部分与植物的枝部分之间产生脱离组织对于有用植物,尤其是棉花的受控脱叶也是必要的。

[1247] 此外,各棉花植株成熟的时间间隔缩短导致收获后的纤维质量提高。

[1248] 此外,已经发现式(I)的尿嘧啶吡啶类或者包含式(I)的尿嘧啶吡啶类的农业化学组合物和/或除草组合物也非常有效地控制PPO耐受性杂草。

[1249] 因此,本发明还提供了一种控制PPO耐受性杂草生长的方法,包括使该类杂草、其部分、其繁殖材料或其生长地与式(I)的尿嘧啶吡啶类接触,其中PPO耐受性杂草是耐受除式(I)的尿嘧啶吡啶类以外的PPO抑制性除草剂的杂草。

[1250] 本发明具体涉及一种在其中所述PPO除草剂耐受性杂草出现或者可能出现的作物中控制PPO耐受性杂草的方法,包括对作物施用式(I)的尿嘧啶吡啶类。

[1251] 本文所用术语“PPO抑制剂”、“PPO抑制剂除草剂”、“PPO抑制性除草剂”、“原卟啉原IX氧化酶抑制剂除草剂”、“原卟啉原IX氧化酶抑制性除草剂”、“原卟啉原氧化酶抑制剂除草剂”和“原卟啉原氧化酶抑制性除草剂”是同义词且涉及抑制植物的酶—原卟啉原氧化酶的除草剂。

[1252] 本文所用术语“PPO抑制剂除草剂耐受性杂草”、“PPO抑制性除草剂耐受性杂草”、“PPO抑制剂耐受性杂草”、“PPO耐受性杂草”、“原卟啉原IX氧化酶抑制剂除草剂耐受性杂草”、“原卟啉原IX氧化酶抑制性除草剂耐受性杂草”、“原卟啉原氧化酶抑制剂除草剂耐受性杂草”和“原卟啉原氧化酶抑制性除草剂耐受性杂草”是同义词且涉及对于用合适施用率或超过合适施用率的PPO抑制性除草剂处理来说继承、产生或获得如下能力的植物:

[1253] (1) 经历该处理之后存活,若该处理对野生型杂草是致命的(即摧毁)的话;或者

[1254] (2) 在该处理之后显示出显著的植物生长或茁壮成长,若该处理抑制野生型杂草的生长的话。

[1255] 有效的杂草控制定义为在处理2周测得作物中至少70%杂草抑制或摧毁或者至少70%杂草植物毒性。

[1256] 因此,PPO耐受性杂草是通过施用式(I)的尿嘧啶吡啶类以外的PPO抑制剂无法控制的杂草,而相应的敏感性生物型在该使用率下被控制。

[1257] 这里“无法控制”是指在视觉评价中杂草控制(除草效果)在处理2周测得<70%

杂草抑制或摧毁;以及“被控制”是指在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得>90%杂草抑制或摧毁。

[1258] 优选PPO耐受性杂草是通过施用式(I)的尿嘧啶吡啶类以外的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁)。

[1259] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用选自唑啶炔草的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁)。

[1260] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用选自唑啶炔草、氟黄胺草醚和乳氟禾草灵的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁)。

[1261] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用选自氟黄胺草醚和乳氟禾草灵的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁)。

[1262] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用选自氟锁草醚、唑啶炔草、氟酮唑草、酰亚胺苯氧乙酸、氟噁嗪酮、氟黄胺草醚、乳氟禾草灵、恶草灵、乙氧氟草醚、氟唑草酯和磺胺草唑的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁)。

[1263] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用选自氟锁草醚、氟酮唑草、酰亚胺苯氧乙酸、氟噁嗪酮、氟黄胺草醚、乳氟禾草灵、恶草灵、乙氧氟草醚、氟唑草酯和磺胺草唑的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁)。

[1264] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用率为200g/ha或更低,特别优选100g/ha或更低,尤其优选50-200g/ha,更优选50-100g/ha的式(I)的尿嘧啶吡啶类以外的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁),而相应的敏感性生物型在该使用率下被控制(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得>90%杂草抑制或摧毁)。

[1265] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用率为200g/ha或更低,特别优选100g/ha或更低,尤其优选50-200g/ha,更优选50-100g/ha的选自唑啶炔草、氟黄胺草醚和乳氟禾草灵的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁),而相应的敏感性生物型在该使用率下被控制(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得>90%杂草抑制或摧毁)。

[1266] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用率为200g/ha或更低,特别优选100g/ha或更低,尤其优选50-200g/ha,更优选50-100g/ha的选自氟黄胺草醚和乳氟禾草灵的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁),而相应的敏感性生物型在该使用率下被控制(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得>90%杂草抑制或摧毁)。

[1267] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用率为200g/ha或更低,特别优选100g/ha或更低,尤其优选50-200g/ha,更优选50-100g/ha的选自氟锁草醚、唑啶炔草、氟酮唑草、酰亚胺苯氧乙酸、氟噁嗪酮、氟黄胺草醚、乳氟禾草灵、恶草灵、乙氧氟草醚、氟唑草酯和磺胺草唑的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁),而相应的敏感性生物型在该使用率下被控制(即在视觉评价中杂草控制在处

理后2周测得>90%杂草抑制或摧毁)。

[1268] 还优选PPO耐受性杂草是通过施用率为200g/ha或更低,特别优选100g/ha或更低,尤其优选50-200g/ha,更优选50-100g/ha的选自氟锁草醚、氟酮唑草、酰亚胺苯氧乙酸、氟噁嗪酮、氟黄胺草醚、乳氟禾草灵、恶草灵、乙氧氟草醚、氟唑草酯和磺胺草唑的PPO抑制性除草剂无法控制的杂草(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得<70%杂草抑制或摧毁),而相应的敏感性生物型在该使用率下被控制(即在视觉评价中杂草控制在处理后2周测得>90%杂草抑制或摧毁)。

[1269] 还优选PPO耐受性杂草是被分类为“PPO耐受性”并且因此根据匿名者:List of herbicide resistant weeds by herbicide mode of action-weeds resistant to PPO-inhibitors (URL:<http://www.weedscience.org/summary/MOA.aspx>) 列出的那些。

[1270] 特别优选PPO耐受性杂草选自铁苋菜属(Acalypha)、苋属(Amaranthus)、豚草属(Ambrosia)、燕麦属(Avena)、白酒草属(Conyza)、播娘蒿属(Descurainia)、大戟属(Euphorbia)和千里光属(Senecio);尤其优选苋属、豚草属和大戟属;更优选苋属和豚草属。

[1271] 还特别优选PPO耐受性杂草选自亚洲铁苋菜(铁苋草(Acalypha australis))、光滑猪草(绿穗苋(Amaranthus hybridus))、长芒苋(Amaranthus Palmeri)、红根苋(反枝苋(Amaranthus retroflexus))、高/普通水麻(糙果苋(Amaranthus tuberculatus))、具瘤苋(Amaranthus rudis)或Amaranthus tamariscinus)、豚草(Ambrosia artemisiifolia)、野燕麦(Avena fatua)、飞蓬(胡椒草(Conyza ambigua))、问荆(加拿大蓬(Conyza Canadensis))、播娘蒿(Descurainia Sophia)、野生一品红(小叶大戟(Euphorbia heterophylla))和东千里光(欧洲千里光(Senecio vernalis));尤其优选光滑猪草(绿穗苋)、长芒苋、红根苋(反枝苋)、高/普通水麻(糙果苋或具瘤苋)、豚草和野生一品红(小叶大戟);更优选高/普通水麻(糙果苋、具瘤苋或Amaranthus tamariscinus)和豚草。

[1272] 大多数PPO耐受性杂草,尤其是糙果苋的生物型由于在核编码基因PPX2L上的密码子缺失是耐受性的,该基因编码对线粒体和叶绿体呈双靶向的PPO酶。这导致在位置210中甘氨酸氨基酸的损失(例如参见B.G.Young等,PP0抑制剂耐受性水麻(糙果苋)对土壤施用的PP0抑制性除草剂的响应的表征,Weed Science 2015,63,511-521)。

[1273] 第二类突变,尤其是在豚草的耐受性生物型中,被识别为表达PPX2酶的R98L变化的突变(S.L.Rousonelos,R.M.Lee,M.S.Moreira,M.J.VanGessel,P.J.Tranel,耐受ALS和PPO抑制性除草剂的豚草群体的表征,Weed Science 60,2012,335-344)。

[1274] 因此,优选PPO耐受性杂草是其Protox酶由于表达为所述Protox酶的 $\Delta G210$ 或R98L变化或分别是PPX2L或PPX2的等价物,尤其是表达为所述Protox酶的 $\Delta G210$ 或R98L变化的突变而耐受PPO抑制剂施用的杂草。

[1275] 式(I)的苯基尿嘧啶的制备由实施例说明;然而,本发明的主题不限于所给实施例。

[1276] A制备实施例

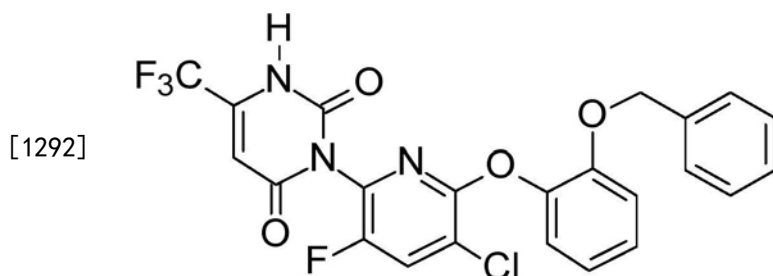
[1277] 实施例1:2-[2-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧化-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]乙酸乙酯



甲烷萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,在无水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上干燥并浓缩,得到14.4g氨基甲酸酯1.3和二取代衍生物的混合物。将粗混合物(12.4g)溶于200mL乙醇中并在 $0^\circ\text{C}$ 下在搅拌下滴加 $\text{NaOH}$ 水溶液(1M)。将该混合物在 $15^\circ\text{C}$ 下搅拌6小时,用盐水稀释并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层在无水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过在硅石上的柱层析(石油醚/乙酸乙酯)提纯,得到6.6g(15.9mmol),62%)所需化合物1.3。

[1290]  $[\text{M}+\text{H}] = 417.1$ ;  $\text{Rt} = 1.293\text{min}$

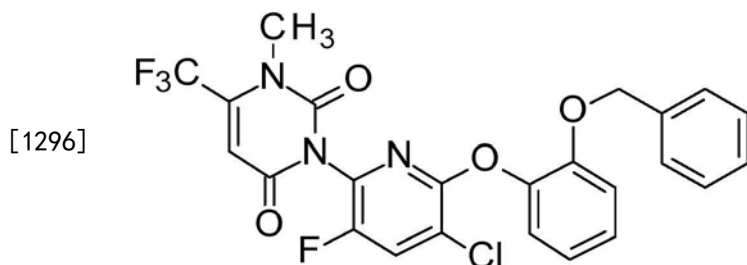
[1291] 实施例1.4:3-[6-(2-苄氧基苯氧基)-5-氯-3-氟-2-吡啶基]-6-三氟甲基-1H-嘧啶-2,4-二酮



[1293] 在 $0^\circ\text{C}$ 下向1.7g(43mmol)  $\text{NaH}$ 在 $\text{NMP}$ ( $N$ -甲基-2-吡咯烷酮)(60mL)中的溶液中加入6g(14mmol)化合物1.3并将该混合物在 $35^\circ\text{C}$ 下搅拌30分钟。然后加入3.9g(21mmol)( $E$ )-3-氨基-4,4,4-三氟丁-2-烯酸乙酯(CAS:372-29-2)并将反应混合物在 $100^\circ\text{C}$ 下搅拌3天。将所得混合物用冰水终止,通过使用6N  $\text{HCl}$ 酸化至 $\text{pH} = 2$ 并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,在无水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上干燥,浓缩并直接用于下一步中。

[1294]  $[\text{M}+\text{H}] = 508.0$ ;  $\text{Rt} = 1.240\text{min}$

[1295] 实施例1.5:3-[6-(2-苄氧基苯氧基)-5-氯-3-氟-2-吡啶基]-1-甲基-6-三氟甲基嘧啶-2,4-二酮

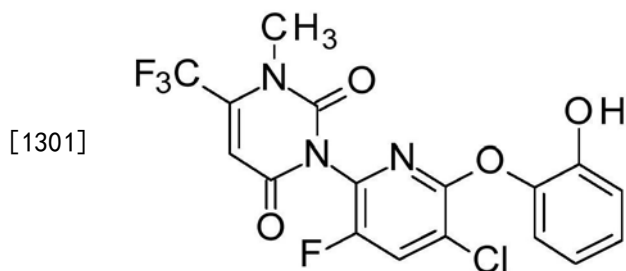


[1297] 在 $0^\circ\text{C}$ 下在搅拌下向6.5g(12.8mmol)化合物1.4在65mL乙腈中的溶液中加入5.3g(38mmol)  $\text{K}_2\text{CO}_3$ ,然后加入7.3g(51mmol)甲基碘。将该混合物在 $15^\circ\text{C}$ 下搅拌16小时,然后加入水(80mL)并通过使用2N  $\text{HCl}$ 将 $\text{pH}$ 调节至 $\text{pH} = 5$ 。将该混合物用乙酸乙酯萃取,将合并的有机层用盐水洗涤,在无水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上干燥,过滤并在减压下除去溶剂,得到7g粗产物1.5,其无需进一步提纯而使用。

[1298]  $^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ , ppm): 7.63(d,  $J = 7.28\text{Hz}$ , 1H); 7.21-7.25(m, 4H); 7.12-7.17(m, 2H); 6.98(t,  $J = 7.03\text{Hz}$ , 3H); 6.26(s, 1H); 4.99(s, 2H); 3.47(s, 3H)。

[1299]  $[\text{M}+\text{H}] = 522.0$ ;  $\text{Rt} = 1.323\text{min}$

[1300] 实施例1.6:3-[5-氯-3-氟-6-(2-羟基苯氧基)-2-吡啶基]-1-甲基-6-三氟甲基嘧啶-2,4-二酮

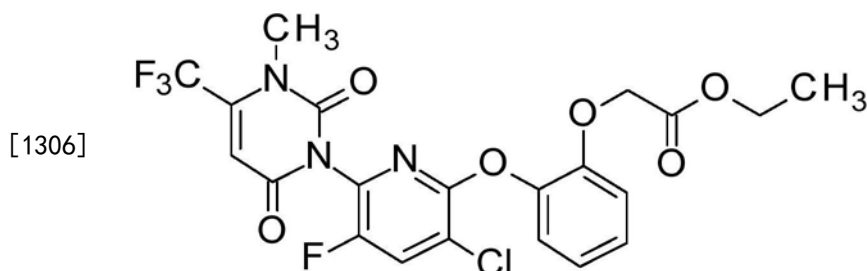


[1302] 在15°C下在搅拌下向7g (13.4mmol) 化合物1.5在70mL二甲苯中的溶液中加入3.6g (26mmol) 固体AlCl<sub>3</sub>。将该混合物在130°C下搅拌16小时并在冷却至15°C之后,将冰水加入该混合物中。在分离二甲苯层之后,将水相用乙酸乙酯萃取,将合并的有机层在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过在硅胶上的柱层析(石油醚/乙酸乙酯)提纯,得到3.2g (7.4mmol, 55%) 所需产物1.6。

[1303] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm): 7.80 (d, J=7.26Hz, 1H); 7.03-7.19 (m, 3H); 6.93 (dt, J=7.68Hz, J=1.7Hz, 1H); 6.3 (s, 1H); 5.6 (s, 1H); 3.5 (s, 3H)。

[1304] [M+H]<sup>+</sup>=431.9; Rt=1.077min

[1305] 实施例1.7:2-[2-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]乙酸乙酯(=实施例1)



[1307] 在0°C下向0.2g (0.46mmol) 化合物1.6在10mL无水乙腈中的溶液中加入0.19g (1.3mmol) K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>, 然后滴加0.15g (0.92mmol) 溴乙酸乙酯。将该混合物在15°C下搅拌16小时,用15mL水稀释并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过反相制备型HPLC(乙腈/含有三氟乙酸的水)提纯,得到0.16g (0.31mmol, 67%) 所需标题产物。

[1308] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm): 7.76 (d, J=7.28Hz, 1H); 7.22 (d, J=7.72Hz, 1H); 7.17 (t, J=7.83Hz, 1H); 6.99-7.06 (m, 1H); 6.88 (d, J=7.94Hz, 1H); 6.25 (s, 1H); 4.49 (s, 2H); 4.19 (q, J=7.20Hz, 2H); 3.47 (s, 3H); 1.25 (t, J=7.17Hz, 3H)。

[1309] [M+H]<sup>+</sup>=518.0; Rt=1.217min

[1310] 由乙醇重结晶提供了晶型A的标题化合物。

[1311] 实施例1的晶型A显示出在96-108°C范围内具有特征性熔融峰的温谱图。作为熔融峰起始测定的熔点通常位于约100-106°C的范围内。这里引用的值涉及通过差示量热法(差示扫描量热法, DSC)测定的值。

[1312] 熔点使用具有Mettler Toledo DSC 823e/700/229组件的DSC测定。将样品置于标准玻璃盘中。样品量在每种情况下为1-20mg。加热速率为2.50K/min。在试验过程中将样品用氮气流吹扫。熔点测定为由在熔融峰的主侧上该峰半高处的切线与线性外推初始基线的交点限定的外推峰起始温度(也称起始温度)。

[1313] 通过粉末X射线衍射 (PXRD) 研究晶型A。PXRD由使用CuK $\alpha$ 射线的Panalytical X'Pert Pro X射线衍射仪以反射几何学 (Bragg-Brentano) 进行。将粉末置于0.2mm深度的硅单晶试样夹中并温柔精确地弄平。管电压为45kV且电流为40mA。在室温下在 $2\theta = 3.0^\circ - 40.0^\circ$ 范围内以例如 $0.017^\circ$ 的增量和19.7s/步进的测量时间收集PXRD数据。

[1314] PXRD图案示于图1中。特征峰位置列于表2中：

[1315] 表2：在呈其晶型A的实施例1的PXRD图案中观察到的峰位置：

$2\theta$ , Cu K $\alpha$ 射线	d[Å]
<b>5.5 ± 0.2</b>	<b>16.2 ± 0.6</b>
<b>7.4 ± 0.2</b>	<b>12.0 ± 0.3</b>
<b>7.8 ± 0.2</b>	<b>11.4 ± 0.3</b>
<b>10.0 ± 0.2</b>	<b>8.9 ± 0.2</b>
<b>10.3 ± 0.2</b>	<b>8.6 ± 0.2</b>
<b>11.2 ± 0.2</b>	<b>7.9 ± 0.1</b>
[1316] <b>11.8 ± 0.2</b>	<b>7.5 ± 0.1</b>
<b>17.1 ± 0.2</b>	<b>5.19 ± 0.06</b>
<b>18.0 ± 0.2</b>	<b>4.92 ± 0.06</b>
<b>18.8 ± 0.2</b>	<b>4.73 ± 0.05</b>
<b>19.3 ± 0.2</b>	<b>4.59 ± 0.05</b>
<b>20.9 ± 0.2</b>	<b>4.24 ± 0.04</b>
<b>21.5 ± 0.2</b>	<b>4.13 ± 0.04</b>
<b>21.9 ± 0.2</b>	<b>4.06 ± 0.04</b>
[1317] <b>23.0 ± 0.2</b>	<b>3.87 ± 0.04</b>
<b>26.3 ± 0.2</b>	<b>3.39 ± 0.03</b>

[1318] 最突出的峰为 $5.5 \pm 0.2, 7.4 \pm 0.2, 7.8 \pm 0.2, 10.0 \pm 0.2, 11.2 \pm 0.2, 17.1 \pm 0.2, 18.0 \pm 0.2, 21.5 \pm 0.2, 21.9 \pm 0.2$ 和 $26.3 \pm 0.2^\circ 2\theta$ 。

[1319] 晶型A的单晶研究表明基础晶体结构是三斜晶系。晶胞具有空间群 **P $\bar{1}$** 。晶体结构 (在100K下测定) 的特征性数据汇编在下表3中：

[1320] 表3

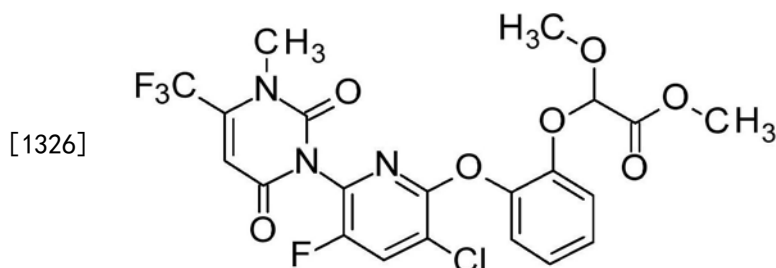
参数	实施例 1 晶型 A
类别	三斜晶系
空间群	$P\bar{1}$
a	11.1534(8) Å
b	12.4573(9) Å
c	16.8546(12) Å
$\alpha$	72.960(3)°
$\beta$	82.651(3)°
$\gamma$	83.283(3)°
体积	2212.8(3) Å <sup>3</sup>
Z	4
密度(计算值)	1.554g/cm <sup>3</sup>
波长	1.54178Å
最大衍射峰和孔	0.716/-0.362eÅ <sup>-3</sup>

[1322] a, b, c = 晶胞长度

[1323]  $\alpha, \beta, \gamma$  = 晶胞角

[1324] Z = 晶胞中的分子数

[1325] 实施例2: 2-[2-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]-2-甲氧基乙酸甲酯

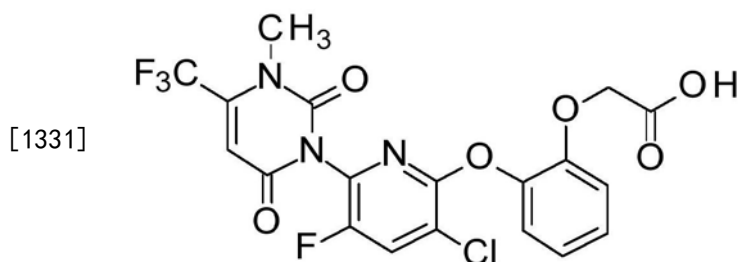


[1327] 在0℃下在N<sub>2</sub>和搅拌下在10分钟内向2.5g (5.8mmol) 化合物1.6在20mL无水乙腈中的溶液中加入2.2g (16mmol) K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>。然后将1.4g (7.5mmol) 2-溴-2-甲氧基乙酸甲酯 (CAS: 5193-96-4) 滴加到该混合物中, 在15℃下搅拌16小时。过滤反应混合物并将滤饼用乙酸乙酯洗涤。浓缩滤液并将粗产物通过反相制备型HPLC (乙腈/含有三氟乙酸的水) 提纯, 得到0.97g (1.8mmol, 31%) 所需化合物2。

[1328] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm): 7.77 (d, J = 7.03Hz, 1H); 7.15-7.27 (m, 3H); 7.07-7.13 (m, 1H); 6.24 (s, 1H); 5.40 (d, J = 8.53Hz, 1H); 3.70 (s, 3H); 3.46 (br. s., 3H); 3.39 (s, 3H)。

[1329] [M+H] = 534.1; Rt = 1.233min

[1330] 实施例3: 2-[2-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]乙酸

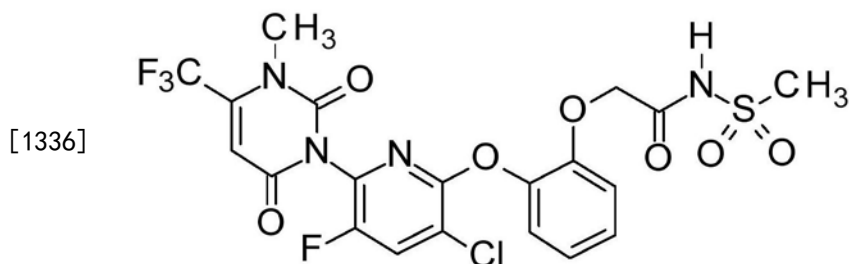


[1332] 在60℃下将3.5g (6.8mmol) 2-[2-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基咪唑-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]乙酸乙酯(实施例1)在20ml浓HCl水溶液和20mL冰醋酸中的溶液搅拌3小时。加入水并将该混合物用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用水和盐水洗涤,在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥,过滤并在减压下除去溶剂,得到2.3g (4.7mmol, 69%) 2-[2-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基咪唑-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]乙酸。

[1333] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm): 7.77 (d, J=7.21Hz, 1H); 7.15-7.25 (m, 2H); 7.06 (dt, J=7.74Hz, J=1.46Hz, 1H); 6.91 (dd, J=8.15Hz, J=1.44Hz, 1H); 6.25 (s, 1H); 4.55 (s, 2H), 3.45 (s, 3H)。

[1334] [M+H]=490.0; Rt=1.189min

[1335] 实施例4: 2-[2-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基咪唑-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]-N-甲基磺酰基乙酰胺

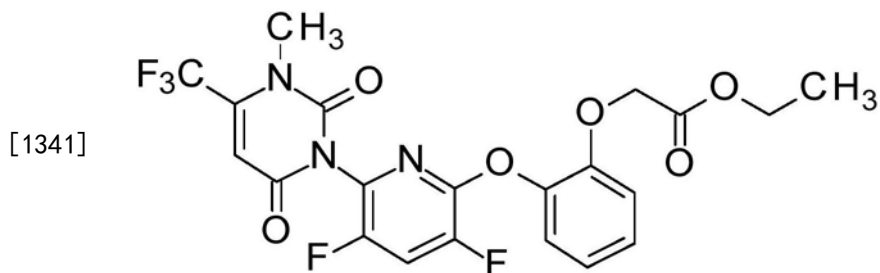


[1337] 在氩气气氛下向0.7g (1.5mmol) 2-[2-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基咪唑-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]乙酸在20mL无水THF中的溶液中加入1.0g (7.4mmol) 二异丙基乙基胺,然后加入0.8g (3.0mmol) 氯化2-氯-1-甲基吡啶鎓 (CAS: 112277-86-8) 和0.2g (2.2mmol) 甲磺酰胺 (CAS: 3144-09-0)。将该悬浮液在室温下搅拌16小时。然后加入水,将该混合物用乙酸乙酯萃取,将合并的有机层用水和盐水洗涤,在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过在硅石上的柱层析(环己烷/乙酸乙酯)提纯,得到0.1g (0.24mmol, 16%) 所需产物。

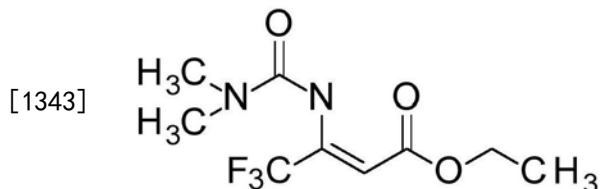
[1338] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm): 8.6 (s, 1H); 7.8 (d, 1H); 7.2-7.3 (m, 2H); 7.1 (m, 1H); 6.9 (d, 1H); 6.3 (s, 1H); 4.5 (s, 2H); 3.5 (s, 3H); 3.1 (s, 3H)。

[1339] [M+H]=567.1; Rt=1.123min

[1340] 实施例5: 2-[2-[[3,5-二氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基咪唑-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]乙酸乙酯

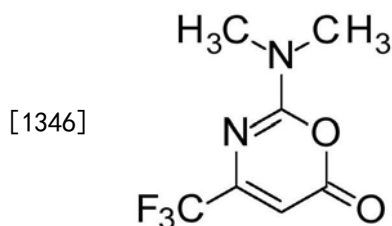


[1342] 实施例5.1: (Z)-3-(二甲基氨基甲酰氨基)-4,4,4-三氟丁-2-烯酸乙酯



[1344] 在0-5℃和搅拌下在1小时内 $N_2$ 气氛下向104g (2.73mol) NaH在600mL无水DMF中的溶液中加入233g (2.18mol) 溶于200mL无水DMF中的N,N-二甲基氨基甲酰氯 (CAS:79-44-7)。然后在0-5℃的温度下在1小时内搅拌下滴加200g (1.09mol) 溶于200mL无水DMF中的(Z)-3-氨基-4,4,4-三氟丁-2-烯酸乙酯 (CAS:372-29-2)。将该混合物在室温下再搅拌2小时,然后倾入冰水中。将该混合物用乙酸乙酯萃取,将合并的有机层用盐水洗涤,在无水 $Na_2SO_4$ 上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过在硅石上的柱层析(石油醚/乙酸乙酯)提纯,得到170g (0.67mol, 64%) 所需产物5.1。

[1345] 实施例5.2:2-二甲氨基-4-三氟甲基-1,3-噁嗪-6-酮

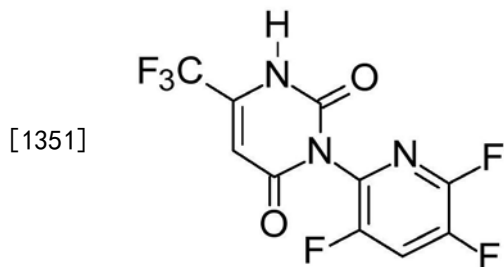


[1347] 在0℃下分三份向170g (0.67mol) 化合物5.1在102mL  $POCl_3$ 中的溶液中加入139g (0.67mol)  $PCl_5$ ,在每两份之间搅拌15分钟,并将该混合物在0℃下再搅拌1小时。然后将该混合物在室温下再搅拌3小时。将反应混合物倾入250mL冰水中,经由过滤收集沉淀并干燥,得到84g (0.40mol, 60%) 所需产物5.2。

[1348]  $^1H-NMR$  ( $CDCl_3$ , ppm): 5.9 (s, 1H); 3.2 (d,  $J=19.58Hz$ , 6H)。

[1349]  $[M+H]^+ = 209.1$ ;  $R_t = 0.980min$

[1350] 实施例5.3:6-三氟甲基-3-(3,5,6-三氟-2-吡啶基)-1H-嘧啶-2,4-二酮



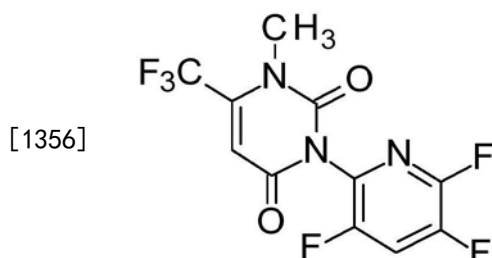
[1352] 将1.5g (15.2mmol) 2-氨基-3,5,6-三氟吡啶 (CAS 3534-50-7) 和3.1g (15.2mmol)

化合物5.2在15mL冰醋酸中的溶液在95℃下搅拌16小时。然后加入水并将该混合物用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用水和盐水洗涤,在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥,过滤并在减压下除去溶剂,得到3.9g (12.5mmol, 82%) 所需产物5.3。

[1353] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm) : 7.6 (m, 1H) ; 6.25 (s, 1H) 。

[1354] [M+H] = 312.0; Rt = 0.873min

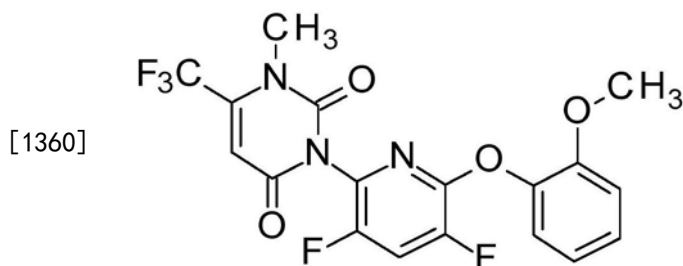
[1355] 实施例5.4: 1-甲基-6-三氟甲基-3-(3,5,6-三氟-2-吡啶基) 嘧啶-2,4-二酮



[1357] 在0℃下向35g (0.11mol) 化合物5.3在400mL DMF中的溶液中加入31g (0.23mol) K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>, 然后加入32g (0.23mol) 甲基碘并将该混合物在室温下搅拌16小时。然后加入水, 将该混合物用乙酸乙酯萃取, 将合并的有机层用水和盐水洗涤, 然后在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥, 过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过在硅石上的柱层析 (石油醚/乙酸乙酯) 提纯, 得到15g (46mmol, 42%) 所需产物5.4。

[1358] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm) : 7.6 (q, J = 7.06Hz, 1H) ; 6.4 (s, 1H) ; 3.6 (s, 3H) 。 [M+H] = 325.9; Rt = 1.058min

[1359] 实施例5.5: 3-[3,5-二氟-6-(2-甲氧基苯氧基)-2-吡啶基]-1-甲基-6-三氟甲基嘧啶-2,4-二酮



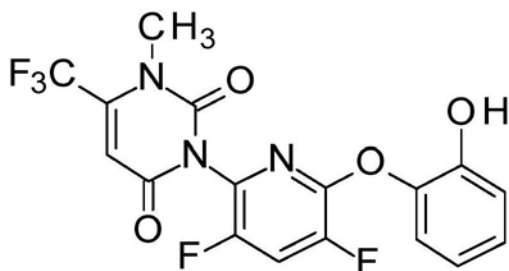
[1361] 在0℃下在5分钟内在搅拌下向5g (0.04mol) 2-甲氧基苯酚 (CAS: 90-05-1) 在400mL THF中的溶液中加入6.9g (0.06mol) K<sup>t</sup>Bu。然后加入10g (31mmol) 化合物5.4, 将该混合物加热至80℃并保持2小时, 然后倾入冰水中。将该混合物用乙酸乙酯萃取, 将合并的有机层用盐水洗涤, 在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥, 过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过在硅石上的柱层析 (石油醚/乙酸乙酯) 提纯, 得到9.3g (22mmol), 71%) 所需产物5.5。

[1362] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm) : 7.5 (t, J = 7.78Hz, 1H) ; 7.2-7.3 (m, 2H) ; 6.9-7.0 (m, 2H) ; 6.3 (s, 1H) ; 3.7 (s, 3H) 。

[1363] [M+H] = 430.0; Rt = 1.197min

[1364] 实施例5.6: 3-[3,5-二氟-6-(2-羟基苯氧基)-2-吡啶基]-1-甲基-6-三氟甲基嘧啶-2,4-二酮

[1365]



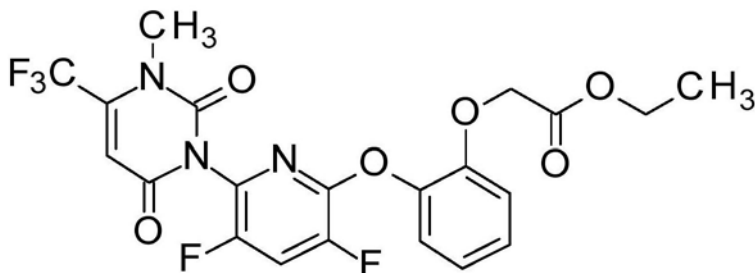
[1366] 向冷却至 $-78^{\circ}\text{C}$ 的9g (20mmol) 化合物5.5在200mL二氯甲烷中的溶液中加入在50mL二氯甲烷中的7.9g (30mmol)  $\text{BBr}_3$ 。将该混合物在5小时内温热至室温, 倾入冰水中并用二氯甲烷萃取。将合并的有机层用盐水洗涤, 在无水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上干燥, 过滤并在减压下除去溶剂, 得到所需产物5.6, 其不经进一步提纯用于下一步中。

[1367]  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , ppm): 7.54 (m, 1H); 7.09-7.18 (m, 2H); 7.00-7.08 (m, 1H); 6.87-6.96 (m, 1H); 6.3 (s, 1H); 5.7 (br. s., 1H); 3.5 (s, 3H)。

[1368]  $[\text{M}+\text{H}] = 416.0$ ;  $\text{Rt} = 1.117\text{min}$

[1369] 实施例5.7: 2-[2-[[3,5-二氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]苯氧基]乙酸乙酯

[1370]



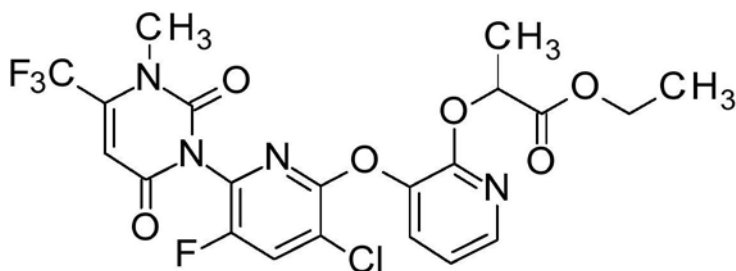
[1371] 在 $0^{\circ}\text{C}$ 下在搅拌下向9.5g (22.8mmol) 化合物5.6在300mL乙腈中的溶液中加入6.3g (45.7mmol)  $\text{K}_2\text{CO}_3$ 。然后加入7.6g (45.7mmol) 溴乙酸乙酯 (CAS: 105-36-2) 并将该混合物在 $80^{\circ}\text{C}$ 下搅拌16小时。加入水, 将该混合物用乙酸乙酯萃取, 将合并的有机层在无水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上干燥, 过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过在硅石上的柱层析(石油醚/乙酸乙酯)提纯并由甲基叔丁基醚和正己烷重结晶, 得到3.9g (7.8mmol, 34%) 所需产物5.7。

[1372]  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , ppm): 7.5 (t,  $J = 7.83\text{Hz}$ , 1H); 7.2 (d,  $J = 7.50\text{Hz}$ , 1H); 7.1-7.2 (m, 1H); 7.0 (t,  $J = 7.72\text{Hz}$ , 1H); 6.9 (d,  $J = 8.16\text{Hz}$ , 1H); 6.3 (s, 1H); 4.5 (s, 1H); 4.2 (q,  $J = 7.13\text{Hz}$ , 2H); 3.5 (s, 3H); 1.3 (t,  $J = 7.17\text{Hz}$ , 3H)。

[1373]  $[\text{M}+\text{H}] = 502.2$ ;  $\text{Rt} = 1.221\text{min}$

[1374] 实施例6.2: [[3-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧代-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]-2-吡啶基]氧基]丙酸乙酯

[1375]

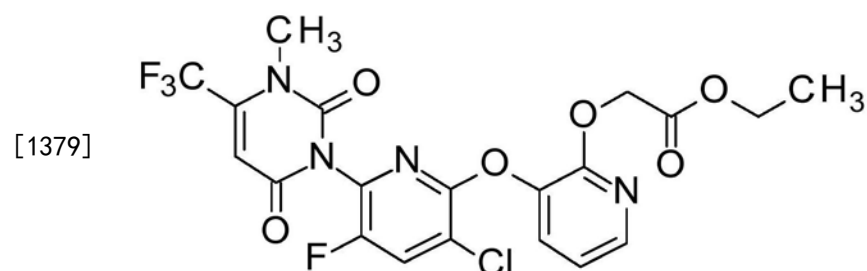


[1376] 在 $15^{\circ}\text{C}$ 下向0.22g (1.1mmol) 2-[(3-羟基-2-吡啶基)氧基]丙酸乙酯 (CAS: 353292-

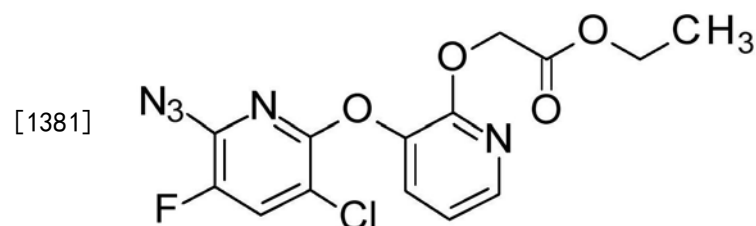
83-8) 在4mL DMSO中的溶液中加入0.042g (1.1mmol) NaH。将该悬浮液在该温度下搅拌10分钟,然后在15℃下将0.3g (0.88mmol) 3-(5-氯-3,6-二氟-2-吡啶基)-1-甲基-6-三氟甲基嘧啶-2,4-二酮加入该混合物中。将所得混合物在90-100℃下搅拌2小时,倾入水中并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过反相制备型HPLC(乙腈/含有三氟乙酸的水)提纯,得到0.17g (0.32mmol),36%所需产物。

[1377] <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm): 7.9 (d, J=4.52Hz, 1H); 7.8 (d, J=7.28Hz, 1H); 7.5 (d, J=7.53Hz, 1H); 6.9 (t, J=5.52Hz, 1H); 6.3 (d, J=3.26Hz, 1H); 5.0-5.1 (m, 1H); 4.2 (q, J=7.11Hz, 2H); 3.5 (d, J=4.27Hz, 3H); 1.4 (d, J=7.03Hz, 3H); 1.2 (t, J=7.15Hz, 3H)。

[1378] 实施例7:2-[3-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧化-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]-2-吡啶基]氧基]乙酸乙酯

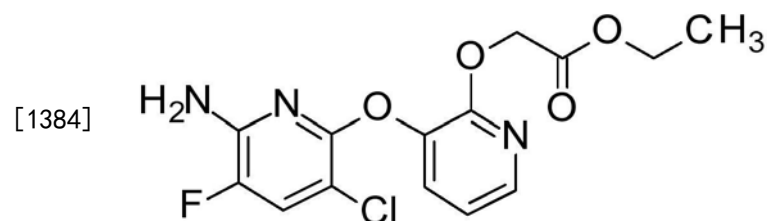


[1380] 实施例7.1:2-[3-[(6-叠氮基-3-氯-5-氟-2-吡啶基)氧基]-2-吡啶基]氧基]乙酸乙酯



[1382] 在室温下向1.8g (10.78mmol) 3-氯-2,5,6-三氟吡啶 (CAS 2879-42-7) 在20mL DMSO中的溶液中加入0.77g (11.8mmol) 叠氮化钠并将该混合物在室温下搅拌3小时。然后将2.2g (11.3mmol) 2-[(3-羟基-2-吡啶基)氧基]乙酸乙酯 (CAS:353292-81-6) 和7g (21.5mmol) Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>在10mL DMSO中的悬浮液分批加入上述混合物中。将所得混合物在室温下搅拌15小时,用水稀释并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物7.1不经进一步提纯用于下一步中。

[1383] 实施例7.2:2-[3-[(6-氨基-3-氯-5-氟-2-吡啶基)氧基]-2-吡啶基]氧基]乙酸乙酯



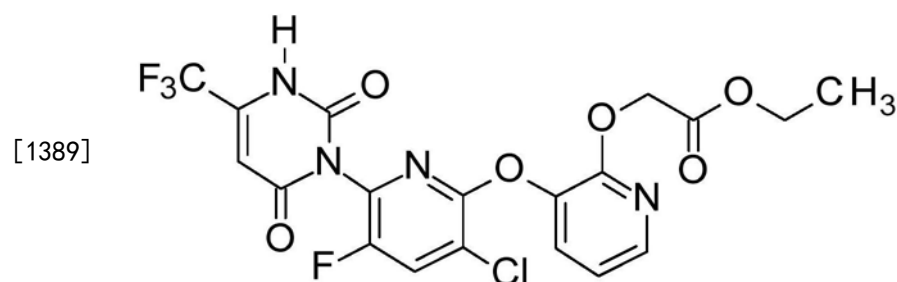
[1385] 在0℃下向4.8g (13mmol) 化合物7.1和4.3g (66mmol) 锌在100mL THF中的悬浮液中滴加50mL半饱和NH<sub>4</sub>Cl水溶液。将该混合物在室温下搅拌5小时,过滤并将滤饼用乙酸乙酯洗涤。向滤液中加入200mL水,将该混合物用乙酸乙酯萃取,将有机层在无水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上干燥,

过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过在硅石上的柱层析(石油醚/乙酸乙酯)提纯,得到2.7g(8mmol),61%)所需产物7.2。

[1386]  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , ppm): 7.9 (dd,  $J=4.89\text{Hz}$ ,  $J=1.51\text{Hz}$ , 1H); 7.4 (d,  $J=7.39\text{Hz}$ , 1H); 7.3 (d,  $J=9.06\text{Hz}$ , 1H); 6.9 (dd,  $J=7.65\text{Hz}$ ,  $J=4.89\text{Hz}$ , 1H); 4.9 (s, 2H); 4.5 (s, 2H); 4.2 (q,  $J=7.15\text{Hz}$ , 2H); 1.25 (t,  $J=7.15\text{Hz}$ , 3H)。

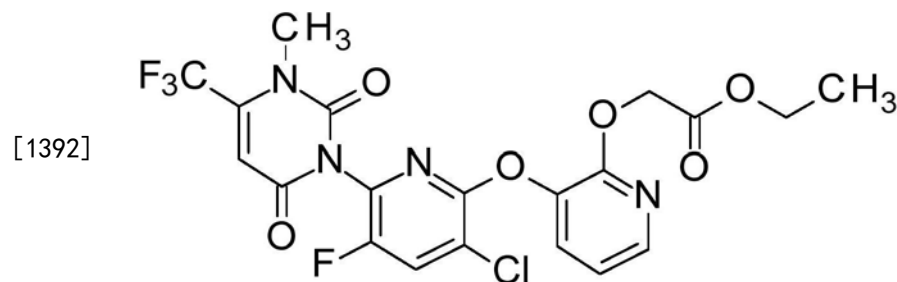
[1387]  $[\text{M}+\text{H}] = 428.1$ ;  $\text{Rt} = 1.332\text{min}$

[1388] 实施例7.3:2-[[3-[[3-氯-6-[2,4-二氧化-6-三氟甲基-1H-嘧啶-3-基]-5-氟-2-吡啶基]氧基]-2-吡啶基]氧基]乙酸乙酯



[1390] 在80℃下将16g(47mmol)化合物7.2和9.8g(47mmol)化合物5.2在430mL冰醋酸中的溶液搅拌16小时。然后加入9.8g(47mmol)化合物5.2并将该混合物在80℃下搅拌16小时。再次加入2.9g(14mmol)化合物5.2并将该混合物在80℃下搅拌16小时。再次加入9.8g(47mmol)化合物5.2并将该混合物在80℃下搅拌16小时。然后加入水,将该混合物用乙酸乙酯萃取,将合并的有机层用水和盐水洗涤,在无水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物7.3(23g,46mmol),97%)不经进一步提纯用于下一步中。

[1391] 实施例7.4:2-[[3-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧化-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]-2-吡啶基]氧基]乙酸乙酯



[1393] 在0℃下向23g(46mmol)粗化合物7.3在500mL DMF中的溶液中加入38g(275mmol)  $\text{K}_2\text{CO}_3$ ,然后加入26.6g(187mmol)甲基碘。将反应混合物在室温下搅拌16小时,然后再次加入38g(275mmol)  $\text{K}_2\text{CO}_3$ ,然后加入26.6g(187mmol)甲基碘并将该混合物再次在室温下搅拌48小时。将该混合物倾入水中,用乙酸乙酯萃取,将合并的有机层用水和盐水洗涤,在无水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上干燥,过滤并在减压下除去溶剂。粗产物通过反相制备型HPLC(乙腈/含有三氟乙酸的水)提纯,得到10.3g(19.9mmol),43%)所需产物2-[[3-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧化-4-三氟甲基嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]-2-吡啶基]氧基]乙酸乙酯。

[1394]  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , ppm): 7.96 (d,  $J=3.97\text{Hz}$ , 1H); 7.76 (d,  $J=7.50\text{Hz}$ , 1H); 7.49 (d,  $J=7.06\text{Hz}$ , 1H); 6.95 (dd,  $J=7.50\text{Hz}$ ,  $J=5.29\text{Hz}$ , 1H); 6.26 (s, 1H); 4.79 (s, 2H); 4.19 (q,  $J=7.06\text{Hz}$ , 2H); 3.48 (s, 3H); 1.24 (t,  $J=7.06\text{Hz}$ , 3H)。

[1395] [M+H]<sup>+</sup>=519.0;Rt=1.183min

[1396] 下面列于表4-9中的化合物可以类似于上面所述实施例制备。



[1398] 表4

序号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	R <sub>i</sub> [min]
8	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	OH	472	1.015
9	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>	486	1.11
10	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	500	1.197
11	CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OH	474	1.004
12	CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>3</sub>	488	1.167
13	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>	561	1.086
14	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>	575	1.094
15	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	CH <sub>3</sub> (S)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	532	1.306
16	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	CH <sub>3</sub> (R)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	532	1.306
17	CH <sub>3</sub>	H	F	CN	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	509	1.212
18	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	516	1.155
19	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	CH <sub>3</sub> (S)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	514	1.241
20	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	CH <sub>3</sub> (R)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	514	1.241
21	CH <sub>3</sub>	H	F	F	OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	532	1.214
22	CH <sub>3</sub>	H	F	F	CH <sub>3</sub> (S)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	516	1.241
23	CH <sub>3</sub>	H	F	F	CH <sub>3</sub> (R)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
24	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	532	1.266
25	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	536	1.287
26	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	536	1.242
27	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	F	F	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	554	1.239
28	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	SCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>		
29	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	SCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	550	1.248
30	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	548	1.195
31	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	590	1.324

[1399]

[1400]

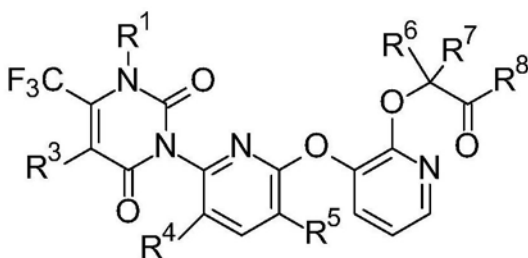
序号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	R <sub>i</sub> [min]
32	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>		
33	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	534	1.270
34	CH <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	544	1.199
35	CH <sub>3</sub>	H	F	Br	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	564	1.247
36	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	534	1.300
37	CH <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
38	CH <sub>3</sub>	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	511	1.165
39	CH <sub>3</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
40	CH <sub>3</sub>	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	481	1.068
41	NH <sub>2</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>		
42	NH <sub>2</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	519	1.172
43	CD <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	521	1.229
44	H	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	504	1.180
45	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>		
46	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	532	1.294
47	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>	504	1.186
48	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	SCH <sub>3</sub>	520	1.278
49	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> C≡CH	528	1.209
50	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	530	1.251
51	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	542	1.288
52	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	544	1.334
53	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	532	1.319
54	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	532	1.312
55	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>		
56	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	546	1.368
57	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	552	1.242
58	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CCl <sub>2</sub> H	588	1.326
59	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	554	1.226
60	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>		
61	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-c-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	544	1.335
62	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	558	1.370
63	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	572	1.418
64	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-苯基	566	1.339
65	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O(氧杂环丁烷-3-基)	546	1.179
66	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O(四氢吡喃-4-基)	574	1.234
67	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	544	1.283
68	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> -c-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	558	1.349
69	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> (苯基)	580	1.322
70	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> (咪喃-2-基)	570	1.290
71	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	548	1.187
72	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	562	1.234
73	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	576	1.277

[1401]

序号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	R <sub>t</sub> [min]
74	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	562	1.253
75	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	600*	1.216
76	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	628*	1.302
77	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	562	1.182
78	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	576	1.257
79	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	576	1.228
80	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	590	1.272
81	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>3</sub>	503	1.125
82	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	517	1.135
83	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHOH	505	0.996
84	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHOCH <sub>3</sub>	519	1.096
85	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	N(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	533	1.162
86	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>2</sub> C≡CH	527	1.153
87	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	589	1.159
88	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
89	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	596	1.165
90	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		

[1402] \* [M+Na]

[1403]



(I),

其中 R<sup>2</sup> 为 CF<sub>3</sub>, n 为 1, Q、W、X 和 Y 为 O 且 Z 为 Z<sup>7</sup>, 其中 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> 和 R<sup>c</sup> 为 H

[1404] 表5

[1405]

序号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	R <sub>t</sub> [min]
91	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H		OH	491	1.052
92	NH <sub>2</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>		
93	NH <sub>2</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	520	1.156
94	CD <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	522	1.215
95	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	543	1.215
96	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>		
97	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	533	1.269
98	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>		
99	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (CO)OCH <sub>3</sub>		
100	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	CH <sub>3</sub> (S)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
101	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	CH <sub>3</sub> (R)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
102	CH <sub>3</sub>	H	F	CN	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
103	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	CH <sub>3</sub> (S)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
104	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	CH <sub>3</sub> (R)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
105	CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	503	1.171

[1406]

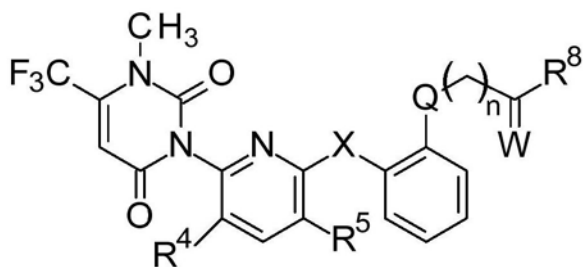
序号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	Rt[min]
106	CH <sub>3</sub>	H	F	F	CH <sub>3</sub> (S)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
107	CH <sub>3</sub>	H	F	F	CH <sub>3</sub> (R)	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
108	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>		
109	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
110	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>		
111	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	F	F	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
112	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	SCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>		
113	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	SCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
114	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>		
115	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
116	CH <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
117	CH <sub>3</sub>	H	F	Br	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
118	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
119	CH <sub>3</sub>	H	F	CF <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
120	CH <sub>3</sub>	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
121	CH <sub>3</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
122	CH <sub>3</sub>	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
123	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>	505	1.154
124	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	SCH <sub>3</sub>		
125	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> C≡CH	529	1.201
126	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	531	1.226
127	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>		
128	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	545	1.305
129	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	533	1.290
130	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	533	1.282
131	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>		
132	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	547	1.335
133	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl		
134	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CCl <sub>2</sub> H		
135	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	555	1.255
136	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>		
137	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-c-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>		
138	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>		
139	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	573	1.395
140	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O-苯基		
141	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O(氧杂环丁烷-3-基)	547	1.143
142	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	O(四氢吡喃-4-基)		
143	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	545	1.257
144	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> -c-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	559	1.359
145	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> (苯基)	581	1.330
146	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> (咪喃-2-基)		
147	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	549	1.174
148	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	563	1.228

序号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	Rt[min]
149	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	577	1.272
150	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	563	1.217
151	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	579	1.207
152	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	629*	1.305
153	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
154	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	577	1.223
155	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	577	1.220
156	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
157	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>3</sub>		
158	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
159	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHOH		
160	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHOCH <sub>3</sub>		
161	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	N(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>		
162	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>2</sub> C≡CH		
163	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
164	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	568	1.052
165	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHSO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	596	1.126
166	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
167	CH <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	H	NHSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		

[1407]

[1408] \* [M+Na]

[1409]



(I),  
其中 R<sup>1</sup> 为 CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> 为 CF<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>,  
R<sup>6</sup> 和 R<sup>7</sup> 为 H, Y 为 O 且 Z 为 Z<sup>1</sup>,  
其中 R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> 和 R<sup>d</sup> 为 H

[1410] 表6

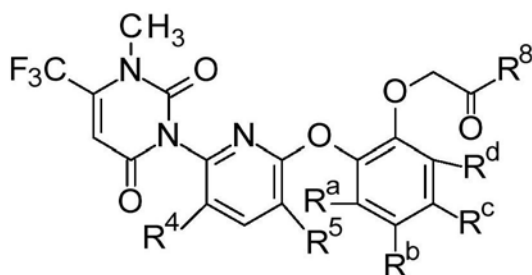
序号	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	n	X	Q	W	n	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	Rt[min]
168	H	Cl	1	S	O	O	1	OCH <sub>3</sub>		
169	H	Cl	1	S	O	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	516	1.222
170	F	F	1	S	O	O	1	OCH <sub>3</sub>		
171	F	F	1	S	O	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
172	F	Cl	1	S	O	O	1	OCH <sub>3</sub>		
173	F	Cl	1	S	O	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
174	F	Cl	1	O	O	S	1	OCH <sub>3</sub>		
175	F	Cl	1	O	O	S	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
176	F	Cl	1	O	NH	O	1	OCH <sub>3</sub>		
177	F	Cl	1	O	NH	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
178	F	Cl	1	O	NCH <sub>3</sub>	O	1	OCH <sub>3</sub>		
179	F	Cl	1	O	NCH <sub>3</sub>	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	531	1.280
180	F	Cl	1	O	S	O	1	OCH <sub>3</sub>		

[1411]

[1412]

181	F	Cl	1	O	S	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
182	F	Cl	1	O	SO	O	1	OCH <sub>3</sub>		
183	F	Cl	1	O	SO	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
184	F	Cl	1	O	SO <sub>2</sub>	O	1	OCH <sub>3</sub>		
185	F	Cl	1	O	SO <sub>2</sub>	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
186	F	Cl	1	O	CH <sub>2</sub>	O	1	OCH <sub>3</sub>	502	1.243
187	F	Cl	1	O	CH <sub>2</sub>	O	1	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
188	F	Cl	2	O	NH	O	2	OCH <sub>3</sub>		
189	F	Cl	2	O	NH	O	2	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
190	F	Cl	2	O	NCH <sub>3</sub>	O	2	OCH <sub>3</sub>		
191	F	Cl	2	O	NCH <sub>3</sub>	O	2	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
192	F	Cl	2	O	CH <sub>2</sub>	O	2	OCH <sub>3</sub>		
193	F	Cl	2	O	CH <sub>2</sub>	O	2	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
194	F	Cl	3	O	O	O	3	OCH <sub>3</sub>		
195	F	Cl	3	O	O	O	3	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	546	1.300

[1413]



(I),

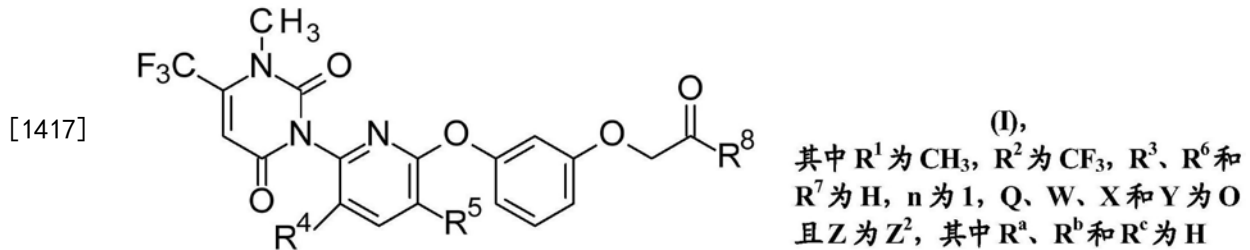
其中 R<sup>1</sup> 为 CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> 为 CF<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>, R<sup>6</sup> 和 R<sup>7</sup> 为 H, n 为 1, Q、W、X 和 Y 为 O 且 Z 为 Z<sup>1</sup>

[1414] 表7

[1415]

序号	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>a</sup>	R <sup>b</sup>	R <sup>c</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	Rt[min]
196	F	Cl	F	H	H	H	OCH <sub>3</sub>		
197	F	Cl	F	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	536	1.230
198	F	Cl	H	F	H	H	OCH <sub>3</sub>		
199	F	Cl	H	F	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	536	1.258
200	F	Cl	H	H	F	H	OCH <sub>3</sub>		
201	F	Cl	H	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	536	1.258
202	F	Cl	H	H	H	F	OCH <sub>3</sub>		
203	F	Cl	H	H	H	F	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	536	1.240
204	F	Cl	Cl	H	H	H	OCH <sub>3</sub>		
205	F	Cl	Cl	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
206	F	Cl	H	Cl	H	H	OCH <sub>3</sub>		
207	F	Cl	H	Cl	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	552	1.303
208	F	Cl	H	H	Cl	H	OCH <sub>3</sub>		
209	F	Cl	H	H	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
210	F	Cl	H	H	H	Cl	OCH <sub>3</sub>		
211	F	Cl	H	H	H	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
212	F	Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCH <sub>3</sub>		
213	F	Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		

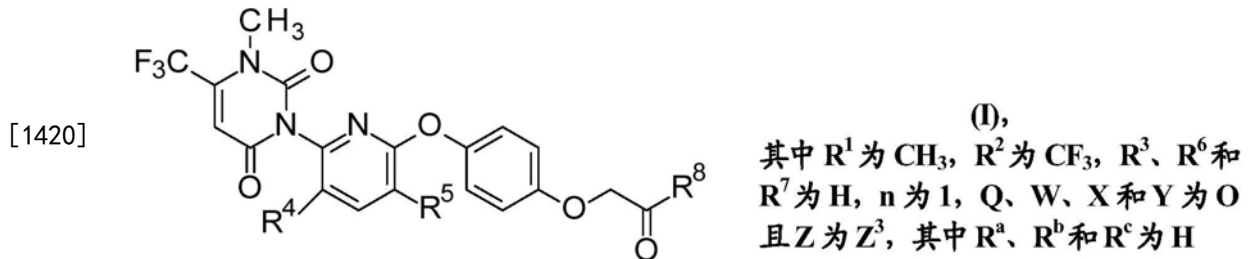
序号	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>a</sup>	R <sup>b</sup>	R <sup>c</sup>	R <sup>d</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	Rt[min]
214	F	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>3</sub>		
215	F	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
216	F	Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>		
217	F	Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
218	F	Cl	H	H	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>		
219	F	Cl	H	H	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
[1416] 220	F	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	OCH <sub>3</sub>		
221	F	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
222	F	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>3</sub>		
223	F	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
224	F	Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>		
225	F	Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	586	1.331
226	F	Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>		
227	F	Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		



[1418] 表8

[1419]

序号	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	Rt[min]
228	F	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	518	1.267



[1421] 表9

[1422]

序号	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>8</sup>	m/z[M+H]	Rt[min]
229	F	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	518	1.256

[1423] B应用实施例

[1424] 式(I)的尿嘧啶吡啶类的除草活性通过下列温室试验证实:

[1425] 所用培养容器为含有含约3.0%腐殖土的壤质砂作为底物的塑料花盆。对每一品种单独播种测试植物的种子。

[1426] 对于出苗前处理,直接在播种之后借助细分布喷嘴施用悬浮或乳化于水中的活性成分。温和灌溉容器以促进发芽和生长,然后用透明塑料罩覆盖,直到植物生根。该覆盖导致测试植物均匀发芽,除非这被活性成分损坏。

[1427] 对于出苗后处理,首先使测试植物生长到3-15cm的高度,这取决于植物习性,并仅

在此时用悬浮或乳化于水中的活性成分处理。为此,将测试植物直接播种并在相同容器中生长,或者首先使它们作为秧苗单独生长并在处理之前几天移植到测试容器中。

[1428] 取决于品种,分别将植物保持在10-25℃或20-35℃。

[1429] 测试期为2-4周。在此期间照料植物并评价它们对各处理的响应。

[1430] 使用0-100的评分进行评价。100表示没有植物出苗,或者至少地面上部分完全受损,而0表示没有损害,或者生长过程正常。对良好的除草活性给予至少70的分值,而对非常好的除草活性给予至少85的分值。

[1431] 温室试验中所用植物属于下列品种:

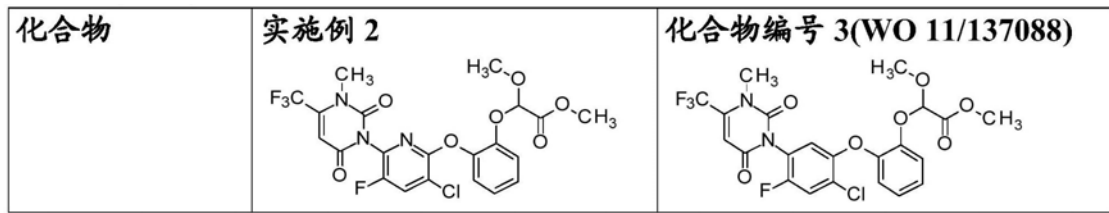
[1432]

Bayer代码	学名
ALOMY	大穗看麦娘 ( <i>Alopecurus myosuroides</i> )
AMARE	反枝苋
BRADC	俯仰臂形草 ( <i>Brachiaria decumbens</i> )
CHEAL	白藜 ( <i>Chenopodium album</i> )
ECHCG	稗草 ( <i>Echinochloa crus-galli</i> )
LOLMU	黑麦草 ( <i>Lolium multiflorum</i> )
MATCH	母菊 ( <i>Matricaria chamomilla</i> )
SETVI	狗尾草 ( <i>Setaria viridis</i> )
ZEAMX	玉米 ( <i>Zea mays</i> )

[1433] 在16g/ha的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物1、2、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、20、21、22、24、25、26、27、33、34、35、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、83、84、85、86、89、91、97、125、126、128、129、130、132、135、143、145、147、149、150、151、152、154、165、169、199、201、207、228和229对AMARE、CHEAL、ECHCG和SETVI显示出非常好的除草活性。

[1434] 在16g/ha的施用率下,通过出苗后方法施用的化合物18、82、87和155对AMARE、CHEAL和SETVI显示出非常好的除草活性。

[1435] 表10:本发明实施例2和由WO 11/137088已知的3号化合物的出苗后除草活性(温室)的对比



[1436]

施用率[g/ha]	8	8
不希望的植物		损害
ALOMY	70	40
LOLMU	70	40
MATCH	70	60

施用率[g/ha]	2	2
不希望的植物		损害
BRADC	80	20
农作物	25	40
ZEAMX		

施用率[g/ha]	1	1
不希望的植物		损害
CHEAL	90	45

[1437] 数据清楚地表明本发明式I化合物相较于由现有技术已知的化合物的优异除草活性。

[1438] 中央苯基环被吡啶环替代不仅导致比由WO 11/137088已知的化合物实现的好得多的除草活性,而且导致好得多的作物相容性。

[1439] 式(I)化合物对耐受性杂草的控制由下列温室试验证实:

[1440] 所用培养容器为含有含约3.0%腐殖土的壤质砂作为底物的塑料花盆。对每一品种和/或耐受性生物型单独播种测试植物的种子。对于出苗前处理,直接在播种之后借助细分布喷嘴施用悬浮或乳化于水中的活性成分。温和灌溉容器以促进发芽和生长,然后用透明塑料罩覆盖,直到植物生根。该覆盖导致测试植物均匀发芽,除非这被活性成分损坏。对于出苗后处理,首先使测试植物生长到3-15cm的高度,这取决于植物习性,并仅在此时用悬浮或乳化于水中的活性成分处理。为此,将测试植物直接播种并在相同容器中生长,或者首先使它们作为秧苗单独生长并在处理之前几天移植到测试容器中。取决于品种,分别将植物保持在10-25℃或20-35℃。测试期为2-4周。在此期间照料植物并评价它们对各处理的响应。使用0-100的评分进行评价。100表示没有植物出苗,或者至少地面上部分完全受损,而0表示没有损害,或者生长过程正常。

[1441] 温室试验中所用植物属于下列品种和生物型:

[1442]

杂草编号	Bayer 代码	学名	通用名	生物型
w.1	AMATA	<i>Amaranthus tamariscinus</i>	普通水麻	敏感性
w.2	AMATA	<i>Amaranthus tamariscinus</i>	普通水麻	显示出含有 ΔG210 突变的 PPO 耐受性生物型 1
w.3	AMATA	<i>Amaranthus tamariscinus</i>	普通水麻	显示出含有 ΔG210 突变的 PPO 耐受性生物型 2

[1443] 下表所示结果表明化合物7和化合物1对含有  $\Delta$  G210突变的敏感性(w.1)和耐受性杂草(w.2,w.3)均具有非常好的活性,而已知的PPO抑制剂唑啶炔草与敏感性生物型相比对耐受性生物型显示出弱得多的控制。

[1444]

除草剂化合物	使用率	杂草控制(%)		
		w.1	w.2	w.3
1	4g/ha	100	100	100
1	2g/ha	88	87	98
7	4g/ha	100	100	100
7	2g/ha	93	100	100
唑啶炔草	4g/ha	100	78	77
唑啶炔草	2g/ha	88	62	77

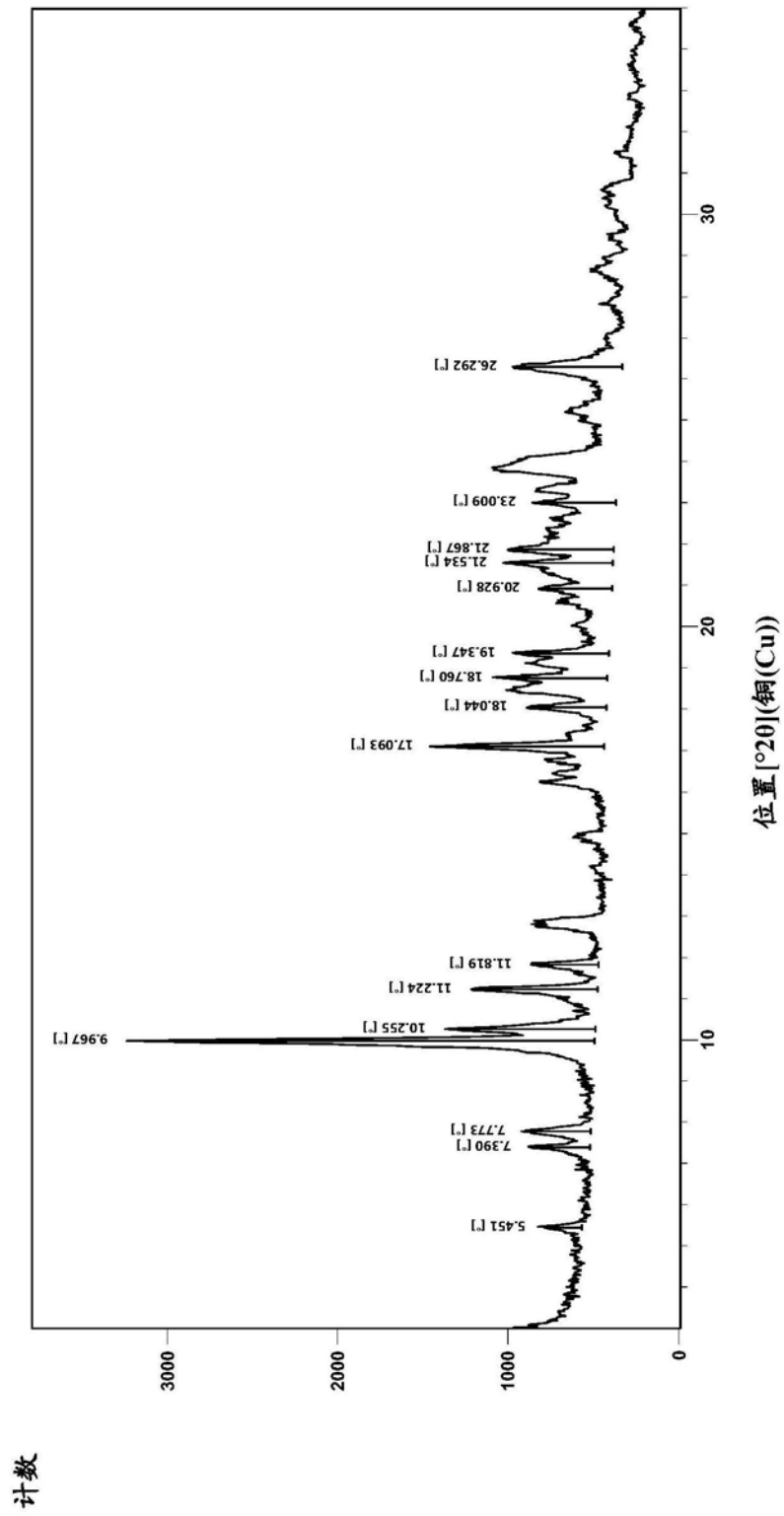


图1