



## (12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 112996780 B

(45) 授权公告日 2024.11.08

(21) 申请号 201980072361.8

(74) 专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所

(22) 申请日 2019.11.01

有限公司 11038

(65) 同一申请的已公布的文献号

专利代理人 徐达

申请公布号 CN 112996780 A

(51) Int.Cl.

(43) 申请公布日 2021.06.18

C07D 401/12 (2006.01)

(30) 优先权数据

A01N 43/42 (2006.01)

1818013.3 2018.11.05 GB

A01N 43/80 (2006.01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

A01N 43/82 (2006.01)

2021.04.30

C07D 405/12 (2006.01)

(86) PCT国际申请的申请数据

C07D 409/12 (2006.01)

PCT/EP2019/079971 2019.11.01

C07D 413/12 (2006.01)

(87) PCT国际申请的公布数据

C07D 417/12 (2006.01)

W02020/094524 EN 2020.05.14

(56) 对比文件

(73) 专利权人 先正达农作物保护股份公司

Yimin Wu等. Rhodium-catalyzed ortho-heteroarylation of phenols: directing group-enabled switching of the electronic bias for heteroaromatic coupling partner. Chemical Science. 2018, 第9卷(第33期), 第6878-6882页, 尤其是第6880页Scheme 1.

地址 瑞士巴塞尔

RN:303148-24-5, 1211770-65-8. STN

(72) 发明人 J·S·韦尔斯 J·布莱克

REGISTRY DATABASE. 2010,

J·A·莫里斯 E·布里吉斯  
J·A·塔特 M·B·阿斯皮诺  
S·恩济

审查员 薛文君

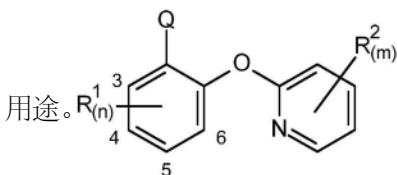
权利要求书2页 说明书55页

(54) 发明名称

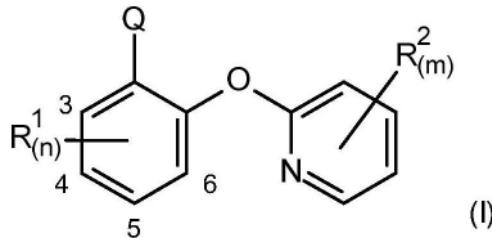
除草化合物

(57) 摘要

本发明涉及具有式(I)的化合物或所述化合物的农艺学上可接受的盐, 其中Q、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、n和m是如本文所定义的。本发明进一步涉及包含具有式(I)的化合物的除草组合物, 以及具有式(I)的化合物用于特别是在有用植物作物中控制杂草的



## 1. 一种具有式(I)的化合物:



或其农艺学上可接受的盐，

其中

Q是5元芳香族杂环，其任选地被1或2个独立地选自由以下组成的组的R<sup>3</sup>取代基取代：  
 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、环丙基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基、 $C_1-C_2$ 烷氧基-、 $C_1-C_2$ 卤代烷氧基-、  
 卤素、-C(O)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、NO<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CN、-CN以及-S(O)<sub>p</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

每个R<sup>1</sup>独立地选自由以下组成的组：卤素、-CN、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、  
 $C_1-C_4$ 卤代烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基-、 $C_1-C_4$ 卤代烷氧基-以及-S(O)<sub>p</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

每个R<sup>2</sup>独立地选自由以下组成的组：卤素、-CN、NO<sub>2</sub>、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基、 $C_3-C_6$ 环  
 烷基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、-S(O)<sub>p</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、-C(O)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷  
 基以及 $C_1-C_4$ 卤代烷氧基；

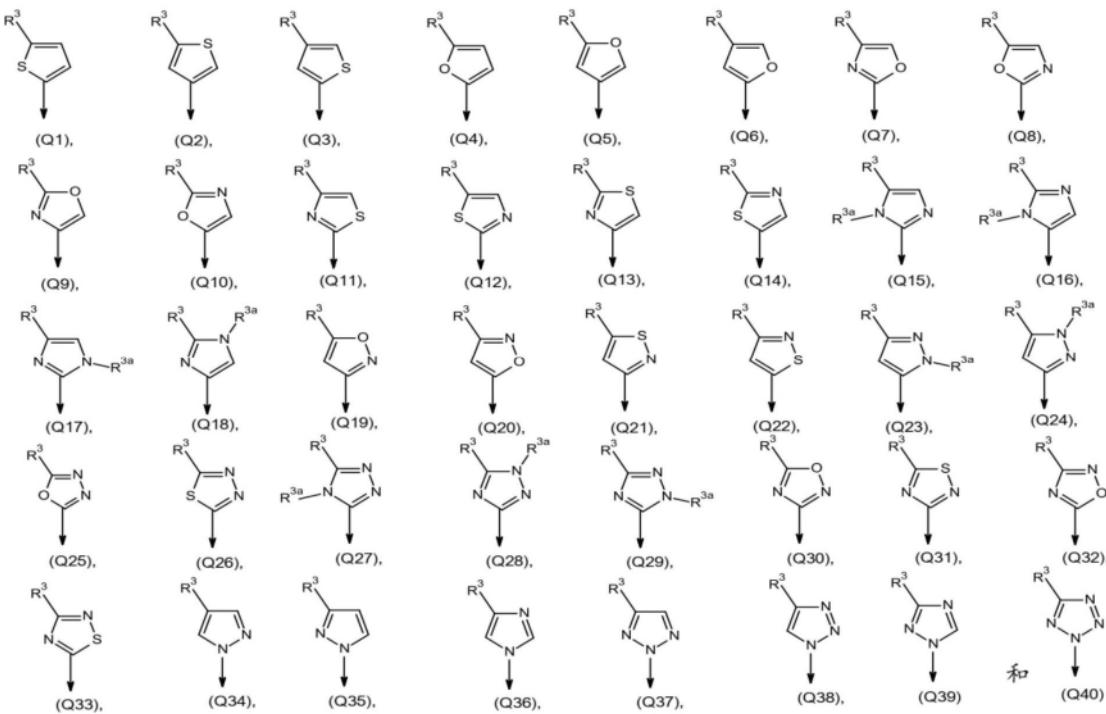
m=0、1或2；

n=0、1或2；并且

p=0、1或2；

其前提是Q不是1,3,4-噁二唑-2-基或C-连接的四唑基，并且其中如果Q是2-噻吩基或  
 2-呋喃基，则所述2-噻吩基或2-呋喃基被1或2个独立地选自由 $C_1-C_2$ 卤代烷基、  
 卤素和-CN组成的组的R<sup>3</sup>取代。

## 2. 根据权利要求1所述的具有式(I)的化合物，其中，Q选自由以下组成的组：



其中R<sup>3</sup>选自由以下组成的组:氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、环丙基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷氧基-、卤素、-C(0)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、NO<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CN、-CN以及-S(0)<sub>p</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基;并且

R<sup>3a</sup>是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基

其前提是Q不是1,3,4-噁二唑-2-基或C-连接的四唑基,并且其中如果Q是2-噻吩基或2-呋喃基,则所述2-噻吩基或2-呋喃基被1或2个独立地选自由C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷基、卤素和-CN组成的组的R<sup>3</sup>取代。

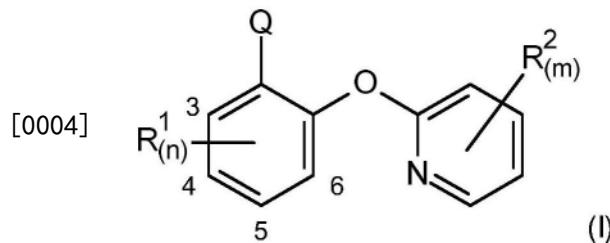
3. 根据权利要求2所述的具有式(I)的化合物,其中,Q选自由Q19、Q20和Q34组成的组。
4. 根据权利要求2所述的具有式(I)的化合物,其中,Q是Q20。
5. 根据权利要求1所述的化合物,其中,n是1并且R<sup>1</sup>是氟。
6. 根据权利要求5所述的化合物,其中,R<sup>1</sup>是3-氟。
7. 根据权利要求1所述的化合物,其中,m是1或2,并且R<sup>2</sup>独立地选自由以下组成的组:氟、硝基、氰基和三氟甲基。
8. 根据权利要求1所述的化合物,其中,R<sup>3</sup>是二氟甲基或三氟甲基。
9. 一种除草组合物,其包含根据权利要求1所述的化合物和农业上可接受的配制辅助剂。
10. 根据权利要求9所述的除草组合物,其进一步包含至少一种另外的杀有害生物剂。
11. 根据权利要求10所述的除草组合物,其中,所述另外的杀有害生物剂是除草剂或除草剂安全剂。
12. 一种在场所处控制杂草的方法,所述方法包括向所述场所施用控制杂草量的根据权利要求9至11中任一项所述的组合物。
13. 根据权利要求1所述的具有式(I)的化合物作为除草剂的用途。

## 除草化合物

[0001] 本发明涉及新颖的除草化合物、其制备方法、包含所述新颖的化合物的除草组合物、以及其用于特别是在有用植物作物中控制杂草的用途或用于抑制植物生长的用途。

[0002] 除草杂芳基取代的苯氧基嘧啶例如披露于W094/17059、W02015/089003和W02015/108779中。本发明涉及新颖的除草苯氧基吡啶化合物，其与已知的嘧啶化合物相比示出改善的特性-尤其是改善的作物选择性。

[0003] 因此，根据本发明，提供了具有式(I)的化合物：



[0005] 或其农艺学上可接受的盐，

[0006] 其中

[0007] Q是5元芳香族杂环，其任选地被1或2个独立地选自由以下组成的组的R<sup>3</sup>取代基取代：C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、环丙基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷氧基-、卤素、-C(O)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、NO<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CN、-CN以及-S(O)<sub>p</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

[0008] 每个R<sup>1</sup>独立地选自由以下组成的组：卤素、-CN、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基-以及-S(O)<sub>p</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

[0009] 每个R<sup>2</sup>独立地选自由以下组成的组：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>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、-S(O)<sub>p</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-、-C(O)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基以及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基；

[0010] m=0、1或2；

[0011] n=0、1或2；并且

[0012] p=0、1或2

[0013] 其前提是Q不是1,3,4-噁二唑-2-基或C-连接的四唑基，并且其中如果Q是2-噻吩基或2-呋喃基，则所述2-噻吩基或2-呋喃基被1或2个独立地选自由C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷基、卤素和-CN组成的组的R<sup>3</sup>取代。

[0014] C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-包括例如甲基(Me,CH<sub>3</sub>)、乙基(Et,C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)、正丙基(n-Pr)、异丙基(i-Pr)、正丁基(n-Bu)、异丁基(i-Bu)、仲丁基和叔丁基(t-Bu)。C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基是甲基(Me,CH<sub>3</sub>)或乙基(Et,C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)。

[0015] 卤素(或卤代)包括例如氟、氯、溴或碘。所述卤素(或卤代)对应地应用于其他定义背景下的卤素，如卤代烷基。

[0016] C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基-包括例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟丙基和2,2,2-三氯乙基、七氟正丙基和全氟正己基。C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷基是例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟

乙基、或1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基。

[0017]  $C_1-C_2$ 烷氧基是甲氧基或乙氧基。

[0018]  $C_1-C_2$ 卤代烷氧基-包括例如氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2,2-二氟乙氧基或2,2,2-三氯乙氧基，优选二氟甲氧基、2-氯乙氧基或三氟甲氧基。

[0019]  $C_3-C_6$ 环烷基-包括环丙基( $c$ -丙基( $c$ -Pr))、环丁基( $c$ -丁基( $c$ -Bu))、环戊基( $c$ -戊基)和环己基( $c$ -己基)。

[0020]  $C_2-C_4$ 烯基-包括例如 $-CH=CH_2$ (乙烯基)和 $-CH_2-CH=CH_2$ (烯丙基)。

[0021]  $C_2-C_4$ 炔基-包括例如 $-C\equiv CH$ (乙炔基)和 $-CH_2-C\equiv CH$ (炔丙基)。

[0022]  $C_1-C_4$ 烷基-S- (烷硫基)包括例如甲硫基、乙硫基、丙硫基、异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基，优选甲硫基或乙硫基。

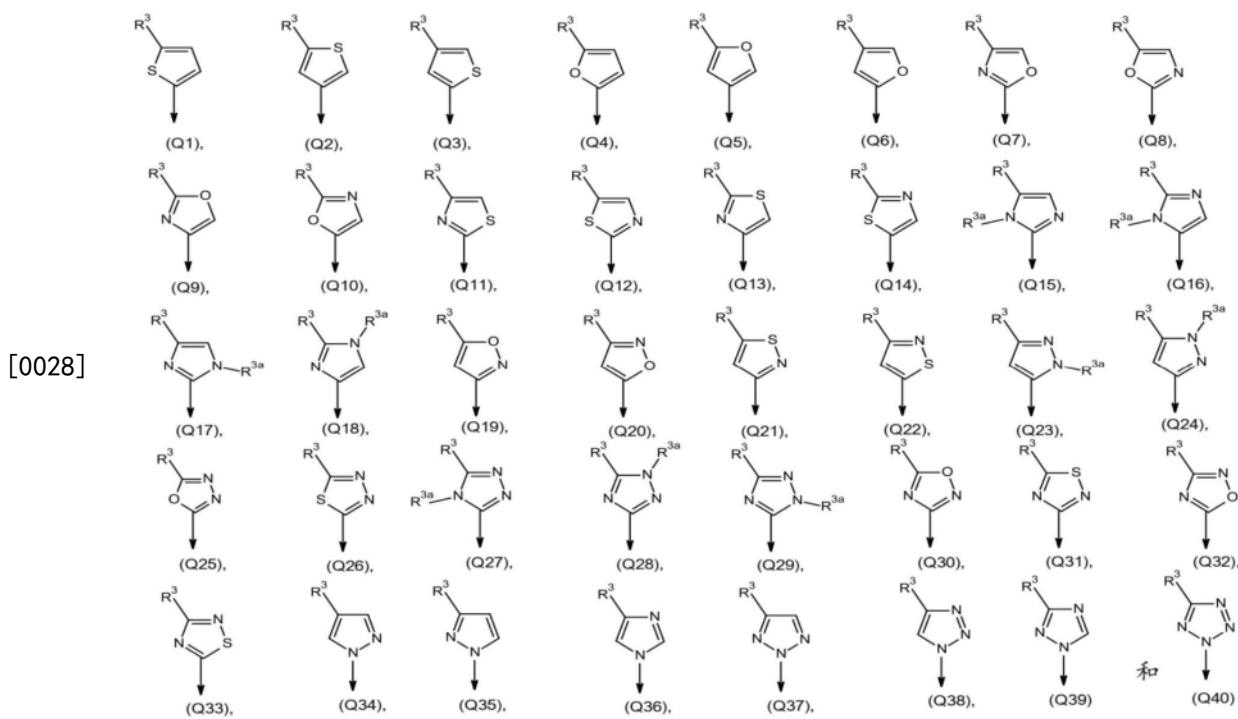
[0023]  $C_1-C_4$ 烷基-S(0)- (烷基亚磺酰基)包括例如甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、丙基亚磺酰基、异丙基亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、异丁基亚磺酰基、仲丁基亚磺酰基或叔丁基亚磺酰基，优选甲基亚磺酰基或乙基亚磺酰基。

[0024]  $C_1-C_4$ 烷基-S(0)<sub>2</sub>- (烷基磺酰基)包括例如甲基磺酰基、乙基磺酰基、丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、异丁基磺酰基、仲丁基磺酰基或叔丁基磺酰基，优选甲基磺酰基或乙基磺酰基。

[0025] 在本发明的一个实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中n是0。在本发明的另一实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中n是1或2，并且每个R<sup>1</sup>独立地选自由以下组成的组：卤素、-CN、硝基、 $C_1-C_2$ 烷基、 $C_1-C_2$ 卤代烷基、 $C_1-C_2$ 烷氧基以及 $C_1-C_2$ 卤代烷氧基-。在本发明的优选实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中n是1，并且R<sup>1</sup>是卤素(尤其是氟、氯或溴)或CN。在本发明的尤其优选的实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中n是1，并且R<sup>1</sup>是氟、尤其是3-氟。

[0026] 在本发明的另一实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中m=0。在本发明的另一实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中m是1或2。在本发明的优选实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中m是1或2，并且每个R<sup>2</sup>独立地选自由以下组成的组：卤素(尤其是氟、氯或溴)、硝基、-CN以及 $C_1-C_4$ 卤代烷基(尤其是三氟甲基)。在本发明的特别优选的实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中m是1或2，并且每个R<sup>2</sup>独立地选自由以下组成的组：氟、氯、溴、硝基、-CN以及三氟甲基。

[0027] 在本发明的另一实施例中，提供了具有式(I)的化合物，其中Q选自由以下组成的组：



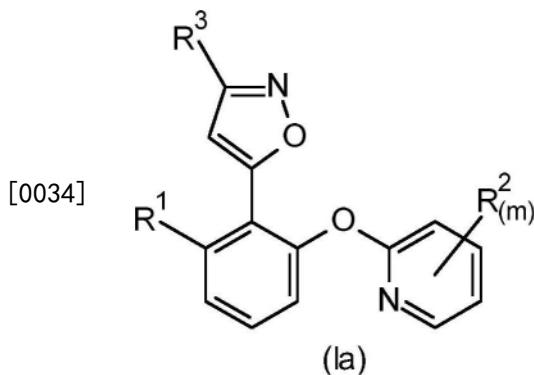
[0029] 其中R<sup>3</sup>选自由以下组成的组:氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、环丙基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基-、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷氧基-、卤素、-C(O)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、NO<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CN、-CN以及-S(O)<sub>p</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基;并且

[0030] R<sup>3a</sup>是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基。

[0031] 在本发明的优选实施例中,Q是Q19、Q20或Q34。

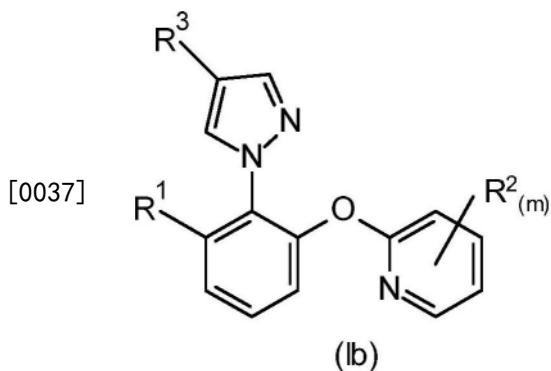
[0032] 在本发明的另一实施例中,提供了具有式(I)的化合物,其中R<sup>3</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>卤代烷基。在更优选实施例中,R<sup>3</sup>是二氟甲基或三氟甲基。

[0033] 因此,在本发明的优选实施例中,具有式(I)的化合物是具有式(Ia)的化合物:



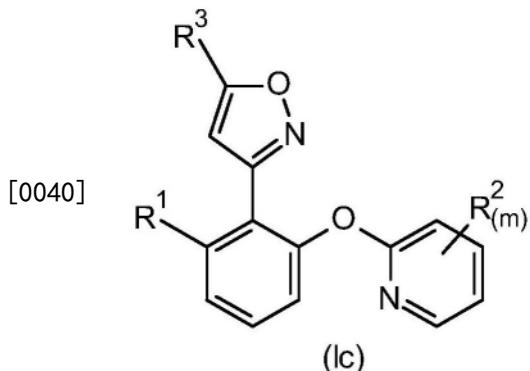
[0035] 其中R<sup>1</sup>是氢、氟、氯、溴或CN,并且R<sup>2</sup>、m和R<sup>3</sup>是如前所定义的。

[0036] 在本发明的另一优选实施例中,具有式(I)的化合物是具有式(Ib)的化合物:



[0038] 其中R<sup>1</sup>是氢、氟、氯、溴或CN,并且R<sup>2</sup>、m和R<sup>3</sup>是如前所定义的。

[0039] 在本发明的另一优选实施例中，具有式(I)的化合物是具有式(Ic)的化合物：



[0041] 其中R<sup>1</sup>是氢、氟、氯、溴或CN,并且R<sup>2</sup>、m和R<sup>3</sup>是如前所定义的。

[0042] 具有式(I)的化合物可以含有不对称中心并且可以作为单一对映异构体、以任何比例的对映异构体对而存在,或在存在多于一个不对称中心的情况下,含有所有可能比率的非对映异构体。典型地,与其他可能性相比,这些对映异构体之一具有增强的生物活性。

[0043] 本发明还提供了具有式(I)的化合物的农业上可接受的盐。优选具有式(I)的化合物可与以下项形成的盐:胺包括伯、仲和叔胺(例如氨、二甲胺和三乙胺),碱金属碱和碱土金属碱,过渡金属碱或季铵碱。

[0044] 根据本发明的具有式(I)的化合物可以自身被用作除草剂,但是通常使用配制辅助剂(如载体、溶剂和表面活性剂(SAA))将它们配制成除草组合物。因此,本发明进一步提供了一种除草组合物,所述除草组合物包含根据前述权利要求中任一项所述的除草化合物和农业上可接受的配制辅助剂。组合物可以呈浓缩物的形式,在使用前稀释这些浓缩物,尽管也可以制成即用型组合物。通常用水进行最终稀释,但是可以替代水或除了水之外使用例如液体肥料、微量营养素、生物有机体、油或溶剂。

[0045] 除草组合物总体上包含按重量计从0.1%至99%、尤其是按重量计从0.1%至95%的具有式I的化合物和按重量计从1%至99.9%的配制辅助剂,所述配制辅助剂优选地包括按重量计从0至25%的表面活性物质。

[0046] 组合物可以选自许多配制品类型。这些包括乳液浓缩物(EC)、悬浮液浓缩物(SC)、悬乳液(SE)、胶囊悬浮液(CS)、水可分散性颗粒剂(WG)、可乳化性颗粒剂(EG)、油包水型乳液(E0)、水包油型乳液(EW)、微乳液(ME)、油分散体(OD)、油悬剂(OF)、油溶性液剂(OL)、可溶性浓缩物(SL)、超低容量悬浮液(SU)、超低容量液剂(UL)、母药(TK)、可分散性浓缩物(DC)、可溶性粉剂(SP)、可湿性粉剂(WP)以及可溶性颗粒剂(SG)。在任何情况下,所选择的

配制品类型将取决于所设想的具体目的以及具有式(I)的化合物的物理、化学和生物特性。

[0047] 可溶性粉剂(SP)可以通过以下方式制备:将具有式(I)的化合物与一种或多种水溶性无机盐(如碳酸氢钠、碳酸钠或硫酸镁)或一种或多种水溶性有机固体(如多糖)以及任选地一种或多种湿润剂、一种或多种分散剂或所述试剂的混合物进行混合,以改进水分散性/水溶性。然后将混合物研磨成细粉末。也可以将类似的组合物颗粒化以形成水溶性颗粒剂(SG)。

[0048] 可湿性粉剂(WP)可以通过将具有式(I)的化合物与一种或多种固体稀释剂或载体、一种或多种湿润剂以及优选地,一种或多种分散剂,以及任选地,一种或多种悬浮剂混合来制备以促进在液体中的分散。然后将混合物研磨成细粉末。也可以将类似的组合物颗粒化以形成水可分散性颗粒剂(WG)。

[0049] 可以这样形成颗粒剂(GR):通过将具有式(I)的化合物与一种或多种粉状固体稀释剂或载体的混合物颗粒化形成,或者通过将具有式(I)的化合物(或其在合适的试剂中的溶液)吸收进多孔颗粒材料(如浮石、凹凸棒石粘土、漂白土、硅藻土(kieselguhr)、硅藻土(diatomaceous earths)或玉米芯粉),或通过将具有式(I)的化合物(或其在合适的试剂中的溶液)吸附到硬芯材料(如沙、硅酸盐、矿物碳酸盐、硫酸盐或磷酸盐)上并且如果必要的话,进行干燥来由预成型的空白颗粒形成。通常用于帮助吸收或吸附的试剂包括溶剂(如脂肪族和芳香族石油溶剂、醇、醚、酮以及酯)和粘着剂(如聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、糊精、糖以及植物油)。一种或多种其他添加剂也可以包含在颗粒剂(例如乳化剂、湿润剂或分散剂)中。

[0050] 可分散的浓缩物(DC)可以通过将具有式(I)的化合物溶于水或有机溶剂(如酮、醇或乙二醇醚)中来制备。这些溶液可以含有表面活性剂(例如以改善水稀释或防止喷雾罐中的结晶)。

[0051] 可乳化性浓缩物(EC)或水包油乳液(EW)可以通过将具有式(I)的化合物溶于有机溶剂(任选地含有一种或多种湿润剂、一种或多种乳化剂或者所述试剂的混合物)中来制备。在EC中使用的合适的有机溶剂包括芳香族烃(如烷基苯或烷基萘,例如SOLVESSO 100、SOLVESSO 150和SOLVESSO 200;SOLVESSO是注册商标)、酮(如环己酮或甲基环己酮)和醇(如苯甲醇、糠醇或丁醇)、N-烷基吡咯烷酮(如N-甲基吡咯烷酮或N-辛基吡咯烷酮)、脂肪酸的二甲基酰胺(如C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>脂肪酸二甲基酰胺)和氯化烃。EC产品可以在添加到水中时自发地乳化,从而产生具有足够稳定性的乳液,以允许通过适当设备进行喷洒施用。

[0052] EW的制备涉及获得作为一种液体(如果它在室温下不是液体,则它可以在典型地低于70°C的合理温度下熔化)或处于溶液中(通过将它溶于适当的溶剂中)的具有式(I)的化合物,然后在高剪切下将所得液体或溶液乳化进含有一种或多种SAA的水中,以产生乳液。在EW中使用的合适的溶剂包括植物油、氯化烃(如氯苯)、芳香族溶剂(如烷基苯或烷基萘)以及在水中具有低溶解度的其他适当的有机溶剂。

[0053] 微乳液(ME)可以通过将水与一种或多种溶剂和一种或多种SAA的共混物混合来制备,以自发地产生热力学稳定的各向同性的液体配制品。具有式(I)的化合物最初就存在于水中或溶剂/SAA共混物中。在ME中使用的合适的溶剂包括此前描述的在EC或EW中使用的那些。ME可以是水包油体系或油包水体系(存在哪种体系可以通过传导率测量来测定)并且可以适用于在同一配制品中混合水溶性的和油溶性的杀有害生物剂。ME适用于稀释到水中,

保持为微乳液或形成常规的水包油乳液。

[0054] 悬浮浓缩物 (SC) 可以包括具有式 (I) 的化合物的精细分散的不溶固体颗粒的水性或非水性悬浮液。SC 可以通过将具有式 (I) 的固体化合物任选地与一种或多种分散剂在合适的介质中球磨或珠磨来制备, 以产生该化合物的细颗粒悬浮液。在组合物中可以包含一种或多种湿润剂, 并且可以包含悬浮剂以降低颗粒沉降的速率。可替代地, 可以干磨具有式 (I) 的化合物并且将其添加到含有此前描述的试剂的水中, 以产生希望的终产物。

[0055] 气溶胶配制品包含具有式 (I) 的化合物和合适的推进剂 (例如正丁烷)。还可将具有式 (I) 的化合物溶于或分散于合适的介质 (例如水或可与水混溶的液体, 如正丙醇) 中以提供在不加压的手动喷雾泵中使用的组合物。

[0056] 胶囊悬浮液 (CS) 可以通过以与制备 EW 配制品类似的方式来制备, 但具有另外的聚合阶段, 这样使得获得油滴的水性分散体, 其中每个油滴都被聚合物壳所包裹并且含有具有式 (I) 的化合物以及任选地用于该油滴的载体或稀释剂。聚合物壳可以通过界面缩聚反应或通过凝聚程序产生。这些组合物可以提供具有式 (I) 的化合物的受控释放并且它们可以用于种子处理。具有式 (I) 的化合物还可以配制在生物可降解的聚合物基质中以提供该化合物的缓慢的、受控的释放。

[0057] 组合物可以包含一或多种添加剂以改善该组合物的生物学性能, 例如通过改善在表面上的湿润性、保持力或分布; 被处理表面上的抗雨水性; 或具有式 (I) 的化合物的吸收或流动。此类添加剂包括表面活性剂 (SAA)、基于油的喷洒添加剂, 例如某些矿物油或天然植物油 (如大豆和油菜籽油), 改性的植物油 (如甲基化油菜籽油 (MRSO)) 以及这些与其他生物增强佐剂 (可帮助或改变具有式 (I) 的化合物的作用的成分) 的掺合物。

[0058] 湿润剂、分散剂和乳化剂可以是阳离子类型、阴离子类型、两性类型或非离子类型的 SAA。

[0059] 合适的阳离子类型的 SAA 包括季铵化合物 (例如鲸蜡三甲基溴化铵)、咪唑啉以及胺盐。

[0060] 合适的阴离子 SAA 包括脂肪酸的碱金属盐、脂肪族硫酸单酯的盐 (例如月桂硫酸钠)、磺化的芳香族化合物的盐 (例如十二烷基苯磺酸钠、十二烷基苯磺酸钙、丁基萘磺酸盐以及二-异丙基-萘磺酸钠和三-异丙基-萘磺酸钠的混合物)、醚硫酸盐、醇醚硫酸盐 (例如月桂醇聚醚-3-硫酸钠)、醚羧酸盐 (例如月桂醇聚醚-3-羧酸钠)、磷酸酯 (来自一种或多种脂肪醇与磷酸 (主要是单酯) 或与五氧化二磷 (主要是二酯) 之间反应的产物, 例如月桂醇与四磷酸之间的反应; 另外这些产物可以被乙氧基化)、硫代琥珀酰胺盐、石蜡或烯烃磺酸盐、牛磺酸盐、木质磺酸盐以及三苯乙烯基苯酚的磷酸盐/硫酸盐。

[0061] 合适的两性类型的 SAA 包括甜菜碱、丙酸盐和甘氨酸盐。

[0062] 合适的非离子类型的 SAA 包括环氧烷 (如环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或其混合物) 与脂肪醇 (如油醇或鲸蜡醇) 或与烷基酚 (如辛基酚、壬基酚或辛基甲酚) 的缩合产物; 衍生自长链脂肪酸或己糖醇酐的偏酯; 所述偏酯与环氧乙烷的缩合产物; 嵌段聚合物 (包含环氧乙烷和环氧丙烷); 烷醇酰胺; 单酯 (例如脂肪酸聚乙二醇酯); 胺氧化物 (例如月桂基二甲基氧化胺); 卵磷脂和脱水山梨糖醇及其酯, 烷基多糖苷和三苯乙烯基酚。

[0063] 合适的悬浮剂包括亲水性胶体 (如多糖、聚乙烯吡咯烷酮或羧甲基纤维素钠) 和膨胀性粘土 (如膨润土或凹凸棒石)。

[0064] 本发明的除草化合物还可以在具有一种或多种另外的除草剂和/或植物生长调节剂的混合物中使用。此类另外的除草剂或植物生长调节剂的实例包括乙草胺、三氟羧草醚(包括三氟羧草醚-钠)、苯草醚、莠灭净、氨唑草酮、氯氨吡啶酸、杀草强、莠去津、苄嘧磺隆(包括苄嘧磺隆-甲基)、灭草松、二环吡喃酮、双丙氨膦、双草醚-钠、比克罗腙(bixlozone)、除草定、溴苯腈、丁草胺、氟丙嘧草酯、唑草酮(包括唑草酮-乙基)、氯酯磺草胺(包括氯酯磺草胺-甲基)、氯嘧磺隆(包括氯嘧磺隆-乙基)、绿麦隆、氯磺隆、环庚草醚、氯酰草膦(clacyfos)、烯草酮、炔草酸(包括炔草酯)、异噁草酮、二氯吡啶酸、环吡拉尼(cyclopyranil)、环吡瑞莫(cyclopyrimorate)、环丙嘧磺隆、氰氟草酯(包括氰氟草酯-丁基)、2,4-D(包括其胆碱盐和2-乙基己基酯)、2,4-DB、敌菜安、麦草畏(包括其铝、氨基丙基、双-氨基丙基甲基、胆碱、二氯丙、二甘醇胺、二甲胺、二甲基铵、钾盐和钠盐)、双氯磺草胺、吡氟酰草胺、氟吡草腙、二甲草胺、精二甲吩草胺、二溴敌草快、敌草隆、乙丁烯氟灵、乙氧呋草黄、噁唑禾草灵(包括精噁唑禾草灵-乙基)、苯磺噁唑草(fenoxy sulfone)、芬奎崔顿(fenquinotriione)、四噁酰草胺、啶嘧磺隆、双氟磺草胺、氯氟吡啶酯(florpyrauxifen)(包括氯氟吡啶酯-苄基)、吡氟禾草灵(包括精吡氟禾草灵-丁基)、氟酮磺隆(包括氟酮磺隆-钠)、氟噻草胺、唑嘧磺草胺、丙炔氟草胺、氟啶嘧磺隆(包括氟啶嘧磺隆-甲基-钠)、氟草烟(包括氯氟吡氧乙酸(fluoroxypyrmethyl))、氟黄胺草醚、甲酰胺磺隆、草铵膦(包括其铵盐)、草甘膦(包括其联胺、异丙基铵和钾盐)、氟氯吡啶酯(halauxifen)(包括氟氯吡啶酯-甲基)、氟吡甲禾灵(包括氟吡甲禾灵-甲基)、环嗪酮、hydantocidin、甲氧咪草烟、甲咪唑烟酸、灭草烟、咪草烟、茚嗪氟草胺、碘甲磺隆(包括碘甲磺隆-甲基-钠)、iofensulfuron(包括iofensulfuron-钠)、碘苯腈、异丙隆、异噁唑草酮、lancotriione、MCPA、MCPB、高二甲四氯丙酸(mecoprop-P)、甲基二磺隆(包括甲基二磺隆-甲基)、甲基磺草酮、苯嗪草酮、吡草胺、异噁唑草醚(methiozolin)、异丙甲草胺、磺草唑胺、嗪草酮、甲磺隆、敌草胺、烟嘧磺隆、达草灭、噁草酮、环氧嘧磺隆、乙氧氟草醚、二氯化百草枯、二甲戊乐灵、五氟磺草胺、苯敌草、毒莠定、唑啉草酯、丙草胺、氟嘧磺隆-甲基、敌稗、喔草酯、丙嗪嘧磺隆(proprysulfuron)、戊炔草胺、苄草丹、氟磺隆、双唑草腈、吡草醚(pyraflufen)(包括吡草醚-乙基)、磺酰草吡唑、哒草特、环酯草醚、吡丙醚(pyrimisulfan)、吡咯磺隆(pyroxasulfone)、啶磺草胺、二氯喹啉酸、氯甲喹啉酸、喹禾灵(包括精喹禾灵-乙基和喹禾糠酯(quizalofop-P-tefuryl))、砜嘧磺隆、嘧啶肟草醚、烯禾啶、西玛津、精异丙甲草胺、甲磺草胺、磺酰磺隆、丁噁隆、特味三酮、环磺酮、特丁津、特丁净、噻酮磺隆(thiencarbazone)、噻吩磺隆、氟嘧硫草酯(tiafenacil)、托比利特(tolpyralate)、苯吡唑草酮、三甲苯草酮、氟酮磺草胺(triafamone)、野麦畏、醚苯磺隆、苯磺隆(包括苯磺隆-甲基)、绿草定、三氟啶磺隆(包括三氟啶磺隆-钠)、三氟草嗪(trifludimoxazin)、氟乐灵、氟胺磺隆、4-羟基-1-甲氧基-5-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑啉-2-酮、4-羟基-1,5-二甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑啉-2-酮、5-乙氧基-4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑啉-2-酮、4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑啉-2-酮、4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑啉-2-酮、(4R)1-(5-叔丁基异噁唑-3-基)-4-乙氧基-5-羟基-3-甲基-咪唑啉-2-酮、3-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]二环[3.2.1]辛烷-2,4-二酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-甲基-环己烷-1,3-二酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]环己

烷-1,3-二酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮、6-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,4,4-四甲基-环己烷-1,3,5-三酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-乙基-环己烷-1,3-二酮、2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-4,4,6,6-四甲基-环己烷-1,3-二酮、2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-甲基-环己烷-1,3-二酮、3-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]二环[3.2.1]辛烷-2,4-二酮、2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮、6-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,4,4-四甲基-环己烷-1,3,5-三酮、2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]环己烷-1,3-二酮、4-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,6,6-四甲基-四氢吡喃-3,5-二酮和4-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,6,6-四甲基-四氢吡喃-3,5-二酮。

[0065] 具有式(I)的化合物的混合配伍物还可以呈酯或盐的形式,如例如在The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册],第十六版,英国作物保护委员会(British Crop Protection Council),2012中所提到的。

[0066] 具有式(I)的化合物还可以与具有其他农用化学品(如杀真菌剂、杀线虫剂或杀昆虫剂)的混合物使用,其实例在The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]中给出。

[0067] 具有式(I)的化合物与混合配伍物的混合比优选地是从1:100至1000:1。

[0068] 这些混合物可以有利地用于以上提到的配制品中(在这种情况下“活性成分”涉及具有式(I)的化合物与混合配伍物的对应混合物)。

[0069] 本发明的化合物或混合物还可以与一种或多种除草剂安全剂组合使用。此类安全剂的实例包括解草嗪、解草酯(包括解毒唑)、环丙磺酰胺、二氯丙烯胺、解草唑(包括解草唑-乙基)、解草啶、氟草肟、解草噁唑、双苯噁唑酸(包括双苯噁唑酸-乙基)、吡唑解草酸(mefenpyr)(包括吡唑解草酸-二乙基)、metcamifen和解草腈。

[0070] 特别优选的是具有式(I)的化合物与环丙磺酰胺、双苯噁唑酸-乙基、解毒唑和/或N-(2-甲氧基苯甲酰基)-4-[(甲基-氨基羰基)氨基]苯磺酰胺的混合物。

[0071] 具有式(I)的化合物的安全剂还可以呈酯或盐的形式,如例如在The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册],第16版(BCPC),2012中所提到的。对解毒唑的提及还适用于其锂、钠、钾、钙、镁、铝、铁、铵、季铵、锍或𬭸盐(如在WO 02/34048中披露的)。

[0072] 优选地,具有式(I)的化合物与安全剂的混合比是从100:1至1:10,尤其是从20:1至1:1。

[0073] 本发明还进一步提供了一种在场所控制杂草的方法,所述方法包括向所述场所施用控制杂草量的包含具有式(I)的化合物的组合物。此外,本发明可以进一步提供一种在包括作物植物和杂草的场所处选择性地控制杂草的方法,其中所述方法包括向所述场所施用控制杂草量的根据本发明的组合物。‘控制’意指杀死、减少或延迟生长或防止或减少发芽。应指出,与已知的结构类似的化合物相比,本发明的化合物示出很大改善的选择性。通常有待控制的植物是不想要的植物(杂草)。‘场所’意指植物正生长或将生长的区域。施用可以在作物植物的出苗前和/或出苗后施用至场所。一些作物植物可以固有地耐受具有式(I)的化合物的除草作用。优选的作物植物包括玉米、小麦、大麦和水稻。

[0074] 具有式I的化合物的施用率可以在宽范围之内变化并且取决于土壤的性质、施用方法(出苗前或出苗后;拌种;施用至种子垄沟;免耕施用等)、作物植物、一种或多种有待控制的杂草、主要气候条件、以及受施用方法、施用时间以及目标作物支配的其他因素。根据本发明的具有式I的化合物通常以从10至2500g/ha、尤其是从25至1000g/ha、更尤其是从25至250g/ha的比率施用。

[0075] 通常通过喷洒该组合物进行施用,典型地是通过用于大面积的装在拖拉机上的喷洒机,但是还可以使用其他方法如撒粉(针对粉末)、滴加或浸湿。

[0076] 作物植物应理解为还包括通过常规的育种方法或通过基因工程已经赋予对其他除草剂或多种类别的除草剂(例如ALS-抑制剂、GS-抑制剂、EPSPS-抑制剂、PPO-抑制剂、HPPD-抑制剂、抑制剂-PDS以及ACC酶-抑制剂)的耐受性的那些作物植物。通过常规育种方法已经赋予其对咪唑啉酮(例如,甲氧咪草烟)的抗性的作物的实例是**Clearfield®**夏季油菜(卡诺拉(canola))。通过基因工程方法已经赋予对除草剂的抗性的作物的实例包括例如草甘膦和草丁膦抗性的玉米品种,这些玉米品种在商标名**RoundupReady®**和**LibertyLink®**下是可商购的。

[0077] 作物植物还应理解为通过基因工程方法已经赋予其对有害昆虫的抗性的那些作物,例如Bt玉米(对欧洲玉米螟有抗性)、Bt棉花(对棉铃象鼻虫有抗性)以及还有Bt马铃薯(对科罗拉多甲虫有抗性)。Bt玉米的实例是**NK®**的Bt 176玉米杂交体(先正达种子公司(Syngenta Seeds))。Bt毒素是由苏云金芽孢杆菌土壤细菌天然形成的蛋白质。毒素或能够合成此类毒素的转基因植物的实例被描述于EP-A-451 878、EP-A-374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、WO 03/052073和EP-A-427 529中。包含一个或多个编码杀昆虫剂抗性和表达一种或多种毒素的基因的转基因植物的实例是**KnockOut®**(玉米)、**Yield Gard®**(玉米)、**NuCOTIN33B®**(棉花)、**Bollgard®**(棉花)、**NewLeaf®**(马铃薯)、

**NatureGard®**以及**Protexcta®**。植物作物或其种子材料均可以是抗除草剂的并且同时是抗昆虫摄食的(“叠加的”转基因结果)。例如,种子可以具有表达杀昆虫的Cry3蛋白的能力,而同时是抗草甘膦的。

[0078] 作物植物还应理解为包括通过常规的育种或基因工程的方法获得并且包含所谓的输出性状(例如改善的储存稳定性、更高的营养价值以及改善的香味)的那些。

[0079] 可以使用这些组合物来控制不想要的植物(统称为‘杂草’)。有待控制的杂草既可以是单子叶的物种,例如剪股颖属、看麦娘属、燕麦属、臂形草属、雀麦属、蒺藜草属、莎草属、马唐属、稗属、穆属、黑麦草属、雨久花属、筒轴茅属、慈姑属、藨草属、狗尾草属以及高粱属,也可以是双子叶的物种,例如苘麻属、苋属、豚草属、藜属、菊属、白酒草属、拉拉藤属、番薯属、旱金莲属、黄花稔属、白芥属、茄属、繁缕属、婆婆纳属、堇菜属以及苍耳属。

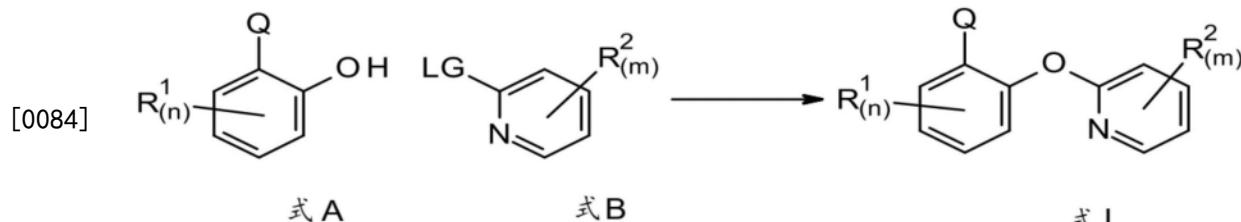
[0080] 在本发明的另外的方面,提供了如本文所定义的具有式(I)的化合物作为除草剂的用途。

[0081] 本发明的化合物可以根据以下方案来制备。

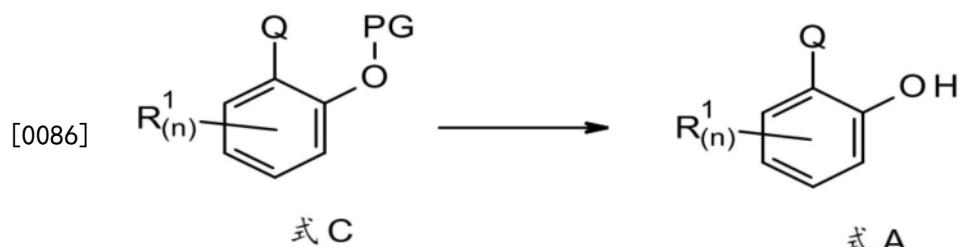
[0082] 用于制备具有式(I)的化合物的方法

[0083] 用于制备化合物(例如具有式(I)的化合物(所述化合物任选地可以是其农业化学

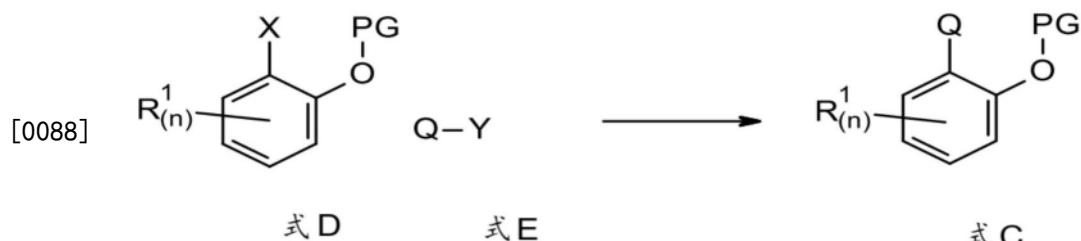
上可接受的盐)) 的方法现在加以描述, 并且形成本发明的另外的方面。



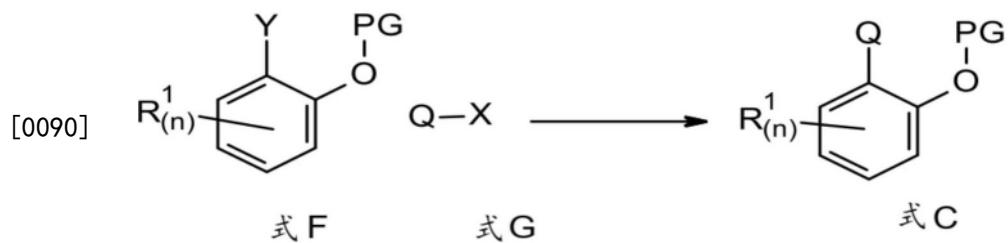
[0085] 具有式I的化合物可以由具有式A的化合物通过与具有式B的化合物(其中LG表示合适的离去基团,如Br、Cl、F或OSO<sub>2</sub>Me)任选地在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中在合适的反应温度下的反应来制备。合适的碱可以包括K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>或Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>。合适的溶剂包括DMF。合适的反应温度是在20℃与120℃之间。具有式B的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。



[0087] 可替代地,具有具有式A的化合物可以由具有式C的化合物(其中PG表示合适的保护基团,如Me或Ac)经由脱保护反应来制备。当PG=Me时,合适的脱保护条件包括在合适的溶剂(如DCM)中使用 $\text{BBr}_3$ 。当PG=Ac时,合适的脱保护条件包括在合适的溶剂(如MeOH或MeOH/ $\text{H}_2\text{O}$ )中使用 $\text{K}_2\text{CO}_3$ 或 $\text{NH}_4\text{OAC}$ 。

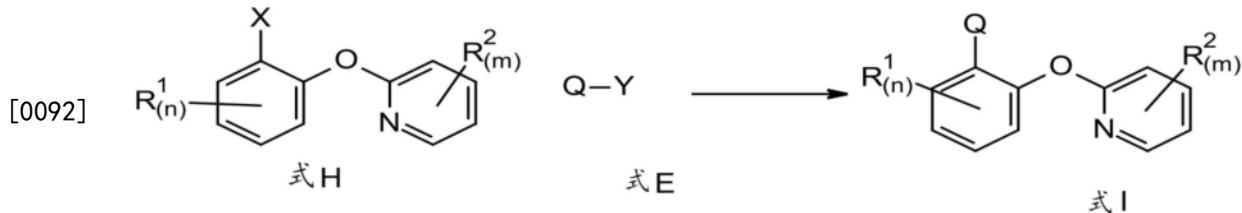


[0089] 具有式C的化合物可以由具有式D的化合物(其中X表示合适的卤素(如F、Cl、Br或I)或者合适的拟卤素(如OTf))经由与具有式E的化合物(其中Y表示合适的偶联配伍体(coupling partner)官能团,如-B(OR)<sub>2</sub>或-SnR<sub>3</sub>)在合适的催化剂/配体组合的存在下、任选地在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中的反应来制备。合适的催化剂可以包括双-三苯基膦-氯化钯(II)。合适的碱可以包括Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>。合适的溶剂可以包括1,4-二噁烷或DMF。具有式D和具有式E的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。

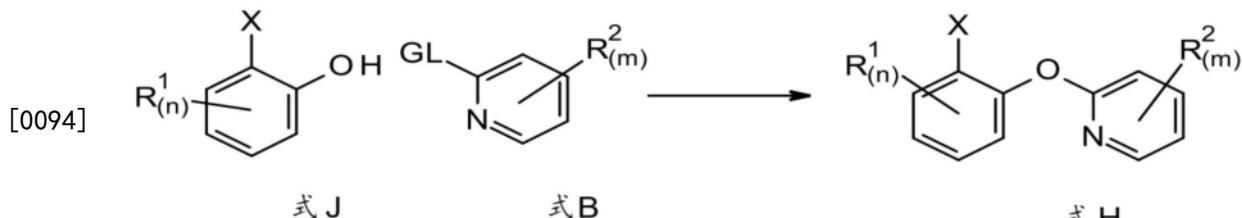


[0091] 在替代性方法中,具有式C的化合物可以由具有式F的化合物(其中Y表示合适的偶

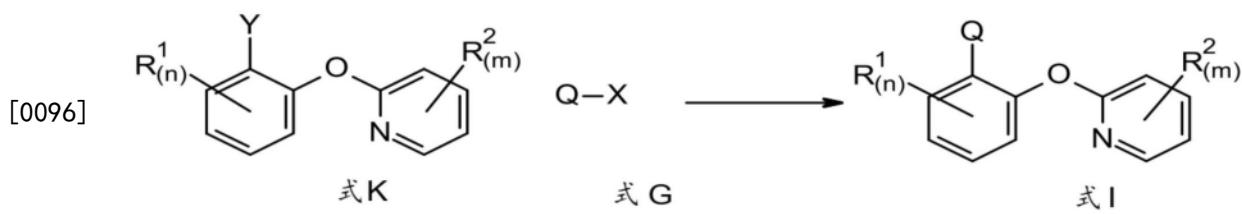
联配伍体官能团,如- $B(OR)_2$ 或- $SnR_3$ )和具有式G的化合物(其中Q是C-连接的杂环(如Q1和Q2),并且其中X表示合适的卤素(如F、Cl、Br或I)或者合适的拟卤素(如OTf))在合适的催化剂/配体组合的存在下、任选地在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中来制备。合适的催化剂可以包括四(三苯基膦)钯。合适的碱可以包括 $K_2CO_3$ 。合适的溶剂可以包括DCM/H<sub>2</sub>O。具有式F和具有式G的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。



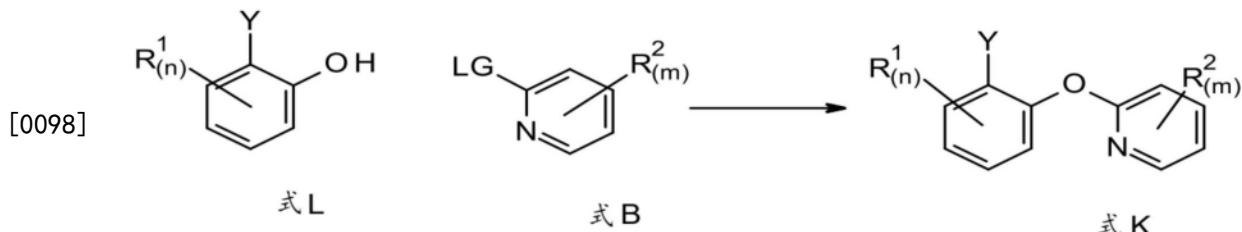
[0093] 在替代性方法中,具有式I的化合物可以由式H的化合物(其中X表示合适的卤素(如F、Cl、Br或I)或者合适的拟卤素(如OTf))和具有式E的化合物(其中Y表示合适的偶联配伍体官能团,如 $-B(OR)_2$ 或 $-SnR_3$ )在合适的催化剂/配体组合的存在下、任选地在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中来制备。合适的催化剂可以包括双-三苯基膦-氯化钯(II)。合适的碱可以包括 $Cs_2CO_3$ 。合适的溶剂可以包括1,4-二噁烷或DMF。具有式E的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。



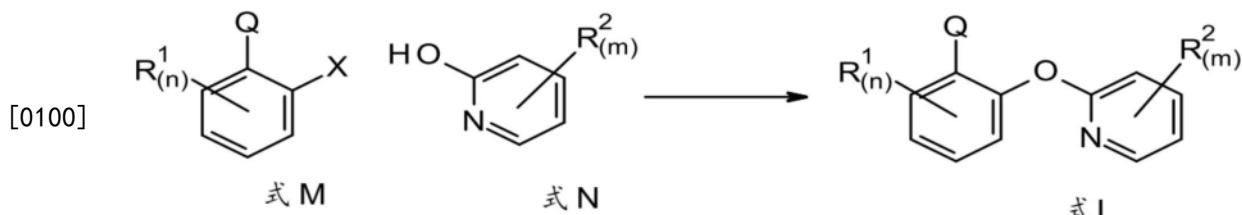
[0095] 具有式H的化合物可以由式J的化合物与式B的化合物(其中LG表示合适的离去基团,如Br、Cl、F或OSO<sub>2</sub>Me)在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中来制备。合适的碱可以包括Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>或NaH。合适的溶剂可以包括DMF或DMSO。具有式J和具有式B的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。



[0097] 在另一替代性方法中,具有式I的化合物可以由具有式K的化合物(其中Y表示合适的偶联配伍体官能团,如-B(OR)<sub>2</sub>或-SnR<sub>3</sub>)和具有式G的化合物(其中Q是C-连接的杂环,并且其中X表示合适的卤素(如F、Cl、Br或I)或者合适的拟卤素(如OTf))在合适的催化剂/配体组合的存在下、任选地在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中来制备。合适的催化剂可以包括四(三苯基膦)钯。合适的碱可以包括K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>。合适的溶剂可以包括DCM/H<sub>2</sub>O。具有式G的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。



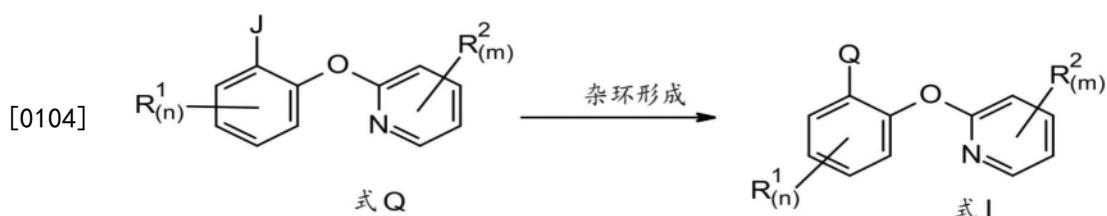
[0099] 具有式K的化合物可以由具有式L的化合物(其中Y表示合适的偶联配伍体官能团,如-B(OR)<sub>2</sub>或-SnR<sub>3</sub>)和具有式B的化合物(其中LG表示合适的离去基团,如Br、Cl、F或OSO<sub>2</sub>Me)在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中来制备。合适的碱可以包括Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>或NaH。合适的溶剂可以包括DMF或DMSO。具有式L和具有式B的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。



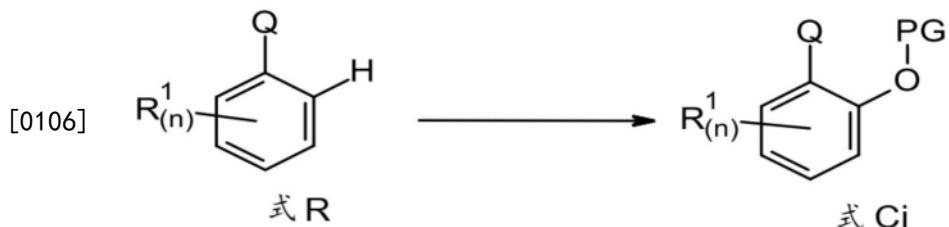
[0101] 在又另一替代性方法中,具有式I的化合物可以由具有式M的化合物(其中X表示合适的卤素(如F、Cl、Br或I)或者合适的拟卤素(如OTf))和具有式N的化合物在合适的催化剂的存在下、任选地在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中来制备。合适的催化剂可以包括碘化铜(I)。合适的碱可以包括 $K_2CO_3$ 。合适的溶剂可以包括DMSO。具有式M和具有式N的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。



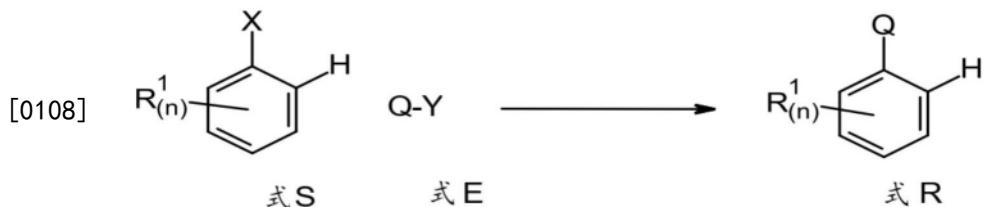
[0103] 在另一替代性方法中,具有式C的化合物可以由具有式P的化合物(其中J是烯烃、炔烃、肟、酮、羧酸、酯、酰胺、肼、叠氮化物或胺)使用文献中已知的杂环形成的方法来制备。



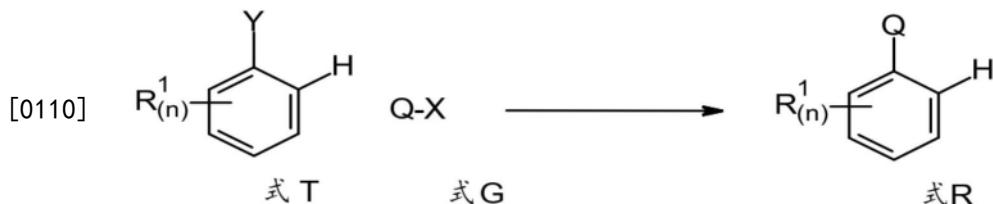
[0105] 类似地,具有式I的化合物可以由具有式Q的化合物(其中J是烯烃、炔烃、肟、酮、羧酸、酯、酰胺、肼、叠氮化物或胺)使用文献中已知的杂环形成的方法来制备。



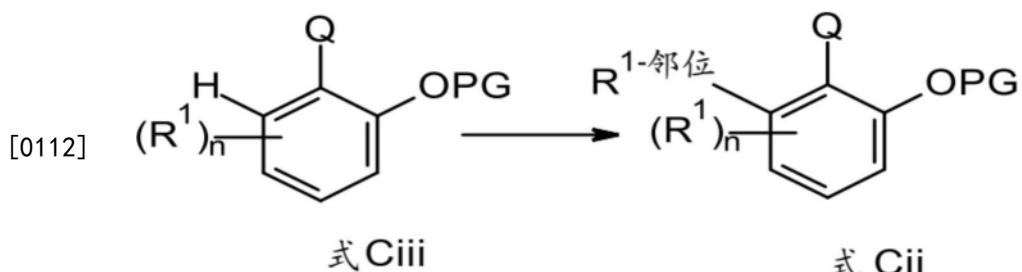
[0107] 在另一方法中,具有式Ci的化合物(具有式C的化合物,其中Q是合适的邻位定位杂环(ortho-directing heterocycle),如Q9、Q11、Q12、Q34或Q35)可以由具有式R的化合物在合适的催化剂、合适的氧化剂和合适的亲核试剂的存在下来制备。合适的催化剂可以包括Pd(OAc)<sub>2</sub>。合适的氧化剂可以包括(二乙酰氧基碘)苯。合适的亲核试剂可以包括乙酸。



[0109] 具有式R的化合物可以由具有式S的化合物(其中X表示合适的卤素(如Cl、Br或I)或者合适的拟卤素(如OTf))经由与具有式E的化合物(其中Y表示合适的偶联配伍体官能团,如-B(OR)<sub>2</sub>或-SnR<sub>3</sub>)在合适的催化剂/配体组合的存在下、任选地在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中的反应来制备。合适的催化剂可以包括双-三苯基膦-氯化钯(II)。合适的碱可以包括Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>。合适的溶剂可以包括1,4-二噁烷或DMF。具有式S和具有式E的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。

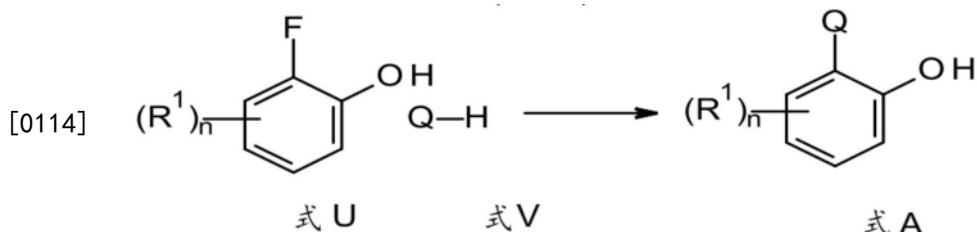


[0111] 可替代地,具有式R的化合物可以由具有式T的化合物(其中Y表示合适的偶联配伍体官能团,如-B(OR)<sub>2</sub>或-SnR<sub>3</sub>)和具有式G的化合物(其中Q是C-连接的杂环,并且其中X表示合适的卤素(如F、Cl、Br或I)或者合适的拟卤素(如OTf))在合适的催化剂/配体组合的存在下、任选地在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中来制备。合适的催化剂可以包括四(三苯基膦)钯。合适的碱可以包括K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>。合适的溶剂可以包括DCM/H<sub>2</sub>O。具有式T和具有式G的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。



[0113] 在替代性方法中,具有式Cii的化合物(具有式C的化合物,其中R<sup>1</sup>-邻位=卤素,并且Q是合适的邻位定位杂环,如Q9、Q11、Q12、Q34或Q35)可以由具有式Ciii的化合物(具有式C的)

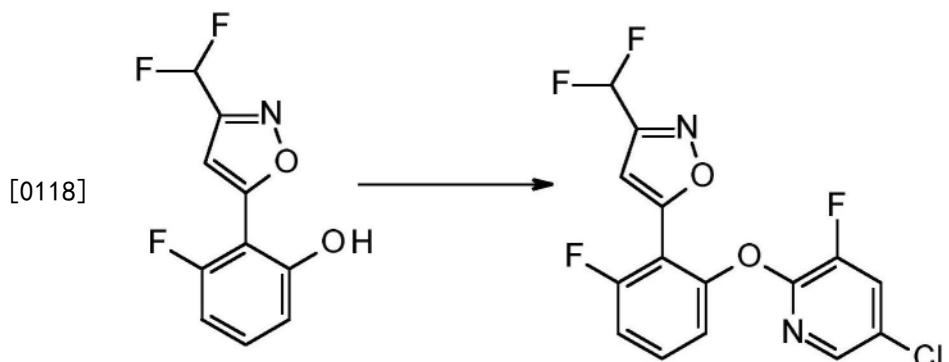
化合物,其中R<sup>1</sup>-邻位=H经由与合适的卤化试剂在合适的催化剂的存在下并且任选地在合适的溶剂中的反应来制备。合适的卤化试剂可以包括N-碘代琥珀酰亚胺、N-溴代琥珀酰亚胺、N-氯代琥珀酰亚胺或N-氟代苯磺酰亚胺。合适的催化剂可以包括Pd (OAc)<sub>2</sub>。合适的溶剂可以包括乙酸。



[0115] 在又另一替代性方法中,具有式A的化合物(其中Q是N-连接的杂环,并且R<sup>1</sup>是吸电子基团,如卤素、CN或NO<sub>2</sub>)可以由具有式U的化合物经由与具有式V的化合物在合适的碱的存在下并且在合适的溶剂中的S<sub>N</sub>Ar反应来制备。合适的碱可以包括K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>。合适的溶剂可以包括N,N-二甲基乙酰胺。具有式U和具有式V的化合物是可商购的或可以通过文献中已知的方法制备。

[0116] 以下非限制性实例提供了用于本发明的代表性化合物(如下表1中所提及的)的具体合成方法。

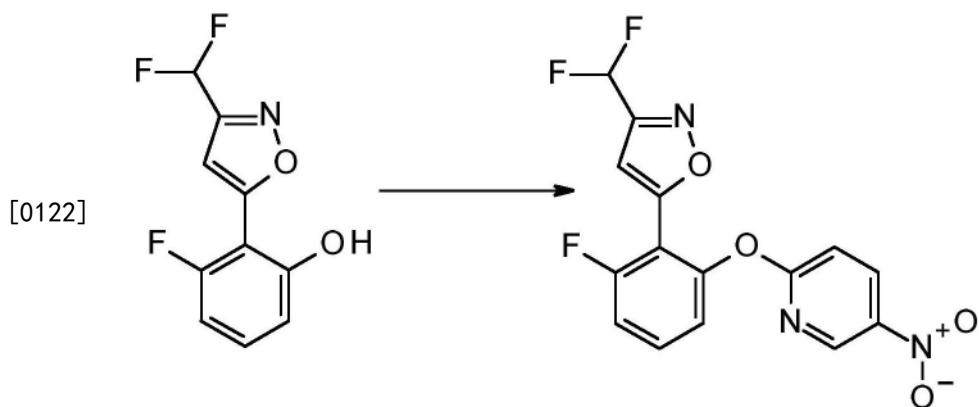
[0117] 实例1:5-[2-[5-氯-3-氟-2-吡啶基]氧基]-6-氟-苯基]-3-(二氟甲基)异噁唑(A1)的合成



[0119] 向2-[3-(二氟甲基)异噁唑-5-基]-3-氟-苯酚(0.06g,0.26mmol)在N-二甲基酰胺(1.8mL)中的搅拌溶液中添加K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(0.18g,1.3mmol),随后添加5-氯-2,3-二氟-吡啶(0.049g,0.33mmol)。将反应在室温下搅拌过夜,并且然后加热至80℃持续4小时。将反应混合物冷却至室温、用DCM稀释并用2M HCl酸化,将各相分离,然后将水相用DCM再萃取,并将经合并的有机物在减压下蒸发至干燥。将粗残留物通过使用乙酸乙酯在异己烷中的0%-10%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈白色固体的所需产物(0.066g,70%)。

[0120] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7.83 (d, 1H), 7.57 (d, 2H), 7.24-7.08 (m, 2H), 6.94-6.61 (m, 2H)

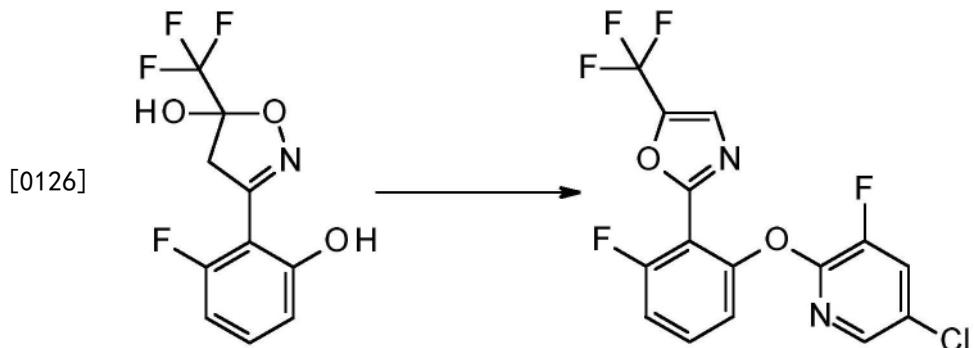
[0121] 实例2:3-(二氟甲基)-5-[2-氟-6-[(5-硝基-2-吡啶基)氧基]苯基]异噁唑(A2)的合成



[0123] 向2-[3-(二氟甲基)异噁唑-5-基]-3-氟-苯酚(0.06g,0.26mmol)在N,N-二甲基甲酰胺(1.8mL)中的搅拌溶液中添加K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(0.18g,1.3mmol),随后添加2-氯-5-硝基-吡啶(0.052g,0.33mmol)。将反应在室温下搅拌过夜、然后用DCM稀释并用2M HCl酸化,将各相分离,然后将水相用DCM再萃取,并将经合并的有机物在减压下蒸发至干燥。将粗残留物通过使用乙酸乙酯在异己烷中的0%-20%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈无色油状物的所需产物(0.078g,85%)。

[0124] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ8.95(d,1H),8.64-8.43(m,1H),7.59(dt,1H),7.32-7.10(m,3H),6.97-6.53(m,2H)

[0125] 实例3:2-[2-[(5-氯-3-氟-2-吡啶基)氧基]-6-氟-苯基]-5-(三氟甲基)噁唑(A3)的合成

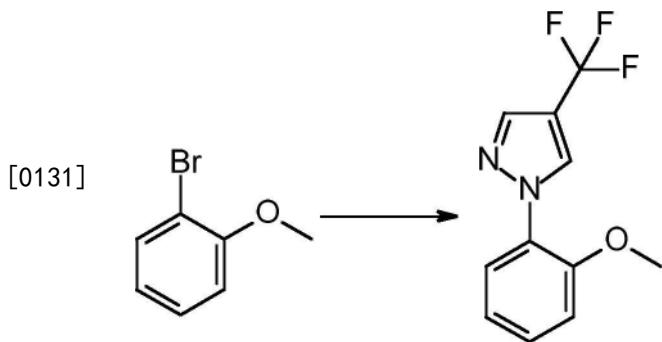


[0127] 向3-(2-氟-6-羟基-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-5-醇(0.100g,0.377mmol)在DMF(5mL)中的搅拌溶液中添加K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(0.317g,2.26mmol)和5-氯-2,3-二氟吡啶(0.141g,0.943mmol)。将反应在80℃下加热4小时,并且然后使其冷却至室温。将反应混合物用EtOAc和H<sub>2</sub>O稀释,将各相分离并将水相用另外的EtOAc萃取。将经合并的有机物用H<sub>2</sub>O洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗残留物通过使用0%-10%EtOAc/异己烷作为洗脱液经硅胶快速色谱法来纯化,以给出呈淡黄色固体的所需产物(0.068g,48%)。

[0128] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ7.78(d,1H),7.67-7.42(m,3H),7.24-7.05(m,2H)。

[0129] 实例4:5-硝基-2-[2-[(4-(三氟甲基)吡唑-1-基)苯氧基]吡啶(A14)的合成

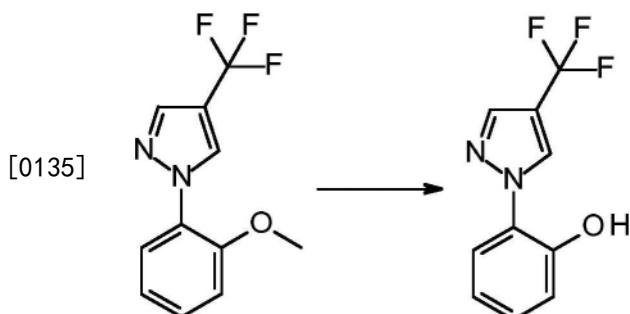
[0130] 步骤1:1-(2-甲氧基苯基)-4-(三氟甲基)吡唑的合成



[0132] 向1-溴-2-甲氧基-苯(0.20g,1.07mmol)在1,4-二噁烷(4mL)中的搅拌溶液中添加4-(三氟甲基)-1H-吡唑(0.291g,2.14mmol)、CuI(0.204g,1.07mmol)、N,N'-二甲基乙烷-1,2-二胺(0.189mg,2.74mmol)以及K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(0.227g,1.64mmol)。将反应在回流下加热72小时,使其冷却至室温,将其吸附在硅胶上并通过使用EtOAc在异己烷中5%-50%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈无色油状物的所需产物(0.169g,65%)。

[0133] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ8.31(s,1H),7.88(s,1H),7.72(d,1H),7.36(t,1H),7.11-7.03(m,2H),3.91(s,3H)。

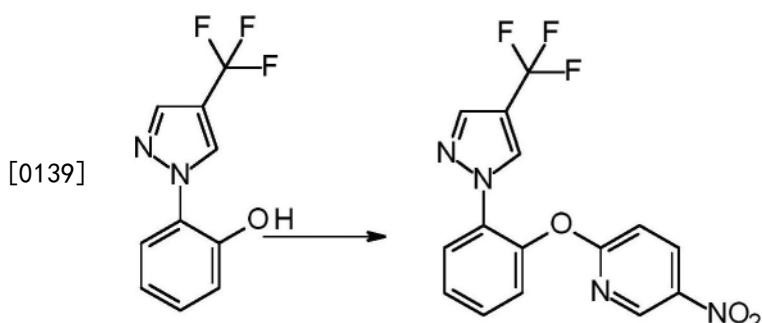
[0134] 步骤2:2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯酚的合成



[0136] 在0℃下在N<sub>2</sub>气氛下,向1-(2-甲氧基苯基)-4-(三氟甲基)吡唑(1.25g,5.16mmol)在DCM(100mL)中的搅拌溶液中添加BBr<sub>3</sub>(12.9mL的在DCM中的1M溶液,12.9mmol)。使反应混合物经2小时升温至15℃、用水淬灭、用饱和NaHCO<sub>3</sub>溶液将pH调节至7并用DCM(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥、吸附在硅胶上并通过使用EtOAc在异己烷中5%-50%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈白色固体的所需产物(1.06g,90%)。

[0137] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ10.50(s,1H),8.28(s,1H),7.94(s,1H),7.39(d,1H),7.26(t,1H),7.12(d,1H),6.96(t,1H)。

[0138] 步骤3:5-硝基-2-[2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]吡啶(A14)的合成

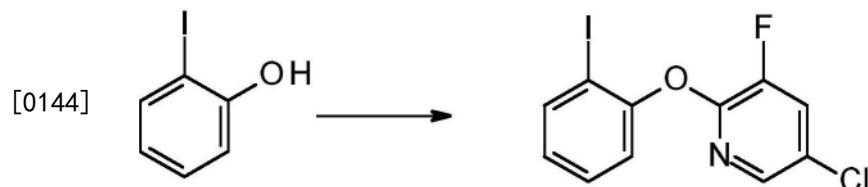


[0140] 向2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯酚(0.20g,0.88mmol)在DMF(5mL)中的搅拌溶液中添加K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(0.242g,1.75mmol)和2-氯-5-硝基-吡啶(0.166mg,1.05mmol)。将反应在80℃下加热3小时、使其冷却至室温、用H<sub>2</sub>O洗涤并用Et<sub>2</sub>O(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥以给出棕色固体。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5%-50%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈淡黄色固体的所需产物(0.078g,26%)。

[0141] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ8.91(s,1H),8.45(dd,1H),8.02(s,1H),7.79-7.70(m,2H),7.55-7.49(m,1H),7.49-7.42(m,1H),7.32(d,1H),7.03(d,1H)

[0142] 实例5:5-氯-2-[2-(4-氯吡唑-1-基)苯氧基]-3-氟-吡啶(A24)的合成

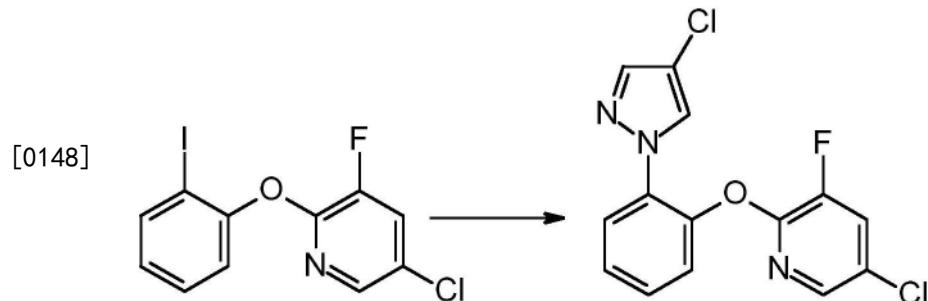
[0143] 步骤1:5-氯-3-氟-2-(2-碘苯氧基)吡啶的合成



[0145] 向2-碘苯酚(6.40g,29.1mmol)在DMF(64mL)中的搅拌溶液中添加K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(8.04g,58.2mmol)和5-氯,2,3-二氟吡啶(5.22g,34.9mmol)并将反应在80℃下加热16小时。将反应冷却至室温、用H<sub>2</sub>O(200mL)稀释并用Et<sub>2</sub>O(3×75mL)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥,以给出黄色油状物。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5%-50%的梯度在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈无色油状物的所需产物(10.10g,99%)。

[0146] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ7.91-7.82(m,2H),7.53(dd,1H),7.41(t,1H),7.18(d,1H),7.01(t,1H)

[0147] 步骤2:5-氯-2-[2-(4-氯吡唑-1-基)苯氧基]-3-氟-吡啶(A24)的合成

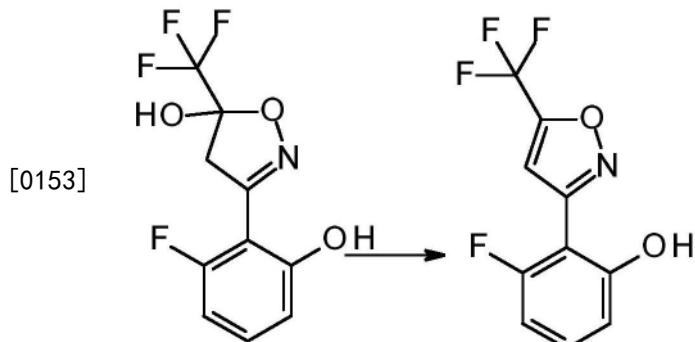


[0149] 向5-氯-3-氟-2-(2-碘苯氧基)吡啶(0.20g,0.572mmol)在1,4-二噁烷(4mL)中的搅拌溶液中添加4-氯-1H-吡唑(0.117mg,1.14mmol)、CuI(0.109g,0.572mmol)、N,N'-二甲基乙烷-1,2-二胺(0.108g,1.14mmol)和K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(0.168g,1.22mmol),并将反应在回流下加热16小时。使反应冷却至室温、用H<sub>2</sub>O(10mL)稀释并用EtOAc(3×15mL)萃取。将合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥,以给出棕色油状物。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5%-50%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈白色固体的所需产物(27mg,14%)。

[0150] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ7.81(s,1H),7.72(d,1H),7.69(dd,1H),7.48(s,1H),7.42(dd,1H),7.37-7.28(m,2H),7.19(dd,1H)。

[0151] 实例6:3-[(2-[(5-氯-3-氟-2-吡啶基)氧基]-6-氟-苯基]-5-(三氟甲基)异噁唑(A25)的合成

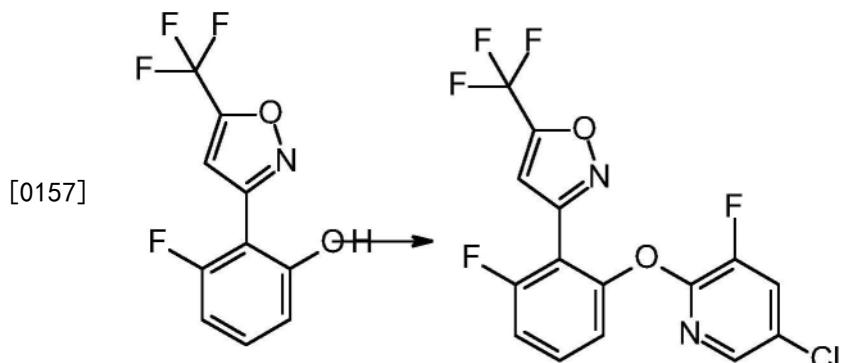
[0152] 步骤1:3-氟-2-[5-(三氟甲基)异噁唑-3-基]苯酚的合成



[0154] 向3-(2-氟-6-羟基-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-5-醇(20.0g, 75.4mmol)在甲苯(150mL)中的搅拌溶液中添加对甲苯磺酸一水合物(1.59g, 9.05mmol)。将反应在回流下加热2h, 同时共沸除去水, 然后冷却至室温并在减压下蒸发至干燥。将残留物溶于CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>(500ml)中并逐渐添加至饱和NaHCO<sub>3</sub>水溶液的搅拌溶液(200ml)。将有机相分离并用H<sub>2</sub>O然后用盐水洗涤, 并在减压下蒸发至干燥, 以留下呈灰白色固体的所需产物(17.41g, 93%) , 将其不经进一步纯化使用。

[0155] <sup>1</sup>H NMR(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ9.54(s, 1H), 7.35(m, 2H), 6.94(d, 1H), 6.76(t, 1H)。

[0156] 步骤2:3-[(2-[(5-氯-3-氟-2-吡啶基)氧基]-6-氟-苯基]-5-(三氟甲基)异噁唑(A25)的合成

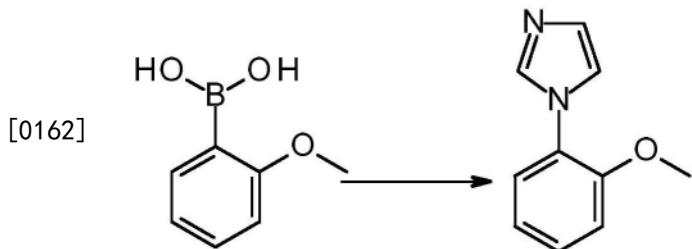


[0158] 向3-氟-2-[5-(三氟甲基)异噁唑-3-基]苯酚(1.00g, 4.05mmol)在N,N-二甲基甲酰胺(15mL)中的溶液中添加5-氯-2,3-二氟-吡啶(3.03g, 20.2mmol)和碳酸钾(0.85g, 6.07mmol)。将反应在80℃下加热3.5小时, 使其冷却至室温, 并且然后通过添加H<sub>2</sub>O淬灭。然后将反应用EtOAc(×3)萃取, 并且将经合并的有机萃取物用H<sub>2</sub>O和盐水洗涤, 之后经MgSO<sub>4</sub>干燥, 并在减压下蒸发至干燥以留下黄色油状物。将粗产物通过使用100%环己烷至10% EtOAc/环己烷的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化, 以给出呈淡黄色胶状物的所需产物(30mg, 2%)。

[0159] <sup>1</sup>H NMR(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ7.81(s, 1H), 7.54(m, 2H), 7.15(t, 1H), 7.10(d, 1H), 6.99(s, 1H)

[0160] 实例7:5-氯-3-氟-2-(2-咪唑-1-基苯氧基)吡啶(A28)的合成

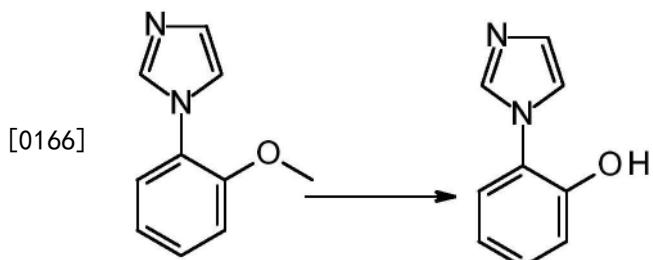
[0161] 步骤1:1-(2-甲氧基苯基)咪唑的合成



[0163] 将咪唑 (0.806g, 0.012mol)、(2-甲氧基苯基) 硼酸 (1.50g, 0.0099mol) 和 Cu(I) Cl (0.100g, 0.001mol) 在 MeOH (50mL) 中的混合物在回流下加热过夜。使反应混合物冷却至室温并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用 MeOH/DCM 0% - 5% 的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化, 以给出呈棕色油状物的所需产物 (133mg, 7%)。

[0164]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.79 (s, 1H), 7.34 (t, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.09-7.00 (m, 2H), 3.84 (s, 3H)

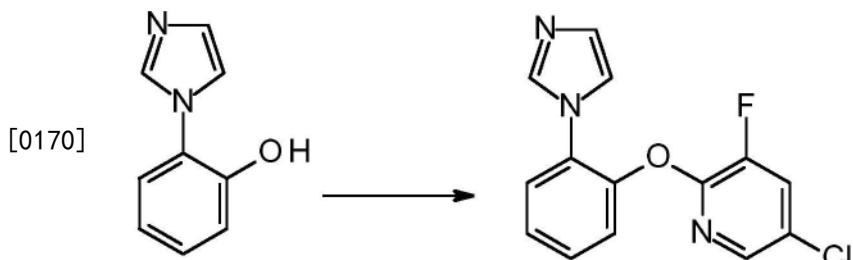
[0165] 步骤2: 2-咪唑-1-基苯酚的合成



[0167] 在0°C下在氮气下, 向1- (2-甲氧基苯基) 咪唑 (55mg, 0.89mmol) 在二氯甲烷 (18mL) 中的溶液中逐滴添加三溴化硼 (在DCM中的1M溶液) (2.22mL, 2.22mmol), 将温度维持在<5°C。一旦完成添加, 使反应混合物在此温度下搅拌1小时, 并且然后使其升温至室温并在室温下搅拌72小时。将反应混合物用水淬灭并用饱和碳酸氢钠水溶液调节至pH 7, 然后用DCM (×3) 洗涤。从水层中沉淀出灰白色固体。将固体滤出、用少量水洗涤并在真空烘箱中在40°C下干燥3小时, 以给出呈米色固体的所需产物 (133mg, 93%)。

[0168]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  = 7.92 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.01 (d, 1H), 6.93 (t, 1H)

[0169] 步骤3: 5-氯-3-氟-2- (2-咪唑-1-基苯氧基) 吡啶 (A28) 的合成

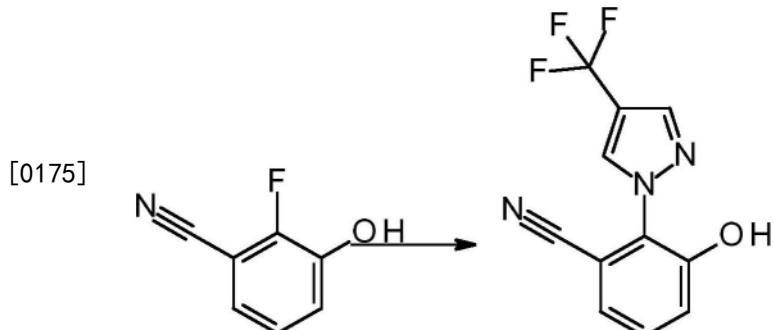


[0171] 将5-氯-2,3-二氟-吡啶 (0.149g, 0.10mmol)、2-咪唑-1-基苯酚 (0.133g, 0.83mmol) 和  $\text{K}_2\text{CO}_3$  (0.230g, 1.66mmol) 在DMF (5mL) 中的混合物在90°C下加热过夜。使反应混合物冷却至室温、用水稀释并用EtOAc (×3) 萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经  $\text{MgSO}_4$  干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用 MeOH 在 DCM 中 0% - 5% 的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化, 以给出呈黄色油状物的所需产物 (0.226g, 94%)。

[0172]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.71 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.51-7.34 (m, 4H), 7.31 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.03 (s, 1H)

[0173] 实例8:3-[(5-氯-3-氟-2-吡啶基)氧基]-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯甲腈(A33)的合成

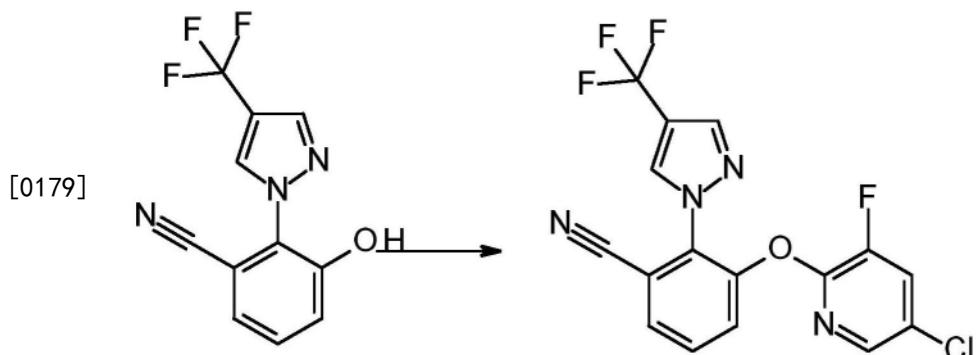
[0174] 步骤1:3-羟基-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯甲腈的合成



[0176] 在氮气气氛下,向2-氟-3-羟基-苯甲腈(1.0g,7.3mmol)和4-(三氟甲基)-1H-吡唑(1.1g,8.0mmol)在N,N-二甲基乙酰胺(15mL)中的溶液中添加粉末状 $\text{K}_2\text{CO}_3$ (3.1g,22mmol)。将所得混合物在150℃下加热22小时。使反应混合物冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×4)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经 $\text{MgSO}_4$ 干燥并蒸发至干燥以给出橙色液体。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中20%至40%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈黄色固体的所需产物(594mg,32%)。

[0177]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  = 8.64 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.42-7.35 (m, 3H)。

[0178] 步骤2:3-[(5-氯-3-氟-2-吡啶基)氧基]-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯甲腈(A33)的合成



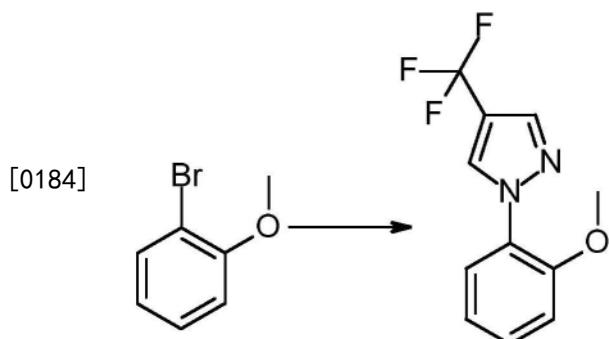
[0180] 向3-羟基-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯甲腈(0.180g,0.711mmol)和5-氯-2,3-二氟-吡啶(0.138g,0.924mmol)在N,N-二甲基甲酰胺(4.50mL)中的溶液中添加 $\text{K}_2\text{CO}_3$ (0.248g,1.78mmol)。将混合物在微波辐射下在130℃下加热1小时。将反应混合物倾倒入水中并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用1M NaOH溶液然后用盐水洗涤、经 $\text{MgSO}_4$ 干燥并在减压下蒸发至干燥以给出棕色液体。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中0%至50%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈白色固体的所需产物(0.191g,63%)。

[0181]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  = 8.03 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.48 (dd, 1H)

[0182] 实例9:5-氯-3-氟-2-[3-甲氧基-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]吡啶(A36)

的合成。

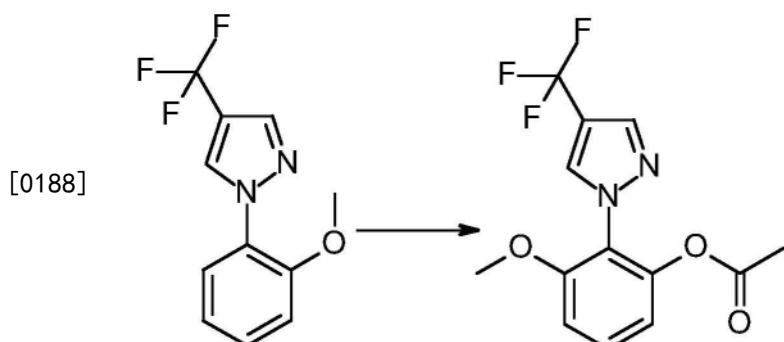
[0183] 步骤1:1- (2-甲氧基苯基) -4- (三氟甲基) 吡唑的合成



[0185] 将4- (三氟甲基) -1H- 吡唑 (291mg, 2.14mmol) 、1-溴-2-甲氧基-苯 (200mg, 1.07mmol) 、Cu (I) I (204mg, 1.07mmol) 、N,N'-二甲基乙烷-1,2-二胺 (188mg, 2.14mmol) 和 K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (227mg, 2.25mmol) 在1,4-二噁烷 (20mL) 中的溶液在回流下加热18小时。使反应冷却至室温并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5% -50% 的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化, 以给出呈无色油状物的所需产物 (169mg, 65%)。

[0186] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ=8.31 (s, 1H) , 7.88 (s, 1H) , 7.72 (d, 1H) , 7.36 (t, 1H) , 7.11-7.03 (m, 2H) , 3.91 (s, 3H) 。

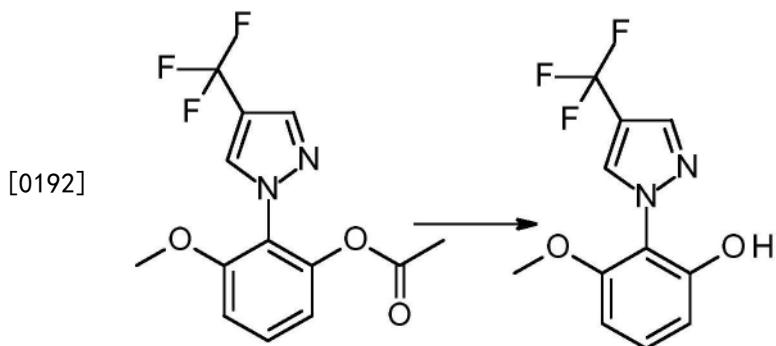
[0187] 步骤2:[3-甲氧基-2-[4- (三氟甲基) 吡唑-1-基]苯基]乙酸酯的合成



[0189] 将1- (2-甲氧基苯基) -4- (三氟甲基) 吡唑 (326mg, 1.35mmol) 、Pd (OAc)<sub>2</sub> (31mg, 0.13mmol) 和(二乙酰氧基碘) 苯 (1.77g, 5.38mmol) 在乙酸 (13.5mL) 中的溶液在100℃下加热2小时。使反应冷却至室温、然后在减压下蒸发至干燥并与甲苯共沸三次。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5% -100% 的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化, 以给出呈黄色固体的所需产物 (292mg, 72%)。

[0190] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ=7.90 (s, 1H) , 7.81 (s, 1H) , 7.46 (t, 1H) , 6.95 (d, 1H) , 6.85 (d, 1H) , 3.83 (s, 3H) , 2.08 (s, 3H)

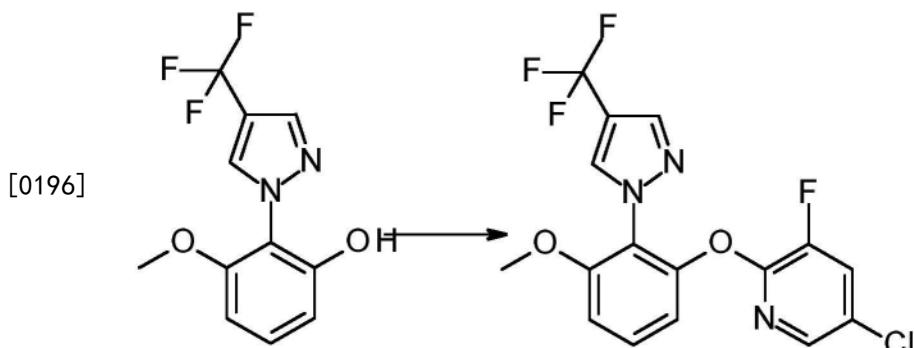
[0191] 步骤3:3-甲氧基-2-[4- (三氟甲基) 吡唑-1-基]苯酚的合成



[0193] 将[3-甲氧基-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯基]乙酸酯(295mg, 0.95mmol)和NaOH(133mg, 3.32mmol)在MeOH(5.7mL)和H<sub>2</sub>O(0.57mL)中的溶液在室温下搅拌过夜。将反应用水稀释、用2M HCl变成酸性并用DCM(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥,以给出所需产物(245mg, 定量),将其不经进一步纯化使用。

[0194]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  = 10.1 (br, 1H), 8.52 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.74 (d, 1H), 6.59 (d, 1H), 3.91 (s, 3H)

[0195] 步骤4:5-氯-3-氟-2-[3-甲氧基-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]吡啶(A36)的合成

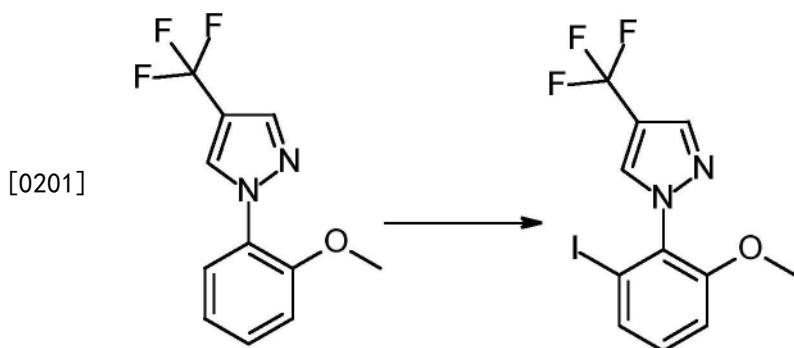


[0197] 将3-甲氧基-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯酚(150mg,0.58mmol)、5-氯-2,3-二氟-吡啶(104mg,0.70mmol)和K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(161mg,1.16mmol)在DMF(2mL)中的溶液在80℃下加热18小时。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5%-30%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈无色胶状物的所需产物(169mg,75%)。

[0198]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  = 7.78 (s, 1H), 7.72 (s, 2H), 7.47 (t, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.00-6.91 (m, 2H), 3.83 (s, 3H)

[0199] 实例10:5-氯-3-氟-2-[3-碘-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]吡啶(A57)的合成

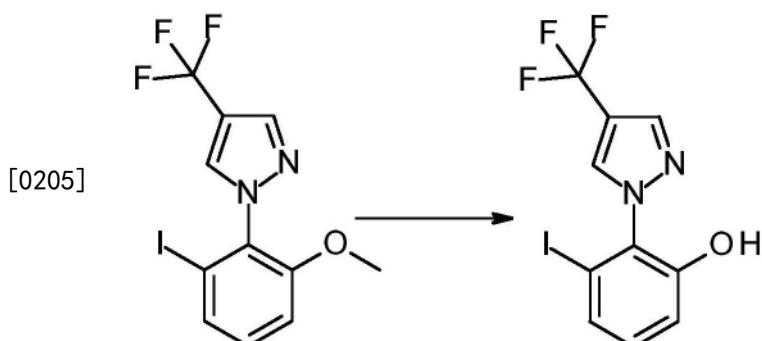
### [0200] 步驟1.1- (2-碘-6-甲氨基-苯基)-4-(三氟甲基) 吡唑的合成



[0202] 将1-(2-甲氧基苯基)-4-(三氟甲基)吡唑(270mg, 1.11mmol)、Pd(OAc)<sub>2</sub>(26mg, 0.11mmol)和N-碘代琥珀酰亚胺(284mg, 1.23mmol)在乙酸(11.5mL)中的溶液在100℃下加热2小时。使反应冷却至室温、然后在减压下蒸发至干燥并与甲苯共沸三次。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5%-30%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈淡黄色胶状物的所需产物(397mg, 97%)。

[0203] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ = 7.95 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.16 (t, 1H), 7.00 (d, 1H), 3.77 (s, 3H)

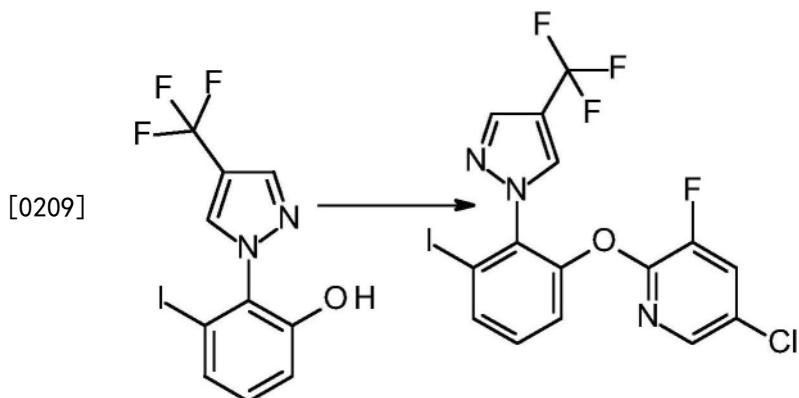
[0204] 步骤2:3-碘-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯酚的合成



[0206] 在氮气气氛下,向1-(2-碘-6-甲氧基-苯基)-4-(三氟甲基)吡唑(234mg, 0.64mmol)在二氯甲烷(12.5mL)中的溶液中逐滴添加BBr<sub>3</sub>(在DCM中的1M溶液)(1.59mL, 1.59mmol)。将反应混合物在室温下搅拌2.5小时、然后用水淬灭。将反应用饱和碳酸氢钠水溶液碱化并用DCM(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥,以给出呈米色固体的所需产物(228mg, 定量),将其不经进一步纯化使用。

[0207] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ = 8.20 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.11-7.01 (m, 2H)

[0208] 步骤3:5-氯-3-氟-2-[3-碘-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]吡啶(A57)的合成

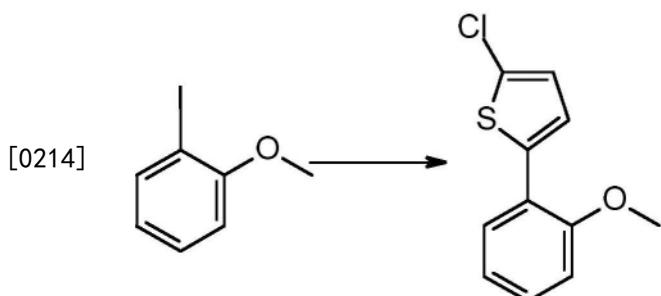


[0210] 将3-碘-2-[4-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯酚(228mg, 0.64mmol)、5-氯-2,3-二氟-吡啶(116mg, 0.77mmol)和K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(178mg, 1.29mmol)在DMF(2mL)中的溶液在80℃下加热18小时。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5%-30%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈白色固体的所需产物(210mg, 67%)。

[0211] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ=7.88 (dd, 1H), 7.80 (dd, 2H), 7.72 (s, 1H), 7.40 (dd, 1H), 7.36-7.22 (m, 2H)

[0212] 实例11:5-氯-2-[2-(5-氯-2-噻吩基)苯氧基]-3-氟-吡啶(A66)的合成

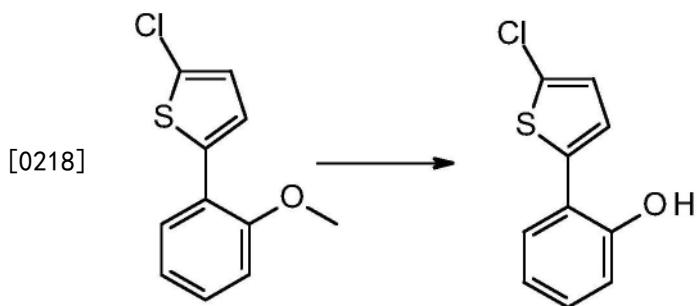
[0213] 步骤1:2-氯-5-(2-甲氧基苯基)噻吩的合成



[0215] 在N<sub>2</sub>气氛下,将1-碘-2-甲氧基-苯(500mg, 2.14mmol)、(5-氯-2-噻吩基)硼酸(416mg, 2.56mmol)、Pd(OAc)<sub>2</sub>(25mg, 0.11mmol)、2-二环己基膦基-2'-甲基联苯(MePhos)(159mg, 0.43mmol)和KF(372mg, 6.41mmol)在1,4-二噁烷(7.5mL)中的脱气溶液在回流下加热18小时。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中5%-15%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈橙色油状物的所需产物(438mg, 91%)。

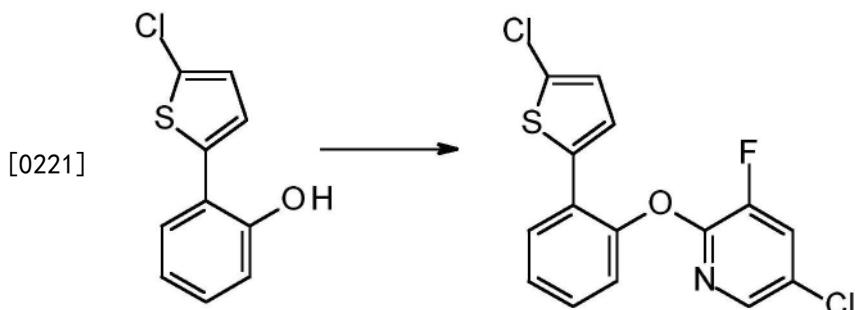
[0216] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ=7.58 (d, 1H), 7.28-7.20 (m, 2H), 7.02-6.92 (m, 2H), 6.88 (d, 1H), 3.92 (s, 3H)

[0217] 步骤2:2-(5-氯-2-噻吩基)苯酚的合成



[0219] 在 $N_2$ 气氛下,向2-氯-5-(2-甲氧基苯基)噻吩(438mg,1.95mmol)在DCM(39mL)中的溶液中逐滴添加 $BBBr_3$ (在DCM中的1M溶液)(4.87mL,4.87mmol)。将反应混合物搅拌3小时并且然后用水淬灭、用饱和碳酸氢钠水溶液变成碱性并用EtOAc( $\times 3$ )萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经 $MgSO_4$ 干燥并在减压下蒸发至干燥,以给出橙色固体(559mg),将其不经进一步纯化使用。

[0220] 步骤3:5-氯-2-[2-(5-氯-2-噻吩基)苯氧基]-3-氟-吡啶(A66)的合成

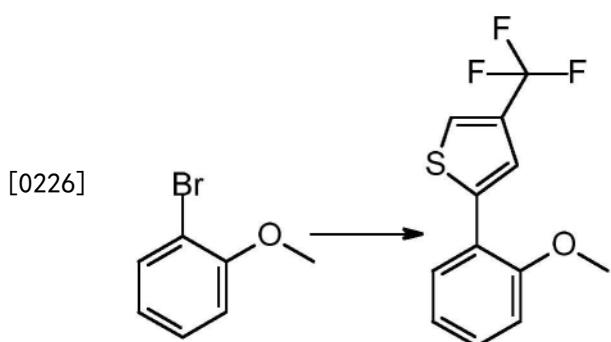


[0222] 将来自以上步骤2的粗2-(5-氯-2-噻吩基)苯酚(559mg)、5-氯-2,3-二氟-吡啶(476mg,3.18mmol)和 $K_2CO_3$ (733mg,5.31mmol)在DMF(5mL)中的搅拌溶液在80℃下加热18小时。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc( $\times 3$ )萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经 $MgSO_4$ 干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过首先使用EtOAc在环己烷中5%-25%的梯度作为洗脱液并且其次使用EtOAc在环己烷中0%-10%的梯度在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈橙色胶状物的所需产物(51mg)。

[0223]  $^1H$  NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>) $\delta$ =7.81(s,1H),7.62(d,1H),7.51(d,1H),7.40-7.22(m,2H),7.19-7.11(m,2H),6.82(s,1H)

[0224] 实例12:5-氯-3-氟-2-[2-[4-(三氟甲基)-2-噻吩基]苯氧基]吡啶(A97)的合成

[0225] 步骤1:2-(2-甲氧基苯基)-4-(三氟甲基)噻吩的合成

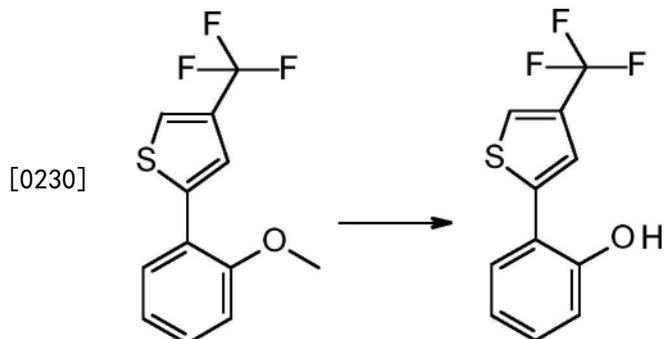


[0227] 将3-(三氟甲基)噻吩(0.56g,3.68mmol)、1-溴-2-甲氧基苯(0.688g,3.68mmol)、 $K_2CO_3$ (0.771g,5.52mmol)、 $Pd(OAc)_2$ (17mg,0.076mmol)、特戊酸(0.128mL,1.10mmol)和三环

己基膦四氟硼酸盐(54mg, 0.147mmol)在N,N-二甲基乙酰胺(12mL)中的脱气溶液在N<sub>2</sub>气氛下在100℃下加热18小时。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过两次均使用EtOAc在环己烷中0%-5%的梯度在硅胶上进行快速色谱法来纯化两次,以给出呈淡黄色油状物的所需产物(210mg, 22%)。

[0228] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7.69-7.61 (m, 2H), 7.58 (s, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.04-6.97 (m, 2H), 3.94 (s, 3H)

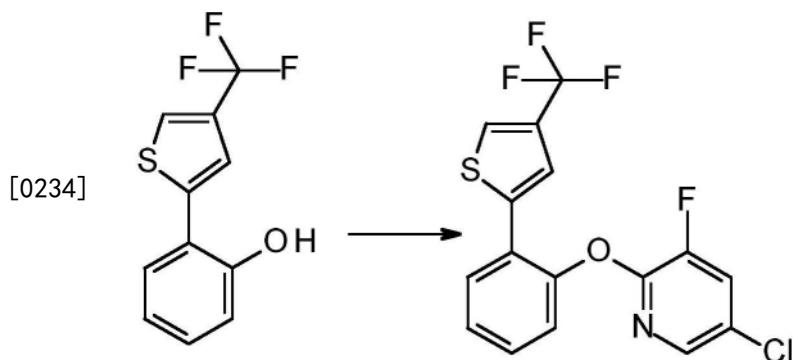
[0229] 步骤2:2-[4-(三氟甲基)-2-噻吩基]苯酚的合成



[0231] 在N<sub>2</sub>气氛下,向2-(2-甲氧基苯基)-4-(三氟甲基)噻吩(210mg, 0.81mmol)在DMF(2.5mL)中的溶液中添加1-十二烷硫醇(0.397mL, 1.626mmol)和叔丁醇锂(在THF中1M)(1.6mL, 1.6mmol)。将反应混合物在100℃下加热18小时。使反应混合物冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中0%-20%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈黄色油状物的所需产物(189mg, 95%)。

[0232] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ=7.71 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.29-7.20 (m, 1H), 6.97 (t, 1H), 6.91 (d, 1H), 5.34 (s, 1H)

[0233] 步骤3:5-氯-3-氟-2-[2-[4-(三氟甲基)-2-噻吩基]苯氧基]吡啶(A97)的合成

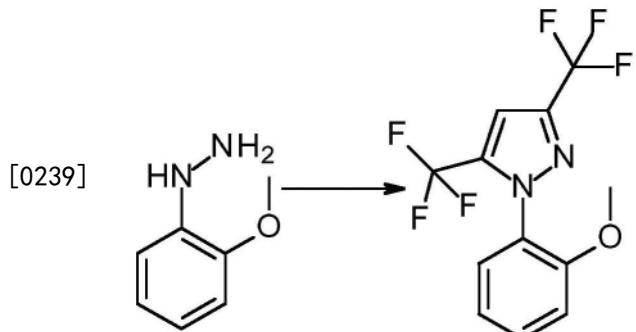


[0235] 将2-[4-(三氟甲基)-2-噻吩基]苯酚(174mg, 0.71mmol)、5-氯-2,3-二氟-吡啶(128mg, 0.86mmol)和K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(197mg, 1.43mmol)在DMF(5mL)中的溶液在微波辐射下在140℃下加热30分钟。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经MgSO<sub>4</sub>干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过首先使用EtOAc在环己烷中0%-5%的梯度作为洗脱液随后使用DCM在环己烷中0%-30%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行两次快速色谱法来纯化,以给出呈无色胶状物的所需产物(136mg, 51%)。

[0236]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ =7.80 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.52-7.48 (m, 2H), 7.40 (t, 1H), 7.31 (t, 1H), 7.20 (d, 1H)

[0237] 实例13:2-[2-[3,5-双(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]-5-氯-3-氟-吡啶(A123)的合成

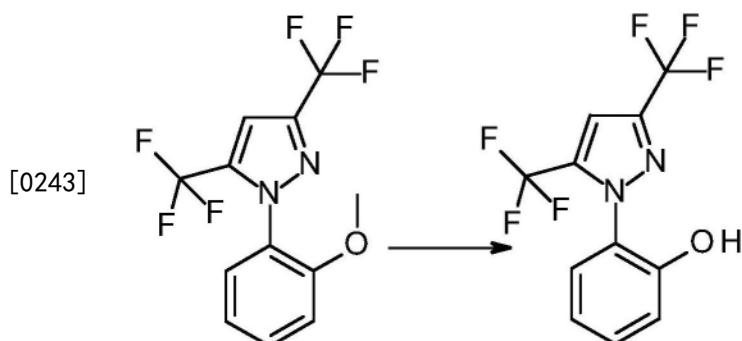
[0238] 步骤1:1-(2-甲氧基苯基)-3,5-双(三氟甲基)吡唑的合成



[0240] 将(2-甲氧基苯基)肼盐酸盐(500mg, 2.86mmol)和1,1,1,5,5,5-六氟戊烷-2,4-二酮(596mg, 2.86mmol)在EtOH(3.6mL)和浓 $\text{H}_2\text{SO}_4$ (0.1mL)中的溶液在回流下加热18小时。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc( $\times 3$ )萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经 $\text{MgSO}_4$ 干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中0%-50%的梯度作为梯度在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈黄色油状物的所需产物(101mg, 11%)。

[0241]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ =7.52 (t, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.09-7.00 (m, 3H), 3.79 (s, 3H)

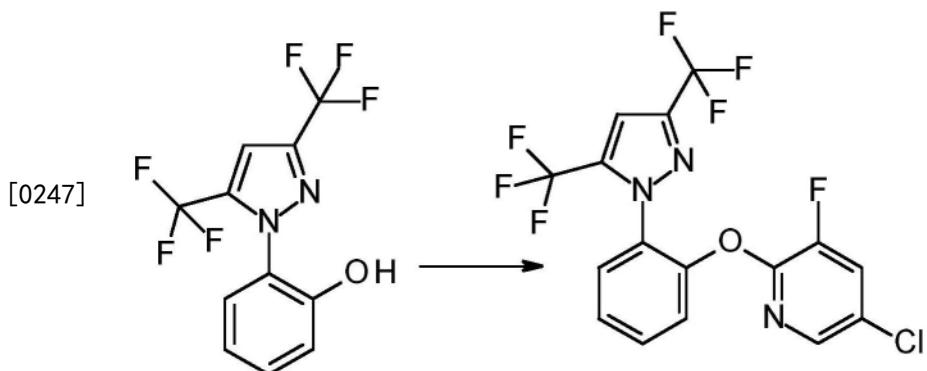
[0242] 步骤2:2-[3,5-双(三氟甲基)吡唑-1-基]苯酚的合成



[0244] 在 $\text{N}_2$ 气氛下,向1-(2-甲氧基苯基)-3,5-双(三氟甲基)吡唑(101mg, 0.33mmol)在二氯甲烷(6.5mL)中的搅拌溶液中逐滴添加三溴化硼(在DCM中的1M溶液)(0.81mL, 0.81mmol)。将反应在室温下搅拌过夜。将反应混合物用水淬灭并用DCM( $\times 3$ )萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经 $\text{MgSO}_4$ 干燥并在减压下蒸发至干燥,以给出呈黄色胶状物的所需产物(91mg, 94%),将其不经进一步纯化使用。

[0245]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ =7.45-7.30 (m, 2H), 7.18-7.07 (m, 2H), 7.02 (t, 1H), 6.32 (s, 1H)

[0246] 步骤3:2-[2-[3,5-双(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]-5-氯-3-氟-吡啶(A123)的合成

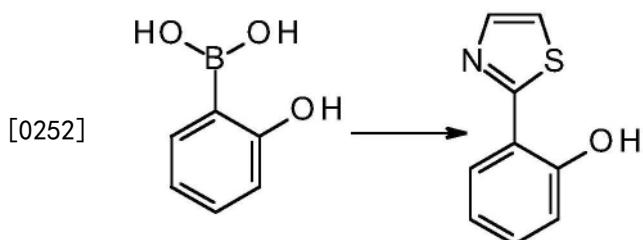


[0248] 将2-[3,5-双(三氟甲基)吡唑-1-基]苯酚(97mg,0.23mmol)、5-氯-2,3-二氟-吡啶(55mg,0.35mmol)和 $K_2CO_3$ (85mg,0.61mmol)在DMF(5mL)中的溶液在微波辐射下在140℃下加热30分钟。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经 $MgSO_4$ 干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中0%-10%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈棕色胶状物的所需产物(97mg,75%)。

[0249]  $^1H$  NMR (400MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  = 7.84 (s, 1H), 7.61 (t, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.43-7.35 (m, 2H), 6.96 (s, 1H)

[0250] 实例14:2-[2-[(5-氯-3-氟-2-吡啶基)氧基]苯基]噻唑(A147)的合成

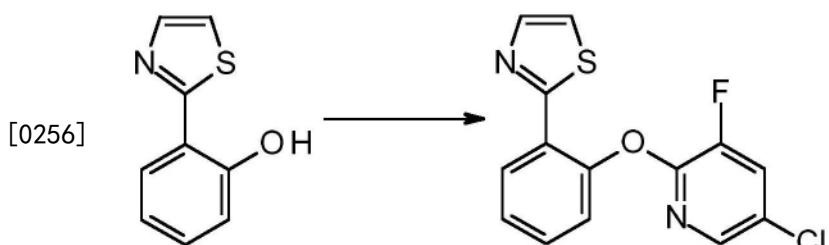
[0251] 步骤1:2-噻唑-2-基苯酚的合成



[0253] 将2-氯噻唑(260mg,2.18mmol)、(2-羟基苯基)硼酸(250mg,1.81mmol)、 $Na_2CO_3$ (576mg,5.44mmol)、四(三苯基膦)钯(21mg,0.018mmol)在甲苯(2.5mL)、EtOH(2.5mL)和水(1.25mL)中的脱气溶液在微波辐射下在160℃下加热30分钟。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc(×3)萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经 $MgSO_4$ 干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中0%-50%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化,以给出呈淡绿色油状物的所需产物(127mg,40%)。

[0254]  $^1H$  NMR (400MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  = 12.3 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.35-7.21 (m, 2H), 7.05 (d, 1H), 6.90 (t, 1H)

[0255] 步骤2:2-[2-[(5-氯-3-氟-2-吡啶基)氧基]苯基]噻唑(A147)的合成

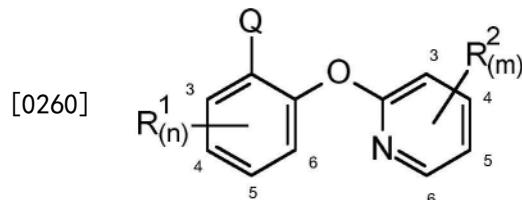


[0257] 将2-噻唑-2-基苯酚(127mg,0.72mmol)、5-氯-2,3-二氟-吡啶(129mg,0.86mmol)

和 $K_2CO_3$  (198mg, 1.43mmol) 在DMF (5mL) 中的溶液在微波辐射下在140℃下加热30分钟。使反应冷却至室温、用水稀释并用EtOAc ( $\times 3$ ) 萃取。将经合并的有机萃取物用盐水洗涤、经 $MgSO_4$  干燥并在减压下蒸发至干燥。将粗产物通过使用EtOAc在环己烷中0% - 20%的梯度作为洗脱液在硅胶上进行快速色谱法来纯化, 以给出呈淡黄色油状物的所需产物 (208mg, 95%)。

[0258]  $^1H$  NMR (400MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  = 8.42 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.41-7.32 (m, 2H), 7.21 (d, 1H)

[0259] 表1-本发明的除草化合物的实例.



化合物	n	$R^1$	Q	m	$R^2$	$^1H$ NMR (400 MHz, $CDCl_3$ , 除非说明)
A1	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	7.83 (d, 1H), 7.57 (d, 2H), 7.24-7.08 (m, 2H), 6.94-6.61 (m, 2H)
A2	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-N <sub>O<sub>2</sub></sub>	8.95 (d, 1H), 8.64-8.43 (m, 1H), 7.59 (dt, 1H), 7.32-7.10 (m, 3H), 6.97-6.53 (m, 2H)
A3	1	3-F	2-(5-三氟甲基)-噁唑	2	3-F、5-Cl	7.78 (d, 1H), 7.67-7.42 (m, 3H), 7.24-7.05 (m, 2H)
A4	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-Cl、5-Cl	8.07 - 7.40 (m, 3H), 7.23 - 7.02 (m, 2H), 7.00 - 6.51 (m, 2H)
A5	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	6-Cl	7.75-7.61 (m, 1H), 7.55-7.45 (m, 1H), 7.21-7.00 (m, 3H), 6.95-6.56 (m, 3H)
A6	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-C <sub>F<sub>3</sub></sub>	8.35 (s, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.60-7.50 (m, 1H), 7.23 - 6.99 (m, 3H), 6.80 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)

[0262]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
A7	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	6-F	7.85-7.77 (m, 1H), 7.55-7.47 (m, 1H), 7.21 - 7.02 (m, 2H), 6.95 - 6.57 (m, 4H)
A8	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-C F <sub>3</sub>	8.24 (d, 1H), 7.58-7.50 (m, 1H), 7.26 - 7.05 (m, 4H), 6.80 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)
A9	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-Cl	8.03 (d, 1H), 7.73 - 7.62 (m, 1H), 7.57 - 7.43 (m, 1H), 7.19 - 7.09 (m, 1H), 7.09 - 7.03 (m, 1H), 6.99 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.75 (t, 1H)
A10	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-F	7.76 (d, 1H), 7.53-7.48 (m, 1H), 7.41 - 7.31 (m, 1H), 7.22 - 6.98 (m, 2H), 6.88 (d, 1H), 6.75 (t, 1H)
A11	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	4-Cl 、 6-Cl	7.54-7.49 (m, 1H), 7.22 - 7.12 (m, 1H), 7.10-7.05 (m, 2H), 6.95 (s, 1H), 6.82 (d, 1H), 6.78 (t, 1H)
A12	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-C N	8.36 (d, 1H), 7.97 (dd, 1H), 7.59-7.51 (m, 1H), 7.29 - 7.06 (m, 3H), 6.81 (d, 1H), 6.75 (t, 1H)
A13	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、4-Cl	7.96 (s, 1H), 7.55 - 7.48 (m, 1H), 7.19-7.00 (m, 3H), 6.81 (d, 1H), 6.78 (t, 1H)
A14	0	-	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	1	5-N O <sub>2</sub>	8.91 (s, 1H), 8.45 (dd, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.79-7.70 (m, 2H), 7.55-7.49 (m, 1H), 7.49-7.42 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.03 (d, 1H)
A15	0	-	4-(三氟甲基)吡唑	1	5-C F <sub>3</sub>	8.32 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.89 (dd, 1H), 7.79-7.71

[0263]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			-1-基			(m, 2H), 7.52-7.46 (m, 1H), 7.46-7.38 (m, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.01 (d, 1H)
A16	0	-	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	8.18 (s, 1H), 7.81-7.73 (m, 3H), 7.51-7.43 (m, 2H), 7.40 (t, 1H), 7.32 (d, 1H)
A17	0	-	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	1	5-Cl	8.09 (s, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.49-7.41 (m, 1H), 7.41-7.33 (m, 1H), 7.25 (d, 1H), 6.88 (d, 1H)
A18	0	-	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-F	8.20 (s, 1H), 7.81-7.73 (m, 2H), 7.72 (s, 1H), 7.49-7.42 (m, 1H), 7.41-7.34 (m, 1H), 7.34-7.22 (m, 2H)
A19	0	-	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	1	5-C <sub>N</sub>	8.34 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.90 (dd, 1H), 7.79-7.70 (m, 2H), 7.55-7.48 (m, 1H), 7.48-7.41 (m, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.01 (d, 1H)
A20	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Br	7.90 (d, 1H), 7.66 (dd, 1H), 7.52 (dt, 1H), 7.17 (ddd, 1H), 7.10 (td, 1H), 6.95 - 6.57 (m, 2H)
A21	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-C <sub>F<sub>3</sub></sub>	8.11 (dd, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.56 (dt, 1H), 7.26 - 7.18 (m, 1H), 7.16 (td, 1H), 6.92 - 6.57 (m, 2H)
A22	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-N <sub>O<sub>2</sub></sub>	8.73 (d, 1H), 8.32 (dd, 1H), 7.60 (dt, 1H), 7.30 - 7.22 (m, 1H), 7.18 (td, 1H), 6.94 - 6.56 (m, 2H)
A23	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异	2	3-F、5-C <sub>N</sub>	8.08 (d, 1H), 7.79 (dd, 1H), 7.57 (dt, 1H), 7.23 (ddd, 1H), 7.15 (td, 1H),

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)	
			噁唑			6.97 - 6.58 (m, 2H)	
A24	0	-	4-(氯)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.81(s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.37-7.28 (m, 2H), 7.19 (dd, 1H)	
A25	1	3-F	3-(5-三氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	7.81 (s, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.15 (t, 1H), 7.10 (d, 1H), 6.99 (s, 1H)	
A26	0	-	4-氯基吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	8.32 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.79 (dd, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.51-7.45 (m, 1H), 7.45-7.39 (m, 1H), 7.30 (dd, 1H)	
[0264]	A27	0	-	4-溴吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.91 (s, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.44-7.33 (m, 2H), 7.27 (dd, 1H)
	A28	0	-	咪唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.71 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.51-7.34 (m, 4H), 7.31 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.03 (s, 1H)
A29	0		1,2,4-三唑-1-基	2	3-F、5-Cl	8.58 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.82-7.78 (m, 2H), 7.52-7.38 (m, 3H), 7.32 (d, 1H)	
A30	1	3-F	3-(5-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	8.80 (s, 1H), 7.55-7.40 (m, 2H), 7.18 (t, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)	
A31	1	3-F	5-(3-三氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	7.82 (s, 1H), 7.57-7.51 (m, 2H), 7.18 (t, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.88 (s, 1H)	
A32	1	3-CN	4-(三氟甲基)吡唑	1	5-Cl	8.00 (d, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.73 (d, 1H),	

[0265]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			-1-基			7.67-7.55 (m, 3H), 6.85 (d, 1H)
A33	1	3-CN	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	8.03 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.78-7.70 (m, 2H), 7.67-7.60 (m, 2H), 7.48 (dd, 1H)
A34	1	3-CN	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3,5-二-F	8.03 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.75-7.70 (m, 2H), 7.65-7.60 (m, 2H), 7.30 (ddd, 1H)
A35	1	3-F	2-(5-二氟甲基)-噁唑	2	3-F、5-Cl	7.78 (s, 1H), 7.55-7.45 (m, 2H), 7.38 (s, 1H), 7.20-7.10 (m, 2H), 6.68 (t, 1H)
A36	1	3-OMe	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.78 (s, 1H), 7.72 (s, 2H), 7.47 (t, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.00-6.91 (m, 2H), 3.83 (s, 3H)
A37	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-CN、5-Cl	8.15 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.60-7.52 (m, 1H), 7.27-7.20 (m, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.76 (t, 1H)
A38	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-N <sub>2</sub> 、5-Cl	8.41 (d, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.60-7.54 (m, 1H), 7.24 (t, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.74 (t, 1H)
A39	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-S <sub>2</sub> O <sub>2</sub> M <sub>2</sub> e	8.36 (d, 1H), 7.99 (dd, 1H), 7.59 (td, 1H), 7.28-7.24 (m, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.76 (t, 1H), 3.10 (s, 3H)
A40	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-S <sub>2</sub> O <sub>2</sub> M <sub>2</sub> e	8.61 (d, 1H), 8.22 (dd, 1H), 7.59-7.53 (m, 1H), 7.25-7.19 (m, 2H), 7.12 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 3.08 (s, 3H)。
A41	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-Br	8.13 (d, 1H), 7.82 (dd,

[0266]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			甲基)-异噁唑			1H), 7.51 (dt, 1H), 7.14 (ddd, 1H), 7.06 (td, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)
A42	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	7.83 (d, 1H), 7.53-7.40 (m, 3H), 7.21 (dd, 1H), 6.78 (t, 1H), 6.69 (s, 1H)
A43	0	-	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	8.05 (dd, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.59 (dd, 1H), 7.56-7.50 (m, 1H), 7.39 (dt, 1H), 7.29-7.21 (m, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)
A44	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	7.84 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.50-7.40 (m, 2H), 7.23 (d, 1H), 6.80 (t, 1H), 6.64 (s, 1H)
A45	0	-	1,2,3-三唑-2-基	2	3-F、5-Cl	7.84 (dd, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.60 (s, 2H), 7.45-7.28 (m, 4H)
A46	1	3-NO <sub>2</sub>	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.99 (s, 1H), 7.89 (dd, 1H), 7.84-7.73 (m, 2H), 7.72-7.60 (m, 2H), 7.49 (dd, 1H)
A47	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	6-CF <sub>3</sub>	7.87 (t, 1H), 7.53-7.48 (m, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.20-7.12 (m, 3H), 6.79 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)
A48	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	6-O CF <sub>2</sub> H	7.77 (t, 1H), 7.52-7.48 (m, 1H), 7.14 (t, 1H), 7.08 (d, 1H), 6.95 (t, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.76 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.60 (d, 1H)
A49	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	3-CN	8.23 (d, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.60-7.52 (m, 1H), 7.25-7.10 (m, 3H), 6.87

[0267]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
						(s, 1H), 6.65 (t, 1H)
A50	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	5,6-二-F	7.62-7.55 (m, 1H), 7.54-7.49 (m, 1H), 7.18-7.10 (m, 2H), 6.87 (s, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.61 (dd, 1H)
A51	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-Cl、5-CF <sub>3</sub>	8.20 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.58-7.53 (m, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.14 (d, 1H), 6.90 (s, 1H), 6.78 (t, 1H)
A53	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	3-F	7.86 (d, 1H), 7.54-7.45 (m, 2H), 7.18-7.08 (m, 2H), 7.05-7.00 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)
A54	1	3-Me	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.80 (s, 1H), 7.79-7.70 (m, 2H), 7.49-7.34 (m, 2H), 7.24 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 2.18 (s, 3H)
A55	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	6-C HF <sub>2</sub>	7.85 (t, 1H), 7.52-7.45 (m, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.17-7.05 (m, 3H), 6.80 (s, 1H), 6.73 (t, 1H), 6.32 (t, 1H)
A56	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-Et	8.00 (d, 1H), 7.49-7.42 (m, 1H), 7.08 (t, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.88-6.85 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.77 (t, 1H), 2.67 (q, 2H), 1.27 (t, 3H)
A57	1	3-I	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	1	3-F、5-Cl	7.88 (dd, 1H), 7.80 (dd, 2H), 7.72 (s, 1H), 7.40 (dd, 1H), 7.36-7.22 (m, 2H)
A58	1	3-F	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	1	3-F、5-Cl	7.84 (s, 1H), 7.76 (s, 2H), 7.53-7.45 (m, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.22-7.12 (m, 2H)
A59	1	3-Br	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	1	3-F、	7.81-7.70 (m, 3H), 7.65

[0268]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			基)吡唑-1-基		5-Cl	(d, 1H), 7.48-7.35 (m, 2H), 7.30 (d, 1H)
A60	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-Cl	8.30 (d, 1H), 7.60-7.52 (m, 1H), 7.23 (t, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.85-6.50 (m, 3H), 6.77 (t, 1H)
A61	2	3,4-二-Br	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.85 (d, 1H), 7.82-7.78 (m, 2H), 7.72 (s, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.25 (d, 1H)
A62	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-O CF <sub>3</sub>	8.29 (d, 1H), 7.58-7.52 (m, 1H), 7.22 (q, 1H), 7.04 (d, 1H), 6.87-6.80 (m, 3H), 6.76 (t, 1H)
A63	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-N O <sub>2</sub> 、4-M e	7.98 (d, 1H), 7.53 (q, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.14 (d, 1H), 6.96 (d, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.76 (t, 1H), 2.43 (s, 3H)
A64	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-O CF <sub>3</sub>	8.00 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.55-7.49 (m, 1H), 7.15 (t, 1H), 7.10-7.04 (m, 2H), 6.80 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)
A65	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-M e	7.98 (d, 1H), 7.48 (q, 1H), 7.10 (t, 1H), 7.04 (d, 1H), 6.87-6.77 (m, 3H), 6.75 (t, 1H), 2.47 (s, 3H)
A66	0	-	5-氯-2-噻吩基	2	3-F、5-Cl	7.81 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.40-7.22 (m, 2H), 7.19-7.11 (m, 2H), 6.82 (d, 1H)
A67	0	-	5-氯基-2-噻吩基	2	3-F、5-Cl	7.81 (s, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.60-7.49 (m, 2H), 7.43 (t, 1H), 7.40-7.31 (m, 2H), 7.20 (d, 1H)
A69	0	-	5-氯-3-噻	2	3-F、	7.77 (s, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.41-7.32

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)	
			吩基		5-Cl	(m, 1H), 7.32-7.26 (m, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.20-7.11 (m, 2H)	
A70	0	-	3-噻吩基	2	3-F、5-Cl	7.75 (s, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.36-7.21 (m, 4H), 7.20 (d, 1H)	
A71	0	-	4-甲氧基-2-噻吩基	2	3-F、5-Cl	7.81 (s, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.38-7.24 (m, 2H), 7.14 (d, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.20 (s, 1H), 3.77 (s, 3H)	
A72	0	-	2,5-二甲基吡唑-3-基	2	3-F、5-Cl	7.74 (s, 1H), 7.44-7.50 (m, 1H), 7.41-7.30 (m, 3H), 7.25-7.21 (m, 1H), 5.92 (s, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.19 (s, 3H)	
[0269]	A73	0	-	2-甲基-5-(三氟甲基)吡唑-3-基	2	3-F、5-Cl	7.78 (s, 1H), 7.59-7.51 (m, 1H), 7.45-7.36 (m, 3H), 7.30-7.22 (m, 1H), 6.41 (s, 1H), 3.82 (s, 3H)
	A74	0	-	5-甲基硫烷基-1,3,4-噻二唑-2-基	2	3-F、5-Cl	8.45 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.39 (t, 1H), 7.20 (d, 1H), 2.81 (s, 3H)
A75	0		5-甲基磺酰基-1,3,4-噻二唑-2-基	0	3-F、5-Cl	8.60 (d, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.68-7.55 (m, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.28-7.20 (m, 1H), 3.48 (s, 3H)	
A76	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-Me、6-CN	7.87 (d, 1H), 7.55-7.50 (m, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.75 (t, 1H), 2.35 (s, 3H)	
A77	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异	1	5-C HF <sub>2</sub>	8.20 (d, 1H), 7.55-7.48 (m, 1H), 7.19-7.10 (m,	

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)	
			噁唑			3H), 7.08 (d, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.65 (t, 1H)	
A78	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	4,5-二-CF <sub>3</sub>	8.52 (s, 1H), 7.60-7.54 (m, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.25 (t, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.77 (t, 1H)	
A79	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	6-CN	7.85 (t, 1H), 7.55-7.50 (m, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.72 (t, 1H)	
A80	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-CF <sub>3</sub> , 6-Cl	8.02(d, 1H), 7.55-7.50 (m, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.11 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.78 (t, 1H)	
[0270]	A81	0	-	4-(三氟甲基)三唑-2-基	2	3-F、5-Cl	7.93 (d, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.54 (t, 1H), 7.50-7.39 (m, 3H)
	A82	0	-	4-(三氟甲基)三唑-1-基	2	3-F、5-Cl	8.33 (s, 1H), 7.81-7.89 (m, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.38 (d, 1H)
A83	1	6-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	7.99 (dd, 1H), 7.78 (dd, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.59 (dd, 1H), 7.34 (t, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)	
A84	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-CN、5-F	8.11 (s, 1H), 7.72-7.66 (m, 2H), 7.47 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.74 (t, 1H), 6.70 (s, 1H)	
A85	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-CN、5-F	8.11 (s, 1H), 7.72-7.68 (m, 1H), 7.57-7.48 (m, 2H), 7.28-7.22 (m, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.74 (t, 1H)	
A86	1	3-Br	5-(3-二氟	1	4-Cl	8.01 (d, 1H), 7.61 (d,	

[0271]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			甲基)-异噁唑			1H), 7.43 (t, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.77 (t, 1H), 6.57 (s, 1H)
A87	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-C N	8.25 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.25-7.18 (m, 2H), 7.10 (s, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.58 (s, 1H)
A88	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-N O <sub>2</sub>	8.98 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.50 (t, 1H), 7.28-7.22 (m, 1H), 6.99 (d, 1H), 6.74 (t, 1H), 6.60 (s, 1H)
A89	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3,5- 二 -Cl	7.90 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.44 (t, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.76 (t, 1H), 6.64 (s, 1H)
A90	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-C F <sub>3</sub>	8.36 (s, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.24 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.72 (t, 1H), 6.58 (s, 1H)
A91	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-C N	8.26 (d, 1H), 7.57-7.45 (m, 2H), 7.21-7.16 (m, 2H), 7.14 (s, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.63 (s, 1H)
A92	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-Cl	8.00 (d, 1H), 7.50 (t, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.61 (s, 1H)
A93	1	6-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、 5-Cl	7.85 - 7.79 (m, 2H), 7.60 (dd, 1H), 7.41 (dt, 1H), 7.37 - 7.30 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.77 (t, 1H)
A94	1	6-Me	5-(3-二氟甲基)-异	2	3-F、 5-Cl	7.85 (dd, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.46 -

[0272]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			噁唑			7.39 (m, 1H), 7.39 - 7.33 (m, 1H), 6.73 (t, 1H), 6.72 (s, 1H), 2.18 (s, 3H)
A95	1	6-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	7.95 (dd, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.60 (dt, 2H), 7.40 (t, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)
A96	0	-	4-甲氧基吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.79-7.72 (m, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.39-7.31 (m, 3H), 7.30-7.22 (m, 1H), 3.71 (s, 3H)
A97	0	-	4-(三氟甲基)噻吩-2-基	2	3-F、5-Cl	7.80 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.52-7.48 (m, 2H), 7.40 (t, 1H), 7.31 (t, 1H), 7.20 (d, 1H)
A98	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	6-F	7.74 (q, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.29-7.20 (m, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.70 (d, 1H), 6.65-6.55 (m, 2H)
A99	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-C <sub>F<sub>3</sub></sub>	8.26 (d, 1H), 7.64 (dd, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.29-7.18 (m, 2H), 7.08 (s, 1H), 6.73 (t, 1H), 6.56 (s, 1H)
A100	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-Cl	8.04 (s, 1H), 7.63-7.57 (m, 2H), 7.41 (t, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.76 (t, 1H), 6.57 (s, 1H)
A101	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3,5-二-F	7.85 (s, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.21 (t, 1H), 6.93 (d, 1H), 6.84 (t, 1H), 6.75 (s, 1H)
A102	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异	1	5-C <sub>N</sub>	8.39 (s, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.25 (d, 1H), 6.95 (d, 1H),

[0273]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			噁唑			6.73 (t, 1H), 6.58 (s, 1H)
A103	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Br	7.93 (s, 1H), 7.67-7.55 (m, 2H), 7.45 (t, 1H), 7.27 (d, 1H), 6.77 (t, 1H), 6.66 (s, 1H)
A104	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-C F <sub>3</sub>	8.14 (s, 1H), 7.71-7.62 (m, 2H), 7.48 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.66 (s, 1H)
A105	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-C N、5-Cl	8.18 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.71 (s, 1H)
A106	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-Br	8.15 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.60 d, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 6.76 (t, 1H), 6.56 (s, 1H)
A107	1	3-Br	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	3-C N	8.26 (s, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.11 (m, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.69 (s, 1H)
A108	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-N O <sub>2</sub>	8.98 (s, 1H), 8.49 (d, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.24 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.67 (s, 1H)
A109	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3,5-二-Cl	7.90 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.51 (t, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.68 (s, 1H)
A110	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-C F <sub>3</sub>	8.35 (s, 1H), 7.89 (dd, 1H), 7.54-7.42 (m, 2H), 7.20 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.71 (t, 1H), 6.61 (s, 1H)
A111	1	3-Cl	5-(3-二氟	1	6-F	7.75 (q, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.20 (d,

[0274]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			甲基)-异噁唑			1H), 6.75 (t, 1H), 6.77-6.70 (m, 1H), 6.65-6.58 (m, 2H)
A112	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	4-C F <sub>3</sub>	8.26 (d, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.23 - 7.18 (m, 2H), 7.11 (s, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.60 (s, 1H)
A113	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-Cl	8.05 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.49 (t, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.19 (d, 1H) 6.86 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.51 (s, 1H)
A114	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3,5-二-F	7.86 (s, 1H), 7.47-7.40 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 7.90 (d, 1H), 6.83 (t, 1H), 6.77 (s, 1H)
A115	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-C N	8.38 (s, 1H), 7.91 (d, 1H), 7.55-7.45 (m, 2H), 7.20 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.74 (t, 1H), 6.64 (s, 1H)
A116	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Br	7.91 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.52-7.42 (m, 2H), 7.20 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 6.70 (s, 1H)
A117	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-C F <sub>3</sub>	8.12 (s, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.58-7.45 (m, 2H), 7.28-7.22 (m, 1H), 6.74 (t, 1H), 6.70 (s, 1H)
A118	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-C N、5-C F <sub>3</sub>	8.19 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.58-7.49 (m, 2H), 7.29-7.21 (m, 1H), 6.75 (s, 1H), 6.75 (t, 1H)
A119	1	3-Cl	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-Br	8.14 (s, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.49 (t, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.76 (t, 1H), 6.61 (s, 1H)
A120	1	3-Cl	5-(3-二氟	1	3-C N	8.25 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.58-7.45 (m, 2H),

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			甲基)-异噁唑			7.30-7.23 (m, 1H), 7.12-7.08 (m, 1H), 6.74 (t, 1H), 6.73 (s, 1H)
A121	0	-	3-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.89 (s, 1H), 7.80-7.71 (m, 2H), 7.49-7.42 (m, 2H), 7.40 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 6.56 (s, 1H)
A122	0	-	5-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.82 (s, 1H), 7.60-7.53 (m, 2H), 7.51 (d, 1H), 7.41-7.32 (m, 3H), 6.70 (s, 1H)
A123	0	-	3,5-双(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.84 (s, 1H), 7.61 (t, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.43-7.35 (m, 2H), 6.96 (s, 1H)
[0275]	A124	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	4-Cl 、 5-C O <sub>2</sub> E t	8.60 (s, 1H), 7.55-7.50 (m, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.75 (t, 1H), 4.37 (q, 2H), 1.38 (t, 3H)
	A126	0	-	5-(3-甲基-1,2,4-噁二唑)	3-F、5-Cl	8.20 (d, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.66 (t, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.44 (t, 1H), 7.30 (d, 1H), 2.38 (s, 3H)
A128	0	-	3-(5-甲基-1,2,4-噁二唑)	3-F、5-Cl	8.16 (d, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.56 (t, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.30 (d, 1H), 2.55 (s, 3H)	
A129	0	-	2-(4-甲基-噻唑)	3-F、5-Cl	8.35 (d, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.35 (t, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.87 (s, 1H), 2.46 (s, 3H)	
A130	0	-	2-(5-甲基-1,3,4-噁二唑)	3-F、5-Cl	8.12 (d, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.60 (t, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.31 (d, 1H), 2.49 (s, 3H)	
A131	0	-	4-(5-甲基	2	3-F、	7.76 (d, 1H), 7.62 (d,

[0276]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			-噻二唑)		5-Cl	1H), 7.55 (t, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.37 (dd, 1H), 7.31 (d, 1H), 2.58 (s, 3H)
A132	0	-	2-(1,3,4-噁二唑)	2	3-F、5-Cl	8.40 (s, 1H), 8.17 (d, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.62 (t, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.44 (t, 1H), 7.31 (d, 1H)
A137	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-C O <sub>2</sub> E t、 6-Cl	8.25 (d, 1H), 7.55-7.50 (m, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.75 (t, 1H), 4.38 (q, 2H), 1.40 (t, 3H)
A142	0	-	2-(5-二氟甲基硫烷基)-1,3,4-噻二唑	2	3-F、5-Cl	8.52 (d, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.58-7.51 (m, 1H), 7.45-7.37 (m, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.22 (d, 1H)
A143	0	-	3-甲基咪唑-4-基	2	3-F、5-Cl	8.86 (br, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.65-7.58 (m, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.42-7.37 (m, 2H), 7.23 (t, 2H), 3.80 (s, 3H)
A144	0	-	2-甲基吡唑-3-基	2	3-F、5-Cl	7.98 (d, 1H), 7.29 (s, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.35-7.24 (m, 3H), 7.17 (d, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.90 (s, 3H)
A145	0	-	5-异噻唑	2	3-F、5-Cl	8.42 (s, 1H), 7.82-7.75 (m, 2H), 7.58-7.51 (m, 2H), 7.45 (t, 1H), 7.36 (t, 1H), 7.25 (d, 1H)
A146	0	-	5-噻唑	2	3-F、5-Cl	8.73 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.21 (d, 1H)
A147	0	-	2-噻唑	2	3-F、5-Cl	8.42 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.41-7.32

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)	
						(m, 2H), 7.21 (d, 1H)	
A148	0	-	3-呋喃	2	3-F、5-Cl	7.78 (d, 2H), 7.56 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.36-7.21 (m, 2H), 7.16 (d, 1H), 6.69 (s, 1H)	
A149	0	-	2-呋喃	2	3-F、5-Cl	7.98-7.88 (m, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.35-7.26 (m, 2H), 7.20-7.12 (m, 1H), 6.73 (s, 1H), 6.41 (s, 1H)	
A154	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	5-C O <sub>2</sub> E t、 6-M e	8.25 (d, 1H), 7.50 (q, 1H), 7.13 (t, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.84-6.78 (m, 2H), 6.75 (t, 1H), 4.37 (q, 2H), 2.61 (s, 3H), 1.37 (t, 3H)	
[0277]	A156	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	4-C O <sub>2</sub> E t、 6-Br	7.75 (s, 1H), 7.55-7.48 (m, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.17 (t, 1H), 7.10 (d, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.76 (t, 1H), 4.42 (q, 2H), 1.40 (t, 3H)
	A158	1	3-CF <sub>3</sub>	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.83-7.78 (m, 2H), 7.78-7.67 (m, 3H), 7.60 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H)
A159	1	3-Cl	4-(三氟甲基)吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.81-7.71 (m, 3H), 7.53-7.42 (m, 2H), 7.40 (dd, 1H), 7.29 (dd, 1H)	
A160	1	3-CN	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3,5-二-F	7.81 - 7.71 (m, 2H), 7.66 (t, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.38 (ddd, 1H), 6.98 (s, 1H), 6.80 (t, 1H)	
A161	1	3-CN	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	1	5-Cl	8.03 (d, 1H), 7.78 - 7.68 (m, 2H), 7.65 (t, 1H), 7.51 (dd, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.79 (t, 1H)	
A162	1	3-CN	5-(3-二氟甲基)-异	2	3-F、5-Cl	7.82 (d, 1H), 7.77 (dd, 1H), 7.67 (t, 1H), 7.59 -	

[0278]

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)
			噁唑			7.54 (m, 2H), 6.98 (s, 1H), 6.80 (t, 1H)
A163	0	-	3-(5-二氟甲基)-异噁唑	2	3-F、5-Cl	7.97 (d, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.58-7.50 (m, 2H), 7.38 (t, 1H), 7.22 (d, 1H), 6.95 (s, 1H), 6.73 (t, 1H)
A167	0	-	吡唑-1-基	2	3-F、5-Cl	7.86 (s, 1H), 7.82-7.71 (m, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.40-7.32 (m, 2H), 7.32-7.22 (m, 1H), 6.31 (s, 1H)
A168	0	-	(4-二氟甲基)-三唑-2-基	2	3-F、5-Cl	7.90 (d, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.49-7.37 (m, 3H), 6.75 (t, 1H)
A169	0	-	(4-二氟甲基)-三唑-1-基	2	3-F、5-Cl	8.25 (s, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.52-7.40 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 6.88 (t, 1H)
A170	0	-	2(5-二氟甲基)-噁唑	2	3-F、5-Cl	8.10 (d, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.25-7.20 (m, 2H), 6.55 (t, 1H)
A171	1	4-Cl	塞唑-2-基	2	3-F、5-Cl	8.43 (s, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.43-7.37 (m, 2H), 7.16 (d, 1H)
A172	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	5-Cl、6-C N	7.85 (d, 1H), 7.57-7.52 (m, 1H), 7.26-7.18 (m, 2H), 7.10 (d, 1H), 6.85 (d, 1H), 6.67 (t, 1H)
A173	1	3-F	5-(3-二氟甲基)-异噁唑	2	3-C N、4-Cl	8.19 (s, 1H), 7.56-7.52 (m, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.07 (d, 1H), 6.84 (d, 1H), 6.76 (t, 1H)
A174	1	3-F	塞唑-2-基	2	3-F、5-Cl	7.82 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.50-7.39 (m, 3H), 7.14 (t, 1H), 7.09 (d, 1H)

化合物	n	R <sup>1</sup>	Q	m	R <sup>2</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 除非说明)	
[0279]	A175	1	3-Br	塞唑-2-基	2	3-F、5-Cl	7.84 (dd, 2H), 7.61 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.41-7.35 (m, 2H), 7.25-7.20 (m, 1H)
	A176	1	3-Cl	塞唑-2-基	2	3-F、5-Cl	7.88-7.80 (m, 2H), 7.48-7.41 (m, 3H), 7.38 (d, 1H), 7.21-7.15 (m, 1H)

[0280] 生物学实例

[0281] 将多种测试物种的种子播种在盆中的标准土壤中(多年生黑麦草(*Lolium perenne*) (LOLPE)、龙葵(*Solanum nigrum*) (SOLNI)、反枝苋(*Amaranthus retroflexus*) (AMARE)、大狗尾草(*Setaria faberii*) (SETFA)、稗草(*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG)、牵牛花(*Ipomoea hederacea*) (IPOHE))。在温室中在受控条件(在24℃/16℃白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度)下培养一天后(出苗前)或八天培养后(出苗后),用水性喷雾溶液喷洒这些植物,该水性喷雾溶液源自工业级活性成分在丙酮/水(50:50)溶液中的配制品,该溶液含有0.5%吐温20(聚氧乙烯脱水山梨糖醇单月桂酸酯,CAS RN9005-64-5)。除非另有说明,否则化合物以500g/ha施用。然后使测试植物在温室中在受控条件(在24℃/16℃白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度)下生长,并且每天浇水两次。对于出苗前和出苗后13天后,对测试给植物造成的损害百分比进行评估。以五分制形式将生物活性示于下表中(5=81% - 100%; 4=61% - 80%; 3=41% - 60%; 2=21% - 40%; 1=0% - 20%)。

## [0282] 表B1.出苗后测试

化合物	施用率(g/ha)	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
[0283]	A1	500	5	5	5	5	5
	A2	500	5	5	5	5	4
	A3	500	2	3	4	1	1
	A4	500	5	5	3	1	1

[0284]

化 合 物	施用率 (g/ha)	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A6	500	4	5	5	4	5	3
A7	500	2	5	5	2	4	2
A8	500	2	5	4	1	2	1
A9	500	5	5	5	5	5	4
A10	500	5	5	5	5	5	5
A12	500	5	5	5	5	5	5
A14	1000	5	5	5	5	5	4
A15	1000	1	4	3	1	2	2
A16	1000	4	5	5	5	5	5
A17	1000	5	5	5	5	5	5
A18	250	3	3	3	2	4	2
A19	1000	5	5	5	5	5	5
A20	1000	5	5	4	4	4	5
A21	1000	4	3	4	3	4	3
A22	1000	4	4	3	2	2	3
A23	1000	5	5	5	5	5	5
A24	1000	4	4	4	3	4	3
A25	1000	5	5	5	5	4	4
A26	1000	5	5	5	3	5	3
A27	250	4	5	5	2	5	2
A28	1000	5	4	1	1	1	1
A29	1000	4	4	2	1	1	2
A30	1000	5	5	5	5	5	5
A31	1000	5	5	5	5	5	5
A32	1000	5	5	5	5	5	5
A33	1000	5	5	5	5	5	5
A34	1000	5	5	5	5	5	5
A35	1000	5	5	4	1	1	2
A36	1000	5	5	5	4	4	2
A37	1000	5	5	5	4	4	5
A38	1000	5	5	1	1	1	1
A39	1000	3	3	1	1	1	1
A40	1000	3	4	1	1	1	1
A41	1000	5	5	5	5	5	5
A42	250	5	5	5	5	4	4
A43	1000	5	5	5	5	4	4
A44	1000	5	5	5	5	5	5

[0285]

化 合 物	施用率 (g/ha)	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A46	1000	5	5	4	3	3	2
A47	1000	3	3	1	1	1	1
A48	1000	5	5	2	1	1	2
A49	1000	5	5	2	1	3	3
A50	1000	3	5	3	1	2	1
A51	1000	4	5	1	1	1	1
A54	1000	3	5	5	4	3	1
A55	1000	5	5	2	1	1	1
A57	1000	5	5	4	1	1	2
A58	1000	5	5	5	5	4	5
A59	1000	5	5	5	4	3	5
A60	1000	4	4	2	1	1	2
A61	1000	5	5	2	1	1	2
A62	1000	4	3	3	2	3	3
A66	1000	5	5	2	1	3	2
A69	1000	3	4	3	1	4	2
A70	1000	3	4	2	1	3	1
A71	1000	4	5	2	1	1	1
A76	250	2	4	1	1	1	3
A77	250	5	5	5	2	2	1
A78	1000	3	4	1	1	1	1
A80	1000	5	5	1	1	1	1
A81	1000	5	4	4	1	4	2
A82	1000	5	5	5	5	4	5
A83	1000	5	4	4	4	4	2
A84	1000	5	5	5	5	5	5
A85	1000	5	5	5	5	5	5
A86	1000	4	4	4	4	4	4
A87	1000	4	4	5	3	3	3
A88	1000	5	4	4	3	4	2
A89	1000	5	4	5	3	4	4
A90	1000	5	4	5	4	4	4
A91	1000	4	4	4	4	4	4
A92	1000	4	4	4	4	4	4
A93	1000	5	3	5	3	4	3
A94	1000	4	4	3	2	2	1
A95	1000	4	4	4	3	3	1

[0286]

化 合 物	施用率 (g/ha)	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A97	1000	5	4	5	3	4	4
A98	1000	4	4	5	3	4	3
A99	1000	5	4	4	3	4	2
A100	250	5	NT	5	NT	5	2
A101	1000	5	5	5	4	4	5
A102	1000	5	5	5	4	4	5
A103	1000	5	5	5	5	4	5
A104	1000	4	5	4	3	4	4
A105	1000	5	5	5	4	4	5
A106	1000	5	5	5	5	4	4
A107	1000	5	5	5	3	4	4
A108	1000	5	4	4	4	4	3
A109	1000	5	5	5	3	4	4
A110	1000	5	5	5	4	4	4
A111	1000	5	5	5	4	4	4
A112	1000	4	4	4	3	3	3
A113	1000	5	4	5	5	4	5
A114	1000	5	5	5	4	4	5
A115	1000	5	5	5	4	4	5
A116	1000	5	5	5	5	4	5
A117	1000	5	4	4	4	4	5
A118	1000	5	5	5	5	5	5
A119	1000	5	5	5	5	4	5
A120	1000	5	5	5	3	4	4
A121	1000	4	4	3	1	3	2
A159	1000	5	5	5	4	3	4
A160	1000	5	5	5	5	5	5
A161	1000	5	5	5	5	5	5
A162	1000	5	5	5	5	4	5
A163	250	5	NT	5	NT	5	3
A169	250	5	NT	5	NT	5	5

[0287] NT=未测试

[0288] 表B2.出苗前测试

[0289]

化 合 物	施用率 (g/ha)	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A1	500	5	5	5	5	5	5

[0290]

化 合 物	施用率 (g/ha)	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A2	500	5	4	5	4	5	2
A3	500	3	3	3	1	3	1
A4	500	3	3	2	1	2	1
A6	500	5	5	5	4	4	2
A7	500	5	5	4	1	4	1
A8	500	5	4	3	1	2	1
A9	500	5	5	5	4	5	3
A10	500	5	5	5	5	5	5
A12	500	5	5	5	5	5	5
A14	1000	5	5	5	5	5	3
A15	1000	5	4	5	3	5	1
A16	1000	5	5	5	5	5	5
A17	1000	5	5	5	5	5	5
A18	250	5	5	5	1	5	1
A19	1000	5	5	5	5	5	5
A20	1000	4	3	5	5	5	3
A21	1000	5	2	5	4	5	2
A22	1000	5	1	3	1	3	1
A23	1000	5	4	5	5	5	5
A24	1000	5	3	5	4	5	3
A25	1000	5	5	5	5	5	5
A26	1000	5	5	5	5	5	4
A27	250	5	5	4	3	5	1
A28	1000	3	1	1	1	1	1
A29	1000	5	3	4	1	1	1
A30	1000	5	5	5	5	5	5
A31	1000	5	5	5	5	5	5
A32	1000	5	5	5	4	5	5
A33	1000	5	5	5	4	5	2
A34	1000	5	5	5	5	5	5
A35	1000	3	5	5	1	5	1
A36	1000	5	5	5	3	5	5
A37	1000	5	5	5	5	5	5
A38	1000	4	1	1	1	1	1
A39	1000	5	1	1	1	1	1
A40	1000	2	1	1	1	1	1
A41	1000	5	5	5	5	5	3

[0291]

化 合 物	施用率 (g/ha)	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A42	250	5	4	5	5	5	3
A43	1000	5	5	5	5	5	4
A44	1000	5	5	5	5	5	5
A46	1000	4	1	5	1	4	1
A47	1000	1	1	1	1	1	1
A48	1000	1	1	1	1	1	1
A49	1000	5	5	5	1	3	1
A50	1000	4	4	4	1	1	1
A51	1000	1	1	1	1	1	1
A54	1000	5	5	5	5	3	1
A55	1000	2	2	4	1	1	1
A57	1000	5	4	5	1	1	NT
A58	1000	5	5	5	5	5	5
A59	1000	5	5	5	4	2	2
A60	1000	5	1	1	1	2	1
A61	1000	1	1	2	1	1	1
A62	1000	4	1	1	1	1	1
A69	1000	3	1	1	1	1	1
A70	1000	2	1	1	1	1	1
A71	1000	5	1	1	1	1	1
A77	250	5	4	5	2	2	1
A78	1000	1	1	2	1	1	1
A80	1000	2	1	1	1	1	1
A81	1000	5	3	4	1	4	2
A82	1000	5	4	5	5	5	5
A83	1000	4	1	2	1	2	1
A84	1000	5	4	5	5	5	5
A85	1000	5	5	5	5	5	5
A86	1000	4	2	5	4	5	1
A87	1000	4	3	5	4	4	1
A88	1000	5	4	5	4	5	1
A89	1000	4	2	4	2	4	3
A90	1000	4	4	5	5	5	3
A91	1000	4	3	5	4	5	4
A92	1000	4	2	5	5	1	4
A93	1000	4	4	4	3	4	3
A94	1000	4	2	2	2	3	1

[0292]

化 合 物	施用率 (g/ha)	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A95	1000	4	1	3	1	4	1
A97	1000	4	2	4	2	3	2
A98	1000	4	3	5	3	5	1
A99	1000	5	1	4	3	4	1
A100	250	5	NT	5	NT	2	1
A101	1000	5	4	5	5	5	5
A102	1000	5	4	5	5	5	4
A103	1000	5	3	5	5	5	5
A104	1000	4	2	5	4	4	4
A105	1000	5	5	5	5	5	5
A106	1000	4	3	5	5	5	3
A107	1000	5	2	5	2	4	3
A108	1000	4	4	5	5	5	1
A109	1000	4	3	4	2	2	1
A110	1000	5	4	5	4	4	4
A111	1000	5	4	5	4	5	1
A112	1000	5	2	5	3	4	1
A113	1000	5	4	5	5	5	4
A114	1000	5	4	5	5	5	5
A115	1000	5	4	5	5	5	5
A116	1000	5	4	5	5	5	4
A117	1000	5	2	5	4	4	5
A118	1000	5	4	5	5	5	4
A119	1000	5	4	5	5	5	4
A120	1000	5	4	5	2	5	3
A121	1000	4	1	3	1	4	1
A126	250	5	NT	3	NT	4	1
A159	1000	5	5	5	5	5	2
A160	1000	5	4	5	5	5	5
A161	1000	5	4	5	5	5	5
A162	1000	5	4	5	5	5	5
A163	250	5	NT	5	NT	4	1
A169	250	5	NT	5	NT	5	5

[0293] NT=未测试

[0294] 表B3. 比较测试

[0295] 生物学实例

[0296] 将多种测试物种的种子播种在盆中的标准土壤中。在温室中的受控条件(24°C/16°C, 白天/夜晚; 14小时光照; 65%湿度)下培养一天之后(出苗前), 用水性喷雾溶液来喷雾这些植物, 该水性喷雾溶液源自0.6ml丙酮和含有10.6%Emulsogen EL(登记号61791-12-6)、42.2%N-甲基吡咯烷酮、42.2%二丙二醇单甲醚(CAS RN 34590-94-8)和0.2%X-77(CAS RN 11097-66-8)的45ml配制品溶液中的工业级活性成分的配制品。

[0297] 然后使测试植物在温室中在温室中的受控条件(24°C/16°C, 白天/夜晚; 14小时光

照;65%湿度)下生长,并每天浇水两次。21天之后,对测试进行评估(100=对植物的完全损害;0=无植物损害)。

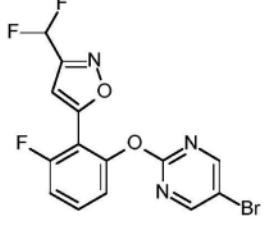
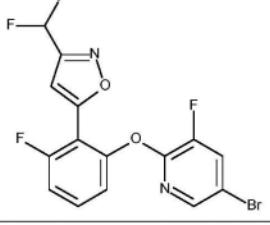
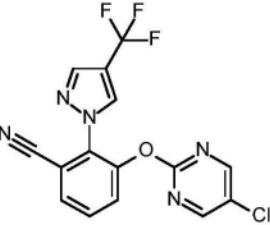
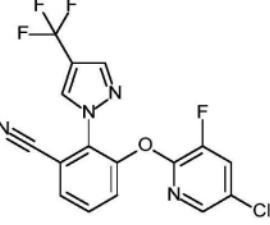
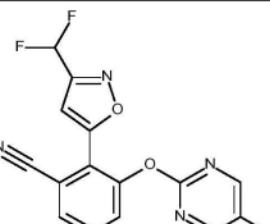
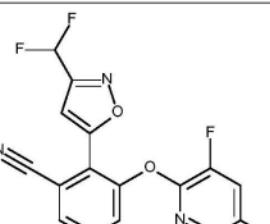
[0298] 测试植物:

[0299] 杂草物种:反枝苋(AMARE)

[0300] 作物:大豆(杰克大豆(Glycine max) (GLYMA))

[0301] 结果证明,与现有技术的嘧啶化合物相比,本发明的吡啶化合物展现出对作物(大豆)的很大降低的除草损害,而杂草(AMARE)控制保持相当。

测试	化合物	比率	GLYMA	AMARE
1	嘧啶 比较物 <b>WO2015/10 8779 CMP 55</b>	<b>500</b>	<b>90</b>	<b>100</b>
		<b>250</b>	<b>70</b>	<b>100</b>
	<b>A30</b>	<b>500</b>	<b>0</b>	<b>100</b>
		<b>250</b>	<b>0</b>	<b>100</b>
[0302]	嘧啶 比较物 <b>WO2015/10 8779 CMP 144</b>	<b>500</b>	<b>90</b>	<b>100</b>
		<b>250</b>	<b>10</b>	<b>100</b>
	<b>A1</b>	<b>500</b>	<b>0</b>	<b>100</b>
		<b>250</b>	<b>0</b>	<b>100</b>
	<b>A37</b>	<b>500</b>	<b>0</b>	<b>100</b>
		<b>250</b>	<b>0</b>	<b>100</b>

3	嘧啶 比较物 WO2015/10 8779 CMP 145		500	40	100
			250	10	100
	A20		500	0	100
			250	0	100
4	嘧啶 比较物 WO2015/08 9003 CMP 58		500	100	100
			250	90	100
	A33		500	0	100
			250	0	100
5	嘧啶 比较物		500	100	100
			250	90	100
	A162		500	10	100
			250	0	100