



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 104854104 B

(45)授权公告日 2017.11.21

(21)申请号 201380064017.7

D·施姆茨勒

(22)申请日 2013.12.03

(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

(65)同一申请的已公布的文献号

公司 11285

申请公布号 CN 104854104 A

代理人 王媛 钟守期

(43)申请公布日 2015.08.19

(51)Int.Cl.

(30)优先权数据

C07D 413/12(2006.01)

12195959.7 2012.12.06 EP

C07D 417/14(2006.01)

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

C07D 263/48(2006.01)

2015.06.08

A01N 43/76(2006.01)

A01N 43/82(2006.01)

(86)PCT国际申请的申请数据

(56)对比文件

PCT/EP2013/075297 2013.12.03

WO 2012028579 A1,2012.03.08,权利要求

(87)PCT国际申请的公布数据

1,4-13;说明书第242页表8.

W02014/086734 DE 2014.06.12

JP 昭64-9978 A,1989.01.13,全文.

(73)专利权人 拜尔农作物科学股份公司

US 6096688 A,2000.08.01,全文.

地址 德国蒙海姆

CN 102803203 A,2012.11.28,全文.

(72)发明人 A·库恩 H·阿伦斯 R·布劳恩

CN 102639517 A,2012.08.15,全文.

I·海涅曼 J·蒂贝斯

R.B.西尔弗曼 编,郭宗儒 主译.生物电子

C·沃尔德拉夫 H·迪特里希

等排.《有机药物化学》.2008,第20-22页.

E·加茨魏勒 C·H·罗辛格

审查员 郭军霞

权利要求书2页 说明书54页

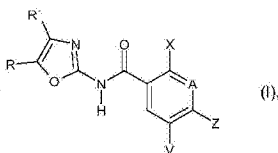
(54)发明名称

N-(噁唑-2-基)-芳基-羧酸酰胺及其作为除草剂的用途

(57)摘要

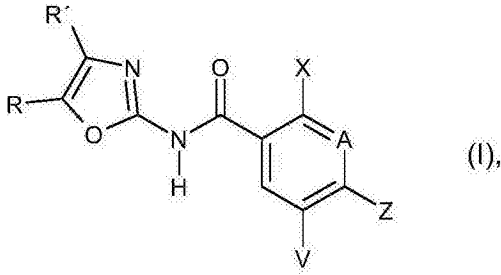
本发明涉及N-(异噁唑-3-基)芳基羧酸酰胺

及其作为除草剂的用途。



在式(I)中,A代表N或C-Y。R、R'、V、X、Y和Z代表基团例如氢、卤素基团和有机基团如取代的烷基。

1. 式 (I) 的 N-(噁唑-2-基) 芳基甲酰胺或其盐



其中

A 代表 N 或 CY,

R 和 R' 彼此独立地代表氢或 (C₁-C₆)-烷基,

X 代表卤素和 (C₁-C₆)-烷基,

Y 代表氢、S(O)_nR² 和 (C₁-C₆)-烷基-OR¹,

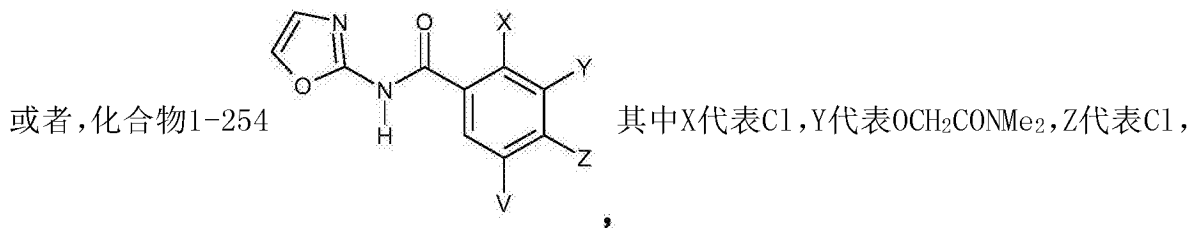
Z 代表卤素、卤代-(C₁-C₆)-烷基和 S(O)_nR²,

V 代表氢,

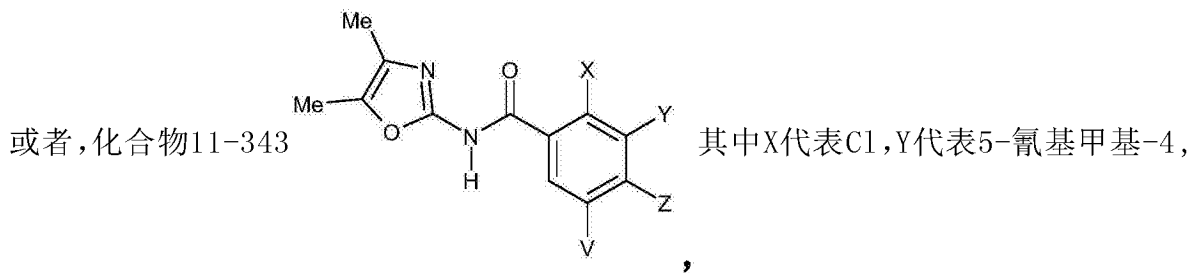
R¹ 代表 (C₁-C₆)-卤代烷基,

R² 代表 (C₁-C₆)-烷基,

n 代表 0、1 或 2,



并且 V 代表 H;



5-二氢-1,2-噁唑-3-基, Z 代表 SO₂Et, 并且 V 代表 H。

2. 一种除草组合物, 其特征在于, 其包含除草活性量的至少一种权利要求 1 的式 (I) 的化合物。

3. 如权利要求 2 的所述除草组合物, 与制剂助剂混合。

4. 如权利要求 2 或 3 所述的除草组合物, 其包含至少一种选自如下的其它农药活性物质: 杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂、安全剂和生长调节剂。

5. 如权利要求 4 所述的除草组合物, 其包含安全剂。

6. 如权利要求 5 所述的除草组合物, 其包含环丙磺酰胺、解毒啉、吡唑解草酯或双苯噁唑酸。

7. 如权利要求 5 或 6 所述的除草组合物, 其包含其他除草剂。

8. 一种防治不想要的植物的方法,其特征在于,将有效量的至少一种权利要求1的式(I)的化合物或权利要求2至7中任一项的除草组合物施用于植物或不想要的植物生长位置。

9. 权利要求1的式(I)的化合物或权利要求2至7中任一项的除草组合物用于防治不想要的植物的用途。

10. 如权利要求9所述的用途,其特征在于,所述式(I)的化合物用于防治有用植物作物中不想要的植物。

11. 如权利要求10所述的用途,其特征在于,所述有用植物为转基因有用植物。

N-(噁唑-2-基)-芳基-羧酸酰胺及其作为除草剂的用途

[0001] 本发明涉及除草剂技术领域,特别是用于选择性防治有用植物作物中的阔叶杂草和禾本科杂草的除草剂的技术领域。

[0002] WO 2011/035874 A1公开了N-(1,2,5-噁二唑-3-基)苯甲酰胺及其作为除草剂的用途。WO 2012/028579 A1公开了N-(四唑-5-基)芳基甲酰胺和N-(三唑-5-基)芳基甲酰胺及其作为除草剂的用途。

[0003] 然而,这些文献中的已知化合物具有无或经常不足的除草效力。因此,本发明的目的是提供其他的除草活性化合物。

[0004] WO 2010/132404 A1记载了药理学活性化合物{[(5-甲氧基-2-[[5-(2,2,2-三氟乙基)-1,3-噁唑-2-基]氨基甲酰基]苯氧基)羰基]氧基}甲基2,2-二甲基丙酸酯。

[0005] 在下列CAS号中,各个CAS号后面提及的化合物是已知的:

[0006] 1187436-88-9:4-甲基-2-([2-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3-基]羰基)氨基)-1,3-噁唑-5-羧酸乙酯。

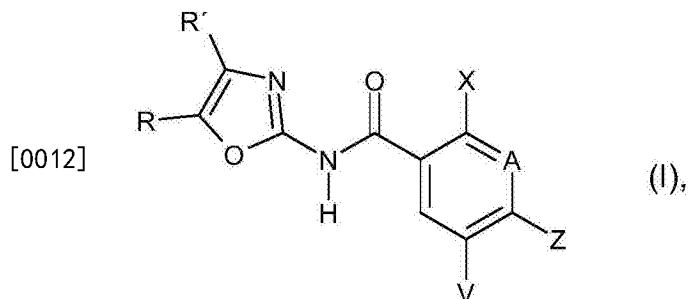
[0007] 1090036-46-6:N-(4,5-二甲基-1,3-噁唑-2-基)-2,4-二甲基苯甲酰胺。

[0008] 587008-52-4:2,4-二氯-N-(4,5-二苯基-1,3-噁唑-2-基)苯甲酰胺。

[0009] 已公开由这些CAS号已知的化合物无除草效力。

[0010] 现已发现,在芳基羧酸部分带有某些取代基的N-(1,3-噁唑-2-基)-芳基甲酰胺特别适合作除草剂。

[0011] 因此,本发明提供式(I)的N-(1,3-噁唑-2-基)芳基甲酰胺或其盐



[0013] 其中

[0014] A代表N或CY,

[0015] R和R'彼此独立地代表氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₇)-环烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-烯氧基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-炔氧基、(C₂-C₆)-卤代炔基、氰基-(C₁-C₆)-烷基、氰基、硝基、甲基硫基、甲基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙酰基氨基、苯甲酰基氨基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲氧基羰基甲基、乙氧基羰基甲基、苯甲酰基、甲基羰基、哌啶基羰基、三氟甲基羰基、卤素、氨基、氨基羰基、甲基氨基羰基、二甲基氨基羰基、甲氧基甲基或杂芳基、杂环基或苯基,其各自被s个选自如下的基团取代:甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基和卤素,

[0016] X代表硝基、卤素、氰基、甲酰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-

(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、COR¹、COOR¹、OCOR¹、NR¹COOR¹、C(O)N(R¹)₂、NR¹C(O)N(R¹)₂、OC(O)N(R¹)₂、C(O)NR¹OR¹、OR²、OCOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-S(O)_nR²、(C₁-C₆)-烷基-OR¹、(C₁-C₆)-烷基-OCOR¹、(C₁-C₆)-烷基-OSO₂R²、(C₁-C₆)-烷基-CO₂R¹、(C₁-C₆)-烷基-SO₂OR¹、(C₁-C₆)-烷基-CON(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-NR¹SO₂R²、NR¹R₂、P(O)(OR⁵)₂、CH₂P(O)(OR⁵)₂、(C₁-C₆)-烷基-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-杂环基，其中最后提及的2个基团各自被s个选自如下的基团取代：卤素、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基和卤代-(C₁-C₆)-烷氧基，其中杂环基带有n个氧代基团，

[0017] Y代表氢、硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、COR¹、COOR¹、OCOR¹、NR¹COOR¹、C(O)N(R¹)₂、NR¹C(O)N(R¹)₂、OC(O)N(R¹)₂、CO(NOR¹)R¹、CHNOR¹、CH₂ONCR³)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、OR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-S(O)_nR²、NS(O)R⁶R⁷、S(O)R⁸NR⁹、(C₁-C₆)-烷基-OR¹、(C₁-C₆)-烷基-OCOR¹、(C₁-C₆)-烷基-OSO₂R²、(C₁-C₆)-烷基-CO₂R¹、(C₁-C₆)-烷基-CN、(C₁-C₆)-烷基-SO₂OR¹、(C₁-C₆)-烷基-CON(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-NR¹SO₂R²、N(R¹)₂、P(O)(OR⁵)₂、CH₂P(O)(OR⁵)₂、(C₁-C₆)-烷基苯基、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂环基、苯基、杂芳基或杂环基，其中最后提及的6个基团各自被s个选自如下的基团取代：卤素、硝基、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基和氰基甲基，其中杂环基带有n个氧代基团，

[0018] Z代表卤素、氰基、氰硫基、硝基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、COR¹、COOR¹、OCOR¹、NR¹COOR¹、C(O)N(R¹)₂、NR¹C(O)N(R¹)₂、OC(O)N(R¹)₂、C(O)NR¹OR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-S(O)_nR²、(C₁-C₆)-烷基-OR¹、(C₁-C₆)-烷基-OCOR¹、(C₁-C₆)-烷基-OSO₂R²、(C₁-C₆)-烷基-CO₂R¹、(C₁-C₆)-烷基-SO₂OR¹、(C₁-C₆)-烷基-CON(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-NR¹SO₂R²、NR¹R²、P(O)(OR⁵)₂、杂芳基、杂环基或苯基，其中最后提及的3个基团各自被s个选自如下的基团取代：卤素、硝基、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基或卤代-(C₁-C₆)-烷氧基，其中杂环基带有0至2个氧代基团，或

[0019] 如果Y代表S(O)_nR²基团，则Z还可代表氢，

[0020] V代表氢、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、卤素、硝基或氰基，

[0021] R¹代表氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、(C₃-C₆)-卤代环烷基、

(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、杂环基、(C₁-C₆)-烷基杂环基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂环基、(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂环基,其中最后提及的21个基团各自被s个选自如下的基团取代:氰基、卤素、硝基、氰硫基、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、SCOR⁴、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、COSR⁴、CON(R³)₂和(C₁-C₄)-烷氧基-(C₂-C₆)-烷氧基羰基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0022] R²代表(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-卤代炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、(C₃-C₆)-卤代环烷基、(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、杂环基、(C₁-C₆)-烷基杂环基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂环基、(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂环基,其中最后提及的21个基团各自被s个选自如下的基团取代:氰基、卤素、硝基、氰硫基、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、SCOR⁴、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、COSR⁴、CON(R³)₂和(C₁-C₄)-烷氧基-(C₂-C₆)-烷氧基羰基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0023] R³代表氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基或(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基,

[0024] R⁴代表(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基或苯基,

[0025] R⁵代表甲基或乙基,

[0026] R⁶和R⁷彼此独立地代表(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、苯基、杂芳基或杂环基,其中最后提及的3个基团各自被s个选自如下的基团取代:硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S和R¹O-(C₁-C₆)-烷基,其中杂环基带有n个氧代基团,或者R⁶和R⁷连同与其相连的硫原子形成不饱和、部分饱和或饱和的3元至8元环,所述环除了碳原子和亚砷亚胺(sulfoximino)的硫原子外,在每种情况下还包含m个选自N(R¹)、O和S(O)_n的环单元,其中所述环在每种情况下被s个选自如下的基团取代:硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S和R¹O-(C₁-C₆)-烷基,其中所述环带有n个氧代基团,

[0027] R⁸代表(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基或(C₂-C₆)-炔基,其各自被s个选自如下的基团取代:硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹(R¹O)N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹S(O)C、R¹O、R¹(O)CO、R²(O)₂SO、R²O(O)CO、(R¹)₂N(O)CO、(R¹)₂N、R¹O(R¹)N、R¹(O)C(R¹)N、R²(O)₂S(R¹)N、R²O(O)C(R¹)N、(R¹)₂N(O)C(R¹)N、R¹O(O)₂S(R¹)N、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N、R²(O)_nS、R¹C(O)S、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S和(R⁵O)₂(O)P,或(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、杂芳基-(C₁-C₆)-烷基、杂环基、杂环基-(C₁-C₆)-烷基、苯基-O-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-O-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-O-

(C₁-C₆)-烷基、苯基-N(R¹)-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-N(R¹)-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-N(R¹)-(C₁-C₆)-烷基、苯基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基或杂环基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基,其各自在环部分被s个选自如下的基团取代:硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹(R¹O)N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹S(O)C、R¹O、R¹(O)CO、R²(O)₂SO、R²O(O)CO、(R¹)₂N(O)CO、(R¹)₂N、R¹O(R¹)N、R¹(O)C(R¹)N、R²(O)₂S(R¹)N、R²O(O)C(R¹)N、(R¹)₂N(O)C(R¹)N、R¹O(O)₂S(R¹)N、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N、R²(O)_nS、R¹C(O)S、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S、(R⁵O)₂(O)P和R¹O-(C₁-C₆)-烷基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0028] R⁹代表氢、硝基、卤素、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-烯基、卤代-(C₃-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C、R²O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R²S(O)C、(R¹)₂N(S)C、R¹(R¹O)N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R²(O)_nS、(R²)₃Si-(C₁-C₆)-烷基-(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S、R²(O)₂S(R¹)N(O)₂S、(R⁵O)₂(O)P、(R²)₃Si、R¹(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹O)(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂SO-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)_nS-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、(R⁵O)₂(O)P-(C₁-C₆)-烷基、(R²)₃Si-(C₁-C₆)-烷基,或苯基、杂芳基、杂环基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-(C₁-C₆)-烷基或杂环基-(C₁-C₆)-烷基,其各自在环部分被s个选自如下的基团取代:硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S和R¹O-(C₁-C₆)-烷基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0029] m代表0、1、2、3或4,

[0030] n代表0、1或2,

[0031] s代表0、1、2或3,

[0032] 排除化合物{[(5-甲氧基-2-[[5-(2,2,2-三氟乙基)-1,3-噁唑-2-基]氨基甲酰基]苯氧基)羰基]氧基}甲基2,2-二甲基丙酸酯、4-甲基-2-([2-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3-基]羰基)氨基)-1,3-噁唑-5-羧酸乙酯、N-(4,5-二甲基-1,3-噁唑-2-基)-2,4-二甲基苯甲酰胺和2,4-二氯-N-(4,5-二苯基-1,3-噁唑-2-基)苯甲酰胺。

[0033] 在下面给出的式(1)和所有式中,具有多于两个碳原子的烷基基团可以是直链或支链的。烷基为,例如甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基或2-丁基、戊基、己基(如正己基、异己基和1,3-二甲基丁基)。卤素为氟、氯、溴或碘。

[0034] 杂环基为含有3至6个环原子的饱和的、部分饱和的或完全不饱和的环状基团,其

中1至4个环原子选自氧、氮和硫,且其可额外地与苯并环稠合。杂环基为,例如哌啶基、吡咯烷基、四氢呋喃基、二氢呋喃基和氧杂环丁烷基(oxetanyl)。

[0035] 杂芳基代表含有3至6个环原子的芳族环状基团,其中1至4个环原子选自氧、氮和硫,且其可额外地与苯并环稠合。杂芳基为,例如苯并咪唑-2-基、呋喃基、咪唑基、异噁唑基、异噻唑基、噁唑基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、吡啶基、苯并异噁唑基、噻唑基、吡咯基、吡唑基、噻吩基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,4-三唑基、1,2,3-三唑基、1,2,5-三唑基、1,3,4-三唑基、1,2,4-三唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、2H-1,2,3,4-四唑基、1H-1,2,3,4-四唑基、1,2,3,4-噁三唑基、1,2,3,5-噁三唑基、1,2,3,4-噻三唑基和1,2,3,5-噻三唑基。

[0036] 如果一个基团被基团多取代,这应理解为意指该基团被选自提及的那些基团的一个或多个相同或不同的基团取代。

[0037] 根据取代基的性质和连接方式,通式(I)的化合物可作为立体异构体存在。例如,如果存在一个或多个不对称碳原子,则可能出现对映异构体和非对映异构体。当n为1(亚砷)时,也存在立体异构体。立体异构体可由在制备过程中获得的混合物通过常规分离方法(例如色谱分离法)获得。还可通过使用光学活性的起始材料和/或助剂的立体选择性反应来选择性地制备立体异构体。本发明还涉及通式(I)所涵盖的但未具体定义的所有立体异构体及其混合物。

[0038] 优选通式(I)的化合物,其中

[0039] A代表N或CY,

[0040] X代表硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、COR¹、OR²、OCOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-S(O)_nR²、(C₁-C₆)-烷基-OR¹、(C₁-C₆)-烷基-OCOR¹、(C₁-C₆)-烷基-OSO₂R²、(C₁-C₆)-烷基-CO₂R¹、(C₁-C₆)-烷基-SO₂OR¹、(C₁-C₆)-烷基-CON(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-NR¹COR¹或(C₁-C₆)-烷基-NR¹SO₂R²、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂环基,其中最后提及的2个基团各自被s个选自如下的基团取代:卤素、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基和卤代-(C₁-C₆)-烷氧基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0041] Y代表氢、硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、COR¹、OR¹、COOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-S(O)_nR²、(C₁-C₆)-烷基-OR¹、(C₁-C₆)-烷基-OCOR¹、(C₁-C₆)-烷基-OSO₂R²、(C₁-C₆)-烷基-CO₂R¹、(C₁-C₆)-烷基-SO₂OR¹、(C₁-C₆)-烷基-CON(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-NR¹SO₂R²、(C₁-C₆)-烷基苯基、(C₁-C₆)-烷基-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-杂环基、苯基、杂芳基或杂环基,其中最后提及的6个基团各自被s个选自如下的基团取代:卤素、硝基、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基和氰基甲基,其中

杂环基带有n个氧代基团,

[0042] Z代表卤素、氰基、氰硫基、硝基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、COR¹、COOR¹、C(O)N(R¹)₂、C(O)NR¹OR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-S(O)_nR²、(C₁-C₆)-烷基-OR¹、(C₁-C₆)-烷基-OCOR¹、(C₁-C₆)-烷基-OSO₂R²、(C₁-C₆)-烷基-CO₂R¹、(C₁-C₆)-烷基-SO₂OR¹、(C₁-C₆)-烷基-CON(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-NR¹SO₂R²、1,2,4-三唑-1-基,或

[0043] 如果Y代表S(O)_nR²基团,则Z还可代表氢,

[0044] V代表氢、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、卤素、硝基或氰基,

[0045] R、R'彼此独立地代表氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₇)-环烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基、氰基-(C₁-C₆)-烷基、氰基、甲基硫基、甲基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙酰基氨基、甲氧基甲基,或杂芳基、杂环基或苯基,其各自被s个选自如下的基团取代:甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基和卤素,

[0046] R¹代表氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、杂环基、(C₁-C₆)-烷基杂环基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂环基、(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂芳基或(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂环基,其中最后提及的16个基团各自被s个选自如下的基团取代:氰基、卤素、硝基、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、CON(R³)₂和(C₁-C₄)-烷氧基-(C₂-C₆)-烷氧基羰基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0047] R²代表(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、杂环基、(C₁-C₆)-烷基杂环基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂环基、(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂芳基或(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂环基,其中这些基团被s个选自如下的基团取代:氰基、卤素、硝基、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、NR³SO₂R⁴、COR³、OCOR³、NR³COR³、CO₂R³、CON(R³)₂和(C₁-C₄)-烷氧基-(C₂-C₆)-烷氧基羰基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0048] R³代表氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基或(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基,

[0049] R⁴代表(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基或(C₂-C₆)-炔基,

[0050] R⁶和R⁷彼此独立地代表(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基、苯基、杂芳基或杂环基,其中最后提及的3个基团各自被s个选自如下的基团取代:硝基、卤素、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R²(O)_nS和R¹O-(C₁-C₆)-烷基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0051] 或R⁶和R⁷连同与其连接的硫原子形不饱和、部分饱和或饱和的成3元至8元环,所述

环除了碳原子和亚砷亚胺的硫原子外,在每种情况下还包含m个选自N(R¹)、O和S(O)_n的环单元,其中所述环在每种情况下被s个选自如下的基团取代:卤素、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S和R¹O-(C₁-C₆)-烷基,其中所述环带有n个氧代基团,

[0052] R⁸代表(C₁-C₆)-烷基,其在每种情况下被s个选自如下的基团取代:卤素、氰基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R¹(O)C(R¹)N、R²(O)₂S(R¹)N、R²O(O)C(R¹)N、(R¹)₂N(O)C(R¹)N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S和(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S或(C₃-C₆)-环烷基,其在每种情况下被s个选自如下的基团取代:卤素、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹O(O)C和(R¹)₂N(O)C,

[0053] R⁹代表氢、硝基、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C、R²O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R²(O)₂S、R¹(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N-(C₁-C₆)-烷基或R²(O)_nS-(C₁-C₆)-烷基,

[0054] m代表0、1或2,

[0055] n代表0、1或2,

[0056] s代表0、1、2或3。

[0057] 特别优选通式(I)的化合物,其中

[0058] A代表N或CY,

[0059] X代表硝基、卤素、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、OR²、S(O)_nR²、(C₁-C₆)-烷基-S(O)_nR²、(C₁-C₆)-烷基-OR¹、(C₁-C₆)-烷基-CON(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-NR¹SO₂R²、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂环基,其中最后提及的2个基团各自被s个选自如下的基团取代:卤素、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0060] Y代表氢、硝基、卤素、氰基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、OR¹、S(O)_nR²、SO₂N(R¹)₂、N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-S(O)_nR²、(C₁-C₆)-烷基-OR¹、(C₁-C₆)-烷基-CON(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆)-烷基-NR¹COR¹、(C₁-C₆)-烷基-NR¹SO₂R²、(C₁-C₆)-烷基苯基、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂环基、苯基、杂芳基或杂环基,其中最后提及的6个基团各自被s个选自如下的基团取代:卤素、硝基、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基和氰基甲基,其中杂环基带有n个氧代基团,

[0061] Z代表卤素、氰基、硝基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、S(O)_nR²、1,2,4-三唑-1-基,或者如果Y代表S(O)_nR²基团,则Z还可代表氢,,

[0062] V代表氢、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、S(O)_n-(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、卤素、硝基或氰基,

[0063] R、R'彼此独立地代表氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₇)-环烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基、氰基-(C₁-C₆)-烷基、氰基、甲基硫基、甲基亚磺酰基、甲

基磺酰基、乙酰基氨基、卤素、氨基、甲氧基甲基，

[0064] R^1 代表氢、(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、(C₁-C₆)-烷基杂芳基、杂环基、(C₁-C₆)-烷基杂环基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂芳基、(C₁-C₆)-烷基-O-杂环基、(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂芳基或(C₁-C₆)-烷基-NR³-杂环基，其中最后提及的16个基团各自被s个选自如下的基团取代：氰基、卤素、硝基、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、CON(R³)₂和(C₁-C₄)-烷氧基-(C₂-C₆)-烷氧基羰基，其中杂环基带有n个氧代基团，

[0065] R^2 代表(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基或(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基，其中上述提及的这三个基团各自被s个选自如下的基团取代：卤素和OR³，

[0066] R^3 代表氢或(C₁-C₆)-烷基，

[0067] R^4 代表(C₁-C₆)-烷基，

[0068] R^6 和 R^7 彼此独立地代表甲基、乙基或正丙基，

[0069] 或

[0070] R^6 和 R^7 连同与其连接的硫原子形成5元或6元饱和环，所述环除了碳原子和亚砷亚胺的硫原子外还含有m个氧原子，

[0071] R^8 代表甲基、乙基或正丙基，

[0072] R^9 代表氢或氰基，

[0073] m代表0或1，

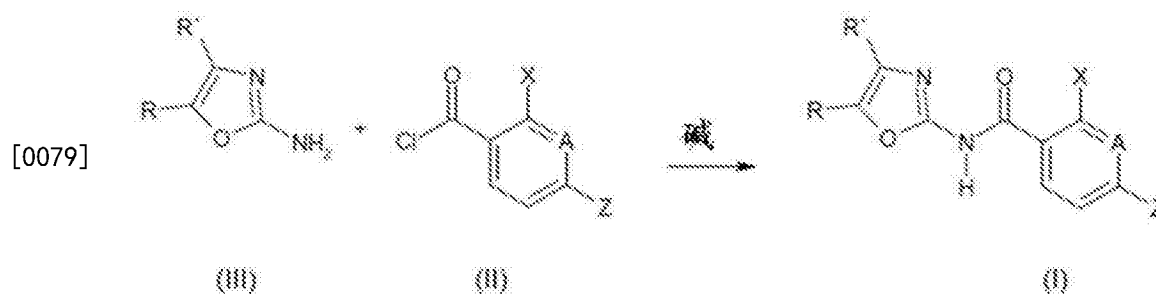
[0074] n代表0、1或2，

[0075] s代表0、1、2或3。

[0076] 在下文所示的所有式中，除非另外定义，取代基和符号具有如式(I)中描述的相同含义。

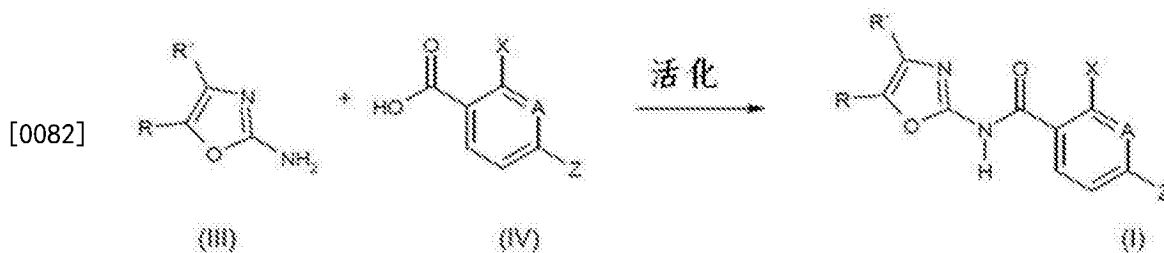
[0077] 本发明的化合物可例如通过方案1所示的方法由苯甲酰氯(II)与2-氨基-1,3-噁唑(III)的碱催化反应制备：

[0078] 方案1



[0080] 本发明的化合物还可通过方案2描述的方法由式(IV)的苯甲酸和2-氨基-1,3-噁唑(III)反应制备：

[0081] 方案2



[0083] 对于活化反应,可使用常规用于酰胺化反应的脱水剂,例如1,1'-羰基二咪唑(CDI)、二环己基碳二亚胺(DCC)、2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷(trioxatriphosphinane)2,4,6-三氧化物(T3P)等。

[0084] 改变反应步骤的顺序可能是有利的。因此,带有亚砷的苯甲酸不能直接转化为苯甲酰氯。此处,在硫醚阶段首先制备酰胺,然后将硫醚氧化成亚砷是可取的。

[0085] 式(II)的苯甲酰氯或其母体苯甲酸(IV)原则上是已知的并可通过例如记载于US 6,376,429 B1、EP 1 585 742 A1和EP 1 202 978 A1中的方法制备。

[0086] 式(III)的2-氨基-1,3-噁唑为市售可得或者可用文献中已知的类似方法制备。

[0087] 由上述反应合成的式(I)的化合物和/或其盐的集合还可以并行方式制备,在这种情况下,所述制备可以手动、部分自动或全部自动的方式实现。例如,可使反应过程、产物和/或中间体的后处理或纯化自动化。大体上,应理解为意指例如D. Tiebes在Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening (Editor Günther Jung), Wiley 1999,第1至34页中描述的过程。

[0088] 对于反应和后处理的并行实施,可使用很多市售可得的设备,例如购自Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA的Calpso反应槽(reaction blocks),或购自Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 113AZ, England的反应台(reaction stations),或购自Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, USA的MultiPROBE自动工作站(Automated Workstations)。通式(I)的化合物及其盐或制备过程中产生的中间体的并行纯化,可用的设备包括例如购自ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA的色谱设备。

[0089] 所列设备导致模块化操作,其中各个操作步骤均自动进行,但是在各操作步骤之间必须进行手动操作。这可通过使用部分或完全一体化的自动化系统而避免,其中所述各自动化模块由例如机器人操控。这类自动化系统可自例如Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA获得。

[0090] 单个或多个合成步骤的执行可以通过使用聚合物负载试剂/清除树脂(scavenger resin)来支持。专业文献描述了一系列实验方案,例如在ChemFiles,第4卷,第1期, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich)中。

[0091] 除了本文所述的方法之外,通式(I)的化合物及其盐的制备可以全部或部分地通过固相负载法进行。为此,将所述合成中的或适用于相应操作的合成中的各个单独的中间体或全部中间体结合至合成树脂。固相负载合成法在专业文献中有充分的描述,例如Barry A. Bunin, "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998和Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening (Günther Jung编), Verlag Wiley, 1999。使用

固相负载合成法可以进行多种文献中已知的方案,这些方案也可以手动或自动的方式实施。例如,反应可在购自Nexus Biosystems,12140Community Road,Poway,CA92064,USA的微型反应器中通过IRORI技术进行。

[0092] 在固相和液相上进行单个或多个合成步骤可通过使用微波技术支持。专业文献中描述了一系列实验方案,例如在Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (C.O.Kappe和A.Stadler编),Verlag Wiley,2005中。

[0093] 根据本文所述的方法的制备可以获得物质集合形式的通式(I)化合物及其盐,称为库(library)。本发明还提供了包含至少两种式(I)化合物及其盐的库。

[0094] 本发明的式(I)的化合物(和/或其盐)在下文中统称为“本发明的化合物”,其对宽范围的经济上重要的单子叶和双子叶一年生有害植物具有优异的除草活性。所述活性化合物对从根茎、根状茎和其他多年生器官中发芽的难以防治的多年生有害植物具有良好的防治。

[0095] 因此,本发明还涉及一种防治不需要的植物或调节植物生长(优选在植物作物中)的方法,其中将一种或多种本发明的化合物施用于植物(例如有害植物,如单子叶或双子叶杂草或不需要的作物植物)、种子(例如谷物、种子或无性繁殖体,如块茎或带芽的幼枝部位)或植物生长区域(例如耕种区域)。本发明化合物可以例如在播种前(如果合适,也可以通过混入土壤而施用)、出苗前或出苗后施用。可以通过本发明的化合物防治的有代表性的单子叶和双子叶杂草的具体实例如下,而以下的列举并不意欲限于某些属种。

[0096] 单子叶有害植物属:山羊草属(Aegilops)、冰草属(Agropyron)、剪股颖属(Agrostis)、看麦娘属(Alopecurus)、Apera属、燕麦属(Avena)、臂形草属(Brachiaria)、雀麦属(Bromus)、蒺藜草属(Cenchrus)、鸭跖草属(Commelina)、狗牙根属(Cynodon)、莎草属(Cyperus)、龙爪茅属(Dactyloctenium)、马唐属(Digitaria)、稗属(Echinochloa)、荸荠属(Eleocharis)、蟋蟀草属(Eleusine)、画眉草属(Eragrostis)、野黍属(Eriochloa)、羊茅属(Festuca)、飘拂草属(Fimbristylis)、异蕊花属(Heteranthera)、白茅属(Imperata)、鸭嘴草属(Ischaemum)、千金子属(Leptochloa)、黑麦草属(Lolium)、雨久花属(Monochoria)、黍属(Panicum)、雀稗属(Paspalum)、藨草属(Phalaris)、梯牧草属(Phleum)、早熟禾属(Poa)、筒轴茅属(Rottboellia)、慈姑属(Sagittaria)、莞草属(Scirpus)、狗尾草属(Setaria)、高粱属(Sorghum)。

[0097] 双子叶杂草属:苘麻属(Abutilon)、苋属(Amaranthus)、豚草属(Ambrosia)、Anoda、春黄菊属(Anthemis)、Aphanes、蒿属(Artemisia)、滨藜属(Atriplex)、雏菊属(Bellis)、鬼针属(Bidens)、芥属(Capsella)、飞廉属(Carduus)、决明属(Cassia)、矢车菊属(Centaurea)、藜属(Chenopodium)、蓟属(Cirsium)、旋花属(Convolvulus)、曼陀罗属(Datura)、山蚂蝗属(Desmodium)、刺酸模属(Emex)、糖芥属(Erysimum)、大戟属(Euphorbia)、鼬瓣花属(Galeopsis)、牛膝菊属(Galinsoga)、拉拉藤属(Galium)、芙蓉属(Hibiscus)、番薯属(Ipomoea)、地肤属(Kochia)、野芝麻属(Lamium)、独行菜属(Lepidium)、母草属(Lindernia)、母菊属(Matricaria)、薄荷属(Mentha)、山靛属(Mercurialis)、粟米草属(Mullugo)、勿忘我属(Myosotis)、罂粟属(Papaver)、牵牛属(Pharbitis)、车前属(Plantago)、蓼属(Polygonum)、马齿苋属(Portulaca)、毛茛属(Ranunculus)、萝卜属(Raphanus)、焯菜属(Rorippa)、节节菜属(Rotala)、酸模属(Rumex)、

猪毛菜属 (*Salsola*)、千里光属 (*Senecio*)、田菁属 (*Sesbania*)、黄花稔属 (*Sida*)、白芥属 (*Sinapis*)、茄属 (*Solanum*)、苦苣菜属 (*Sonchus*)、尖瓣花属 (*Sphenoclea*)、繁缕属 (*Stellaria*)、蒲公英属 (*Taraxacum*)、葇荑属 (*Thlaspi*)、车轴草属 (*Trifolium*)、荨麻属 (*Urtica*)、婆婆纳属 (*Veronica*)、堇菜属 (*Viola*)、苍耳属 (*Xanthium*)。

[0098] 如果在发芽前将本发明的化合物施用至土壤表面,则完全阻止杂草的出苗,或者使得杂草生长直至达到子叶期,但之后其停止生长,并最终在三至四周后完全死亡。

[0099] 如果将所述活性化合物在出苗后施用至植物的绿色部分,则在处理后生长停止,并且有害植物停留在施用时间点的生长阶段,或者在一段时间后完全死亡,从而在非常早的时期并以持续的方式消除对作物植物有害的杂草的竞争。

[0100] 虽然本发明的化合物对单子叶和双子叶杂草显示出优异的除草活性,但对经济上重要的作物中的作物植物,例如双子叶作物属:花生属 (*Arachis*)、甜菜属 (*Beta*)、芸苔属 (*Brassica*)、黄瓜属 (*Cucumis*)、南瓜属 (*Cucurbita*)、向日葵属 (*Helianthus*)、胡萝卜属 (*Daucus*)、大豆属 (*Glycine*)、棉属 (*Gossypium*)、番薯属 (*Ipomoea*)、莴苣属 (*Lactuca*)、亚麻属 (*Linum*)、番茄属 (*Lycopersicon*)、烟草属 (*Nicotiana*)、菜豆属 (*Phaseolus*)、豌豆属 (*Pisum*)、茄属 (*Solanum*)、蚕豆属 (*Vicia*),或单子叶作物属:葱属 (*Allium*)、凤梨属 (*Ananas*)、天门冬属 (*Asparagus*)、燕麦属 (*Avena*)、大麦属 (*Hordeum*)、稻属 (*Oryza*)、黍属 (*Panicum*)、甘蔗属 (*Saccharum*)、黑麦属 (*Secale*)、高粱属 (*Sorghum*)、小黑麦属 (*Triticale*)、小麦属 (*Triticum*)、玉蜀黍属 (*Zea*),特别是玉蜀黍属和小麦属,仅具有微小程度的损害或者完全没有损伤,这取决于本发明各个化合物的结构及其施用率。这就是本发明化合物非常适用于选择性地防治植物作物(例如农业有用的植物或观赏植物)中不想要的植物的生长的原因。

[0101] 而且,本发明的化合物(取决于其各自的结构和使用的施用率)在作物植物中具有突出的生长调节性能。它们以调节的方式参与植物的新陈代谢,并且因此可用于针对性地影响植物成分和促进采收,例如引发脱水和使植株矮小生长。此外,它们还适用于一般地防治和抑制不想要的植物生长,而在此过程中不破坏植物。抑制植物生长在许多单子叶和双子叶作物中起到了非常重要的作用,因为例如可以减少或完全防止倒伏。

[0102] 所述活性化合物由于其除草活性和植物生长调节性能,也可用于防治基因修饰植物作物或通过常规突变修饰的植物中的有害植物。一般而言,转基因植物特征在于具有特别有利的性质,例如对某些农药的抗性,主要是对于某些除草剂的抗性,对于植物疾病或植物疾病病原体——例如某些昆虫或微生物(如真菌、细菌或病毒)——的抗性。其他特别的性质涉及,例如采收物的产量、质量、储存性、组成和特定成分。因此,已知转基因植物的采收物具有增加的淀粉含量或改进的淀粉质量,或具有不同的脂肪酸组成。

[0103] 关于转基因植物,优选将本发明的化合物用于经济上重要的有益植物和观赏性植物的转基因作物中,所述作物例如谷物,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、粟/高粱、稻、玉米,或者甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆以及其他蔬菜的作物。优选在对除草剂的植物毒性作用具有抗性或已通过重组方式产生抗性的有用植物作物中使用本发明的化合物作为除草剂。

[0104] 优选在有用植物或观赏性植物的经济上重要的转基因植物中使用本发明的化合物或其盐,所述作物例如谷物,如大麦、小麦、黑麦、燕麦、粟/高粱、稻、木薯、玉米,或者甜

菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆以及其他蔬菜的作物。优选在对除草剂的植物毒性作用具有抗性或已通过基因工程产生抗性的有用植物作物中使用本发明的化合物作为除草剂。

[0105] 制备与现有植物相比具有改进特性的新植物的常规方法包括,例如常规育种方法和突变体产生法。或者,具有改进特性的新植物可借助重组方法产生(参见例如,EP-A-0221044,EP-A-0131624)。例如,在多个案例中已描述以下情况:

[0106] -通过基因修饰作物植物以使植物中合成的淀粉改性(例如WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806),

[0107] -对草铵磷(glufosinate)类(参见例如EP-A-0242236、EP-A-0242246)或草甘膦(gluphosate)类(WO 92/00377)或磺酰脲类(EP-A-0257993、US A 5013659)的某些除草剂具有抗性的转基因作物植物,

[0108] -能产生苏云金芽孢杆菌毒素(Bt毒素)从而使植物对某些害虫具有抗性的转基因作物植物,例如棉花(EP-A-0142924、EP-A-0193259),

[0109] -具有改变的脂肪酸组成的转基因作物植物(WO 91/13972),

[0110] -具有新成分或次级代谢产物,例如能够增强的抗病性的新的植物抗毒素的基因修饰作物植物(EPA 309862,EPA0464461),

[0111] -光呼吸作用降低的基因修饰植物,其具有更高的产量和更高的胁迫耐受性(EPA 0305398),

[0112] -生产药用或诊断用的重要蛋白质的转基因作物植物(“分子农场”(molecular pharming))

[0113] -具有更高产量或更好品质特征的转基因作物,

[0114] -以例如上述新性能的组合(“基因叠加”)为特征的转基因作物。

[0115] 原则上,借助其可制备具有改进特性的新转基因植物的许多分子生物技术是已知的,参见例如I.Potrykus and G.Spangenberg(编)Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual(1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg. or Christou, “Trends in Plant Science”1(1996)第423-431页。

[0116] 为了进行这类重组操作,可以将可通过DNA序列重组而发生突变或序列改变的核酸分子引入质粒中。例如,可借助于标准方法进行碱基置换、移除部分序列或加入天然的或合成的序列。为了使DNA片段彼此连接,可向片段上添加接头(adapter)或连接体(linker);参见,例如Sambrook et al.,1989,Molecular Cloning,A Laboratory Manual,第二版,Cold Spring Harbor Laboratory Press,Cold Spring Harbor,NY;或Winnacker“Gene und Klone”,VCH Weinheim第二版,1996。

[0117] 例如,基因产物活性降低的植物细胞的产生可以通过下列方法实现:通过表达至少一种相应的反义RNA、用于实现共抑制效应的正义RNA,或者通过表达至少一种对上述基因产物的转录物进行特异性裂解而相应构建的核酶。为此,可以首先使用包括基因产物的完整编码序列——包括所有可能存在的侧翼序列——的DNA分子,也可以使用仅含有部分编码序列的DNA分子,其中所述部分编码序列必须足够长,以便在细胞中产生反义效果。还可以使用与所述基因产物的编码序列具有高度同源性但并不完全相同的DNA序列。

[0118] 当表达植物中的核酸分子时,所合成的蛋白可被定位至植物细胞的任意所需的区

室中。然而,为了实现在特定区室中的定位,可以例如将编码区与确保在特定区室中定位的DNA序列相连。此类序列是本领域技术人员已知的(参见,例如Braun et al.,EMBO J.11 (1992),3219-3227;Wolter et al.,Proc.Natl.Acad.Sci.USA 85(1988),第846-850页;Sonnewald et al.,Plant J.1(1991),第95-106页)。核酸分子还可在植物细胞的细胞器中表达。

[0119] 转基因植物细胞可通过已知的技术再生以得到完整植物。原则上,所述转基因植物可为任意所需植物品种的植物,即既可为单子叶植物也可为双子叶植物。

[0120] 因此,可以通过对同源(即天然)基因或基因序列的过表达、阻遏或抑制,或者通过对异源(即外源)基因或基因序列的表达而获得性质改变的转基因植物。

[0121] 优选将本发明的化合物用于对以下物质具有抗性的转基因作物中:生长调节剂,例如麦草畏;或者抑制重要的植物酶(例如乙酰乳酸合成酶(ALS)、5-烯醇式丙酮酰莽草酸-3-磷酸(EPSP)合成酶、谷氨酰胺合成酶(GS)或羟基苯丙酮酸双加氧酶(HPPD))的除草剂;或者选自磺酰脲、草甘膦、草铵磷或苯甲酰基异噁唑以及类似的活性化合物的除草剂。

[0122] 当将本发明的活性化合物用于转基因作物时,除了可在其他作物中观察到的对于有害植物的效果之外,还观察到施用于所述转基因作物的特殊效果,例如改变了或特别是拓宽了可防治的杂草谱、改进了施用时可以使用的施用率、优选地与转基因作物对其有抗性的除草剂的良好结合性,以及对转基因作物植物的生长和产量的影响。

[0123] 因此,本发明还涉及本发明的化合物作为除草剂用于防治转基因作物中的有害植物的用途。

[0124] 本发明的化合物可以可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、可喷洒溶液剂、粉剂或颗粒剂的形式以常规制剂使用。因此,本发明还提供含有本发明的化合物的除草组合物和植物生长调节组合物。

[0125] 根据本发明的化合物可以多种方式根据其需要的生物学和/或物理化学参数进行配制。合适的制剂包括,例如:可湿性粉剂(WP)、水溶性粉剂(SP)、水溶性浓缩剂、可乳化浓缩剂(EC)、乳剂(EW)(例如水包油型乳剂和油包水型乳剂)、可喷洒型溶液剂、悬浮浓缩剂(SC)、油基分散剂或水基分散剂、油混溶性溶液剂、胶囊悬浮剂(CS)、粉剂(DP)、拌种产品、撒播和土壤施用的颗粒剂、微粒形式的颗粒剂(GR)、喷洒颗粒剂、包衣颗粒剂和吸附性颗粒剂、水分散性颗粒剂(WG)、水溶性颗粒剂(SG)、ULV制剂、微胶囊剂和蜡剂。

[0126] 这些制剂的各个类型原则上是已知的,并记载于下列文献中,例如:Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”[Chemical Technology],第7卷,C.Hauser Verlag Munich,第4版,1986;Wade van Valkenburg,“Pesticide Formulations”,Marcel Dekker, N.Y.,1973;K.Martens,“Spray Drying”Handbook,第3版.1979,G.Goodwin Ltd.London。

[0127] 所需的制剂助剂,例如惰性物质、表面活性剂、溶剂和其他添加剂也是已知的,并记载于下列文献中,例如:Watkins,“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”,第2版,Darland Books,Caldwell N.J.;H.v.Olphen,“Introduction to Clay Colloid Chemistry”;第2版,J.Wiley&Sons,N.Y.;C.Marsden,“Solvents Guide”;第2版,Interscience,N.Y.1963;McCutcheon’s“Detergents and Emulsifiers Annual”,MC Publ.Corp.,Ridgewood N.J.;Sisley and Wood,“Encyclopedia of Surface Active Agents”,Chem.Publ.Co.Inc.,N.Y.1964; **Schönfeldt,**

"Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", 第7卷, C. Hanser Verlag Munich, 第4版, 1986。

[0128] 基于上述制剂, 可以生产与其它农药活性物质(例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂和杀菌剂)以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物, 例如以成品制剂的形式或作为桶混物。合适的安全剂为, 例如吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)、解毒唑(cloquintocet-mexyl)和二氯丙烯胺(dichlormid)。

[0129] 可湿性粉剂为可均匀分散于水中的制剂, 其除了含有活性化合物——稀释剂或惰性物质除外——外, 还含有离子型表面活性剂和/或非离子型表面活性剂(湿润剂、分散剂), 例如聚乙氧基化烷基酚、聚乙氧基化脂肪醇、聚乙氧基化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基苯磺酸盐、木素磺酸钠、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰基甲基牛磺酸钠。为了制备可湿性粉剂, 将除草活性的化合物例如在常规设备(例如锤式研磨机、鼓风式研磨机和空气喷射式研磨机)中精细研磨, 并同时或随后与制剂助剂相混合。

[0130] 可乳化浓缩剂通过下述过程制备: 将活性化合物溶于有机溶剂(例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或相对高沸点的芳香族化合物或烃类)或有机溶剂混合物中, 并加入一种或多种离子型和/或非离子型表面活性剂(乳化剂)。可使用的乳化剂的实例为: 烷基芳基磺酸钙盐, 例如十二烷基苯磺酸钙; 或非离子型乳化剂, 例如脂肪酸聚乙二醇酯、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、环氧丙烷-环氧乙烷缩合物、烷基聚醚、山梨聚糖酯, 例如山梨聚糖脂肪酸酯或聚氧乙烯山梨聚糖酯例如聚氧乙烯山梨聚糖脂肪酸酯。

[0131] 粉剂可通过将活性化合物与细分散的固体物质一起研磨而制得, 所述固体物质例如滑石、天然粘土(例如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。

[0132] 悬浮浓缩剂可为水基或油基的。它们可以例如通过使用市售的球磨机并任选地加入例如在上文其他剂型中所列的表面活性剂进行湿研磨而制备。

[0133] 乳剂例如水包油型乳剂(EW), 可以例如使用搅拌器、胶体磨机和/或静态混合器并使用水性有机溶剂以及任选地使用例如在上文其他剂型中所列的表面活性剂来制备。

[0134] 颗粒剂可以通过将所述活性化合物喷洒在吸附性颗粒状惰性物质上、或通过使用粘合剂(例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油)将活性化合物浓缩物施用到载体(例如砂、高岭土或颗粒状惰性材料)表面而制备。合适的活性化合物还可以制备肥料颗粒的常规方式——如果需要, 可以与肥料混合——制备成颗粒。

[0135] 水分散性颗粒剂通常可以通过常规方法, 例如喷雾-干燥法、流化床制粒法、盘式制粒法、使用高速混合器混合以及不使用固体惰性物质挤出而制备。

[0136] 关于盘式颗粒、流化床颗粒、挤出颗粒和喷雾颗粒的制备, 参见例如: "Spray-Drying Handbook" 第3版, 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, 第147页及后文; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 第5版, McGraw-Hill, New York 1973, 第8-57页。

[0137] 关于作物保护组合物制剂的其他详细内容, 参见例如 G. C. Klingman, "Weed

Control as a Science”, John Wiley and Sons., Inc., New York, 1961, 第81-96页和 J.D.Freyer, S.A.Evans, “Weed Control Handbook”, 第5版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 第101-103页。

[0138] 所述农业化学制剂通常含有0.1至99重量%、特别为0.1至95重量%的本发明的化合物。

[0139] 在可湿性粉剂中, 活性化合物的浓度为, 例如约10至90重量%, 100重量%的剩余部分由常规制剂成分组成。在可乳化浓缩剂中, 活性化合物的浓度可为约1至90重量%, 优选5至80重量%。粉剂形式的制剂中含有1至30重量%的活性化合物, 通常优选5至20重量%的活性化合物; 可喷洒型溶液剂中含有约0.05至80重量%、优选2至50重量%的活性化合物。在水分散性颗粒剂中, 活性化合物的含量部分地取决于所述活性化合物以液体形式还是固体形式存在, 以及所使用的颗粒化助剂和填料等。在水分散性颗粒剂中, 活性化合物的含量为, 例如1至95重量%, 优选10至80重量%。

[0140] 此外, 所提及的活性化合物制剂中任选含有各常规粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、抗冻剂和溶剂、填料、载体和染料、消泡剂、蒸发抑制剂、影响pH值和粘度的试剂。

[0141] 基于这些制剂, 还可生产与其它农药活性物质(例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂和杀真菌剂)以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物, 例如以成品制剂或桶混物的形式。

[0142] 为了使用, 如果合适, 将以市售形式的制剂以常规方式稀释, 例如在可湿性粉剂、可乳化浓缩剂、分散剂和水分散性颗粒剂的情况下用水稀释。粉剂、土壤颗粒剂或播撒型颗粒剂和可喷洒型溶液剂形式的制剂在使用前通常不用其他惰性物质进一步稀释。

[0143] 式(I)的化合物所需的施用率随外界条件(包括温度、湿度和所使用的除草剂类型)变化。其可在宽范围内变化, 例如在0.001和1.0kg/ha之间或更多的活性物质, 然而, 优选在0.005和750g/ha之间。

[0144] 下列实施例用于说明本发明。

[0145] A. 化学实施例

[0146] 合成2-氯-4-(甲基磺酰基)-N-(1,3-噁唑-2-基)-3-[(2,2,2-三氟乙氧基)甲基]苯甲酰胺, (表实例编号1-334)

[0147] 在室温(RT)下, 将347mg (1.0mmol) 2-氯-4-(甲基磺酰基)-3-[(2,2,2-三氟乙氧基)甲基]苯甲酸和84mg (1.0mmol) 1,3-噁唑-2-胺溶于7ml二氯甲烷中, 并加入0.14ml (1.0mmol) 三乙胺、24mg (0.20mmol) DMAP和955mg (1.5mmol) 2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷2,4,6-三氧化物(50% THF溶液)。反应混合物在室温下搅拌20小时, 然后用水洗涤两次(每次5ml)。用Na₂SO₄干燥有机相并浓缩。残余物使用柱色谱(HPLC, 乙腈/水)纯化。得到产物93mg (20%)。

[0148] 合成2-氯-N-(4-甲基-1,3-噁唑-2-基)-4-(甲基磺酰基)苯甲酰胺, (表实例编号7-13)

[0149] 在室温下, 将574mg (2.0mmol) 2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酸和240mg (1.0mmol) 4-甲基-1,3-噁唑-2-胺溶于7ml二氯甲烷中, 并加入0.34ml (2.0mmol) 三乙胺、60mg (0.49mmol) DMAP和2.335g (4mmol) 2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷2,4,6-三氧化物

(50% THF溶液)。反应混合物在室温下搅拌20小时,然后用水洗涤两次(每次5ml)。用 Na_2SO_4 干燥有机相并浓缩。残余物使用柱色谱(HPLC,乙腈/水)纯化。得到产物66mg(7.3%)。

[0150] 合成2-氯-N-(4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-4-(甲基磺酰基)苯甲酰胺,(表实例编号9-13)

[0151] 在室温下,将293mg(1.25mmol)2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酸和200mg(1.25mmol)4-苯-1,3-噁唑-2-胺溶于7ml二氯甲烷中,并加入0.17ml(1.25mmol)三乙胺、31mg(0.25mmol)DMAP和1.19g(1.88mmol)2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷2,4,6-三氧化物(50% THF溶液)。反应混合物在室温下搅拌20小时,然后用水洗涤两次(每次5ml)。用 Na_2SO_4 干燥有机相并浓缩。残余物使用柱色谱(HPLC,乙腈/水)纯化。得到产物91mg(17%)。

[0152] 合成2-氯-N-(1,3-噁唑-2-基)-6-(三氟甲基)烟酰胺,(表实例编号10-1)

[0153] 在室温下,将537mg(2.38mmol)2-氯-6-(三氟甲基)烟酸和200mg(2.38mmol)1,3-噁唑-2-胺溶于7ml二氯甲烷中,并加入0.33ml(2.38mmol)三乙胺、58mg(0.47mmol)DMAP和2.27g(3.57mmol)2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷2,4,6-三氧化物(50% THF溶液)。反应混合物在室温下搅拌20小时,然后用水洗涤两次(每次5ml)。用 Na_2SO_4 干燥有机相并浓缩。残余物使用柱色谱(HPLC,乙腈/水)纯化。得到产物40mg(5%)。

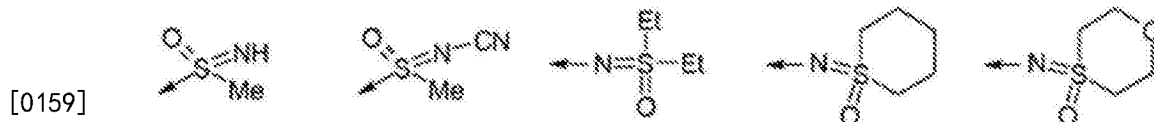
[0154] 下表中所列的实例用与上述方法类似的方法制备或用与上述方法类似的方法得到。非常特别优选下表中所列的化合物。

[0155] 使用的缩写和术语表示:

[0156] Et=乙基 Me=甲基 n-Pr=正丙基 c-Pr=环丙基

[0157] i-Pr=异丙基 Bn=苄基 Ph=苯基 Ac=乙酰基

[0158] t-Bu=叔丁基



亚磷酰胺 1

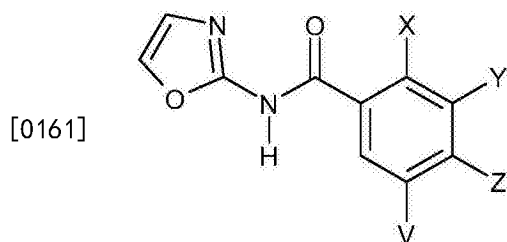
亚磷酰胺 2

亚磷酰胺 3

亚磷酰胺 4

亚磷酰胺 5

[0160] 表1:本发明通式(I)的化合物,其中R和R'代表H且A代表C-Y。



[0162]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-1	F	H	F	H	
1-2	F	H	Cl	H	
1-3	F	H	SO ₂ Me	H	
1-4	F	H	SO ₂ Et	H	
1-5	F	H	CF ₃	H	
1-6	F	H	NO ₂	H	
1-7	Cl	H	F	H	
1-8	Cl	H	F	F	
1-9	Cl	H	Cl	H	
1-10	Cl	H	Br	H	
1-11	Cl	H	SMe	H	
1-12	Cl	H	SOMe	H	
1-13	Cl	H	SO ₂ Me	H	
1-14	Cl	H	SO ₂ Et	H	
1-15	Cl	H	CF ₃	H	
1-16	Cl	H	NO ₂	H	
1-17	Cl	H	吡啶-1-基	H	
1-18	Br	H	Cl	H	
1-19	Br	H	Br	H	
1-20	Br	H	SO ₂ Me	H	
1-21	Br	H	SO ₂ Et	H	
1-22	Br	H	CF ₃	H	
1-23	SO ₂ Me	H	Cl	H	
1-24	SO ₂ Me	H	Br	H	
1-25	SO ₂ Me	H	SMe	H	
1-26	SO ₂ Me	H	SOMe	H	
1-27	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me	H	
1-28	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et	H	
1-29	SO ₂ Me	H	CF ₃	H	
1-30	SO ₂ Et	H	Cl	H	
1-31	SO ₂ Et	H	Br	H	

[0163]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-32	NO ₂	H	NO ₂	H	
1-33	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me	H	
1-34	SO ₂ Et	H	CF ₃	H	
1-35	CH ₂ SO ₂ Me	H	Br	H	
1-36	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	H	12.03 (s, 1H), 7.95-7.86 (m, 4H), 7.17 (s, 1H), 4.97 (s, 2H), 2.96 (s, 3H)
1-37	NO ₂	H	F	H	
1-38	NO ₂	H	Cl	H	
1-39	NO ₂	H	Br	H	
1-40	NO ₂	H	I	H	
1-41	NO ₂	H	CN	H	
1-42	NO ₂	H	SO ₂ Me	H	
1-43	NO ₂	H	SO ₂ Et	H	
1-44	NO ₂	H	CF ₃	H	
1-45	Me	H	F	H	
1-46	Me	H	Cl	H	
1-47	Me	H	Br	H	
1-48	Me	H	I	H	
1-49	Me	H	CN	H	
1-50	Me	H	SO ₂ Me	H	
1-51	Me	H	SO ₂ Et	H	
1-52	Me	H	CF ₃	H	
1-53	Et	H	F	H	
1-54	Et	H	Cl	H	
1-55	Et	H	Br	H	
1-56	Et	H	I	H	
1-57	Et	H	CN	H	
1-58	Et	H	SO ₂ Me	H	
1-59	Et	H	SO ₂ Et	H	
1-60	Et	H	CF ₃	H	
1-61	CF ₃	H	NO ₂	H	
1-62	CF ₃	H	Br	H	
1-63	CF ₃	H	CF ₃	H	
1-64	CF ₃	H	SO ₂ Me	H	
1-65	CF ₃	H	SO ₂ Et	H	
1-66	CF ₃	H	Cl	H	
1-67	NO ₂	NH ₂	F	H	
1-68	NO ₂	NHMe	F	H	
1-69	NO ₂	NMe ₂	F	H	
1-70	NO ₂	Me	Cl	H	

[0164]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-71	NO ₂	NH ₂	Cl	H	
1-72	NO ₂	NHMe	Cl	H	
1-73	NO ₂	NMe ₂	Cl	H	
1-74	NO ₂	NH ₂	Br	H	
1-75	NO ₂	NHMe	Br	H	
1-76	NO ₂	NMe ₂	Br	H	
1-77	NO ₂	NH ₂	CF ₃	H	
1-78	NO ₂	NMe ₂	CF ₃	H	
1-79	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me	H	
1-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et	H	
1-81	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me	H	
1-82	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me	H	
1-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et	H	
1-84	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4- 三唑-1-基	H	
1-85	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4- 三唑-1-基	H	
1-86	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4- 三唑-1-基	H	
1-87	Me	F	F	H	
1-88	Me	F	Cl	H	
1-89	Me	Me	SO ₂ Me	H	
1-90	Me	F	SO ₂ Me	H	
1-91	Me	Cl	Cl	H	
1-92	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-93	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl	H	
1-94	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl	H	
1-95	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl	H	
1-96	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl	H	
1-97	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)N Me ₂	Cl	H	
1-98	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)N HCO ₂ Et	Cl	H	
1-99	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl	H	
1-100	Me	OCH ₂ -NHSO ₂ cPr	Cl	H	
1-101	Me	O(CH ₂)-5-2,4-二甲 基-2,4-二氢 -3H-1,2,4-三唑-3-酮	Cl	H	
1-102	Me	O(CH ₂)-3,5-二甲基 -1,2-噁唑-4-基	Cl	H	
1-103	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Br	H	
1-104	Me	O(CH ₂)-5-吡咯烷-2- 酮	Br	H	

[0165]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-105	Me	Cl	CF ₃	H	
1-106	Me	Me	SO ₂ Me	H	
1-107	Me	4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Me	H	
1-108	Me	4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Et	H	
1-109	Me	5-氟基甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Me	H	
1-110	Me	5-氟基甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Et	H	
1-111	Me	NHCH ₂ C(O)NMe ₂	SO ₂ Me	H	
1-112	Me	SMe	Me	H	
1-113	Me	SOMe	Me	H	
1-114	Me	SO ₂ Me	Me	H	
1-115	Me	SEt	Me	H	
1-116	Me	SOEt	Me	H	
1-117	Me	SO ₂ Et	Me	H	
1-118	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Me	H	
1-119	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Me	H	
1-120	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Me	H	
1-121	Me	SO ₂ cPr	Me	H	
1-122	Me	OH	SO ₂ Me	H	
1-123	Me	OMe	SO ₂ Me	H	
1-124	Me	OMe	SO ₂ Et	H	
1-125	Me	OEt	SO ₂ Me	H	
1-126	Me	OEt	SO ₂ Et	H	
1-127	Me	OiPr	SO ₂ Me	H	
1-128	Me	OiPr	SO ₂ Et	H	
1-129	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-130	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	H	
1-131	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	H	
1-132	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	H	
1-133	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	H	
1-134	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	H	
1-135	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me	H	
1-136	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et	H	
1-137	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me	H	
1-138	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et	H	
1-139	Me	[1,4]二氧杂环己烷-2-基-甲氧基	SO ₂ Me	H	
1-140	Me	[1,4]二氧杂环己烷-2-基-甲氧基	SO ₂ Et	H	

[0166]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-141	Me	O(CH ₂) ₂ -O-(3,5-二甲氧基嘧啶-2-基)	SO ₂ Me	H	
1-142	Me	Cl	SO ₂ Me	H	8.01 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.18 (d, 1H), 3.42 (s, 3H), 2.42 (s, 1H)
1-143	Me	SMe	H	H	
1-144	Me	SOMe	H	H	
1-145	Me	SO ₂ Me	H	H	
1-146	Me	SEt	H	H	
1-147	Me	SOEt	H	H	
1-148	Me	SO ₂ Et	H	H	
1-149	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H	H	
1-150	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H	H	
1-151	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H	H	
1-152	Me	SMe	F	H	
1-153	Me	SOMe	F	H	
1-154	Me	SO ₂ Me	F	H	
1-155	Me	SEt	F	H	
1-156	Me	SOEt	F	H	
1-157	Me	SO ₂ Et	F	H	
1-158	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	F	H	
1-159	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	F	H	
1-160	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	F	H	
1-161	Me	SMe	SO ₂ Me	H	
1-162	Me	SOMe	SO ₂ Me	H	
1-163	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	8.23 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.94(s, 1H), 7.19 (s, 1H), 3.59 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 2.68 (s, 3H)
1-164	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et	H	
1-165	Me	SEt	SO ₂ Me	H	
1-166	Me	SOEt	SO ₂ Me	H	
1-167	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me	H	
1-168	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-169	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-170	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-171	Me	SMe	CF ₃	H	11.76 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.16 (s, 1H), 2.67 (s, 3H), 2.31 (s, 3H)

[0167]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-172	Me	SOMe	CF ₃	H	11.88 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.79(d, 1H), 7.17 (s, 1H), 3.04 (s, 3H), 2.83 (s, 3H)
1-173	Me	SO ₂ Me	CF ₃	H	
1-174	Me	SEt	CF ₃	H	
1-175	Me	SOEt	CF ₃	H	
1-176	Me	SO ₂ Et	CF ₃	H	
1-177	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-178	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-179	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-180	Me	SMe	Br	H	
1-181	Me	SOMe	Br	H	
1-182	Me	SO ₂ Me	Br	H	
1-183	Me	SEt	Br	H	
1-184	Me	SOEt	Br	H	
1-185	Me	SO ₂ Et	Br	H	
1-186	Me	SMe	I	H	
1-187	Me	SOMe	I	H	
1-188	Me	SO ₂ Me	I	H	
1-189	Me	SEt	I	H	
1-190	Me	SOEt	I	H	
1-191	Me	SO ₂ Et	I	H	
1-192	Me	SMe	Cl	H	
1-193	Me	SOMe	Cl	H	
1-194	Me	SO ₂ Me	Cl	H	
1-195	Me	SEt	Cl	H	
1-196	Me	SOEt	Cl	H	
1-197	Me	SO ₂ Et	Cl	H	
1-198	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-199	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-200	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-201	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me	H	
1-202	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me	H	
1-203	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me	H	
1-204	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me	H	
1-205	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me	H	
1-206	CH ₂ O(CH ₂) ₂	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	

[0168]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
	OMe				
1-207	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	H	
1-208	Et	SMe	Cl	H	
1-209	Et	SOMe	Cl	H	
1-210	Et	SO ₂ Me	Cl	H	
1-211	Et	SMe	CF ₃	H	
1-212	Et	SOMe	CF ₃	H	
1-213	Et	SO ₂ Me	CF ₃	H	
1-214	Et	F	SO ₂ Me	H	
1-215	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-216	iPr	SMe	CF ₃	H	
1-217	iPr	SOMe	CF ₃	H	
1-218	iPr	SO ₂ Me	CF ₃	H	
1-219	cPr	SMe	CF ₃	H	
1-220	cPr	SOMe	CF ₃	H	
1-221	cPr	SO ₂ Me	CF ₃	H	
1-222	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F	H	
1-223	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F	H	
1-224	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F	H	
1-225	CF ₃	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基-甲氧基	F	H	
1-226	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-227	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl	H	
1-228	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl	H	
1-229	CF ₃	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	Cl	H	
1-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	H	
1-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br	H	
1-232	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br	H	
1-233	CF ₃	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	Br	H	
1-234	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I	H	
1-235	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I	H	
1-236	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I	H	
1-237	CF ₃	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	I	H	
1-238	CF ₃	F	SO ₂ Me	H	
1-239	CF ₃	F	SO ₂ Et	H	
1-240	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-241	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	H	
1-242	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	H	

[0169]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-243	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	H	
1-244	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me	H	
1-245	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et	H	
1-246	CF ₃	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	SO ₂ Me	H	
1-247	CF ₃	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	SO ₂ Et	H	
1-248	F	SMe	CF ₃	H	
1-249	F	SOMe	CF ₃	H	
1-250	Cl	Me	SO ₂ Et	H	11.92 (s, 1H), 8.07 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.69(d, 1H), 7.15 (s, 1H), 3.39 (q, 2H), 2.71 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)
1-251	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl	H	
1-252	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl	H	
1-253	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-254	Cl	OCH ₂ CONMe ₂	Cl	H	11.88 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.58(d, 1H), 7.15 (s, 1H), 4.73 (s, 2H), 3.01 (s, 3H), 2.87 (s, 3H)
1-255	Cl	O(CH ₂)-5-吡咯烷-2- 酮	Cl	H	
1-256	Cl	SMe	H	H	
1-257	Cl	SOMe	H	H	
1-258	Cl	SO ₂ Me	H	H	
1-259	Cl	SEt	H	H	
1-260	Cl	SOEt	H	H	
1-261	Cl	SO ₂ Et	H	H	
1-262	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	H	H	
1-263	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	H	H	
1-264	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H	H	
1-265	Cl	SMe	Me	H	
1-266	Cl	SOMe	Me	H	
1-267	Cl	SO ₂ Me	Me	H	
1-268	Cl	SEt	Me	H	
1-269	Cl	SOEt	Me	H	
1-270	Cl	SO ₂ Et	Me	H	
1-271	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	Me	H	
1-272	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	Me	H	
1-273	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Me	H	

[0170]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-274	Cl	SMe	F	H	
1-275	Cl	SOMe	F	H	
1-276	Cl	SO ₂ Me	F	H	
1-277	Cl	SEt	F	H	
1-278	Cl	SOEt	F	H	
1-279	Cl	SO ₂ Et	F	H	
1-280	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	F	H	
1-281	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	F	H	
1-282	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	F	H	
1-283	Cl	SMe	SO ₂ Me	H	12.02 (s, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.17 (s, 1H), 3.57 (s, 3H), 2.52 (s, 3H)
1-284	Cl	SOMe	SO ₂ Me	H	8.22 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.19 (s, 1H), 3.54 (s, 3H), 2.50 (s, 3H)
1-285	Cl	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	
1-286	Cl	SO ₂ Me	SO ₂ Et	H	
1-287	Cl	SEt	SO ₂ Me	H	
1-288	Cl	SOEt	SO ₂ Me	H	
1-289	Cl	SO ₂ Et	SO ₂ Me	H	
1-290	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-291	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-292	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-293	Cl	SMe	CF ₃	H	12.01 (bs, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.89 (d, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 2.09 (s, 3H)
1-294	Cl	SOMe	CF ₃	H	12.12 (bs, 1H), 8.01-7.92 (m, 3H), 7.18 (s, 1H), 2.50 (s, 3H)
1-295	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	H	12.20 (bs, 1H), 8.16-8.11 (m, 2H), 7.96 (s, 1H), 3.52 (s, 3H)
1-296	Cl	SEt	CF ₃	H	
1-297	Cl	SOEt	CF ₃	H	
1-298	Cl	SO ₂ Et	CF ₃	H	
1-299	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-300	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-301	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-302	Cl	SMe	Br	H	
1-303	Cl	SOMe	Br	H	
1-304	Cl	SO ₂ Me	Br	H	

[0171]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-305	Cl	SEt	Br	H	
1-306	Cl	SOEt	Br	H	
1-307	Cl	SO ₂ Et	Br	H	
1-308	Cl	SMe	I	H	
1-309	Cl	SOMe	I	H	
1-310	Cl	SO ₂ Me	I	H	
1-311	Cl	SEt	I	H	
1-312	Cl	SOEt	I	H	
1-313	Cl	SO ₂ Et	I	H	
1-314	Cl	SMe	Cl	H	
1-315	Cl	SOMe	Cl	H	
1-316	Cl	SO ₂ Me	Cl	H	
1-317	Cl	SEt	Cl	H	
1-318	Cl	SOEt	Cl	H	
1-319	Cl	SO ₂ Et	Cl	H	
1-320	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-321	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-322	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-323	Cl	F	SMe	H	
1-324	Cl	Cl	SO ₂ Me	H	
1-325	Cl	COOMe	SO ₂ Me	H	
1-326	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me	H	
1-327	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me	H	
1-328	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-329	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	H	
1-330	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me	H	
1-331	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et	H	
1-332	Cl	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-333	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me	H	
1-334	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	12.05 (bs, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.94-7.89 (m, 2H), 7.18 (s, 1H), 5.24 (s, 2H), 4.28 (q, 2H), 3.35 (s, 3H)
1-335	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et	H	
1-336	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me	H	
1-337	Cl	CH ₂ OcPentyl	SO ₂ Me	H	
1-338	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me	H	
1-339	Cl	4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SMe	H	
1-340	Cl	4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Me	H	

[0172]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-341	Cl	4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Et	H	
1-342	Cl	5-氟基甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Me	H	
1-343	Cl	5-氟基甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Et	H	
1-344	Cl	5-(甲氧基甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Et	H	
1-345	Cl	5-(甲氧基甲基)-5-甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Et	H	
1-346	Cl	CH ₂ O-四氢呋喃-3-基	SO ₂ Me	H	
1-347	Cl	CH ₂ O-四氢呋喃-3-基	SO ₂ Et	H	
1-348	Cl	CH ₂ OCH ₂ -四氢呋喃-2-基	SO ₂ Me	H	
1-349	Cl	CH ₂ OCH ₂ -四氢呋喃-2-基	SO ₂ Et	H	
1-350	Cl	CH ₂ OCH ₂ -四氢呋喃-3-基	SO ₂ Me	H	
1-351	Cl	CH ₂ OCH ₂ -四氢呋喃-3-基	SO ₂ Et	H	
1-352	Cl	OMe	SO ₂ Me	H	
1-353	Cl	OMe	SO ₂ Et	H	
1-354	Cl	OEt	SO ₂ Me	H	
1-355	Cl	OEt	SO ₂ Et	H	
1-356	Cl	OiPr	SO ₂ Me	H	
1-357	Cl	OiPr	SO ₂ Et	H	
1-358	Cl	OnPr	SO ₂ Me	H	
1-359	Cl	O(CH ₂) ₂ F	SO ₂ Me	H	
1-360	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-361	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	H	
1-362	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	H	
1-363	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	H	
1-364	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	H	
1-365	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-366	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	H	
1-367	Cl	OCH ₂ -c-Pr	SO ₂ Et	H	
1-368	Cl	[1,4]二氧杂环己烷-2-基-甲氧基	SO ₂ Me	H	
1-369	Cl	[1,4]二氧杂环己烷-2-基-甲氧基	SO ₂ Et	H	
1-370	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me	H	

[0173]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-371	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et	H	
1-372	Br	OMe	Br	H	
1-373	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	H	
1-374	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-375	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	H	
1-376	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	H	
1-377	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	H	
1-378	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	H	
1-379	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	H	
1-380	Br	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	SO ₂ Me	H	
1-381	Br	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	SO ₂ Et	H	
1-382	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-383	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	H	
1-384	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	H	
1-385	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	H	
1-386	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	H	
1-387	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	H	
1-388	I	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	SO ₂ Me	H	
1-389	I	[1,4]二氧杂环己烷 -2-基甲氧基	SO ₂ Et	H	
1-390	OMe	SMe	CF ₃	H	
1-391	OMe	SOMe	CF ₃	H	
1-392	OMe	SO ₂ Me	CF ₃	H	
1-393	OMe	SEt	CF ₃	H	
1-394	OMe	SOEt	CF ₃	H	
1-395	OMe	SO ₂ Et	CF ₃	H	
1-396	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-397	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-398	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-399	OMe	SMe	CHF ₂	H	
1-400	OMe	SOMe	CHF ₂	H	
1-401	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	H	
1-402	OMe	SEt	CHF ₂	H	
1-403	OMe	SOEt	CHF ₂	H	
1-404	OMe	SO ₂ Et	CHF ₂	H	
1-405	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	H	
1-406	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	H	
1-407	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	H	

[0174]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-408	OMe	SMe	Cl	H	
1-409	OMe	SOMe	Cl	H	
1-410	OMe	SO ₂ Me	Cl	H	
1-411	OMe	SEt	Cl	H	
1-412	OMe	SOEt	Cl	H	
1-413	OMe	SO ₂ Et	Cl	H	
1-414	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-415	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-416	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-417	OEt	SMe	CF ₃	H	
1-418	OEt	SOMe	CF ₃	H	
1-419	OEt	SO ₂ Me	CF ₃	H	
1-420	OEt	SEt	CF ₃	H	
1-421	OEt	SOEt	CF ₃	H	
1-422	OEt	SO ₂ Et	CF ₃	H	
1-423	OEt	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-424	OEt	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-425	OEt	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-426	OEt	SMe	CHF ₂	H	
1-427	OEt	SOMe	CHF ₂	H	
1-428	OEt	SO ₂ Me	CHF ₂	H	
1-429	OEt	SEt	CHF ₂	H	
1-430	OEt	SOEt	CHF ₂	H	
1-431	OEt	SO ₂ Et	CHF ₂	H	
1-432	OEt	S(CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	H	
1-433	OEt	SO(CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	H	
1-434	OEt	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CHF ₂	H	
1-435	OEt	SMe	Cl	H	
1-436	OEt	SOMe	Cl	H	
1-437	OEt	SO ₂ Me	Cl	H	
1-438	OEt	SEt	Cl	H	
1-439	OEt	SOEt	Cl	H	
1-440	OEt	SO ₂ Et	Cl	H	
1-441	OEt	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-442	OEt	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-443	OEt	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-444	O(CH ₂)c-Pr	SMe	CF ₃	H	
1-445	O(CH ₂)c-Pr	SOMe	CF ₃	H	
1-446	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃	H	
1-447	O(CH ₂)c-Pr	SEt	CF ₃	H	

[0175]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-448	O(CH ₂)c-Pr	SOEt	CF ₃	H	
1-449	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃	H	
1-450	O(CH ₂)c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-451	O(CH ₂)c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-452	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-453	O(CH ₂)c-Pr	SMe	Cl	H	
1-454	O(CH ₂)c-Pr	SOMe	Cl	H	
1-455	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ Me	Cl	H	
1-456	O(CH ₂)c-Pr	SEt	Cl	H	
1-457	O(CH ₂)c-Pr	SOEt	Cl	H	
1-458	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ Et	Cl	H	
1-459	O(CH ₂)c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-460	O(CH ₂)c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-461	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	H	
1-462	O(CH ₂)c-Pr	SMe	SO ₂ Me	H	
1-463	O(CH ₂)c-Pr	SOMe	SO ₂ Me	H	
1-464	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	
1-465	O(CH ₂)c-Pr	SEt	SO ₂ Me	H	
1-466	O(CH ₂)c-Pr	SOEt	SO ₂ Me	H	
1-467	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me	H	
1-468	O(CH ₂)c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-469	O(CH ₂)c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-470	O(CH ₂)c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-471	SO ₂ Me	F	CF ₃	H	
1-472	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃	H	
1-473	SO ₂ Me	NHEt	Cl	H	
1-474	SMe	SEt	F	H	
1-475	SMe	SMe	F	H	
1-476	Me	NH ₂	Cl	H	
1-477	Me	NHMe	Cl	H	
1-478	Me	NMe ₂	Cl	H	
1-479	Me	吡唑-1-基	Cl	H	
1-480	Me	NH ₂	Br	H	
1-481	Me	NHMe	Br	H	
1-482	Me	NMe ₂	Br	H	
1-483	Me	NH ₂	SO ₂ Me	H	
1-484	Me	NHMe	SO ₂ Me	H	
1-485	Me	NMe ₂	SO ₂ Me	H	
1-486	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-487	Me	吗啉-4-基	SO ₂ Me	H	

[0176]

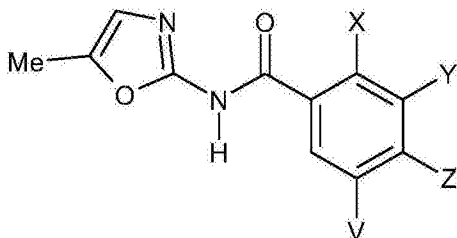
编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-488	Me	1,2,3-三唑-1-基	SO ₂ Me	H	
1-489	Me	1,2,3-三唑-2-基	SO ₂ Me	H	
1-490	Me	吡唑-1-基	SO ₂ Me	H	
1-491	Me	1,2,4-三唑-1-基	SO ₂ Me	H	
1-492	Me	NH ₂	CF ₃	H	
1-493	Me	NHMe	CF ₃	H	
1-494	Me	NMe ₂	CF ₃	H	
1-495	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-496	Me	吗啉-4-基	CF ₃	H	
1-497	Me	1,2,3-三唑-1-基	CF ₃	H	
1-498	Me	1,2,3-三唑-2-基	CF ₃	H	
1-499	Me	吡唑-1-基	CF ₃	H	
1-500	Me	1,2,4-三唑-1-基	CF ₃	H	
1-501	Cl	NH ₂	Cl	H	
1-502	Cl	NHMe	Cl	H	
1-503	Cl	NMe ₂	Cl	H	
1-504	Cl	吡唑-1-基	Cl	H	
1-505	Cl	NH ₂	Br	H	
1-506	Cl	NHMe	Br	H	
1-507	Cl	NMe ₂	Br	H	
1-508	Cl	NH ₂	SO ₂ Me	H	
1-509	Cl	NHMe	SO ₂ Me	H	
1-510	Cl	NMe ₂	SO ₂ Me	H	
1-511	Cl	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	H	
1-512	Cl	吗啉-4-基	SO ₂ Me	H	
1-513	Cl	1,2,3-三唑-1-基	SO ₂ Me	H	
1-514	Cl	1,2,3-三唑-2-基	SO ₂ Me	H	
1-515	Cl	吡唑-1-基	SO ₂ Me	H	
1-516	Cl	1,2,4-三唑-1-基	SO ₂ Me	H	
1-517	Cl	NH ₂	CF ₃	H	
1-518	Cl	NHMe	CF ₃	H	
1-519	Cl	NMe ₂	CF ₃	H	
1-520	Cl	NH(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	H	
1-521	Cl	吗啉-4-基	CF ₃	H	
1-522	Cl	1,2,3-三唑-1-基	CF ₃	H	
1-523	Cl	1,2,3-三唑-2-基	CF ₃	H	
1-524	Cl	吡唑-1-基	CF ₃	H	
1-525	Cl	1,2,4-三唑-1-基	CF ₃	H	
1-526	Cl	亚砷亚胺 1	Cl	H	
1-527	Cl	亚砷亚胺 2	Cl	H	

[0177]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-528	Cl	亚砷亚胺 3	Cl	H	
1-529	Cl	亚砷亚胺 4	Cl	H	
1-530	Cl	亚砷亚胺 5	Cl	H	
1-531	Cl	亚砷亚胺 3	OMe	H	
1-532	Cl	亚砷亚胺 4	OMe	H	
1-533	Cl	亚砷亚胺 5	OMe	H	
1-534	Cl	亚砷亚胺 3	COOMe	H	
1-535	Cl	亚砷亚胺 4	COOMe	H	
1-536	Cl	亚砷亚胺 5	COOMe	H	
1-537	OMe	亚砷亚胺 3	OMe	H	
1-538	OMe	亚砷亚胺 4	OMe	H	
1-539	OMe	亚砷亚胺 5	OMe	H	
1-540	Me	亚砷亚胺 1	CF ₃	H	
1-541	Me	亚砷亚胺 2	CF ₃	H	
1-542	Me	亚砷亚胺 1	SO ₂ Me	H	
1-543	Me	亚砷亚胺 2	SO ₂ Me	H	
1-544	Me	亚砷亚胺 1	Cl	H	
1-545	Me	亚砷亚胺 2	Cl	H	

[0178] 表2:本发明通式(I)的化合物,其中R代表甲基且R'代表氢,A代表C-Y,且V、X、Y和Z具有表1所给出的定义。

[0179]

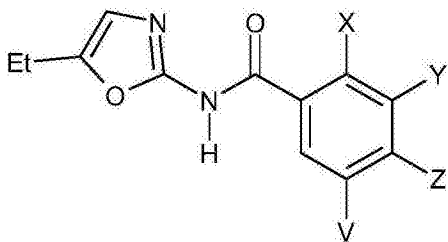


[0180]

编号	X	Y	Z	V	物理数据(1H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
2-173	Me	SO ₂ Me	CF ₃	H	11.82 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.63 (s, 1H), 3.41 (s, 3H), 2.70 (s, 3H), 2.07 (s, 3H)

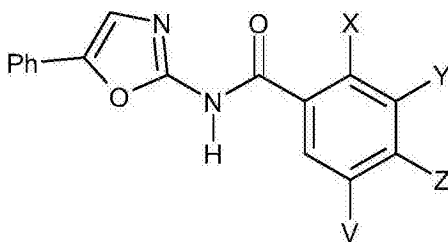
[0181] 表3:本发明通式(I)的化合物,其中R代表乙基且R'代表氢,A代表C-Y,且V、X、Y和Z具有表1所给出的定义。

[0182]



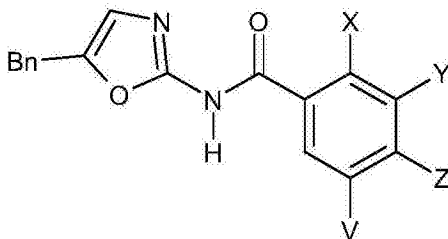
[0183] 表4:本发明通式(I)的化合物,其中R代表苯基且R'代表氢,A代表C-Y,且V、X、Y和Z具有表1所给出的定义。

[0184]



[0185] 表5:本发明通式(I)的化合物,其中R代表苄基且R'代表氢,A代表C-Y,且V、X、Y和Z具有表1所给出的定义。

[0186]

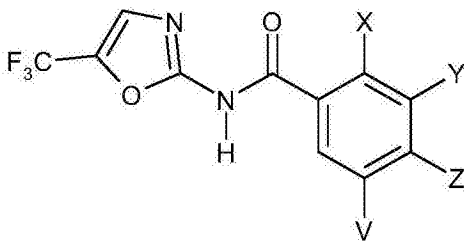


[0187]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
5-163	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	11.81 (s, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.34-7.25 (m, 5H), 6.66 (s, 1H), 4.02 (s, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 2.66 (s, 3H)
5-173	Me	SO ₂ Me	CF ₃	H	11.79 (bs, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.34-7.25 (m, 5H), 6.64 (s, 1H), 4.02 (s, 2H), 3.39 (s, 3H), 2.71 (s, 3H)

[0188] 表6:本发明通式(I)的化合物,其中R代表三氟甲基且R'代表氢,A代表C-Y,且V、X、Y和Z具有表1所给出的定义。

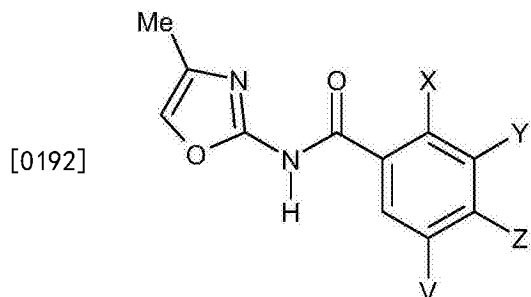
[0189]



[0190]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
6-173	Me	SO ₂ Me	CF ₃	H	7.92 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 3.26 (s, 3H), 2.87 (s, 3H),

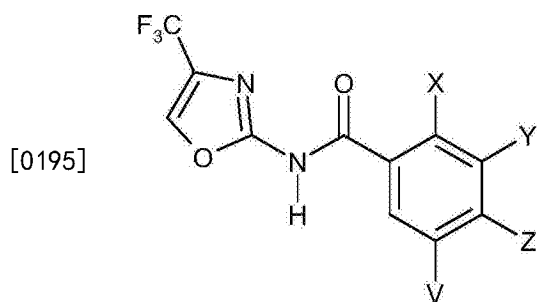
[0191] 表7: 本发明通式 (I) 的化合物, 其中R代表氢且R' 代表甲基, A代表C-Y, 且V、X、Y和Z具有表1所给出的定义。



[0193]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
7-13	Cl	H	SO ₂ Me	H	11.89 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.61 (d, 1H) 3.33 (s, 3H), 2.07 (s, 3H)
7-334	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	12.94 (s, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.62 (s, 1H), 5.24 (s, 2H), 4.28 (q, 2H), 3.36 (s, 3H), 2.08 (s, 3H)

[0194] 表8: 本发明通式 (I) 的化合物, 其中R代表氢, R' 代表三氟甲基且A代表C-Y, 且V、X、Y和Z具有表1所给出的定义。



[0196]

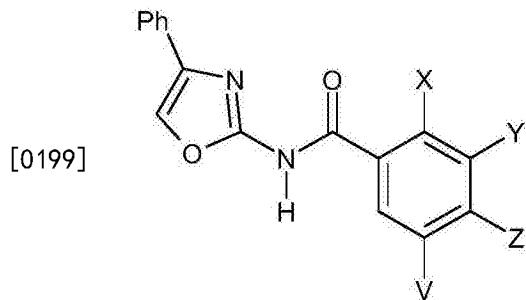
编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
8-13	Cl	H	SO ₂ Me	H	12.52 (s, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.13 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.95 (d, 1H) 3.33 (s, 3H)
8-29	CF ₃	H	SO ₂ Me	H	12.65 (s, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.37-8.22 (m, 2H), 8.08 (d, 1H), 3.34 (s, 3H)
8-32	NO ₂	H	NO ₂	H	12.75 (s, 1H), 8.89 (s, 1H), 8.81-8.65 (m, 2H), 8.13 (d, 1H),
8-37	NO ₂	H	F	H	12.79 (s, 1H), 8.89 (s, 1H), 8.80-8.67 (m, 2H), 8.13 (d, 1H),
8-38	NO ₂	H	Cl	H	12.51 (s, 1H), 8.71 (s, 1H),

[0197]

					8.31 (d, 1H), 8.01 (dd, 1H), 7.87 (d, 1H)
8-39	NO ₂	H	Br	H	12.50 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.14 (dd, 1H), 7.78 (d, 1H)
8-42	NO ₂	H	SO ₂ Me	H	12.67 (s, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.66 (d, 1H), 8.44 (dd, 1H), 8.12(d, 1H), 3.42 (s, 3H)
8-44	NO ₂	H	CF ₃	H	12.62 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 7.33 (d, 1H), 8.06 (d, 1H)
8-172	Me	SOMe	CF ₃	H	13.38 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 7.87-7.82 (m, 2H), 3.06 (s, 3H), 2.83 (s, 3H)
8-173	Me	SO ₂ Me	CF ₃	H	12.43 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 3.42 (s, 3H), 2.72 (s, 3H)
8-249	F	SOMe	CF ₃	H	
8-334	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	12.60 (s, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.11 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.30 (q, 2H), 3.36 (s, 3H)
8-343	Cl	5-氟基甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基	SO ₂ Et	H	12.60 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.11 (d, 1H), 8.07 (d, 1H), 5.19 (m, 1H), 3.66-3.54 (m, 1H), 3.25-3.49 (m, 5H), 3.17 (dd, 1H), 3.09-2.95 (m, 2H), 1.15 (t, 3H)
8-348	Cl	CH ₂ OCH ₂ -四氢吡喃-2-基	SO ₂ Me		12.54 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.00 (d,1H), 7.89 (d, 1H), 5.08 (s, 2H), 3.97 (m, 1H), 3.70 (dd, 1H), 3.65-3.51 (m, 3H), 3.40 (s, 3H), 1.93-1.70 (m, 3H), 1.58-1.49 (m, 1H).

[0198] 表9: 本发明通式(I)的化合物, 其中R代表氢, R'代表苯基且A代表C-Y, 且V、X、Y和Z

具有表1所给出的定义。



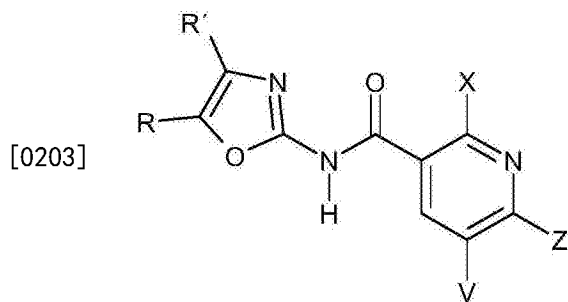
[0200]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
9-13	Cl	H	SO ₂ Me	H	8.87 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.87 (m,

[0201]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
					2H), 7.49 (m, 3H), 6.92 (s, 1H), 3.12 (s, 3H)
9-334	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	8.99 (s, 1H), 8.17 (d, 1H), 7.89-7.80 (m, 3H), 7.49 (m, 3H), 6.91 (s, 1H), 5.38 (s, 2H), 4.08 (q, 2H), 3.20 (s, 3H)

[0202] 表10: 本发明通式(I)的化合物, 其中A代表N。



[0204]

编号	R	R'	X	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
10-1	H	H	Cl	CF ₃	H	8.34 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 6.92 (s, 1H)
10-2	H	H	Me	CF ₃	H	8.22 (d, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 2.65 (s, 3H)
10-3	H	H	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-4	H	H	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-5	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-6	H	H				
10-7	H	Me	Cl	CF ₃	H	
10-8	H	Me	Me	CF ₃	H	
10-9	H	Me	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-10	H	Me	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-11	H	Me	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-12	H	Me				
10-13	H	Et	Cl	CF ₃	H	
10-14	H	Et	Me	CF ₃	H	
10-15	H	Et	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-16	H	Et	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-17	H	Et	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-18	H	Et				
10-19	H	CF ₃	Cl	CF ₃	H	

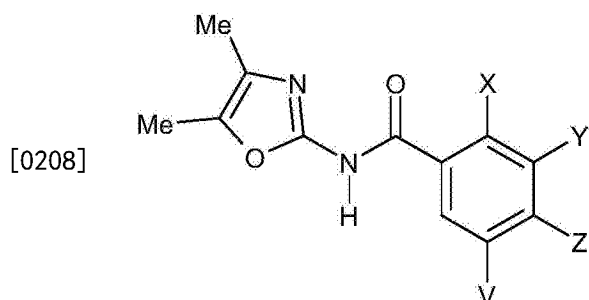
[0205]

编号	R	R'	X	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
10-20	H	CF ₃	Me	CF ₃	H	
10-21	H	CF ₃	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-22	H	CF ₃	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-23	H	CF ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-24	H	CF ₃				
10-25	H	Ph	Cl	CF ₃	H	9.32 (bs, 1H), 8.43 (d, 1H), 7.88-7.69 (m, 3H), 7.51-7.47 (m, 3H), 6.90 (s, 1H)
10-26	H	Ph	Me	CF ₃	H	
10-27	H	Ph	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-28	H	Ph	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-29	H	Ph	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-30	H	Ph				
10-31	Me	H	Cl	CF ₃	H	
10-32	Me	H	Me	CF ₃	H	
10-33	Me	H	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-34	Me	H	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-35	Me	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-36	Me	H				
10-37	Et	H	Cl	CF ₃	H	
10-38	Et	H	Me	CF ₃	H	
10-39	Et	H	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-40	Et	H	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-41	Et	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-42	Et	H				
10-43	CF ₃	H	Cl	CF ₃	H	
10-44	CF ₃	H	Me	CF ₃	H	
10-45	CF ₃	H	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-46	CF ₃	H	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-47	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-48	CF ₃	H				
10-49	Ph	H	Cl	CF ₃	H	
10-50	Ph	H	Me	CF ₃	H	
10-51	Ph	H	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-52	Ph	H	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-53	Ph	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	

[0206]

编号	R	R'	X	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
10-54	Ph	H				
10-55	Me	Me	Cl	CF ₃	H	8.48 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.12 (s, 3H)
10-56	Me	Me	Me	CF ₃	H	
10-57	Me	Me	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-58	Me	Me	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-59	Me	Me	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-60	Me	Me				
10-61	Ph	Ph	Cl	CF ₃	H	
10-62	Ph	Ph	Me	CF ₃	H	
10-63	Ph	Ph	CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-64	Ph	Ph	(1,1-二氧-1,2-噻二唑烷-1-基)-甲基	CF ₃	H	
10-65	Ph	Ph	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	
10-66	Ph	Ph				

[0207] 表11: 本发明通式 (I) 的化合物, 其中R和R' 代表甲基且A代表C-Y, 且V、X、Y和Z具有表1所给出的定义。



[0209]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
11-13	Cl	H	SO ₂ Me	H	11.48 (s, 1H), 8.02-7.97 (m, 2H), 7.86 (d, 1H), 3.07 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.11 (s, 3H)
11-29	SO ₂ Me		CF ₃	H	11.89(s, 1H), 8.30-8.14 (m, 2H), 7.92 (d, 1H), 3.50 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.02 (s, 3H)
11-173	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	H	7.98 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 3.37 (s, 3H), 2.70 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.01 (s, 3H)
11-334	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	8.11 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 5.39 (s, 2H), 4.02 (q, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.13 (s, 3H)
11-343	Cl	5-氟基甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑	SO ₂ Et	H	8.11 (d, 1H), 8.07 (d, 1H), 5.18 (m, 1H), 3.62-3.54 (m, 1H), 3.25-3.49

[0210]

编号	X	Y	Z	V	物理数据 (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
		-3-基			(m, 2H), 3.17 (dd, 1H), 3.09-2.96 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.15 (t, 3H)

[0211] B. 制剂实施例

[0212] a) 通过如下方法获得粉剂:将10重量份的式(I)化合物和/或其盐和90重量份的作为惰性物质的滑石混合并将该混合物在锤式磨机中粉碎。

[0213] b) 通过如下方法获得易分散于水中的可湿性粉剂:将25重量份的式(I)化合物和/或其盐、64重量份的作为惰性物质的含高岭土的石英、10重量份的木质素磺酸钾和1重量份的作为润湿剂和分散剂的油酰基甲基牛磺酸钠混合,并将该混合物在销-盘式磨机中研磨。

[0214] c) 通过如下方法获得易分散于水中的分散浓缩剂:将20重量份的式(I)的化合物和/或其盐与6重量份的烷基酚聚乙二醇醚(®**Triton** X207)、3重量份的异十三烷醇聚乙二醇醚(8E0)和71重量份的石蜡矿物油(沸程为例如约255℃至高于277℃)混合,并将该混合物在球磨机中研磨至细度低于5微米。

[0215] d) 可乳化浓缩剂由15重量份的式(I)的化合物和/或其盐、75重量份的作为溶剂的环己酮和10重量份的作为乳化剂的乙氧基化壬基酚而制得。

[0216] e) 通过如下方法获得水分散性颗粒剂:

[0217] 将以下物质混合

[0218] 75重量份式(I)的化合物和/或其盐、

[0219] 10重量份木质素磺酸钙、

[0220] 5重量份月桂基硫酸钠、

[0221] 3重量份聚乙烯醇和

[0222] 7重量份高岭土,

[0223] 将该混合物在销-盘式磨机中研磨并在流化床中通过喷洒作为粒化液体的水而使粉末粒化。

[0224] f) 通过如下方法获得水分散性颗粒剂:将以下物质在胶磨机中均化和预粉碎

[0225] 25重量份式(I)的化合物和/或其盐、

[0226] 5重量份2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、

[0227] 2重量份油酰基甲基牛磺酸钠、

[0228] 1重量份聚乙烯醇、

[0229] 17重量份碳酸钙和

[0230] 50重量份水,

[0231] 随后将该混合物在砂磨机中研磨,并在喷雾塔中通过单料喷嘴将所得悬浮剂雾化和干燥。

[0232] C. 生物实施例

[0233] 1. 对有害植物的出苗前的除草作用

[0234] 将单子叶杂草植物和双子叶杂草植物和作物植物的种子置于盛有沙质壤土的木质纤维盆中,并用土壤覆盖。然后将本发明的化合物配制为可湿性粉剂(WP)或可乳化浓缩剂(EC)的形式,以水性悬浮液或乳液的形式在600至800l/ha(经换算的)的水施用率下、并添加0.2%的润湿剂施用至覆盖土壤的表面。处理之后,将盆置于温室内并且保持在对于所测试的植物而言良好的生长条件下。在3周测试期后,通过与未处理的对照组比较,目测评估对测试植物的损害程度(除草活性百分比(%):100%活性=植物死亡、0%活性=与对照植物相似)。此处,例如在320g/ha的施用率下,化合物编号1-163、1-171、1-172、1-283、1-284、1-294、1-295、1-334、10-001和11-343对阿拉伯婆婆纳(*Veronica persica*)具有至少80%的活性。

[0235] 2. 对有害植物的出苗后的除草作用

[0236] 将单子叶杂草植物和双子叶杂草植物和作物植物的种子置于盛有沙质壤土的木质纤维盆中,用土壤覆盖并在温室内良好的生长条件下栽培。在播种两到三周后,对生长至一叶期(one-leaf stage)的测试植物进行处理。然后将本发明化合物配制为可湿性粉剂(WP)或可乳化浓缩剂(EC),以水悬浮液或乳液的形式在600至800l/ha(经换算)的水施用率下、并添加0.2%的润湿剂喷洒至植物的绿色部位。将测试植物在温室内于最佳生长条件下放置约3周后,通过与未处理的对照组比较,目测评估制剂的活性(除草活性百分比(%):100%活性=植物已死亡、0%活性=与对照植物相似)。此处,例如在80g/ha的施用率下,化合物编号1-163、1-171、1-172、1-173、1-254、1-283、1-284、1-293、1-294和1-334对苘麻(*Abutilon theophrasti*)和反枝苋(*Amaranthus retroflexus*)具有至少80%的活性。

[0237] 3. 对比试验

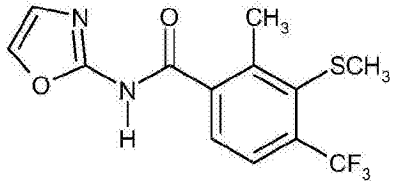
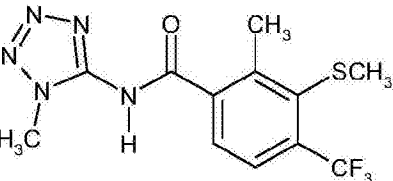
[0238] 在下表中,将本发明化合物的性质与WO 2012/028579A1中已知的结构最相似的化合物进行比较。这些试验在1项和2项中提及的条件下,通过出苗前和出苗后的方法进行。此处,在不同的剂量下比较抗各种有害植物的活性和对一些重要的作物植物的损害。

[0239] 使用的缩写表示:

[0240] 有害植物

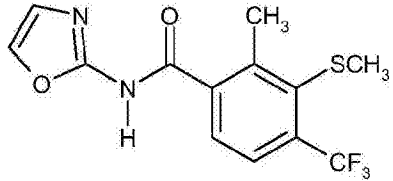
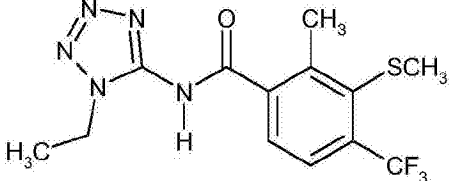
[0241] ABUTH 苘麻(*Abutilon theophrasti*)

- [0242] ALOMY 大穗看麦娘 (*Alopecurus myosuroides*)
 [0243] AMARE 反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*)
 [0244] AVEFA 野燕麦 (*Avena fatua*)
 [0245] CYPES 水莎草 (*Cyperus serotinus*)
 [0246] ECHCG 稗草 (*Echinochloa crus galli*)
 [0247] LOLMU 黑麦草 (*Lolium multiflorum*)
 [0248] MATIN 淡甘菊 (*Matricaria inodora*)
 [0249] PHBPU 圆叶牵牛 (*Pharbitis purpureum*)
 [0250] POLCO 卷茎蓼 (*Polygonum convolvulus*)
 [0251] SETVI 狗尾草 (*Setaria viridis*)
 [0252] STEME 繁缕 (*Stellaria media*)
 [0253] VERPE 阿拉伯婆婆纳 (*Veronica persica*)
 [0254] 作物植物
 [0255] BRSNW 甘蓝型油菜 (*Brassica napus*) (油菜)
 [0256] ORYZA 水稻 (*Oryza sativa*) (稻)
 [0257] ZEAMX 玉米 (*Zea mays*) (玉米)
 [0258] TRZAS 小麦 (*Triticum aestivum*) (小麦)
 [0259] 3a. 表A至L: 出苗前作用
 [0260] 表A: 剂量80/ha, 作物植物的损害
 [0261]

化合物	ORYZA	TRZAS	BRSNW
 <p>本发明的化合物, 编号 1-171</p>	0%	0%	30%
 <p>WO 2012/028579, 编号 4-135</p>	60%	60%	80%

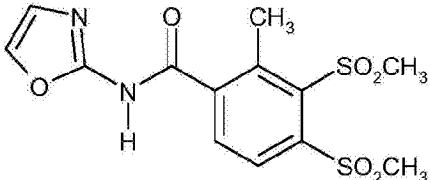
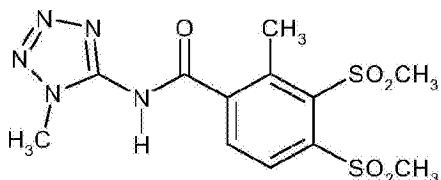
- [0262] 表B: 剂量80/ha, 作物植物的损害

[0263]

化合物	ORYZA	TRZAS	BRSNW
 <p>本发明的化合物, 编号 1-171</p>	0%	0%	30%
 <p>WO 2012/028579, 编号 5-146</p>	90%	30%	90%

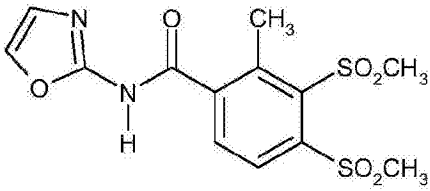
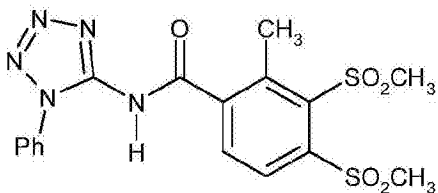
[0264] 表C: 剂量320/ha, 对有害植物的除草活性

[0265]

化合物	ECHCG	ABUTH	AMARE	MATIN
 <p>本发明的化合物, 编号 1-163</p>	70%	100%	90%	100%
 <p>WO 2012/028579, 编号 1-188</p>	0%	0%	40%	40%

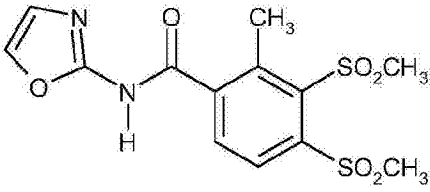
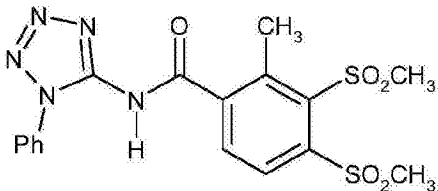
[0266] 表D: 剂量320/ha, 对有害植物的除草活性和作物植物的损害

[0267]

化合物	作物植物 BRSNW	有害植物 ALOMY
 <p>本发明的化合物, 编号 1-163</p>	10%	30%
 <p>WO 2012/028579, 编号 6-189</p>	90%	0%

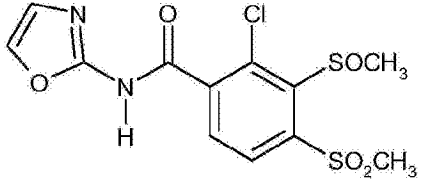
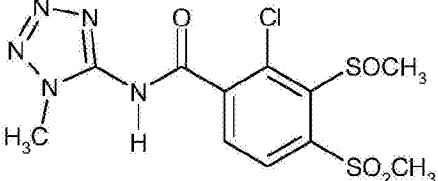
[0268] 表E: 剂量320/ha, 对有害植物的除草活性和作物植物的损害

[0269]

化合物	作物植物		有害植物	
	ORYZA	TRZAS	LOLMU	POLCO
 <p>本发明的化合物, 编号 1-163</p>	0%	0%	100%	70%
 <p>WO 2012/028579, 编号 6-189</p>	80%	30%	70%	0%

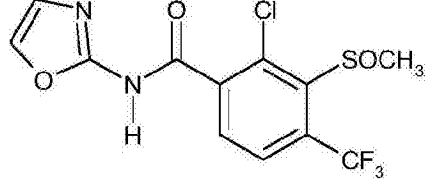
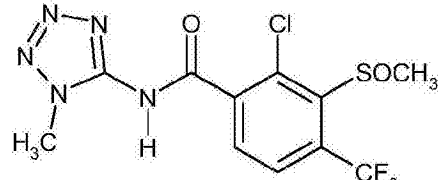
[0270] 表F: 剂量320/ha, 对有害植物的除草活性

[0271]

化合物	LOLMU	POLCO
 <p>本发明的化合物, 编号 1-284</p>	100%	70%
 <p>WO 2012/028579, 编号 4-293</p>	20%	20%

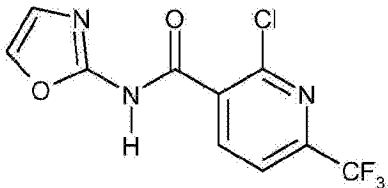
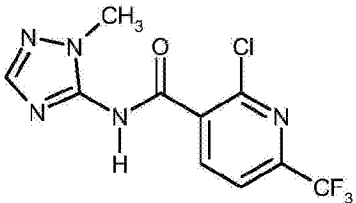
[0272] 表G: 剂量320/ha, 作物植物的损害

[0273]

化合物	ORYZA	ZEAMX	BRSNW
 <p>本发明的化合物, 编号 1-294</p>	30%	0%	20%
 <p>WO 2012/028579, 编号 4-639</p>	90%	40%	90%

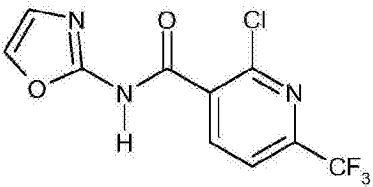
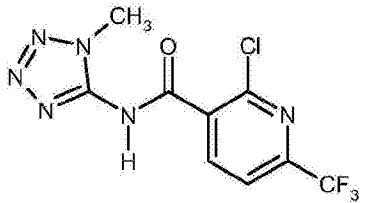
[0274] 表H: 剂量80/ha, 对有害植物的除草活性

[0275]

化合物	ECGCG	MATIN
 <p>本发明的化合物, 编号 10-1</p>	70%	90%
 <p>WO 2012/028579, 编号 8-9</p>	0%	60%

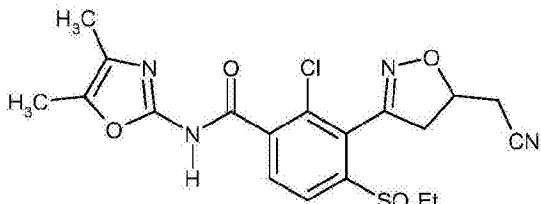
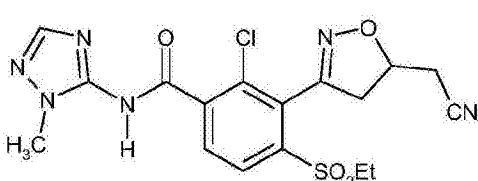
[0276] 表I: 不同剂量下, 对ORYZA的损害

[0277]

化合物	80 g/ha	20 g/ha
 <p>本发明的化合物, 编号 10-1</p>	0%	0%
 <p>WO 2012/028579, 编号 8-10</p>	90%	50%

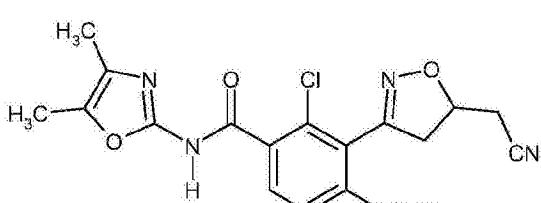
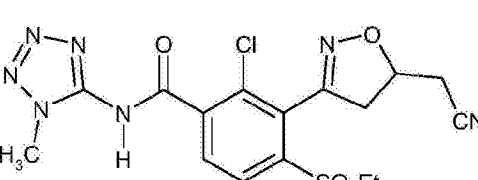
[0278] 表J: 不同剂量下, 对AVEFA的除草活性

[0279]

化合物	320 g/ha	80 g/ha
 <p>本发明的化合物, 编号 11-343</p>	100%	80%
 <p>WO 2012/028579, 编号 1-267</p>	0%	0%

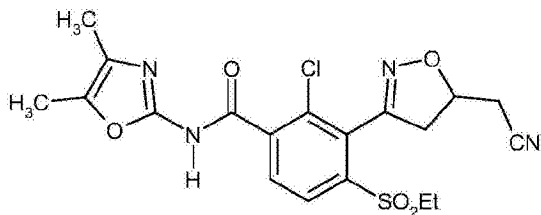
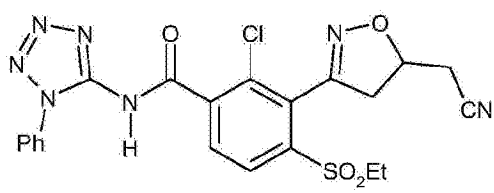
[0280] 表K: 不同剂量下, 对AVEFA的除草活性

[0281]

化合物	80 g/ha	20 g/ha
 <p>本发明的化合物, 编号 11-343</p>	80%	80%
 <p>WO 2012/028579, 编号 4-268</p>	0%	0%

[0282] 表L: 不同剂量下, 对AVEFA的除草活性

[0283]

化合物	80 g/ha	20 g/ha
 <p>本发明的化合物, 编号 11-343</p>	80%	80%
 <p>WO 2012/028579, 编号 6-268</p>	0%	0%

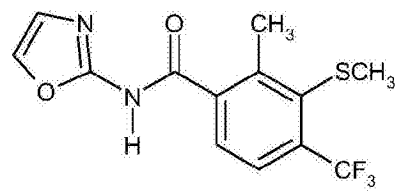
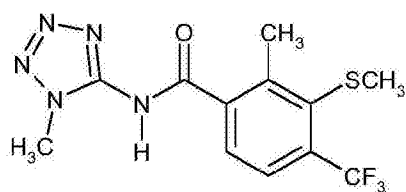
[0284] 3b. 表M至X: 出苗后作用

[0285] 表M: 剂量80/ha, 对作物植物的损害

[0286]

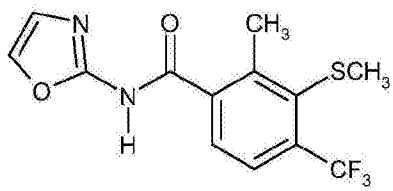
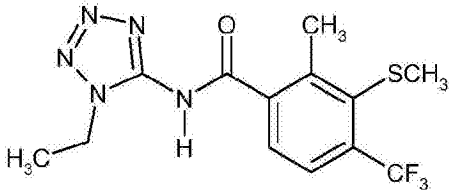
化合物	ORYZA	TRZAS	BRSNW

[0287]

 <p>本发明的化合物, 编号 1-171</p>	0%	0%	0%
 <p>WO 2012/028579, 编号 4-135</p>	100%	100%	100%

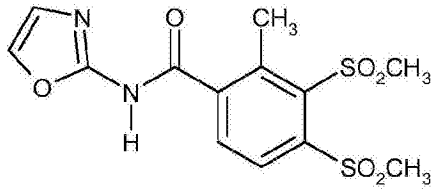
[0288] 表N: 剂量80/ha, 对作物植物的损害

[0289]

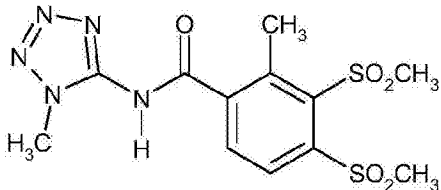
化合物	ORYZA	TRZAS	BRSNW
 <p>本发明的化合物, 编号 1-171</p>	0%	0%	0%
 <p>WO 2012/028579, 编号 5-146</p>	80%	60%	100%

[0290] 表0: 剂量20/ha, 对作物植物的损害

[0291]

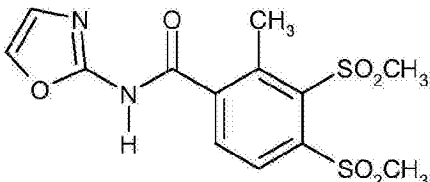
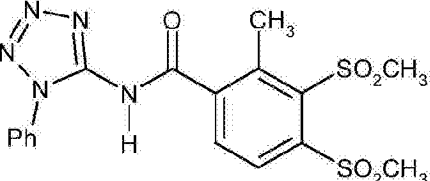
化合物	ORYZA	TRZAS	BRSNW
 <p>本发明的化合物, 编号 1-163</p>	0%	20%	40%

[0292]

 <p>WO 2012/028579, 编号 1-188</p>	20%	40%	100%
---	-----	-----	------

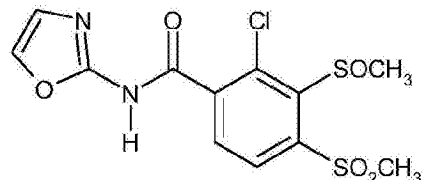
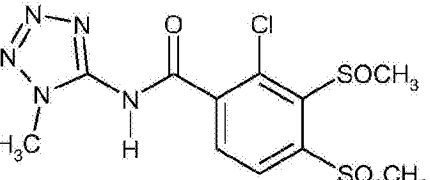
[0293] 表P: 剂量80/ha, 对有害植物的除草活性

[0294]

化合物	ALOMY	AVEFA	LOMU	SETVI
 <p>本发明的化合物, 编号 1-163</p>	60%	40%	20%	100%
 <p>WO 2012/028579, 编号 6-189</p>	0%	0%	0%	20%

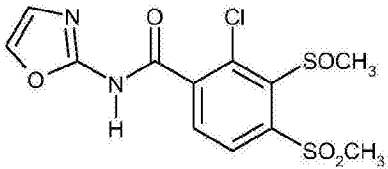
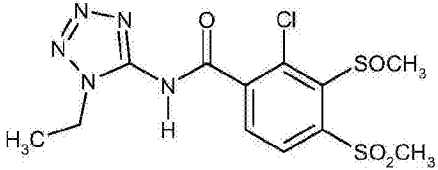
[0295] 表Q: 剂量80/ha, 对有害植物的除草活性和作物植物的损害

[0296]

化合物	作物植物 ORYZA	有害植物	
		CYPES	LOLMU
 <p>本发明的化合物, 编号 1-284</p>	20%	60%	70%
 <p>WO 2012/028579, 编号 4-293</p>	40%	40%	40%

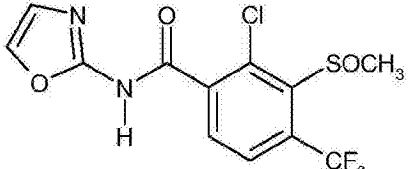
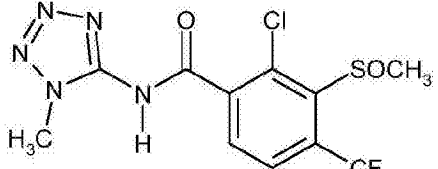
[0297] 表R: 剂量20/ha, 对有害植物的除草活性

[0298]

化合物	LOLMU	SETVI
 <p>本发明的化合物, 编号 1-284</p>	60%	90%
 <p>WO 2012/028579, 编号 5-294</p>	10%	0%

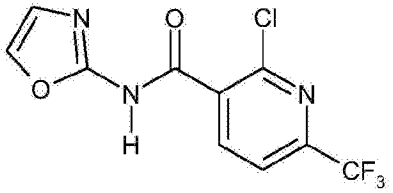
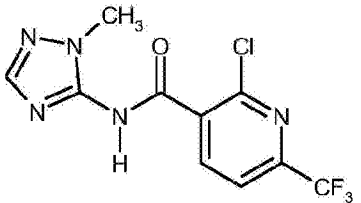
[0299] 表S: 剂量20/ha, 对有害植物的除草活性和作物植物的损害

[0300]

化合物	作物植物			有害植物 PHBPU
	ORYZA	TRZAS	ZEAMX	
 <p>本发明的化合物, 编号 1-294</p>	0%	0%	0%	70%
 <p>WO 2012/028579, 编号 4-639</p>	60%	100%	80%	40%

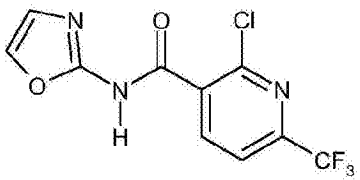
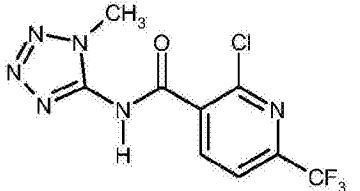
[0301] 表T: 剂量5/ha, 对有害植物的除草活性

[0302]

化合物	STEME	VERPE
 <p>本发明的化合物, 编号 10-1</p>	40%	90%
 <p>WO 2012/028579, 编号 8-9</p>	10%	60%

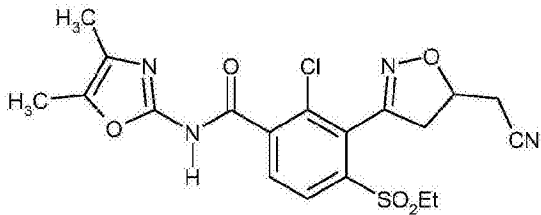
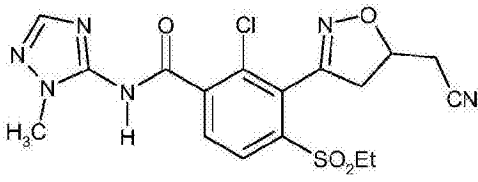
[0303] 表U: 剂量80g/ha, 作物植物的损害

[0304]

化合物	ORYZA	ZEAMX
 <p>本发明的化合物, 编号 10-1</p>	0%	0%
 <p>WO 2012/028579, 编号 8-10</p>	90%	90%

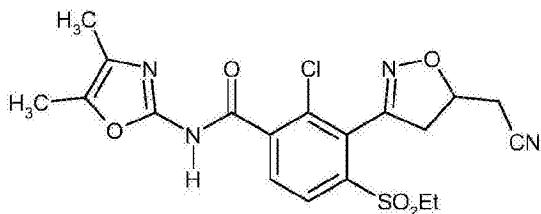
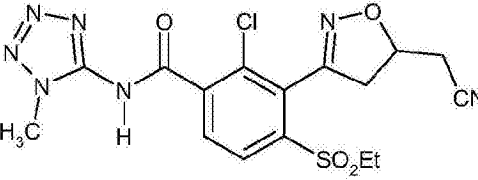
[0305] 表V: 不同剂量下, 对BRSNW的损害

[0306]

化合物	80 g/ha	20 g/ha
 <p>本发明的化合物, 编号 11-343</p>	0%	0%
 <p>WO 2012/028579, 编号 1-267</p>	90%	90%

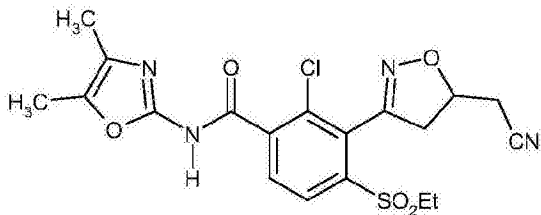
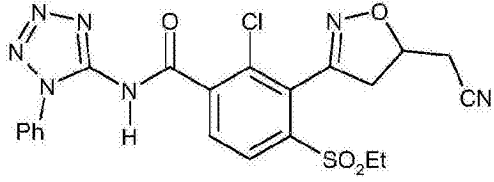
[0307] 表W: 不同剂量下, 对BRSNW的损害

[0308]

化合物	20 g/ha	5 g/ha
 <p>本发明的化合物, 编号 11-343</p>	0%	0%
 <p>WO 2012/028579, 编号 4-268</p>	100%	80%

[0309] 表X: 不同剂量下, 对BRSNW的损害

[0310]

化合物	80 g/ha	20 g/ha
 <p>本发明的化合物, 编号 11-343</p>	0%	0%
 <p>WO 2012/028579, 编号 6-268</p>	60%	20%