

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl<sup>7</sup>

C07C317/24

A01N 35/06 A01N 41/10

# [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 99811954.7

[43] 公开日 2001 年 11 月 21 日

[11] 公开号 CN 1323292A

[22] 申请日 1999.9.9 [21] 申请号 99811954.7

[30] 优先权

[32] 1998.10.10 [33] DE [31] 19846792.3

[86] 国际申请 PCT/EP99/06627 1999.9.9

[87] 国际公布 WO00/21924 德 2000.4.20

[85] 进入国家阶段日期 2001.4.9

[71] 申请人 阿温提斯作物科学有限公司

地址 德国法兰克福

[72] 发明人 A·范阿尔姆希克 L·威尔姆斯

T·奥勒 H·比林格

C·罗辛格

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所

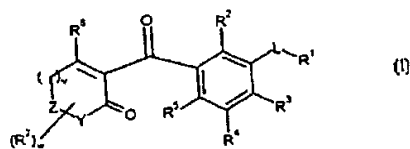
代理人 吴亦华

权利要求书 19 页 说明书 74 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 苯甲酰基环己烷二酮, 其制法, 及其作为除草剂与植物生长调节剂的用途

[57] 摘要

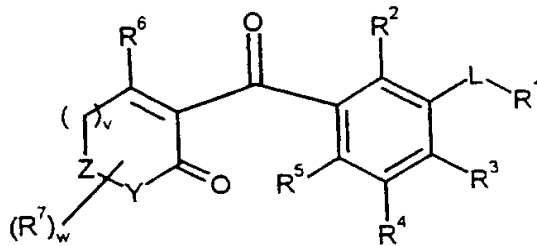
本发明涉及下式(I)的苯甲酰基环己烷二酮, 其制法, 及其作为除草剂与植物生长调节剂的用途。在该式(I)中, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>及 R<sup>7</sup>为各种基团, L为亚烷基链, 且 Y和 Z为单原子桥连单元。



ISSN 1008-4274

权 利 要 求 书

1. 一种下式(I)的苯甲酰基环己烷二酮,

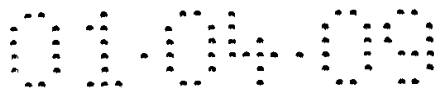


(I)

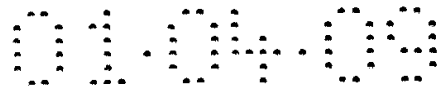
其中的取代基和代号具有下述定义:

- R<sup>1</sup> 为可任选经取代的烃基, 其可任选地另含有一或多个相同或不同的选自下列的杂原子: 磷、氧、硫、氮、氟、氯、溴及碘;
- R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>及 R<sup>5</sup> 彼此各自独立地为氢, 羟基, 巯基, 氨基, 氰基, 硝基, 卤素或可任选经取代的烃基, 该烃基可任选地另含有一或多个相同或不同的选自下列的杂原子: 磷、氧、硫、氮、氟、氯、溴及碘;
- R<sup>6</sup> 为 OR<sup>12</sup>, 烷硫基, 卤烷基硫基, 烯硫基, 卤烯基硫基, 炔硫基, 卤炔基硫基, 烷基亚磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 烯基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 炔基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 卤烷基磺酰基, 烯基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 炔基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 氰基, 氰氧基, 氰硫基或卤素;
- R<sup>7</sup> 为氢, 四氢吡喃-3-基, 四氢吡喃-4-基, 四氢噻喃-3-基, 烷基, 环烷基, 烷氧基, 烷氧烷基, 烷羰基, 烷氧羰基, 烷硫基, 苯基, 其中前述最后八种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自卤素、烷硫基及烷氧基的基团所取代, 或是两个键结至同一个碳原子的 R<sup>7</sup> 基团形成选自下列的桥链: OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S 及 SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S, 该桥链可任选地为一至四个甲基所取代, 或是





基磺酰基, 环烯基炔基磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基烷基磺酰基, 芳基烯基磺酰基, 芳基炔基磺酰基, 杂芳基磺酰基, 杂芳基烷基磺酰基, 杂芳基烯基磺酰基, 杂芳基炔基磺酰基, 杂环基磺酰基, 杂环基烷基磺酰基, 杂环基烯基磺酰基, 杂环基炔基磺酰基, 环烷基亚磺酰基, 环烷基烷基亚磺酰基, 环烷基烯基亚磺酰基, 环烷基炔基亚磺酰基, 环烯基亚磺酰基, 环烯基烷基亚磺酰基, 环烯基烯基亚磺酰基, 环烯基炔基亚磺酰基, 芳基亚磺酰基, 芳基烷基亚磺酰基, 芳基烯基亚磺酰基, 芳基炔基亚磺酰基, 杂芳基亚磺酰基, 杂芳基烷基亚磺酰基, 杂芳基烯基亚磺酰基, 杂芳基炔基亚磺酰基, 杂环基亚磺酰基, 杂环基烷基亚磺酰基, 杂环基烯基亚磺酰基, 杂环基炔基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二烷基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的N-烷基-N-芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的N-烷基-N-杂芳基氨基磺酰基, 烷基磺酰氧基, 烯基磺酰氧基, 炔基磺酰氧基, 环烷基磺酰氧基, 环烷基烷基磺酰氧基, 环烷基烯基磺酰氧基, 环烷基炔基磺酰氧基, 环烯基磺酰氧基, 环烯基烷基磺酰氧基, 环烯基烯基磺酰氧基, 环烯基炔基磺酰氧基, 芳基磺酰氧基, 芳基烷基磺酰氧基, 芳基烯基磺酰氧基, 芳基炔基磺酰氧基, 杂芳基磺酰氧基, 杂芳基烷基磺酰氧基, 杂芳基烯基磺酰氧基, 杂芳基炔基磺酰氧基, 杂环基磺酰氧基, 杂环基烷基磺酰氧基, 杂环基烯基磺酰氧基, 杂环基炔基磺酰氧基, 烷基磺酰氨基, 烯基磺酰氨基, 炔基磺酰氨基, 环烷基磺酰氨基, 环烷基烷基磺酰氨基, 环烷基烯基磺酰氨基, 环烷基炔基磺酰氨基, 环烯基磺酰氨基, 环烯基烷基磺酰氨基, 环烯基烯基磺酰氨基, 环烯基炔基磺酰氨基, 芳基磺酰氨基, 芳基烷基磺酰氨基, 芳基烯基磺酰氨基, 芳基炔基磺酰氨基, 杂芳基磺酰氨基, 杂芳基烷基磺酰氨基, 杂芳基烯基磺酰氨基, 杂芳基炔基磺酰氨基, 烷基磺酰基-N-烷基氨基, 烯基磺酰基-N-烷基氨基, 炔基磺酰基-N-烷基氨基,



环烷基磺酰基—N—烷基氨基，环烷基烷基磺酰基—N—烷基氨基，环烷基烯基磺酰基—N—烷基氨基，环烷基炔基磺酰基—N—烷基氨基，环烯基磺酰基—N—烷基氨基，环烯基烷基磺酰基—N—烷基氨基，环烯基烯基磺酰基—N—烷基氨基，环烯基炔基磺酰基—N—烷基氨基，芳基磺酰基—N—烷基氨基，杂芳基磺酰基—N—烷基氨基，芳基烷基磺酰基—N—烷基氨基，杂芳基烷基磺酰基—N—烷基氨基，芳基烯基磺酰基—N—烷基氨基，杂芳基烯基磺酰基—N—烷基氨基，芳基炔基磺酰基—N—烷基氨基，杂芳基炔基磺酰基—N—烷基氨基，杂环基磺酰基—N—烷基氨基，杂环基烷基磺酰基—N—烷基氨基，杂环基烯基磺酰基—N—烷基氨基，杂环基炔基磺酰基—N—烷基氨基，烷羰基，烯羰基，炔羰基，环烷羰基，环烷基烷羰基，环烷基烯羰基，环烷基炔羰基，环烯羰基，环烯基烷羰基，环烯基烯羰基，环烯基炔羰基，芳羰基，芳基烷羰基，芳基烯羰基，芳基炔羰基，杂芳基羰基，杂芳基烷羰基，杂芳基烯羰基，杂芳基炔羰基，杂环基羰基，羧基，烷氧羰基，烯氧羰基，炔氧羰基，环烷基氧羰基，环烷基烷氧羰基，环烷基烯氧羰基，环烷基炔氧羰基，环烯氧羰基，环烯基烷氧羰基，环烯基烯氧羰基，环烯基炔氧羰基，芳氧羰基，芳基烷氧羰基，芳基烯氧羰基，芳基炔氧羰基，杂芳基氧羰基，杂芳基烷氧羰基，杂芳基烯氧羰基，杂芳基炔氧羰基，杂环基氧羰基，杂环基烷氧羰基，杂环基烯氧羰基，杂环基炔氧羰基，氨基羰基，可任选经取代的单或二烷基氨基羰基，可任选经取代的单或二芳基氨基羰基，可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰基，可任选经取代的 N—烷基—N—芳基氨基羰基，可任选经取代的 N—烷基—N—杂芳基氨基羰基，可任选经取代的单或二杂芳基胺羰氧基，可任选经取代的 N—烷基—N—芳基胺羰氧基，可任选经取代的 N—烷基—N—杂芳基胺羰氧基，氨基羰氨基，可任选经取代的单或二烷基氨基羰氨基，可任选经取代的单或二芳基氨基羰氨基，可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰氨基，可任选经取代的 N—烷基—N—芳基氨基羰氨基，可任选经取

代的 N-烷基-N-杂芳基氨基羰氨基, 环烷基羰氧基, 环烷基烯羰氧基, 环烷基炔羰氧基, 环烯羰氧基, 环烯基烷羰氧基, 环烯基烯羰氧基, 环烯基炔羰氧基, 芳羰氧基, 芳基烷羰氧基, 芳基烯羰氧基, 芳基炔羰氧基, 杂芳基羰氧基, 杂芳基烷羰氧基, 杂芳基烯羰氧基, 杂芳基炔羰氧基, 杂环基羰氧基, 杂环基烷羰氧基, 杂环基烯羰氧基, 杂环基炔羰氧基, 可任选经取代的单或二烷基羰氨基, 可任选经取代的单或二芳基羰氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基羰氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-芳基氨基, 可任选经取代的芳羰基-N-烷基氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-杂芳基氨基, 可任选经取代的杂芳基羰基-N-烷基氨基, 烷氧基羰氨基, 烯氧基羰氨基, 炔氧基羰氨基, 环烷基氧羰氨基, 环烷基烷氧羰氨基, 环烷基烯氧羰氨基, 环烷基炔氧羰氨基, 环烯基氧羰氨基, 环烯基烷氧羰氨基, 环烯基烯氧羰氨基, 环烯基炔氧羰氨基, 芳氧基羰氨基, 芳基烷氧羰氨基, 芳基烯氧羰氨基, 芳基炔氧羰氨基, 杂芳基氧羰氨基, 杂芳基烷氧羰氨基, 杂芳基烯氧羰氨基, 杂芳基炔氧羰氨基, 杂环基氧羰氨基, 杂环基烷氧羰氨基, 杂环基烯氧羰氨基, 杂环基炔氧羰氨基, 烷氧基羰氧基, 烯氧基羰氧基, 炔氧基羰氧基, 环烷基氧羰氧基, 环烷基烷氧羰氧基, 环烷基烯氧羰氧基, 环烷基炔氧羰氧基, 环烯基氧羰氧基, 环烯基烷氧羰氧基, 环烯基烯氧羰氧基, 环烯基炔氧羰氧基, 芳氧基羰氧基, 芳基烷氧羰氧基, 芳基烯氧羰氧基, 芳基炔氧羰氧基, 杂芳基氧羰氧基, 杂芳基烷氧羰氧基, 杂芳基烯氧羰氧基, 杂芳基炔氧羰氧基, 杂环基氧羰氧基, 杂环基烷氧羰氧基, 杂环基烯氧羰氧基, 杂环基炔氧羰氧基, 烷氧基羰氨基, 烯氧基羰氨基, 炔氧羰基-N-烷氨基, 环烷基氧羰基-N-烷氨基, 环烷基烷氧羰基-N-烷氨基, 环烷基烯氧羰基-N-烷氨基, 环烷基炔氧羰基-N-烷氨基, 环烯基氧羰基-N-烷氨基, 环烯基烷氧羰基-N-烷氨基, 环烯基烯氧羰基-N-烷氨基, 环烯基炔氧羰基-N-烷氨基, 芳氧基羰基-N-烷氨基, 芳基烷氧羰基-N-烷氨基

基, 芳基烯氧羰基-N-烷氨基, 芳基炔氧羰基-N-烷氨基, 杂芳基烷氧羰基-N-烷氨基, 杂芳基烯氧羰基-N-烷氨基, N-烷基杂芳基炔氧羰基-N-烷氨基, N-烷基杂环基烷氧羰基-N-烷氨基, 杂环基烯氧羰基, 杂环基炔氧羰基-N-烷氨基, 甲酰基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羰基, 卤烯羰基, 卤炔羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 卤烯基氨基羰基, 卤炔基氨基羰基, 卤烷基羰氨基, 卤烯基羰氨基, 卤炔基羰氨基, 卤烷氧基羰氨基, 卤烯氧基羰氨基, 卤炔氧基羰氨基, 卤烷基羰氧基, 卤烯基羰氧基, 卤炔基羰氧基, 卤烷基氧羰氧基, 卤烯基氧羰氧基, 卤炔基氧羰氧基, 卤烷基胺羰氨基, 卤烯基胺羰氨基, 卤炔基胺羰氨基, 氰基, 硝基,  $-P(=O)R^8R^9$ ,  $-P(=O)OR^{10}R^8$ ,  $-P(=O)OR^{10}OR^{11}$ , 2-四氢呋喃基氧基甲基, 3-四氢呋喃基氧基甲基, 2-四氢噻吩基氧基甲基, 3-四氢噻吩基氧基甲基, 2-四氢吡喃基氧基甲基, 其中的环烷基、环烯基、芳基、四氢呋喃基、四氢噻吩基、四氢吡喃基氧基甲基、杂芳基及杂环基可任选地为相同或不同的  $R^2$  所单或多取代, 或下列基团之一:  $-O-(CH_2)_n-$ ,  $O-(CH_2)_n-R^{2a}$ ,  $-O-CH_2-S-(O)_p-R^{13}$ ,  $-CONHNH-(CH_2)_n-$  烷基及  $-CONHNH-(CH_2)_n-$  芳基;

$R^{2a}$  为环烷基, 环烯基, 环烷基烷基, 环烷基烯基, 环烷基炔基, 环烯基烷基, 环烯基烯基, 芳基, 芳烷基, 芳烯基, 芳炔基, 杂芳基, 杂芳基烷基, 杂芳基烯基, 杂芳基炔基, 杂环基, 杂环基烷基, 杂环基烯基, 杂环基炔基, 羟基, 烷氧基, 烯氧基, 炔氧基, 环烷氧基, 环烷基烷氧基, 环烷基烯氧基, 环烷基炔氧基, 环烯氧基, 环烯基烷氧基, 环烯基烯氧基, 环烯基炔氧基, 芳氧基, 芳基烷氧基, 芳基烯氧基, 芳基炔氧基, 杂芳氧基, 杂芳基烷氧基, 杂芳基烯氧基, 杂芳基炔氧基, 杂环氧基, 杂环基烷氧基,

杂环基烯氧基, 杂环基炔氧基, 硫基, 烷硫基, 烯硫基, 炔硫基, 环烷硫基, 环烷基烷硫基, 环烷基烯硫基, 环烷基炔硫基, 环烯硫基, 环烯基烷硫基, 环烯基烯硫基, 环烯基炔硫基, 芳硫基, 芳基烷硫基, 芳基烯硫基, 芳基炔硫基, 杂芳硫基, 杂芳基烷硫基, 杂芳基烯硫基, 杂芳基炔硫基, 杂环硫基, 杂环基烷硫基, 杂环基烯硫基, 杂环基炔硫基, 氨基, 可任选经取代的单或二烷基氨基, 可任选经取代的单或二芳基氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基, 可任选经取代的 N-烷基-N-芳基氨基, 可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基氨基, 烯氨基, 炔氨基, 环烷基氨基, 环烯基氨基, 杂环基烷基氨基, 杂环基烯基氨基, 烷基磺酰基, 烯基磺酰基, 炔基磺酰基, 环烷基磺酰基, 环烷基烷基磺酰基, 环烷基烯基磺酰基, 环烷基炔基磺酰基, 环烯基磺酰基, 环烯基烷基磺酰基, 环烯基烯基磺酰基, 环烯基炔基磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基烷基磺酰基, 芳基烯基磺酰基, 芳基炔基磺酰基, 杂芳基磺酰基, 杂芳基烷基磺酰基, 杂芳基烯基磺酰基, 杂芳基炔基磺酰基, 杂环基磺酰基, 杂环基烷基磺酰基, 杂环基烯基磺酰基, 杂环基炔基磺酰基, 烷基亚磺酰基, 烯基亚磺酰基, 炔基亚磺酰基, 环烷基亚磺酰基, 环烷基烷基亚磺酰基, 环烷基烯基亚磺酰基, 环烷基炔基亚磺酰基, 环烯基亚磺酰基, 环烯基烷基亚磺酰基, 环烯基烯基亚磺酰基, 环烯基炔基亚磺酰基, 芳基亚磺酰基, 芳基烷基亚磺酰基, 芳基烯基亚磺酰基, 芳基炔基亚磺酰基, 杂芳基亚磺酰基, 杂芳基烷基亚磺酰基, 杂芳基烯基亚磺酰基, 杂芳基炔基亚磺酰基, 杂环基亚磺酰基, 杂环基烷基亚磺酰基, 杂环基烯基亚磺酰基, 杂环基炔基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二烷基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的 N-烷基-N-芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基氨基磺酰基, 烷基磺酰氧基, 烯基磺酰氧基, 炔基磺酰氧基, 环烷基磺酰氧基, 环烷基烷基磺酰氧基, 环烷基



烯基磺酰氧基, 环烷基炔基磺酰氧基, 环烯基磺酰氧基, 环烯基  
 烷基磺酰氧基, 环烯基烯基磺酰氧基, 环烯基炔基磺酰氧基, 芳  
 基磺酰氧基, 芳基烷基磺酰氧基, 芳基烯基磺酰氧基, 芳基炔基  
 磺酰氧基, 杂芳基磺酰氧基, 杂芳基烷基磺酰氧基, 杂芳基烯基  
 磺酰氧基, 杂芳基炔基磺酰氧基, 杂环基磺酰氧基, 杂环基烷基  
 磺酰氧基, 杂环基烯基磺酰氧基, 杂环基炔基磺酰氧基, 烷基磺  
 酰氨基, 烯基磺酰氨基, 炔基磺酰氨基, 环烷基磺酰氨基, 环烷  
 基烷基磺酰氨基, 环烷基烯基磺酰氨基, 环烷基炔基磺酰氨基,  
 环烯基烷基磺酰氨基, 环烯基烯基磺酰氨基, 环烯基炔基磺酰氨  
 基, 芳基磺酰氨基, 芳基烷基磺酰氨基, 芳基烯基磺酰氨基, 芳  
 基炔基磺酰氨基, 杂芳基磺酰氨基, 杂芳基烷基磺酰氨基, 杂芳  
 基烯基磺酰氨基, 杂芳基炔基磺酰氨基, 二烷基磺酰基-N-烷基  
 氨基, 烯基磺酰基-N-烷基氨基, 炔基磺酰基-N-烷基氨基,  
 环烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基烷基磺酰基-N-烷基氨  
 基, 环烷基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基炔基磺酰基-N-  
 烷基氨基, 环烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基烷基磺酰基-N-  
 烷基氨基, 环烯基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基炔基磺酰  
 基-N-烷基氨基, 芳基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基磺酰基-N-  
 烷基氨基, 芳基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基烷基磺酰  
 基-N-烷基氨基, 芳基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基烯基  
 磺酰基-N-烷基氨基, 芳基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基  
 炔基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环  
 基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基烯基磺酰基-N-烷基氨  
 基, 杂环基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 烷羰基, 烯羰基, 炔羰基,  
 环烷羰基, 环烷基烷羰基, 环烷基烯羰基, 环烷基炔羰基, 环烯  
 羰基, 环烯基烷羰基, 环烯基烯羰基, 环烯基炔羰基, 芳羰基,  
 芳基烷羰基, 芳基烯羰基, 芳基炔羰基, 杂芳基羰基, 杂芳基烷  
 羰基, 杂芳基烯羰基, 杂芳基炔羰基, 杂环基羰基, 杂环基烷基  
 羰基, 杂环基烯基, 杂环基炔基, 羧基, 烷氧羰基, 烯氧羰基, 炔氧羰

基, 环烷基氧羰基, 环烷基烷氧羰基, 环烷基烯氧羰基, 环烷基炔氧羰基, 环烯氧羰基, 环烯基烷氧羰基, 环烯基烯氧羰基, 环烯基炔氧羰基, 芳氧羰基, 芳基烷氧羰基, 芳基烯氧羰基, 芳基炔氧羰基, 杂芳基氧羰基, 杂芳基烷氧羰基, 杂芳基烯氧羰基, 杂芳基炔氧羰基, 杂环基氧羰基, 杂环基烷氧羰基, 杂环基烯氧羰基, 杂环基炔氧羰基, 烷羰氧基, 烯羰氧基, 炔羰氧基, 环烷羰氧基, 环烷基烯羰氧基, 环烷基炔羰氧基, 环烯羰氧基, 环烯基烷羰氧基, 环烯基烯羰氧基, 环烯基炔羰氧基, 芳羰氧基, 芳基烷羰氧基, 芳基烯羰氧基, 芳基炔羰氧基, 杂芳基羰氧基, 杂芳基烷羰氧基, 杂芳基烯羰氧基, 杂芳基炔羰氧基, 杂环基羰氧基, 杂环基烷羰氧基, 杂环基烯羰氧基, 杂环基炔羰氧基, 氨基羰基, 可任选经取代的单或二烷基氨基羰基, 可任选经取代的单或二芳基氨基羰基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰基, 可任选经取代的 N-烷基-N-芳基氨基羰基, 可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基氨基羰基, 可任选经取代的单或二杂芳基胺羰氧基, 可任选经取代的 N-烷基-N-芳基胺羰氧基, 可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基胺羰氧基, 氨基羰氨基, 可任选经取代的单或二烷基氨基羰氨基, 可任选经取代的单或二芳基氨基羰氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰氨基, 可任选经取代的 N-烷基-N-芳基氨基羰氨基, 可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基氨基羰氨基, 可任选经取代的单或二烷基羰氨基, 可任选经取代的单或二芳基羰氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基羰氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-芳基氨基, 可任选经取代的芳羰基-N-烷基氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-杂芳基氨基, 可任选经取代的杂芳基羰基-N-烷基氨基, 烷氧基羰氧基, 烯氧基羰氧基, 炔氧基羰氧基, 环烷基氧羰氧基, 环烷基烷氧羰氧基, 环烷基烯氧羰氧基, 环烷基炔氧羰氧基, 环烯基氧羰氧基, 环烯基烷氧羰氧基, 环烯基烯氧羰氧基, 环烯基炔氧羰氧基, 芳氧基羰氧基, 芳基烷氧羰氧基, 芳基烯氧羰氧基, 芳基炔氧羰氧基, 杂芳基氧羰氧基,

杂芳基烷氧羰氧基, 杂芳基烯氧羰氧基, 杂芳基炔氧羰氧基, 杂环基氧羰氧基, 杂环基烷氧羰氧基, 杂环基烯氧羰氧基, 杂环基炔氧羰氧基, 烷氧基羰氧基, 烯氧基羰氧基, 炔氧基羰氧基, 环烷基氧羰氧基, 环烷基烷氧羰氧基, 环烷基烯氧羰氧基, 环烷基炔氧羰氧基, 环烯基氧羰氧基, 环烯基烷氧羰氧基, 环烯基烯氧羰氧基, 环烯基炔氧羰氧基, 芳氧基羰氧基, 芳基烷氧羰氧基, 芳基烯氧羰氧基, 芳基炔氧羰氧基, 杂芳基氧羰氧基, 杂芳基烷氧羰氧基, 杂芳基烯氧羰氧基, 杂芳基炔氧羰氧基, 杂环基氧羰氧基, 杂环基烷氧羰氧基, 杂环基烯氧羰氧基, 杂环基炔氧羰氧基, 烷氧基羰氧基, 烯氧基羰氧基, 炔氧基羰氧基, 环烷基氧羰氧基, 环烷基烷氧羰氧基, N-烷基环烷基烯氧羰氧基, 环烷基炔氧羰氧基, 环烯基氧羰氧基, 环烯基烷氧羰氧基, 环烯基烯氧羰氧基, 环烯基炔氧羰氧基, 芳氧基羰氧基, 芳基烷氧羰氧基, 芳基烯氧羰氧基, 芳基炔氧羰氧基, 杂芳基烷氧羰氧基, 杂芳基烯氧羰氧基, 杂芳基炔氧羰氧基, 杂环基烷氧羰氧基, 杂环基烯氧羰氧基, 杂环基炔氧羰氧基, 甲酰基, 卤素, 卤烷基, 卤烯基, 卤炔基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羰基, 卤烯羰基, 卤炔羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 卤烯基氨基羰基, 卤炔基氨基羰基, 卤烷氧基羰氧基, 卤烯氧基羰氧基, 卤炔氧基羰氧基, 卤烷基胺羰氧基, 卤烯基胺羰氧基, 卤炔基胺羰氧基, 氰基, 硝基, 或下列基团之一:

—P(=O)R<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, —P(=O)OR<sup>10</sup>R<sup>8</sup>, —P(=O)OR<sup>10</sup>OR<sup>11</sup>, —CH=N—NH—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—烷基, —CH=N—NH—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—芳基, —CH=N—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—烷基, —CH=N—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—芳基, —O—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—烷基, —CONHNH—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—烷基及—CONHNH—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—芳基;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 各自独立地为 R<sup>2a</sup>, 氢, 烷基, 烯基或炔基;

$R^8$  和  $R^9$  各自独立地为烷基，烯基，炔基，卤烷基，卤烯基，卤炔基，  
可任选经取代的芳基或可任选经取代的芳烷基；

$R^{10}$  和  $R^{11}$  各自独立地为氢或  $R^8$ ，或  $R^{10}$  和  $R^{11}$  共同形成  $C_2-C_5$ -亚烷基  
链；

$R^{13}$  为烷基，烯基，炔基，卤烷基，卤烯基，卤炔基，或苯基，该苯  
基可任选地为一或多个相同或不同的选自卤素、烷基、卤烷基及  
硝基的基团所取代；

m 为 1, 2 或 3；

n 为 0, 1, 2 或 3 且

p 为 0, 1 或 2。

3. 如权利要求第 1 或第 2 项的苯甲酰基环己烷二酮，其中

$R^1$  为环烷基，环烯基，芳基，环烷氧基，环烷基烷氧基，环烷基烯  
氧基，环烷基炔氧基，环烯氧基，环烯基烷氧基，环烯基烯氧基，  
环烯基炔氧基，芳氧基，芳基烷氧基，芳基烯氧基，芳基炔氧基，  
环烷硫基，环烷基烷硫基，环烷基烯硫基，环烷基炔硫基，环烯  
硫基，环烯基烷硫基，环烯基烯硫基，环烯基炔硫基，芳硫基，  
芳基烷硫基，芳基烯硫基，芳基炔硫基，环烷基磺酰基，环烷基  
烷磺酰基，环烷基烯磺酰基，环烷基炔磺酰基，环烯基磺  
酰基，环烯基烷磺酰基，环烯基烯磺酰基，环烯基炔磺酰  
基，芳基磺酰基，芳基烷磺酰基，芳基烯磺酰基，芳基炔基  
磺酰基，杂芳基磺酰基，杂芳基烷磺酰基，杂芳基烯磺酰基，  
杂芳基炔基磺酰基，杂环基磺酰基，杂环基烷磺酰基，杂环基  
烯磺酰基，杂环基炔基磺酰基，环烷基亚磺酰基，环烷基烷  
亚磺酰基，环烷基烯基亚磺酰基，环烷基炔基亚磺酰基，环烯基  
亚磺酰基，环烯基烷基亚磺酰基，环烯基烯基亚磺酰基，环烯基  
炔基亚磺酰基，芳基亚磺酰基，芳基烷基亚磺酰基，芳基烯基亚  
磺酰基，芳基炔基亚磺酰基，杂芳基亚磺酰基，杂芳基烷基亚磺  
酰基，杂芳基烯基亚磺酰基，杂芳基炔基亚磺酰基，杂环基亚磺  
酰基，杂环基烷基亚磺酰基，杂环基烯基亚磺酰基，杂环基炔基

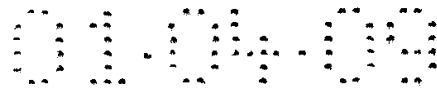


烯羰基, 炔羰基, 环烷羰基, 环烷基烷羰基, 环烷基烯羰基, 环烷基炔羰基, 环烯羰基, 环烯基烷羰基, 环烯基烯羰基, 环烯基炔羰基, 芳羰基, 芳基烷羰基, 芳基烯羰基, 芳基炔羰基, 杂芳基羰基, 杂芳基烷羰基, 杂芳基烯羰基, 杂芳基炔羰基, 杂环基羰基, 羧基, 烷氧羰基, 烯氧羰基, 炔氧羰基, 环烷氧羰基, 环烷基烷氧羰基, 环烷基烯氧羰基, 环烷基炔氧羰基, 环烯氧羰基, 环烯基烷氧羰基, 环烯基烯氧羰基, 环烯基炔氧羰基, 芳氧羰基, 芳基烷氧羰基, 芳基烯氧羰基, 芳基炔氧羰基, 杂芳基氧羰基, 杂芳基烷氧羰基, 杂芳基烯氧羰基, 杂芳基炔氧羰基, 杂环基氧羰基, 杂环基烷氧羰基, 杂环基烯氧羰基, 杂环基炔氧羰基, 氨基羰基, 可任选经取代的单或二烷基氨基羰基, 可任选经取代的单或二芳基氨基羰基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰基, 可任选经取代的N-烷基-N-芳基氨基羰基, 可任选经取代的N-烷基-N-杂芳基氨基羰基, 可任选经取代的单或二烷基羰氨基, 可任选经取代的单或二芳基羰氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基羰氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-芳基氨基, 可任选经取代的芳羰基-N-烷基氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-杂芳基氨基, 可任选经取代的杂芳基羰基-N-烷基氨基, 甲酰基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羰基, 卤烯羰基, 卤炔羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 卤烯基氨基羰基, 卤炔基氨基羰基, 卤烷基羰氨基, 卤烯基羰氨基, 卤炔基羰氨基, 卤烷氧基羰氨基, 卤烯氧基羰氨基, 卤炔氧基羰氨基, 卤烷基羰氧基, 卤烯基羰氧基, 卤炔基羰氧基, 卤烷基氧羰氧基, 卤烯基氧羰氧基, 卤炔基氧羰氧基, 卤烷基胺羰氨基, 卤烯基胺羰氨基, 卤炔基胺羰氨基, 氰基, 硝基,  $-P(=O)R^8R^9$ ,  $-P(=O)OR^{10}R^8$ ,  $-P(=O)OR^{10}OR^{11}$ , 2-四氢吡喃基氧基甲基, 3-四氢吡喃基氧基甲基, 2-四氢噻吩基氧基甲

基, 3-四氢噻吩基氧基甲基, 2-四氢吡喃基氧基甲基, 其中的环烷基、环烯基、芳基、四氢呋喃基、四氢噻吩基、四氢吡喃基、杂芳基及杂环基可任选地为相同或不同的  $R^2$  单或多取代, 或下列基团之一:  $-O-(CH_2)_n-O-(CH_2)_n-R^{2a}$ ,  $-O-CH_2-S-(O)_p-R^{13}$ ,  $-CONHNH-(CH_2)_n-$  烷基及  $-CONHNH-(CH_2)_n-$  芳基, 且

$R^{2a}$  为  $(C_1-C_6)$ -烷氧基,  $(C_2-C_6)$ -烯氧基,  $(C_3-C_6)$ -炔氧基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧基或苯基, 该苯基可任选地为下列基团所单或多取代: 卤素、氟基、硝基、 $(C_1-C_6)$ -烷基,  $(C_1-C_6)$ -烷氧基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基或卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基。

4. 如权利要求第 1 至 3 之任一项目的苯甲酰基环己烷二酮, 其中  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  和  $R^5$  各自独立地为氢, 烷基, 烯基, 炔基, 环烷基, 环烯基, 环烷基烷基, 芳基, 芳烷基, 杂芳基, 杂芳基烷基, 杂环基, 杂环基烷基, 羟基, 烷氧基, 环烷氧基, 芳氧基, 杂芳氧基, 杂环基氧基, 烷硫基, 芳硫基, 杂芳基硫基, 杂环基硫基, 杂环基烷硫基, 氨基, 单或二烷基氨基, 单或二芳基氨基, N-烷基-N-芳基氨基, 环烷基氨基, 烷基磺酰基, 芳基磺酰基, 烷基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 单或二烷基氨基磺酰基, 单或二芳基氨基磺酰基, N-烷基-N-芳基氨基磺酰基, N-烷基-N-杂芳基氨基磺酰基, 烷基磺酰氨基, 环烷基磺酰氨基, 芳基磺酰氨基, 杂芳基磺酰氨基, 环烷基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基磺酰基-N-烷基氨基, 烷羰基, 环烷基羰基, 芳羰基, 芳烷基羰基, 杂芳基羰基, 杂环基羰基, 羧基, 烷氧羰基, 芳氧羰基, 芳烷基羰基, 烷羰氧基, 芳羰氧基, 芳烷基羰氧基, 氨基羰基, 单或二烷基氨基羰基, N-烷基-N-芳基氨基羰基, N-烷基-N-杂芳基氨基羰基, N-烷基-N-芳基胺羰氧基, 胺羰氨基, 单或二烷基胺羰氨基, 单或二芳基胺羰氨基, 单或二杂芳基胺羰氨基, N-烷基-N-芳基胺羰氨基, 单或二烷基羰氨基, 单或二芳基羰氨基, 烷羰基-N-芳氨基, 芳



羰基—N—烷基, 烷氧基羰基, 环烷氧基羰基, 芳氧基羰基, 芳基烷氧基羰基, 烷氧羰基氨基, 环烷基氧羰基, 芳氧基羰基氨基, 烷氧羰基—N—烷基氨基, 甲酰基, 卤素, 卤烷基, 卤烯基, 卤炔基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷基硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷基氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷基羰基, 卤烯羰基, 卤炔羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 卤烯基氨基羰基, 卤炔基氨基羰基, 卤烷氧基羰基氨基, 卤烷基胺羰基氨基, 氰基, 硝基, 芳基烷氧基烷氧基或烷氧基烷氧基烷氧基;

$R^6$  为  $OR^{12}$ , 烷硫基, 烷基磺酰基, 氰基, 氰氧基, 氰硫基或卤素;

$R^7$  为氢, 烷基, 环烷基, 烷氧基, 烷氧基烷基, 烷羰基, 烷氧羰基, 烷硫基或苯基, 或

两个键结至同一个碳原子的  $R^7$  基团形成选自  $OCH_2CH_2O$  及  $OCH_2CH_2CH_2O$  的桥链, 该桥链可任选地为一至四个甲基所取代, 或两个键结至直接相邻碳原子的  $R^7$  基团形成一个键, 或与它们所键结的碳原子形成 3—至 6—元环, 该环可任选地为一或多个相同或不同的选自卤素、烷基、烷硫基及烷氧基的基团所取代;

$R^8$  和  $R^9$  各自独立地为烷基, 烯基, 炔基, 卤烷基, 可任选经取代的芳基或可任选经取代的芳烷基;

$R^{12}$  为氢, 卤烷基, 烷氧烷基, 甲酰基, 烷羰基, 烷氧羰基, 烷基磺酰基, 卤烷基磺酰基, 苯甲酰基或苯基磺酰基, 前述最后两种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自烷基、卤烷基、烷氧基、卤烷氧基、卤素、氰基及硝基的基团所取代;

L 为  $C_1—C_6$ —亚烷基链, 其可任选地为一至四个相同或不同的  $R^2$  基团所取代;

Y 为选自 O、N—H、N—烷基、 $CHR^7$  及  $C(R^7)_2$  的二价单元;

Z 为直接键, 或选自 O、S、 $SO_2$ 、N—烷基、 $CHR^7$  及  $C(R^7)_2$  的二价单元;

且



w 为 0, 1, 2 或 3.

5. 如权利要求第 1 至 4 之任一项的苯甲酰基环己烷二酮, 其中  $R^1$  为卤代-( $C_1-C_6$ )-烷氧基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯氧基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔氧基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷硫基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯硫基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔硫基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷氨基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯氨基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔氨基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷基磺酰基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯基磺酰基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔基磺酰基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷基亚磺酰基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯基亚磺酰基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔基亚磺酰基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷羰基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯羰基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔羰基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷氧羰基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯氧羰基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔氧羰基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷基氨基羰基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯基氨基羰基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔基氨基羰基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷基羰氨基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯基羰氨基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔基羰氨基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷氧基羰氨基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯氧基羰氨基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔氧基羰氨基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷羰氧基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯羰氧基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔羰氧基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷氧基羰氧基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯氧基羰氧基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔氧基羰氧基, 卤代-( $C_1-C_6$ )-烷基胺羰氨基, 卤代-( $C_2-C_6$ )-烯基胺羰氨基, 卤代-( $C_3-C_6$ )-炔基胺羰氨基,  $-O-(CH_2)_n-O-(CH_2)_n-R^{2a}$ ,  $-P(=O)R^8R^9$ ,  $-P(=O)OR^{10}R^8$ ,  $-P(=O)OR^{10}OR^{11}$ , 2-四氢呋喃基氧基甲基, 3-四氢呋喃基氧基甲基, 2-四氢噻吩基氧基甲基, 3-四氢噻吩基氧基甲基, 2-四氢吡喃基氧基甲基,  $C_3-C_6$ -环-( $C_1-C_6$ )-烷基,  $C_3-C_6$ -环-( $C_2-C_6$ )-烯基,  $C_3-C_6$ -环-( $C_1-C_6$ )-烷氧基,  $C_3-C_6$ -环-( $C_1-C_6$ )-烷基-( $C_1-C_6$ )-烷氧基,  $C_3-C_6$ -环-( $C_1-C_6$ )-烷基-( $C_2-C_6$ )-烯氧基,  $C_3-C_6$ -环-( $C_1-C_6$ )-烷基-( $C_2-C_6$ )-炔氧基,  $C_3-C_6$ -环烯氧基,  $C_3-C_6$ -环烯基-( $C_1-C_6$ )-烷氧基,  $C_3-C_6$ -环烯基-( $C_2-C_6$ )-烯氧基,  $C_3-$

C<sub>6</sub>-环烯基-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基, 前述最后 15 种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自下列的基团所取代: 氢, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基亚磺酰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基亚磺酰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基磺酰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基羰氨基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰氨基, 卤素, 硝基及氰基。

6. 如权利要求第 1 至 5 之任一项目的苯甲酰基环己烷二酮, 其中 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 和 R<sup>4</sup> 各自独立地为氢, 烷基, 烯基, 炔基, 环烷基, 环烯基, 环烷基烷基, 羟基, 烷氧基, 环烷氧基, 烷硫基, 氨基, 单或二烷基氨基, 环烷基氨基, 烷基磺酰基, 烷基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 单或二烷基氨基磺酰基, 烷基磺酰氨基, 环烷基磺酰氨基, 烷羰基, 环烷基羰基, 烷氧羰基, 烷羰氧基, 氨基羰基, 单或二烷基氨基羰基, 烷氧基羰基, 环烷氧基羰基, 烷氧羰基氨基, 甲酰基, 卤素, 卤烷基, 卤烯基, 卤炔基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 氰基或硝基;

R<sup>5</sup> 为氢;

R<sup>6</sup> 为 OR<sup>12</sup> 或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基;

R<sup>7</sup> 为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基或苯基;

R<sup>8</sup> 和 R<sup>9</sup> 各自独立地为 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-烯基, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-炔基, 卤代-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, 芳基或苄基;

R<sup>12</sup> 为氢, 卤代-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷羰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧羰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰基, 苯甲酰基或苯基磺酰基, 前述最后两种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、卤代-C<sub>1</sub>-

$C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、卤代- $C_1-C_6$ -烷氧基、卤素、氰基及硝基的基团所取代；

L 为  $C_1-C_3$ -亚烷基链，其可任选地为一至四个相同或不同的  $R^2$  基团所取代；

Y 为选自 N-烷基、 $CHR^7$  及  $C(R^7)_2$  的二价单元；且

Z 为直接键，或选自  $CHR^7$  及  $C(R^7)_2$  的二价单元。

7. 如权利要求第 1 至 6 之任一项目的苯甲酰基环己烷二酮，其中  $R^1$  为卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷硫基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯硫基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔硫基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氨基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氨基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氨基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基磺酰基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯基磺酰基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔基磺酰基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基亚磺酰基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯基亚磺酰基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔基亚磺酰基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷羰基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯羰基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔羰基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧羰基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧羰基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧羰基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氨基羰基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氨基羰基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氨基羰基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基羰氨基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯基羰氨基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔基羰氨基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基羰氨基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧基羰氨基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧基羰氨基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷羰氧基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯羰氧基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔羰氧基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基羰氧基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧基羰氧基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧基羰氧基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基胺羰氨基，卤代- $(C_2-C_6)$ -烯基胺羰氨基，卤代- $(C_3-C_6)$ -炔基胺羰氨基或  $-O-(CH_2)_n-O-(CH_2)_n-R^{2a}$ ；

$R^2$  和  $R^3$  各自独立地为氢， $C_1-C_6$ -烷基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基， $C_1-C_6$ -烷氧基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基， $C_1-C_6$ -烷硫基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷硫基， $C_1-C_6$ -烷基亚磺酰基，卤代- $(C_1-C_6)$ -烷

基亚磺酰基,  $C_1-C_6$ -烷基磺酰基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基磺酰基, 卤素, 硝基或氰基;

$R^4$  为氢;

$R^6$  为  $OR^{12}$ ;

$R^7$  为氢或  $C_1-C_6$ -烷基;

$R^{12}$  为氢,  $C_1-C_6$ -烷基磺酰基, 苯甲酰基或苯基磺酰基, 前述最后两种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自  $C_1-C_6$ -烷基、卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基、 $C_1-C_6$ -烷氧基、卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基、卤素、氰基及硝基的基团所取代;

L 为  $CH_2$ , 其可任选地为一或两个相同或不同的  $C_1-C_6$ -烷基或  $C_1-C_6$ -烷氧基所取代;

Y 和 Z 各自独立地为  $CHR^7$  或  $C(R^7)_2$ ;

v 为 1; 且

w 为 0, 1 或 2.

8. 一种除草组合物, 其包含除草活性量的至少一种如权利要求第 1 至 7 项中任一项的式 (I) 化合物。

9. 如权利要求第 8 项的除草组合物, 其系与调配助剂成混合物形式。

10. 一种控制不需要的植物的方法, 其包含将活性量的至少一种如权利要求第 1 至 7 项中任一项的式 (I) 化合物或如权利要求第 8 或 9 项的除草组合物施加于该植物上或该不需要植物所生长的区域上。

11. 如权利要求第 1 至 7 项中任一项的式 (I) 的化合物或如权利要求第 8 或 9 项的除草组合物用于控制不需要的植物的应用。

12. 如权利要求第 11 项的应用, 其中式 (I) 化合物系用于控制在有用植物中的不需要植物。

13. 如权利要求第 12 项的应用, 其中该有用植物为转基因的有用植物。

说 明 书

苯甲酰基环己烷二酮，其制法，及其作为  
除草剂与植物生长调节剂的用途

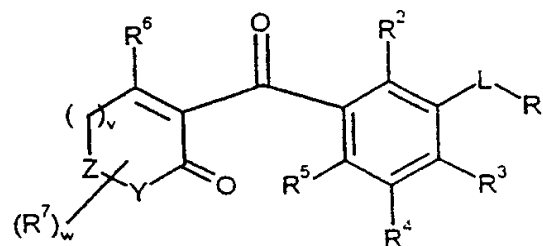
本发明系关于除草剂及植物生长调节剂的技术领域，尤其是有关用于选择性地控制有用农作物中的莠草及杂草的除草剂。

在许多专利中已揭示某些苯甲酰基环己烷二酮类化合物，例如其中在苯环 3-位上带有诸如通过桥而连接的基团的化合物具有除草性质。因此，JP-A 08 020554 中揭示了在上述位置带有经取代苯氧甲基基团的苯甲酰基环己烷二酮类化合物。JP-A 02 00222 则提及同样在上述 3-位上带有通过桥连接的基团的苯甲酰基环己烷二酮类化合物，其中该桥含有至少一个选自氧、硫及氮的原子。WO 99/10327, WO 99/07688 及 WO 99/03845 述及某些苯甲酰基环己烷二酮类化合物，它们在 3-位上带有通过碳链连接的杂环基团，在 WO 99/07688 中该碳链还可夹杂有杂原子。

但是由这些专利所揭示的苯甲酰基环己烷二酮类化合物在实际应用上常有缺陷。亦即这些已知化合物的除草或植物生长调节活性通常不足，即使达到足够的除草活性，但同时也对有用的作物产生不当的损害。

本发明的目的在于提供可克服上述现有技术的缺陷而具有除草及植物生长调节作用的化合物。

此目的已经由下式 (I) 的在苯环 3-位上经特定取代的苯甲酰基环己烷二酮化合物而达成



(I)

其中的取代基和代号具有下述定义：

- $R^1$  为可任选经取代的烃基，其可任选地另含有一或多个相同或不同的选自下列的杂原子：磷、氧、硫、氮、氟、氯、溴及碘；
- $R^2, R^3, R^4$  及  $R^5$  彼此各自独立地为氢，羟基，巯基，氨基，氰基，硝基，卤素或可任选经取代的烃基，该烃基可任选地另含有一或多个相同或不同的选自下列的杂原子：磷、氧、硫、氮、氟、氯、溴及碘；
- $R^6$  为  $OR^{12}$ ，烷硫基，卤烷基硫基，烯硫基，卤烯基硫基，炔硫基，卤炔基硫基，烷基亚磺酰基，卤烷基亚磺酰基，烯基亚磺酰基，卤烯基亚磺酰基，炔基亚磺酰基，卤炔基亚磺酰基，烷基磺酰基，卤烷基磺酰基，烯基磺酰基，卤烯基磺酰基，炔基磺酰基，卤炔基磺酰基，氰基，氰氧基，氰硫基或卤素；
- $R^7$  为氢，四氢吡喃-3-基，四氢吡喃-4-基，四氢噻喃-3-基，烷基，环烷基，烷氧基，烷氧烷基，烷羰基，烷氧羰基，烷硫基，苯基，其中前述最后八种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自卤素、烷硫基及烷氧基的基团所取代，或是两个键结至同一个碳原子的  $R^7$  基团形成选自下列的桥链：  
 $OCH_2CH_2O$ 、 $OCH_2CH_2CH_2O$ 、 $SCH_2CH_2S$  及  $SCH_2CH_2CH_2S$ ，该桥链可任选地为一至四个甲基所取代，或是两个键结至直接相邻碳原子的  $R^7$  基团形成一个键，或与它们所键结的碳原子形成 3-至 6-元环，该环可任选地为一或多个相同或不同的选自卤素、烷基、烷硫基及烷氧基的基团所取代；
- $R^{12}$  为氢，烷基，卤烷基，烷氧烷基，甲酰基，烷羰基，烷氧羰基，烷氨基羰基，二烷氨基羰基，烷基磺酰基，卤烷基磺酰基，苯甲酰基或苯基磺酰基，前述最后两种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自烷基、卤烷基、烷氧基、卤烷氧基、卤素、氰基及硝基的基团所取代；
- L 为  $C_1-C_6$ -亚烷基链，其可任选地为一或多个相同或不同的  $R^2$  基团

所取代；

Y 为选自 O、S、N—H、N—烷基、 $\text{CHR}^7$  及  $\text{C}(\text{R}^7)_2$  的二价单元；

Z 为直接键，或选自 O、S、SO、 $\text{SO}_2$ 、N—H、N—烷基、 $\text{CHR}^7$  及  $\text{C}(\text{R}^7)_2$  的二价单元；

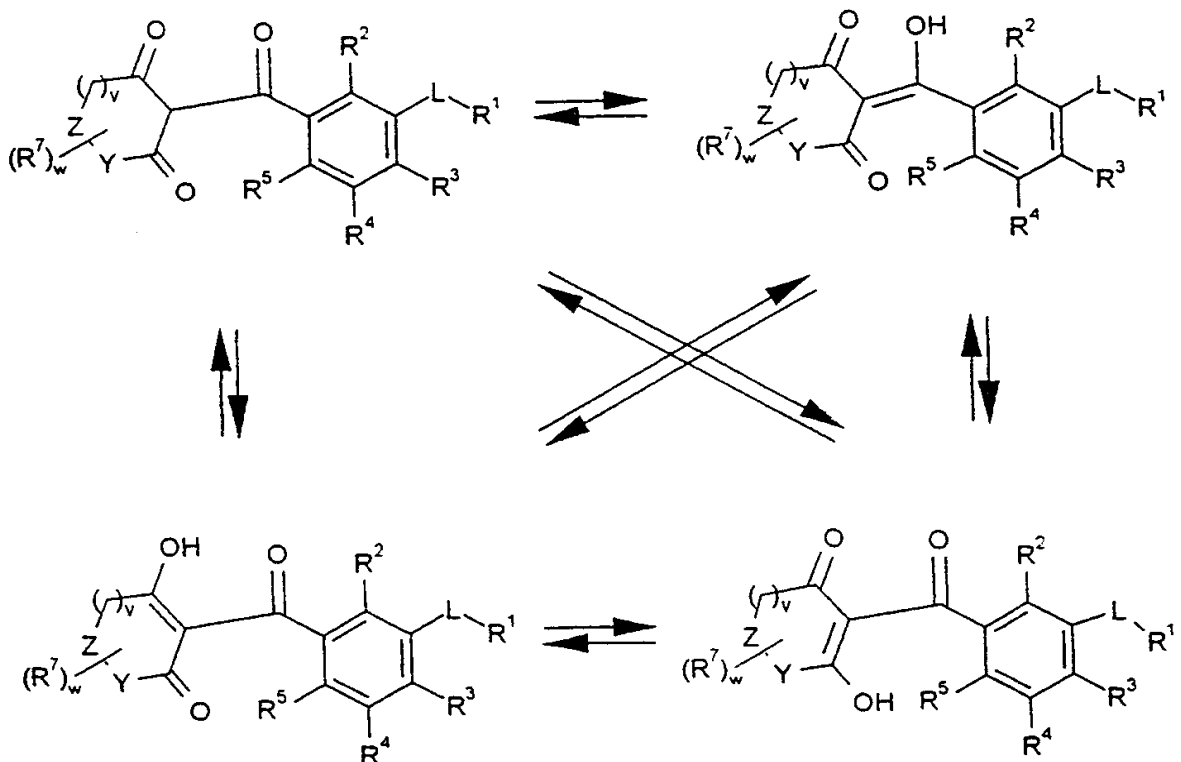
v 为 1 或 2；

w 为 0, 1, 2, 3 或 4；

先决条件为当  $\text{R}^2$  和  $\text{R}^3$  均为氯且  $\text{R}^4$  和  $\text{R}^5$  均为氢时， $-\text{L}-\text{R}^1$  不可为任选经取代的  $\text{CH}_2-\text{O}$ -苯基。

取决于外在条件(诸如溶剂及 pH)，许多本发明的式(I)化合物会以不同的互变异构性结构出现。

在  $\text{R}^6$  为羟基的情况下，可能会有下列的互变异构性结构：



取决于取代基类型，式(I)化合物可含有可通过与碱反应而予移除的酸性质子。适当的碱为，例如碱金属(诸如锂、钠及钾)，碱土金属(诸如钙及镁)，氨以及有机胺类。如此所形成的盐类同样是本发明的主题之一。

烃基系为直链、含支链或环形的饱和、部份饱和、不饱和或芳族

的基团，如烷基，烯基，炔基，环烷基，环烯基，环炔基或芳基。组合词诸如环烷烯基，环炔烷基及芳炔基也包括于此定义中。若此烃基另含杂原子，则这些杂原子可原则上(即在化学结构允许的情况下)位于该烃基团中任何所需的位置上。依据此原则，这些杂原子亦可作为连接至分子中其余部份的连接原子。杂原子可以单键或双键键结的方式存在。

在式(I)以及所有后述的化学式中，链状含碳基团诸如烷基，烷氧基，卤烷基，卤烷氧基，烷氨基及烷硫基以及碳结构中相应的不饱和及/或经取代基团诸如烯基及炔基，在各情况中可为直链或含支链的。若未指明，则在这些基团中以具有低级碳结构者(如含1至6个碳原子)或在饱和基团的情况中以具有2至4个碳原子者较为理想。烷基(甚至在组合定义中，诸如烷氧基，卤烷基，等等)为，例如，甲基，乙基，正一或异一丙基，正一、异一、叔一或2-丁基，戊基类，己基类，诸如正一己基，异一己基及1,3-二甲基丁基，庚基类，诸如正一庚基，1-甲基己基及1,4-二甲基戊基；烯基和炔基具有相应于烷基的可能的不饱和基团定义；烯基为，例如，烯丙基，1-甲基丙-2-烯-1-基，2-甲基丙-2-烯-1-基，丁-2-烯-1-基，丁-3-烯-1-基，1-甲基丁-3-烯-1-基及1-甲基丁-2-烯-1-基；炔基为，例如，炔丙基，丁-2-炔-1-基，丁-3-炔-1-基及1-甲基-丁-3-炔-1-基。多重键可位于不饱和基团中任何所需的位置上。

环烷基为具有三至八个碳原子的饱和碳环系统，例如环丙基，环戊基或环己基。同样的，环烯基系为具有三至八个碳原子的单环烯基环系统，例如环丙烯基，环丁烯基，环戊烯基以及环己烯基，其中双键可位于任何所需的位置上。在组合基团的情况中，诸如环烷烯基，第一个提及的基团可位于第二个提及的基团中任何所需的位置上。

在二取代氨基的情况中，诸如二烷氨基，这两个取代基可相同或不同。

卤素为氟，氯，溴或碘。卤烷基，卤烯基及卤炔基系部份或完全



为卤素所取代的烷基，烯基及炔基，优选为氟，氯及/或溴所取代，尤其是为氟或氯所取代，例如， $\text{CH}_3$ ， $\text{CHF}_2$ ， $\text{CH}_2\text{F}$ ， $\text{CF}_3\text{CF}_2$ ， $\text{CH}_2\text{FCHCl}$ ， $\text{CCl}_3$ ， $\text{CHCl}_2$ ， $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；卤烷氧基为，例如， $\text{OCF}_3$ ， $\text{OCHF}_2$ ， $\text{OCH}_2\text{F}$ ， $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ ， $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  及  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；同样的情况适用于卤烯基及其他为卤素所取代的基团。

杂环基的意义为三至六元饱和或部份不饱和的单或多环杂环类，其含有一至三个选自氧、氮及硫的杂原子。键结可发生在(若化学上可行)这些杂环中任何所需的位置上。这些杂环的实例为 2-四氢呋喃基，环氧乙烷基，3-四氢呋喃基，2-四氢噻吩基，3-四氢噻吩基，1-吡咯烷基，2-吡咯烷基，3-吡咯烷基，3-异噁唑烷基，4-异噁唑烷基，5-异噁唑烷基，3-异噻唑烷基，4-异噻唑烷基，5-异噻唑烷基，3-吡唑烷基，4-吡唑烷基，5-吡唑烷基，2-噁唑烷基，4-噁唑烷基，5-噁唑烷基，2-噻唑烷基，4-噻唑烷基，5-噻唑烷基，2-咪唑烷基，4-咪唑烷基，1,2,4-噁二唑烷-3-基，1,2,4-噁二唑烷-5-基，1,2,4-噻二唑烷-3-基，1,2,4-噻二唑烷-5-基，1,2,4-三唑烷-3-基，1,3,4-噁唑烷-2-基，1,3,4-噻二唑烷-2-基，1,3,4-三唑烷-2-基，2,3-二氢呋喃-2-基，2,3-二氢呋喃-3-基，2,3-二氢呋喃-4-基，2,3-二氢呋喃-5-基，2,5-二氢呋喃-2-基，2,5-二氢呋喃-3-基，2,3-二氢噻吩-2-基，2,3-二氢噻吩-3-基，2,3-二氢噻吩-4-基，2,3-二氢噻吩-5-基，2,5-二氢噻吩-2-基，2,5-二氢噻吩-3-基，2,3-二氢吡咯-2-基，2,3-二氢吡咯-3-基，2,3-二氢吡咯-4-基，2,3-二氢吡咯-5-基，2,5-二氢吡咯-2-基，2,5-二氢吡咯-3-基，2,3-二氢异噁唑-3-基，2,3-二氢异噁唑-4-基，2,3-二氢异噁唑-5-基，4,5-二氢异噁唑-3-基，4,5-二氢异噁唑-4-基，4,5-二氢异噁唑-5-基，2,5-二氢异噻唑-3-基，2,5-二氢异噻唑-4-基，2,5-二氢异噻唑-5-基，2,3-二氢异吡唑-3-基，2,3-二氢异吡唑-4-基，2,3-二氢异吡唑-5-基，4,5-二氢异吡唑-3-基，4,5-二氢异吡唑-4-基，4,5-二氢异吡唑-5-基。

5-基, 2,5-二氢异吡唑-3-基, 2,5-二氢异吡唑-4-基, 2,5-二氢异吡唑-5-基, 2,3-二氢噁唑-3-基, 2,3-二氢噁唑-4-基, 2,3-二氢噁唑-5-基, 4,5-二氢噁唑-3-基, 4,5-二氢噁唑-4-基, 4,5-二氢噁唑-5-基, 2,5-二氢噁唑-3-基, 2,5-二氢噁唑-4-基, 2,5-二氢噁唑-5-基, 2,3-二氢噻唑-2-基, 2,3-二氢噻唑-4-基, 2,3-二氢噻唑-5-基, 4,5-二氢噻唑-2-基, 4,5-二氢噻唑-4-基, 4,5-二氢噻唑-5-基, 2,5-二氢噻唑-2-基, 2,5-二氢噻唑-4-基, 2,5-二氢噻唑-5-基, 2,3-二氢咪唑-2-基, 2,3-二氢咪唑-4-基, 2,3-二氢咪唑-5-基, 4,5-二氢咪唑-2-基, 4,5-二氢咪唑-4-基, 4,5-二氢咪唑-5-基, 2,5-二氢咪唑-2-基, 2,5-二氢咪唑-4-基, 2,5-二氢咪唑-5-基, 1-吗啉基, 2-吗啉基, 3-吗啉基, 1-哌啶基, 2-哌啶基, 3-哌啶基, 4-哌啶基, 3-四氢吡嗪基, 4-四氢吡嗪基, 2-四氢嘧啶基, 4-四氢嘧啶基, 5-四氢嘧啶基, 2-四氢吡嗪基, 1,3,5-四氢三嗪-2-基, 1,2,4-四氢三嗪-3-基, 1,3-二氢噁嗪-2-基, 1,3-二噻烷-2-基, 2-四氢吡喃基, 1,3-二氧戊环-2-基, 3,4,5,6-四氢吡啶-2-基, 4H-1,3-噻嗪-2-基, 4H-3,1-苯并噻嗪-2-基, 1,3-二噻烷-2-基, 1,1-二氧代-2,3,4,5-四氢噻吩-2-基, 2H-1,4-苯并噻嗪-3-基, 2H-1,4-苯并噁嗪-3-基, 及 1,3-二氢噁嗪-2-基。

芳基为芳族单或多环烃基团, 如苯基, 萘基, 联苯基或菲基。

杂芳基为除了碳环原子外另含有一至五个选自氮、氧及硫的杂原子的芳族基团。5元杂芳基的实例为 2-吡咯基, 3-吡咯基, 3-吡唑基, 4-吡唑基, 5-吡唑基, 2-咪唑基, 4-咪唑基, 1,2,4-三唑-3-基, 1,3,4-三唑-2-基, 2-呋喃基, 3-呋喃基, 2-噻吩基, 3-噻吩基, 2-吡咯基, 3-吡咯基, 3-异噁唑基, 4-异噁唑基, 5-异噁唑基, 3-异噻唑基, 4-异噻唑基, 5-异噻唑基, 3-吡唑基, 4-吡唑基, 5-吡唑基, 2-噁唑基, 4-噁唑基, 5-噁唑基, 2-噻唑基, 4-噻唑基, 5-噻唑基, 2-咪唑基, 1,2,4-噁二唑-3-基,

1, 2, 4-噁二唑-5-基, 1, 2, 4-噻二唑-3-基, 1, 2, 4-噻二唑-5-基, 1, 2, 4-三唑-3-基, 1, 3, 4-噁二唑-2-基, 1, 3, 4-噻二唑-2-基, 及 1, 3, 4-三唑-2-基。6元杂芳基的实例为 2-吡啶基, 3-吡啶基, 4-吡啶基, 3-哒嗪基, 4-哒嗪基, 2-嘧啶基, 4-嘧啶基, 5-嘧啶基, 2-吡嗪基, 1, 3, 5-三嗪-2-基, 1, 2, 4-三嗪-3-基及 1, 2, 4, 5-四嗪-3-基。稠合 5元杂芳基的实例为 苯并噻唑-2-基及 苯并噁唑-2-基。苯并稠合 6元杂芳基的实例为 喹啉, 异喹啉, 喹唑啉及 喹喔啉。

“部份或完全卤化”系指在如此标示的基团中, 氢原子可部份或全部为相同或不同的前述卤原子所替代。

如果一个基团系经多取代, 则应了解其意指各种取代基的组合应遵循化学上化合物构造的一般原则, 亦即本领域技术人员所知化学上不稳定或不可能存在的化合物是不会形成的。

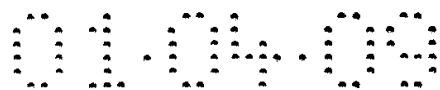
取决于取代基的性质及键结方式, 式 I 化合物可以立体异构体的形式存在。例如, 若存在有一或多个烯基, 则可能会产生非对映异构体。又如, 若存在有一或多个不对称碳原子, 则可能会产生对映异构体及非对映异构体。立体异构体可通过惯用的分离方法自制备期间所产生的混合物制得, 例如利用层析分离方法予以制得。同样的, 立体异构体可通过利用旋光性起始物及/或助剂的立体选择性反应而选择性地制得。因此本发明亦涵盖为式 I 所包括但未特别定义的所有立体异构体及其混合物。

在“Y”和“Z”定义的选择中, 应注意“Y”和“Z”不同时为杂原子二价单元。

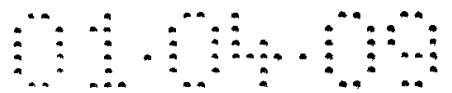
若一个基团定义为可任选经取代而没有进一步说明其取代基的性质时, 意指该基团可为一或多个相同或不同的  $R^2$  基团所取代。

较为理想的式 (I) 化合物为其中

$R^1$  为环烷基, 环烯基, 芳基, 环烷氧基, 环烷基烷氧基, 环烷基烯氧基, 环烷基炔氧基, 环烯氧基, 环烯基烷氧基, 环烯基烯氧基, 环烯基炔氧基, 芳氧基, 芳基烷氧基, 芳基烯氧基, 芳基炔氧基,



环烷基硫基, 环烷基烷硫基, 环烷基烯硫基, 环烷基炔硫基, 环烯硫基, 环烯基烷硫基, 环烯基烯硫基, 环烯基炔硫基, 芳硫基, 芳基烷硫基, 芳基烯硫基, 芳基炔硫基, 可任选经取代的单或二芳基氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基, 可任选经取代的N-烷基-N-芳基氨基, 可任选经取代的N-烷基-N-杂芳基氨基, 环烷基氨基, 环烯基氨基, 杂环基烷基氨基, 杂环基烯基氨基, 环烷基磺酰基, 环烷基烷基磺酰基, 环烷基烯基磺酰基, 环烷基炔基磺酰基, 环烯基磺酰基, 环烯基烷基磺酰基, 环烯基烯基磺酰基, 环烯基炔基磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基烷基磺酰基, 芳基烯基磺酰基, 芳基炔基磺酰基, 杂芳基磺酰基, 杂芳基烷基磺酰基, 杂芳基烯基磺酰基, 杂芳基炔基磺酰基, 杂环基磺酰基, 杂环基烷基磺酰基, 杂环基烯基磺酰基, 杂环基炔基磺酰基, 环烷基亚磺酰基, 环烷基烷基亚磺酰基, 环烷基烯基亚磺酰基, 环烷基炔基亚磺酰基, 环烯基亚磺酰基, 环烯基烷基亚磺酰基, 环烯基烯基亚磺酰基, 环烯基炔基亚磺酰基, 芳基亚磺酰基, 芳基烷基亚磺酰基, 芳基烯基亚磺酰基, 芳基炔基亚磺酰基, 杂芳基亚磺酰基, 杂芳基烷基亚磺酰基, 杂芳基烯基亚磺酰基, 杂芳基炔基亚磺酰基, 杂环基亚磺酰基, 杂环基烷基亚磺酰基, 杂环基烯基亚磺酰基, 杂环基炔基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二烷基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的N-烷基-N-芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的N-烷基-N-杂芳基氨基磺酰基, 烷基磺酰氧基, 烯基磺酰氧基, 炔基磺酰氧基, 环烷基磺酰氧基, 环烷基烷基磺酰氧基, 环烷基烯基磺酰氧基, 环烷基炔基磺酰氧基, 环烯基磺酰氧基, 环烯基烷基磺酰氧基, 环烯基烯基磺酰氧基, 环烯基炔基磺酰氧基, 芳基磺酰氧基, 芳基烷基磺酰氧基, 芳基烯基磺酰氧基, 芳基炔基磺酰氧基, 杂芳基磺酰氧基, 杂芳基烷基磺酰氧基, 杂芳基烯基磺酰氧基, 杂芳基炔基磺酰氧基, 杂环基磺酰氧基, 杂环基烷基磺酰氧基, 杂



环烯基磺酰氧基, 杂环基炔基磺酰氧基, 烷基磺酰氨基, 烯基磺酰氨基, 炔基磺酰氨基, 环烷基磺酰氨基, 环烷基烷基磺酰氨基, 环烷基烯基磺酰氨基, 环烷基炔基磺酰氨基, 环烯基磺酰氨基, 环烯基烷基磺酰氨基, 环烯基烯基磺酰氨基, 环烯基炔基磺酰氨基, 芳基磺酰氨基, 芳基烷基磺酰氨基, 芳基烯基磺酰氨基, 芳基炔基磺酰氨基, 杂芳基磺酰氨基, 杂芳基烷基磺酰氨基, 杂芳基烯基磺酰氨基, 杂芳基炔基磺酰氨基, 烷基磺酰基-N-烷基氨基, 烯基磺酰基-N-烷基氨基, 炔基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基烷基磺酰氨基, 杂芳基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 烷羰基, 烯羰基, 炔羰基, 环烷羰基, 环烷基烷羰基, 环烷基烯羰基, 环烷基炔羰基, 环烯羰基, 环烯基烷羰基, 环烯基烯羰基, 环烯基炔羰基, 芳羰基, 芳基烷羰基, 芳基烯羰基, 芳基炔羰基, 杂芳基羰基, 杂芳基烷羰基, 杂芳基烯羰基, 杂芳基炔羰基, 杂环基羰基, 羧基, 烷氧羰基, 烯氧羰基, 炔氧羰基, 环烷基氧羰基, 环烷基烷氧羰基, 环烷基烯氧羰基, 环烷基炔氧羰基, 环烯氧羰基, 环烯基烷氧羰基, 环烯基烯氧羰基, 环烯基炔氧羰基, 芳氧羰基, 芳基烷氧羰基, 芳基烯氧羰基, 芳基炔氧羰基, 杂芳基氧羰基, 杂芳基烷氧羰基, 杂芳基烯氧羰基, 杂芳基炔氧羰基, 杂环基氧羰基, 杂环基烷氧羰基, 杂环基烯氧羰基, 杂环基炔氧羰基, 氨基羰基, 可任选经取代的单或二烷

基氨基羰基，可任选经取代的单或二芳基氨基羰基，可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰基，可任选经取代的 N-烷基-N-芳基氨基羰基，可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基氨基羰基，可任选经取代的单或二杂芳基胺羰氧基，可任选经取代的 N-烷基-N-芳基胺羰氧基，可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基胺羰氧基，氨基羰氨基，可任选经取代的单或二烷基氨基羰氨基，可任选经取代的单或二芳基氨基羰氨基，可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰氨基，可任选经取代的 N-烷基-N-芳基氨基羰氨基，可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基氨基羰氨基，环烷基羰氧基，环烷基烷羰氧基，环烷基烯羰氧基，环烷基炔羰氧基，环烯羰氧基，环烯基烷羰氧基，环烯基烯羰氧基，环烯基炔羰氧基，芳羰氧基，芳基烷羰氧基，芳基烯羰氧基，芳基炔羰氧基，杂芳基羰氧基，杂芳基烷羰氧基，杂芳基烯羰氧基，杂芳基炔羰氧基，杂环基羰氧基，杂环基烷羰氧基，杂环基烯羰氧基，杂环基炔羰氧基，可任选经取代的单或二烷基羰氨基，可任选经取代的单或二芳基羰氨基，可任选经取代的单或二杂芳基羰氨基，可任选经取代的烷羰基-N-芳基氨基，可任选经取代的芳羰基-N-烷基氨基，可任选经取代的烷羰基-N-杂芳基氨基，可任选经取代的杂芳基羰基-N-烷基氨基，烷氧基羰氨基，烯氧基羰氨基，炔氧基羰氨基，环烷基氧羰氨基，环烷基烷氧羰氨基，环烷基烯氧羰氨基，环烷基炔氧羰氨基，环烯基氧羰氨基，环烯基烷氧羰氨基，环烯基烯氧羰氨基，环烯基炔氧羰氨基，芳氧基羰氨基，芳基烷氧羰氨基，芳基烯氧羰氨基，芳基炔氧羰氨基，杂芳基氧羰氨基，杂芳基烷氧羰氨基，杂芳基烯氧羰氨基，杂芳基炔氧羰氨基，杂环基氧羰氨基，杂环基烷氧羰氨基，杂环基烯氧羰氨基，杂环基炔氧羰氨基，烷氧基羰氧基，烯氧基羰氧基，炔氧基羰氧基，环烷基氧羰氧基，环烷基烷氧羰氧基，环烷基烯氧羰氧基，环烷基炔氧羰氧基，环烯基氧羰氧基，环烯基烷氧羰氧基，环烯基烯氧羰氧基，环烯基炔氧羰氧基，芳氧基羰氧基，芳基烷氧羰氧基，芳基烯氧

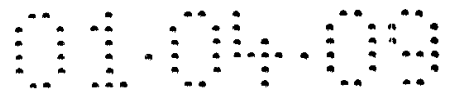
羧氧基, 芳基炔氧羧氧基, 杂芳基氧羧氧基, 杂芳基烷氧羧氧基, 杂芳基烯氧羧氧基, 杂芳基炔氧羧氧基, 杂环基氧羧氧基, 杂环基烷氧羧氧基, 杂环基烯氧羧氧基, 杂环基炔氧羧氧基, 烷氧基羧氨基, 烯氧基羧氨基, 炔氧羧基-N-烷氨基, 环烷基氧羧基-N-烷氨基, 环烷基烷氧羧基-N-烷氨基, 环烷基烯氧羧基-N-烷氨基, 环烷基炔氧羧基-N-烷氨基, 环烯基氧羧基-N-烷氨基, 环烯基烷氧羧基-N-烷氨基, 环烯基烯氧羧基-N-烷氨基, 环烯基炔氧羧基-N-烷氨基, 芳氧基羧基-N-烷氨基, 芳基烷氧羧基-N-烷氨基, 芳基烯氧羧基-N-烷氨基, 芳基炔氧羧基-N-烷氨基, 杂芳基烷氧羧基-N-烷氨基, 杂芳基烯氧羧基-N-烷氨基, N-烷基杂芳基炔氧羧基-N-烷氨基, N-烷基杂环基烷氧羧基-N-烷氨基, 杂环基烯氧羧氨基, 杂环基炔氧羧基-N-烷氨基, 甲酰基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羧基, 卤烯羧基, 卤炔羧基, 卤烷氧羧基, 卤烯氧羧基, 卤炔氧羧基, 卤烷基氨基羧基, 卤烯基氨基羧基, 卤炔基氨基羧基, 卤烷氧基羧氨基, 卤烯氧基羧氨基, 卤炔氧基羧氨基, 卤烷基羧氧基, 卤烯基羧氧基, 卤炔基羧氧基, 卤烷基氧羧氧基, 卤烯基氧羧氧基, 卤炔基氧羧氧基, 卤烷基胺羧氨基, 卤烯基胺羧氨基, 卤炔基胺羧氨基, 氰基, 硝基,  $-P(=O)R^8R^9$ ,  $-P(=O)OR^{10}R^8$ ,  $-P(=O)OR^{10}OR^{11}$ , 2-四氢呋喃基氧基甲基, 3-四氢呋喃基氧基甲基, 2-四氢噻吩基氧基甲基, 3-四氢噻吩基氧基甲基, 2-四氢吡喃基氧基甲基, 其中的环烷基、环烯基、芳基、四氢呋喃基、四氢噻吩基、四氢吡喃基氧基甲基、杂芳基及杂环基可任选地为相同或不同的  $R^2$  所单或多取代, 或下列基团之一:  $-O-(CH_2)_n-O-(CH_2)_n-R^{2a}$ ,  $-O-CH_2-S-(O)_p-R^{13}$ ,  $-CONHNH-(CH_2)_n$ -烷基及  $-CONHNH-(CH_2)_n$ -芳基;

R<sup>2a</sup> 为环烷基, 环烯基, 环烷基烷基, 环烷基烯基, 环烷基炔基, 环烯基烷基, 环烯基烷基, 芳基, 芳烷基, 芳烯基, 芳炔基, 杂芳基, 杂芳基烷基, 杂芳基烯基, 杂芳基炔基, 杂环基, 杂环基烷基, 杂环基烯基, 杂环基炔基, 羟基, 烷氧基, 烯氧基, 炔氧基, 环烷氧基, 环烷基烷氧基, 环烷基烯氧基, 环烷基炔氧基, 环烯氧基, 环烯基烷氧基, 环烯基烯氧基, 环烯基炔氧基, 芳氧基, 芳基烷氧基, 芳基烯氧基, 芳基炔氧基, 杂芳氧基, 杂芳基烷氧基, 杂芳基烯氧基, 杂芳基炔氧基, 杂环氧基, 杂环基烷氧基, 杂环基烯氧基, 杂环基炔氧基, 硫基, 烷硫基, 烯硫基, 炔硫基, 环烷硫基, 环烷基烷硫基, 环烷基烯硫基, 环烷基炔硫基, 环烯硫基, 环烯基烷硫基, 环烯基烯硫基, 环烯基炔硫基, 芳硫基, 芳基烷硫基, 芳基烯硫基, 芳基炔硫基, 杂芳硫基, 杂芳基烷硫基, 杂芳基烯硫基, 杂芳基炔硫基, 杂环硫基, 杂环基烷硫基, 杂环基烯硫基, 杂环基炔硫基, 氨基, 可任选经取代的单或二烷基氨基, 可任选经取代的单或二芳基氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基, 可任选经取代的N-烷基-N-芳基氨基, 可任选经取代的N-烷基-N-杂芳基氨基, 烯氨基, 炔氨基, 环烷基氨基, 环烯基氨基, 杂环基烷基氨基, 杂环基烯基氨基, 烷基磺酰基, 烯基磺酰基, 炔基磺酰基, 环烷基磺酰基, 环烷基烷基磺酰基, 环烷基烯基磺酰基, 环烷基炔基磺酰基, 环烯基磺酰基, 环烯基烷基磺酰基, 环烯基烯基磺酰基, 环烯基炔基磺酰基, 芳基磺酰基, 芳基烷基磺酰基, 芳基烯基磺酰基, 芳基炔基磺酰基, 杂芳基磺酰基, 杂芳基烷基磺酰基, 杂芳基烯基磺酰基, 杂芳基炔基磺酰基, 杂环基磺酰基, 杂环基烷基磺酰基, 杂环基烯基磺酰基, 杂环基炔基磺酰基, 烷基亚磺酰基, 烯基亚磺酰基, 炔基亚磺酰基, 环烷基亚磺酰基, 环烷基烷基亚磺酰基, 环烷基烯基亚磺酰基, 环烷基炔基亚磺酰基, 环烯基亚磺酰基, 环烯基烷基亚磺酰基, 环烯基烯基亚磺酰基, 环烯基炔基亚磺酰基, 芳基亚磺酰基, 芳基烷基亚磺酰基, 芳基烯基亚磺酰基, 芳基炔基亚磺酰基



酰基, 杂芳基亚磺酰基, 杂芳基烷基亚磺酰基, 杂芳基烯基亚磺酰基, 杂芳基炔基亚磺酰基, 杂环基亚磺酰基, 杂环基烷基亚磺酰基, 杂环基烯基亚磺酰基, 杂环基炔基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二烷基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的 N-烷基-N-芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的 N-烷基-N-杂芳基氨基磺酰基, 烷基磺酰氧基, 烯基磺酰氧基, 炔基磺酰氧基, 环烷基磺酰氧基, 环烷基烷基磺酰氧基, 环烷基烯基磺酰氧基, 环烷基炔基磺酰氧基, 环烯基磺酰氧基, 环烯基炔基磺酰氧基, 芳基磺酰氧基, 芳基烷基磺酰氧基, 芳基烯基磺酰氧基, 芳基炔基磺酰氧基, 杂芳基磺酰氧基, 杂芳基烷基磺酰氧基, 杂芳基烯基磺酰氧基, 杂芳基炔基磺酰氧基, 杂环基磺酰氧基, 杂环基烷基磺酰氧基, 杂环基烯基磺酰氧基, 杂环基炔基磺酰氧基, 烷基磺酰氨基, 烯基磺酰氨基, 炔基磺酰氨基, 环烷基磺酰氨基, 环烷基烷基磺酰氨基, 环烷基烯基磺酰氨基, 环烷基炔基磺酰氨基, 环烯基烷基磺酰氨基, 环烯基烯基磺酰氨基, 环烯基炔基磺酰氨基, 芳基磺酰氨基, 芳基烷基磺酰氨基, 芳基烯基磺酰氨基, 芳基炔基磺酰氨基, 杂芳基磺酰氨基, 杂芳基烷基磺酰氨基, 杂芳基烯基磺酰氨基, 杂芳基炔基磺酰氨基, 二烷基磺酰基-N-烷基氨基, 烯基磺酰基-N-烷基氨基, 炔基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基

炔基磺酰基—N—烷基氨基，杂环基磺酰基—N—烷基氨基，杂环基烷基磺酰基—N—烷基氨基，杂环基烯基磺酰基—N—烷基氨基，杂环基炔基磺酰基—N—烷基氨基，烷羰基，烯羰基，炔羰基，环烷羰基，环烷基烷羰基，环烷基烯羰基，环烷基炔羰基，环烯羰基，环烯基烷羰基，环烯基烯羰基，环烯基炔羰基，芳羰基，芳基烷羰基，芳基烯羰基，芳基炔羰基，杂芳基羰基，杂芳基烷羰基，杂芳基烯羰基，杂芳基炔羰基，杂环基羰基，杂环基烷基，杂环基烯基，杂环基炔基，羧基，烷氧羰基，烯氧羰基，炔氧羰基，环烷基氧羰基，环烷基烷氧羰基，环烷基烯氧羰基，环烷基炔氧羰基，环烯氧羰基，环烯基烷氧羰基，环烯基烯氧羰基，环烯基炔氧羰基，芳氧羰基，芳基烷氧羰基，芳基烯氧羰基，芳基炔氧羰基，杂芳基氧羰基，杂芳基烷氧羰基，杂芳基烯氧羰基，杂芳基炔氧羰基，杂环基氧羰基，杂环基烷氧羰基，杂环基烯氧羰基，杂环基炔氧羰基，烷羰氧基，烯羰氧基，炔羰氧基，环烷羰氧基，环烷基烯羰氧基，环烷基炔羰氧基，环烯羰氧基，环烯基烷羰氧基，环烯基烯羰氧基，环烯基炔羰氧基，芳羰氧基，芳基烷羰氧基，芳基烯羰氧基，芳基炔羰氧基，杂芳基羰氧基，杂芳基烷羰氧基，杂芳基烯羰氧基，杂芳基炔羰氧基，杂环基羰氧基，杂环基烷羰氧基，杂环基烯羰氧基，杂环基炔羰氧基，氨基羰基，可任选经取代的单或二烷基氨基羰基，可任选经取代的单或二芳基氨基羰基，可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰基，可任选经取代的N—烷基—N—芳基氨基羰基，可任选经取代的N—烷基—N—杂芳基氨基羰基，可任选经取代的单或二杂芳基胺羰氧基，可任选经取代的N—烷基—N—芳基胺羰氧基，可任选经取代的N—烷基—N—杂芳基胺羰氧基，氨基羰氨基，可任选经取代的单或二烷基氨基羰氨基，可任选经取代的单或二芳基氨基羰氨基，可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰氨基，可任选经取代的N—烷基—N—芳基氨基羰氨基，可任选经取代的N—烷基—N—杂芳基氨基羰氨基，可任选经取代的单或二烷基羰氨基，可任选经取代的单或二



芳基羰氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基羰氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-芳基氨基, 可任选经取代的芳羰基-N-烷基氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-杂芳基氨基, 可任选经取代的杂芳基羰基-N-烷基氨基, 烷氧基羰氧基, 烯氧基羰氧基, 炔氧基羰氧基, 环烷基氧羰氧基, 环烷基烷氧羰氧基, 环烷基烯氧羰氧基, 环烷基炔氧羰氧基, 环烯基氧羰氧基, 环烯基烷氧羰氧基, 环烯基烯氧羰氧基, 环烯基炔氧羰氧基, 芳氧基羰氧基, 芳基烷氧羰氧基, 芳基烯氧羰氧基, 芳基炔氧羰氧基, 杂芳基氧羰氧基, 杂芳基烷氧羰氧基, 杂芳基烯氧羰氧基, 杂芳基炔氧羰氧基, 杂环基氧羰氧基, 杂环基烷氧羰氧基, 杂环基烯氧羰氧基, 杂环基炔氧羰氧基, 烷氧基羰氨基, 烯氧基羰氨基, 炔氧基羰氨基, 环烷基氧羰氨基, 环烷基烷氧羰氨基, 环烷基烯氧羰氨基, 环烷基炔氧羰氨基, 环烯基氧羰氨基, 环烯基烷氧羰氨基, 环烯基烯氧羰氨基, 环烯基炔氧羰氨基, 芳氧基羰氨基, 芳基烷氧羰氨基, 芳基烯氧羰氨基, 芳基炔氧羰氨基, 杂芳基氧羰氨基, 杂芳基烷氧羰氨基, 杂芳基烯氧羰氨基, 杂芳基炔氧羰氨基, 杂环基氧羰氨基, 杂环基烷氧羰氨基, 杂环基烯氧羰氨基, 杂环基炔氧羰氨基, 烷氧基羰氨基, 烯氧基羰氨基, 炔氧基羰氨基, 环烷基氧羰氨基, 环烷基烷氧羰氨基, N-烷基环烷基烯氧羰氨基, 环烷基炔氧羰氨基, 环烯基氧羰氨基, 环烯基烷氧羰氨基, 环烯基烯氧羰氨基, 环烯基炔氧羰氨基, 芳氧基羰氨基, 芳基烷氧羰氨基, 芳基烯氧羰氨基, 芳基炔氧羰氨基, 杂芳基烷氧羰氨基, 杂芳基烯氧羰氨基, 杂芳基炔氧羰氨基, 杂环基烷氧羰氨基, 杂环基烯氧羰氨基, 杂环基炔氧羰氨基, 甲酰基, 卤素, 卤烷基, 卤烯基, 卤炔基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羰基, 卤烯羰基, 卤炔羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 卤烯基氨基羰基, 卤炔

基氨基羰基, 卤烷氧基羰氨基, 卤烯氧基羰氨基, 卤炔氧基羰氨基, 卤烷基胺羰氨基, 卤烯基胺羰氨基, 卤炔基胺羰氨基, 氰基, 硝基, 或下列基团之一:

$-P(=O)R^8R^9$ ,  $-P(=O)OR^{10}R^8$ ,  $-P(=O)OR^{10}OR^{11}$ ,  $-CH=N-NH-$   
 $(CH_2)_n-$ 烷基,  $-CH=N-NH-(CH_2)_n-$ 芳基,  $-CH=N-O-(CH_2)_n-$   
 烷基,  $-CH=N-O-(CH_2)_n-$ 芳基,  $-O-(CH_2)_n-O-(CH_2)_n-$ 烷  
 基,  $-CONHNH-(CH_2)_n-$ 烷基及  $-CONHNH-(CH_2)_n-$ 芳基;

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  和  $R^5$  各自独立地为  $R^{2a}$ , 氢, 烷基, 烯基或炔基;

$R^8$  和  $R^9$  各自独立地为烷基, 烯基, 炔基, 卤烷基, 卤烯基, 卤炔基,  
 可任选经取代的芳基或可任选经取代的芳烷基;

$R^{10}$  和  $R^{11}$  各自独立地为氢或  $R^8$ , 或  $R^{10}$  和  $R^{11}$  共同形成  $C_2-C_5-$ 亚烷基  
 链;

$R^{13}$  为烷基, 烯基, 炔基, 卤烷基, 卤烯基, 卤炔基, 或苯基, 该苯  
 基可任选地为一或多个相同或不同的选自卤素、烷基、卤烷基及  
 硝基的基团所取代;

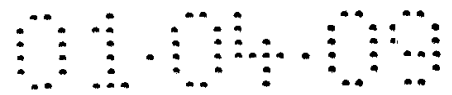
m 为 1, 2 或 3;

n 为 0, 1, 2 或 3 且

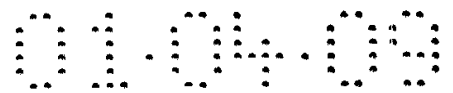
p 为 0, 1 或 2.

优选的式(I)化合物为其中

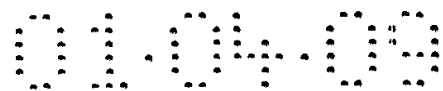
$R^1$  为环烷基, 环烯基, 芳基, 环烷氧基, 环烷基烷氧基, 环烷基烯  
 氧基, 环烷基炔氧基, 环烯氧基, 环烯基烷氧基, 环烯基烯氧基,  
 环烯基炔氧基, 芳氧基, 芳基烷氧基, 芳基烯氧基, 芳基炔氧基,  
 环烷硫基, 环烷基烷硫基, 环烷基烯硫基, 环烷基炔硫基, 环烯  
 硫基, 环烯基烷硫基, 环烯基烯硫基, 环烯基炔硫基, 芳硫基,  
 芳基烷硫基, 芳基烯硫基, 芳基炔硫基, 环烷基磺酰基, 环烷基  
 烷磺酰基, 环烷基烯磺酰基, 环烷基炔磺酰基, 环烯基磺  
 酰基, 环烯基烷磺酰基, 环烯基烯磺酰基, 环烯基炔磺酰  
 基, 芳基磺酰基, 芳基烷磺酰基, 芳基烯磺酰基, 芳基炔基



磺酰基, 杂芳基磺酰基, 杂芳基烷基磺酰基, 杂芳基烯基磺酰基, 杂芳基炔基磺酰基, 杂环基磺酰基, 杂环基烷基磺酰基, 杂环基烯基磺酰基, 杂环基炔基磺酰基, 环烷基亚磺酰基, 环烷基烷基亚磺酰基, 环烷基烯基亚磺酰基, 环烷基炔基亚磺酰基, 环烯基亚磺酰基, 环烯基烷基亚磺酰基, 环烯基烯基亚磺酰基, 环烯基炔基亚磺酰基, 芳基亚磺酰基, 芳基烷基亚磺酰基, 芳基烯基亚磺酰基, 芳基炔基亚磺酰基, 杂芳基亚磺酰基, 杂芳基烷基亚磺酰基, 杂芳基烯基亚磺酰基, 杂芳基炔基亚磺酰基, 杂环基亚磺酰基, 杂环基烷基亚磺酰基, 杂环基烯基亚磺酰基, 杂环基炔基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二烷基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的N-烷基-N-芳基氨基磺酰基, 可任选经取代的N-烷基-N-杂芳基氨基磺酰基, 烷基磺酰氧基, 烯基磺酰氧基, 炔基磺酰氧基, 环烷基磺酰氧基, 环烷基烷基磺酰氧基, 环烷基烯基磺酰氧基, 环烷基炔基磺酰氧基, 环烯基磺酰氧基, 环烯基烷基磺酰氧基, 环烯基烯基磺酰氧基, 环烯基炔基磺酰氧基, 芳基磺酰氧基, 芳基烷基磺酰氧基, 芳基烯基磺酰氧基, 芳基炔基磺酰氧基, 杂芳基磺酰氧基, 杂芳基烷基磺酰氧基, 杂芳基烯基磺酰氧基, 杂芳基炔基磺酰氧基, 杂环基磺酰氧基, 杂环基烷基磺酰氧基, 杂环基烯基磺酰氧基, 杂环基炔基磺酰氧基, 烷基磺酰氨基, 烯基磺酰氨基, 炔基磺酰氨基, 环烷基磺酰氨基, 环烷基烷基磺酰氨基, 环烷基烯基磺酰氨基, 环烷基炔基磺酰氨基, 环烯基磺酰氨基, 环烯基烷基磺酰氨基, 环烯基烯基磺酰氨基, 环烯基炔基磺酰氨基, 芳基磺酰氨基, 芳基烷基磺酰氨基, 芳基烯基磺酰氨基, 芳基炔基磺酰氨基, 杂芳基磺酰氨基, 杂芳基烷基磺酰氨基, 杂芳基烯基磺酰氨基, 杂芳基炔基磺酰氨基, 烷基磺酰基-N-烷基氨基, 烯基磺酰基-N-烷基氨基, 炔基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烷基烯基磺酰基-N-



烷基氨基, 环烷基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 环烯基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基烷基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基烯基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基炔基磺酰基-N-烷基氨基, 烷羰基, 烯羰基, 炔羰基, 环烷羰基, 环烷基烷羰基, 环烷基烯羰基, 环烷基炔羰基, 环烯羰基, 环烯基烷羰基, 环烯基烯羰基, 环烯基炔羰基, 芳羰基, 芳基烷羰基, 芳基烯羰基, 芳基炔羰基, 杂芳基羰基, 杂芳基烷羰基, 杂芳基烯羰基, 杂芳基炔羰基, 杂环基羰基, 羧基, 烷氧羰基, 烯氧羰基, 炔氧羰基, 环烷氧羰基, 环烷基烷氧羰基, 环烷基烯氧羰基, 环烷基炔氧羰基, 环烯氧羰基, 环烯基烷氧羰基, 环烯基烯氧羰基, 环烯基炔氧羰基, 芳氧羰基, 芳基烷氧羰基, 芳基烯氧羰基, 芳基炔氧羰基, 杂芳基氧羰基, 杂芳基烷氧羰基, 杂芳基烯氧羰基, 杂芳基炔氧羰基, 杂环基氧羰基, 杂环基烷氧羰基, 杂环基烯氧羰基, 杂环基炔氧羰基, 氨基羰基, 可任选经取代的单或二烷基氨基羰基, 可任选经取代的单或二芳基氨基羰基, 可任选经取代的单或二杂芳基氨基羰基, 可任选经取代的N-烷基-N-芳基氨基羰基, 可任选经取代的N-烷基-N-杂芳基氨基羰基, 可任选经取代的单或二烷基羰氨基, 可任选经取代的单或二芳基羰氨基, 可任选经取代的单或二杂芳基羰氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-芳基氨基, 可任选经取代的芳羰基-N-烷基氨基, 可任选经取代的烷羰基-N-杂芳基氨基, 可任选经取代的杂芳基羰基-N-烷基氨基, 甲酰基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰

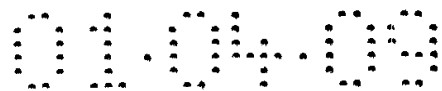


基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羰基, 卤烯羰基, 卤炔羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 卤烯基氨基羰基, 卤炔基氨基羰基, 卤烷基羰氨基, 卤烯基羰氨基, 卤炔基羰氨基, 卤烷氧基羰氨基, 卤烯氧基羰氨基, 卤炔氧基羰氨基, 卤烷基羰氧基, 卤烯基羰氧基, 卤炔基羰氧基, 卤烷基氧羰氧基, 卤烯基氧羰氧基, 卤炔基氧羰氧基, 卤烷基胺羰氨基, 卤烯基胺羰氨基, 卤炔基胺羰氨基, 氰基, 硝基,  $-P(=O)R^8R^9$ ,  $-P(=O)OR^{10}R^8$ ,  $-P(=O)OR^{10}OR^{11}$ , 2-四氢吡喃基氧基甲基, 3-四氢吡喃基氧基甲基, 2-四氢噻吩基氧基甲基, 3-四氢噻吩基氧基甲基, 2-四氢吡喃基氧基甲基, 其中的环烷基、环烯基、芳基、四氢吡喃基、四氢噻吩基、四氢吡喃基、杂芳基及杂环基可任选地为相同或不同的  $R^2$  所单或多取代, 或下列基团之一:  $-O-(CH_2)_n-O-(CH_2)_n-R^{2a}$ ,  $-O-CH_2-S-(O)_p-R^{13}$ ,  $-CONHNH-(CH_2)_n-$  烷基及  $-CONHNH-(CH_2)_n-$  芳基, 且

$R^{2a}$  为  $(C_1-C_6)$ -烷氧基,  $(C_2-C_6)$ -烯氧基,  $(C_3-C_6)$ -炔氧基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧基或苯基, 该苯基可任选地为下列基团所单或多取代: 卤素、氰基、硝基、 $(C_1-C_6)$ -烷基,  $(C_1-C_6)$ -烷氧基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基或卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基。

同样优选的式(I)化合物为其中

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  和  $R^5$  各自独立地为氢, 烷基, 烯基, 炔基, 环烷基, 环烯基, 环烷基烷基, 芳基, 芳烷基, 杂芳基, 杂芳基烷基, 杂环基, 杂环基烷基, 羟基, 烷氧基, 环烷氧基, 芳氧基, 杂芳氧基, 杂环基氧基, 烷硫基, 芳硫基, 杂芳基硫基, 杂环基硫基, 杂环基烷基硫基, 氨基, 单或二烷基氨基, 单或二芳基氨基, N-烷基-N-芳基氨基, 环烷基氨基, 烷基磺酰基, 芳基磺酰基, 烷基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 单或二烷基氨基磺酰基, 单或二芳基氨基磺酰基



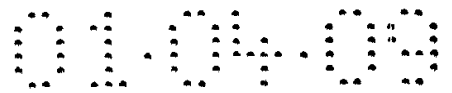
基, N-烷基-N-芳基氨基磺酰基, N-烷基-N-杂芳基氨基磺酰基, 烷基磺酰氨基, 环烷基磺酰氨基, 芳基磺酰氨基, 杂芳基磺酰氨基, 环烷基磺酰基-N-烷基氨基, 芳基磺酰基-N-烷基氨基, 杂芳基磺酰基-N-烷基氨基, 杂环基磺酰基-N-烷基氨基, 烷羰基, 环烷基羰基, 芳羰基, 芳烷基羰基, 杂芳基羰基, 杂环基羰基, 羧基, 烷氧羰基, 芳氧羰基, 芳烷氧基羰基, 烷羧氧基, 芳羧氧基, 芳烷基羧氧基, 氨基羰基, 单或二烷基氨基羰基, N-烷基-N-芳基氨基羰基, N-烷基-N-杂芳基氨基羰基, N-烷基-N-芳基胺羧氧基, 胺羧氨基, 单或二烷基胺羧氨基, 单或二芳基胺羧氨基, 单或二杂芳基胺羧氨基, N-烷基-N-芳基胺羧氨基, 单或二烷基羧氨基, 单或二芳基羧氨基, 烷羰基-N-芳氨基, 芳羰基-N-烷氨基, 烷氧基羧氧基, 环烷氧基羧氧基, 芳氧基羧氧基, 芳基烷氧基羧氧基, 烷氧羰基氨基, 环烷基氧羧氨基, 芳氧基羧氨基, 烷氧羰基-N-烷基氨基, 甲酰基, 卤素, 卤烷基, 卤烯基, 卤炔基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羰基, 卤烯羰基, 卤炔羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 卤烯基氨基羰基, 卤炔基氨基羰基, 卤烷氧基羧氨基, 卤烷基胺羧氨基, 氰基, 硝基, 芳基烷氧基烷氧基或烷氧基烷氧基烷氧基;

R<sup>6</sup> 为 OR<sup>12</sup>, 烷硫基, 烷基磺酰基, 氰基, 氰氧基, 氰硫基或卤素;

R<sup>7</sup> 为氢, 烷基, 环烷基, 烷氧基, 烷氧基烷基, 烷羰基, 烷氧羰基, 烷硫基或苯基, 或

两个键结至同一个碳原子的 R<sup>7</sup> 基团形成选自 OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O 及 OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O 的桥链, 该桥链可任选地为一至四个甲基所取代, 或两个键结至直接相邻碳原子的 R<sup>7</sup> 基团形成一个键, 或与它们所键结的碳原子形成 3-至 6-元环, 该环可任选地为一或多个相同或不同的选自卤素、烷基、烷硫基及烷氧基的基团所取代;





- $R^8$  和  $R^9$  各自独立地为烷基, 烯基, 炔基, 卤烷基, 可任选经取代的芳基或可任选经取代的芳烷基;
- $R^{12}$  为氢, 卤烷基, 烷氧烷基, 甲酰基, 烷羰基, 烷氧羰基, 烷基磺酰基, 卤烷基磺酰基, 苯甲酰基或苯基磺酰基, 前述最后两种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自烷基、卤烷基、烷氧基、卤烷氧基、卤素、氟基及硝基的基团所取代;
- L 为  $C_1-C_6$ -亚烷基链, 其可任选地为一至四个相同或不同的  $R^2$  基团所取代;
- Y 为选自 O、N-H、N-烷基、 $CHR^7$  及  $C(R^7)_2$  的二价单元;
- Z 为直接键, 或选自 O、S、 $SO_2$ 、N-烷基、 $CHR^7$  及  $C(R^7)_2$  的二价单元;
- 且
- w 为 0, 1, 2 或 3.

特别理想的式(I)化合物为其中

- $R^1$  为卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷硫基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯硫基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔硫基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氨基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氨基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氨基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基磺酰基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯基磺酰基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔基磺酰基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基亚磺酰基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯基亚磺酰基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔基亚磺酰基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷羰基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯羰基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔羰基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧羰基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧羰基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧羰基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基氨基羰基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯基氨基羰基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔基氨基羰基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷基羰氨基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯基羰氨基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔基羰氨基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷氧基羰氨基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯氧基羰氨基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔氧基羰氨基, 卤代- $(C_1-C_6)$ -烷羰氧基, 卤代- $(C_2-C_6)$ -烯羰氧基, 卤代- $(C_3-C_6)$ -炔羰氧基,

卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基羰氧基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基羰氧基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基羰氧基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基胺羰氧基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基胺羰氧基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基胺羰氧基, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-R<sup>2a</sup>, -P(=O)R<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, -P(=O)OR<sup>10</sup>R<sup>8</sup>, -P(=O)OR<sup>10</sup>OR<sup>11</sup>, 2-四氢呋喃基氧基甲基, 3-四氢呋喃基氧基甲基, 2-四氢噻吩基氧基甲基, 3-四氢噻吩基氧基甲基, 2-四氢吡喃基氧基甲基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烯氧基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烯基-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烯基-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基, 前述最后 15 种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自下列的基团所取代: 氢, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基亚磺酰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基亚磺酰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基磺酰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基羰氧基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰氧基, 卤素, 硝基及氰基。

同样特别理想的式(I)化合物为其中

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>和 R<sup>4</sup> 各自独立地为氢, 烷基, 烯基, 炔基, 环烷基, 环烯基, 环烷基烷基, 羟基, 烷氧基, 环烷氧基, 烷硫基, 氨基, 单或二烷基氨基, 环烷基氨基, 烷基磺酰基, 烷基亚磺酰基, 氨基磺酰基, 单或二烷基氨基磺酰基, 烷基磺酰氧基, 环烷基磺酰氧基, 烷羰基, 环烷基羰基, 烷氧羰基, 烷羰氧基, 氨羰基, 单或二烷基氨羰基, 烷氧基羰氧基, 环烷氧基羰氧基, 烷氧羰基氨基, 甲酰基, 卤素, 卤烷基, 卤烯基, 卤炔基, 卤烷氧基, 卤烯氧基, 卤炔氧基, 卤烷硫基, 卤烯硫基, 卤炔硫基, 卤烷氨基, 卤烯氨

基, 卤炔氨基, 卤烷基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 卤炔基磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 卤烷羰基, 卤烷氧羰基, 卤烯氧羰基, 卤炔氧羰基, 卤烷基氨基羰基, 氰基或硝基;

R<sup>5</sup> 为氢;

R<sup>6</sup> 为 OR<sup>12</sup> 或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基硫基;

R<sup>7</sup> 为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基或苯基;

R<sup>8</sup> 和 R<sup>9</sup> 各自独立地为 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-烯基, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-炔基, 卤代-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, 芳基或苄基;

R<sup>12</sup> 为氢, 卤代-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷羰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧羰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰基, 苯甲酰基或苯基磺酰基, 前述最后两种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、卤代-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基、卤代-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基、卤素、氰基及硝基的基团所取代;

L 为 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-亚烷基链, 其可任选地为一至四个相同或不同的 R<sup>2</sup> 基团所取代;

Y 为选自 N-烷基、CHR<sup>7</sup> 及 C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub> 的二价单元; 且

Z 为直接键, 或选自 CHR<sup>7</sup> 及 C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub> 的二价单元。

尤为理想的式(I)化合物为其中

R<sup>1</sup> 为卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯硫基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔硫基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氨基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氨基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氨基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基磺酰基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基磺酰基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基磺酰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基亚磺酰基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基亚磺酰基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基亚磺酰基, 卤代-

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基氨基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基氨基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基氨基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基羰基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基羰基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基羰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基羰基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基羰基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基羰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷羰基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯羰基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔羰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基羰基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基羰基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基羰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基胺羰基, 卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基胺羰基, 卤代-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基胺羰基或-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-R<sup>2a</sup>;

R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> 各自独立地为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷硫基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基亚磺酰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基亚磺酰基, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰基, 卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基磺酰基, 卤素, 硝基或氰基;

R<sup>4</sup> 为氢;

R<sup>6</sup> 为 OR<sup>12</sup>;

R<sup>7</sup> 为氢或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基;

R<sup>12</sup> 为氢, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基磺酰基, 苯甲酰基或苯基磺酰基, 前述最后两种基团可任选地为一或多个相同或不同的选自 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基、卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、卤素、氰基及硝基的基团所取代;

L 为 CH<sub>2</sub>, 其可任选地为一或两个相同或不同的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷氧基所取代;

Y 和 Z 各自独立地为 CHR<sup>7</sup> 或 C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>;

v 为 1; 且

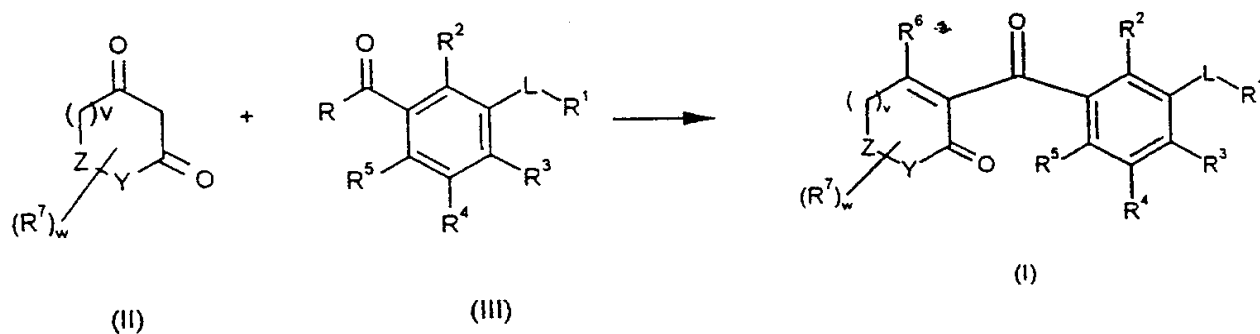
w 为 0, 1 或 2.

在后述所有的通式中, 取代基及代号若没有另外指定的定义则具有和式 (I) 中所述相同的定义。

取决于取代基的定义, 本发明化合物可例如依照下文反应流程中所示的一或多种方法制备。

本发明的式 (I) 化合物可如反应流程 1 中所示, 经由式 (II) 化合物与其中 R 为羟基、氯、溴或氰基的式 (III) 化合物反应而制得。在此反应中, 若 R 为羟基, 则式 (II) 化合物系在脱水剂 (诸如 DCC) 存在下与 (III) 化合物反应; 若 R 为氯或溴, 则在碱催化的条件下以及氰化物来源存在下进行反应; 若 R 为氰基, 则在碱催化的条件下直接与式 (III) 化合物反应。这些方法可参见, 例如, EP-A 0 369 803 及 EP-B 0 283 261。

### 反应流程 1:



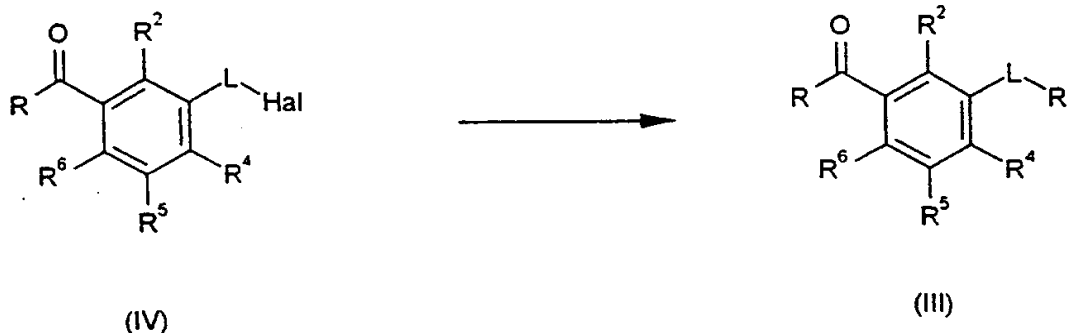
式 (II) 的二羰基化合物均为可由商业市场取得者或可依已知方法制备者。此类已知方法可见于, 例如, EP-A 0 283 261, 四面体通讯 (Tetrahedron Lett.) 32, 3063 (1991), 有机化学杂志 (J. Org. Chem.) 42, 2718, (1977), 瑞士化学学报 (Helv. Chim. Acta.) 75, 2265 (1992), Tetrahedron Lett. 28, 551 (1987), Tetrahedron Lett. 32, 6011 (1991), 化学通讯 (Chem. Lett.) 551, 1981, 杂环化合物 (Heterocycles) 26, 2611 (1987)。

上述式 (III) 化合物可依已知方法由其中 R 为羟基或烷氧基的式

(III)化合物制得。

其中  $R^1$  为烷氧基的式(III)化合物可, 例如, 依反应流程 2 所示, 由其中 Hal 为卤素的式(IV)化合物制得。

反应流程 2:

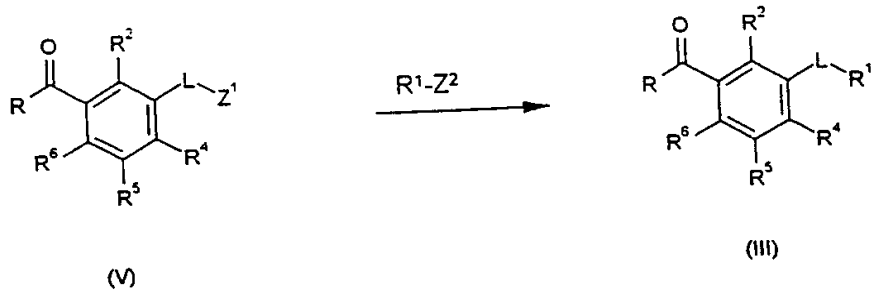


2.1 式(III)化合物可通过利用  $R^1-H$  化合物(诸如醇类、硫醇类、酰胺类、胺类、杂芳族化合物、杂环类化合物)所进行的碱催化反应而制得。此类反应可见于, 例如, J. C. Chem. Res., Synop. 1994, 174, Tetrahedron Lett. 27, 279 (1986), J. Org. Chem. 55, 6037, (1990), J. Org. Chem. 54, 3757, (1989)。

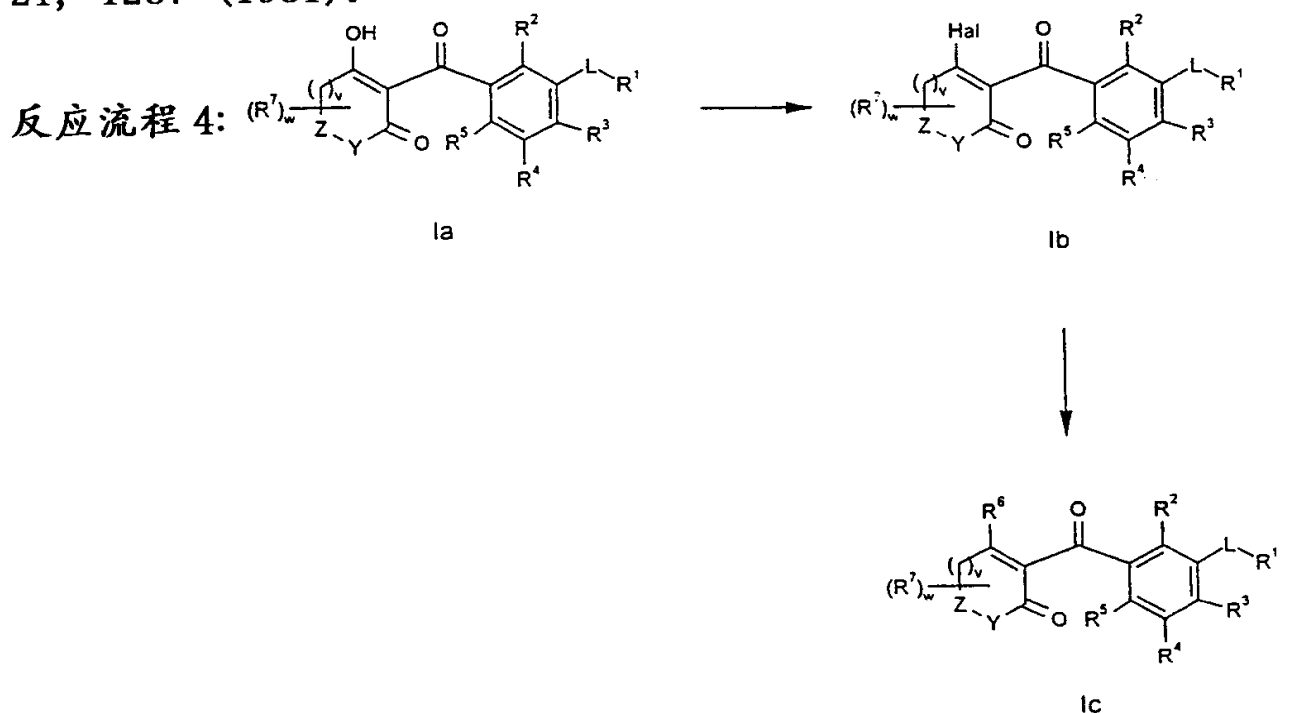
2.2 式(III)化合物也可通过利用通式为  $R^1-Li$  的有机锂化合物的反应而制得。此类反应可见于, 例如, 合成通讯(Synth. Commun.) 18, 1035, (1988), J. Org. Chem. 46, 3132, (1981)。

式(III)化合物亦可依反应流程 3 制备如下, 即令式(V)化合物(其中  $Z^1$  为 OH, SH, NH-烷基, NH-芳基或 NH-杂芳基)与可由商业市场取得或可依已知方法制得的通式为  $R^1-Z^2$  的化合物(其中  $Z^2$  为离去基, 诸如卤素, 苯氧基或烷基磺酰基)进行碱催化反应。此类反应可见于, 例如, 合成(Synthesis) 1980, 573, Tetrahedron Lett. 37, 4065 (1996)。

反应流程 3:



如反应流程 4 中所示, 式 (Ia) 化合物与卤化剂 (诸如草酰氯或草酰溴) 反应形成本发明式 (Ib) 化合物, 而该式 (Ib) 化合物 (视情况在碱催化下) 与亲核试剂 (诸如碱金属氰化物, 碱金属氰酸盐, 碱金属硫代氰酸盐, 烷基硫醇及苯硫酚) 反应, 则可进一步形成本发明式 (Ic) 化合物 (其中  $R^6$  为烷基磺基, 卤烷基磺基, 烯磺基, 卤烯磺基, 炔磺基, 卤炔磺基, 氰基, 氰氧基, 氰磺基或  $OR^{12}$ )。此类反应可见于, 例如, *Synthesis* 12, 1287 (1992)。利用氧化剂 (诸如过氧乙酸, 过氧化氢, 间-氯过氧苯甲酸及过氧单硫酸钾) 进行反应, 可制得其中  $R^6$  为烷基亚磺酰基, 卤烷基亚磺酰基, 烯基亚磺酰基, 卤烯基亚磺酰基, 炔基亚磺酰基, 卤炔基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 卤烷基磺酰基, 烯基磺酰基, 卤烯基磺酰基, 炔基磺酰基或卤炔基磺酰基的本发明式 (Ic) 化合物。此类反应可见于, 例如, *J. Org. Chem.* 53, 532, (1988), *Tetrahedron Lett.* 21, 1287 (1981)。



本发明式(I)化合物具有对抗广范围的经济上极为重要的单及双子叶有害植物的优异除草活性。此类活性物质也可有效作用于难以控制的由根茎、块根或其他多年生器官发芽的多年生杂草。在本发明中，这些物质是否在播种前、出苗前或出苗后施加并不重要。下文经由例示的方式提出可为本发明化合物控制的某些代表性单及双子叶杂草植物，但并不因提出这些植物而使本发明范围仅限于某些物种。

在单子叶杂草类方面，本发明活性物质可有效作用者为，例如，属于一年生的燕麦、毒麦、看麦娘、草、稗、马唐、狗尾草及莎草属，在多年生植物类方面，则有冰草、狗牙根、白茅及高粱属，还有多年生的莎草属。

在双子叶杂草类的情况中，作用范围包括下列物种，例如，一年生的猪殃殃、董菜、婆婆纳、野芝麻、繁缕、苋、芥、牵牛、母菊、苘麻及黄花稔属，以及多年生的旋花、蓟、酸模及蒿属。

在特定耕种条件下发生于稻米中的有害植物，例如，稗、慈菇、泽泻、针蔺、草及莎草属等，也同样地可通过本发明的活性物质予以极佳地控制。

若将本发明化合物在发芽前施加于土壤表面，则可完全防止杂草苗的出土，或是该杂草会生长至子叶期，但接着停止生长并最后在三至四星期后完全死净。

当将本发明活性物质施加于植物出土后的绿色部份上时，同样会在处理后极短的时间内发生彻底的生长停止，而且该杂草植物会停滞在施药当时的生长期，或是在一段时间后完全死净，因此通过这种方式，对有害于农作物的杂草竞争，可及早消除并以持续的方式消除。

虽然本发明化合物具有对抗单及双子叶杂草的极佳除草活性，但对于经济上重要的农作物例如小麦、大麦、黑麦、稻米、玉米、甜菜、棉树及大豆等，则只会受到无关重要的损害或完全无损。因此，本发明化合物极适用于选择性地控制在农作物或装饰用植物的种植方面所



不要的植物生长。

由于它们的除草及植物生长调节性质，本发明活性物质也可用于在已知经基因改良的植物或待发展的经基因改良植物中控制有害植物。通常，转基因的植物会具有特别有利的性质，例如对某些杀虫剂、尤其是某些除草剂的抵抗性，对植物疾病或植物疾病病原(诸如某些昆虫或微生物诸如霉菌、细菌或病毒)的抵抗性。其他特别的性质系关于，例如，收割作物的产量、品质、储藏性、组成及特定成份方面。因此，现今已知具有淀粉含量增加或淀粉品质改变的转基因植物，或其收割作物具有不同脂肪酸组成的转基因植物。

本发明式(I)化合物或其盐类优选用于经济上重要的有用及装饰用植物的转基因作物，例如，谷类诸如小麦、大麦、黑麦、燕麦、粟、稻米、木薯及玉米，或作物如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、蕃茄、豌豆及其他蔬果类。

较为理想的是，式(I)化合物可在对除草剂的植物毒性作用具有抵抗性或已经基因改良为具抵抗性的有用作物中作为除草剂。

与现存植物相比具有经改良特性的新颖植物的惯用产生方式系为，例如，惯用的栽培方法以及产生突变种。或是，可利用基因工程的程序来产生具有经改良特性的新颖植物(请参见，例如，EP-A-0221044，EP-A-0131624)。举例而言，许多专利申请已述及

- 为改良植物中合成淀粉的目的所进行的作物基因工程改良(如 WO 92/11376，WO 92/14827，WO 91/19806)，
- 对某些草铵膦型除草剂(请参见，例如，EP-A-0242236，EP-A-242246)或草甘膦型除草剂(WO 92/00377)或磺酰脲型除草剂(EP-A-0257993，US-A-5013659)具有抵抗性的转基因作物，
- 具有苏云金芽孢杆菌毒素(Bt 毒素)制造能力(该能力可使植物对某些害虫具有抵抗力)的转基因作物，如棉花(EP-A-0142924，EP-A-0193259)，
- 具有经改变的脂肪酸组成的转基因作物(WO 91/13972)。

许多可用以制造具有改良性质的新颖转基因植物的分子生物学技

术原则上是已知的；请参见，例如，Sambrook 等，1989, *Molecular Cloning*[分子克隆], A Laboratory Manual, 2<sup>nd</sup> Ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; 或 Winnacker “Gene und Klone” [基因与克隆], VCH Weinheim 2<sup>nd</sup> Edition 1996 或 Christou “Trends in Plant Science” [植物科学趋势]1 (1996) 423-431.

在此类基因工程操作中，可将核酸分子导入质体中，通过 DNA 序列的重组而诱发基因突变或进行序列的改变。通过上述标准程序，便可例如进行碱基交换以移除部分序列或加入天然或合成序列。若要相互连接 DNA 片段，可将连接物或衔接物接在这些片段上。

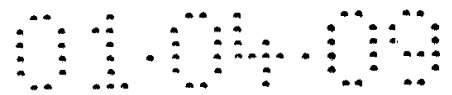
例如，具有经降低活性基因产物的植物细胞可制备如下，即表达至少一种相应的反义 RNA 及有义 RNA 来达成共抑制作用，或表达至少一种经适当建构的核糖酶，该核糖酶可特异地裂解上述基因产物的转录本。

就此目的而言，一方面可使用包含基因产物整个编码序列(包括可能存在的侧序列)的 DNA 分子，另一方面也可使用仅包含部份编码序列的 DNA 分子，但这些部份序列必须长到足以在细胞中产生反义作用。也可使用和基因产物的编码序列具有高度同源性但不是完全相同的 DNA 序列。

当核酸分子表达于植物中时，合成蛋白质可定位于植物细胞中任何所需的区域上。然而，为了达成在某一区域上的定位，可例如将编码区与可确保某一区域的定位作用的 DNA 序列联结。此类序列已为本领域技术人员所知(请参见，例如，Braun 等，EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter 等，Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald 等，植物杂志 ( Plant J. ) 1 (1991), 95-106)。

转基因的植物细胞可依已知技术予以再生成整株植物。原则上，转基因的植物可以是任何所需的植物物种，亦即单子叶及双子叶植物均可。

因此可获得因同源(=天然)基因或基因序列的过度表达、抑制或抑



止作用或是异源(=外来)基因或基因序列的表达作用而具有改良性质的转基因植物。

较为理想的是, 本发明化合物可用于对选自下列的除草剂具有抵抗性的转基因作物: 磺酰脲、草铵膦-铵或草甘膦-异丙铵以及类似的活性物质。

当本发明的活性物质用于转基因的作物时, 除了在其他作物中亦可观察到的对有害植物的作用之外, 在施用于特定的转基因作物时所特有的作用也常会发生, 例如, 可控制的杂草种类范围改变或特别广泛, 可用的施用量改变, 与该转基因作物对其具有抵抗性的除草剂有优选的组合能力, 以及在该转基因作物的生长及产量方面的作用。

本发明因此亦关于将本发明化合物用作控制转基因作物中的有害植物的除草剂。

本发明的物质也对农作物具有极佳的生长调节特性。它们会以调节的方式介入植物本身的新陈代谢作用, 因此可用于以特定方式影响植物组成份, 以及用于促进收获, 例如使植物干燥脱水和阻碍其生长等。此外, 它们也适用于整体控制和抑制不要的植物生长, 同时不会摧毁该植物。对许多单子叶及双子叶农作物而言, 植物生长的抑制相当重要, 因为如此可减少或完全防止倒伏现象。

本发明化合物可用于下列形式的惯用制剂中: 可湿粉末、可乳化浓缩物、喷洒溶液、粉尘剂或粒剂。本发明因此也关于含有式(I)化合物的除草用及植物生长调节用组合物。

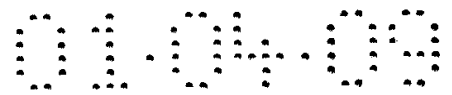
取决于预定的生物及/或物化参数, 式(I)化合物可以多种方式调配。可能的适当配剂有, 例如: 可湿粉末(WP), 水溶性粉末(SP), 水溶性浓缩物, 可乳化浓缩物(EC), 乳化液(EW)诸如水包油型和油包水型乳化液, 喷洒用溶液, 悬浮液浓缩物(SC), 油基或水基分散液, 油可混溶的溶液, 胶囊悬浮体(CS), 粉尘剂(DP), 拌种剂, 用于撒播及土壤施用的粒剂, 微粒型粒剂(GR), 喷洒用粒剂, 经涂覆粒剂和吸附粒剂, 水分散性粒剂(WG), 水溶性粒剂(SG), ULV 配剂, 微胶囊及蜡剂。

这些配剂类型原则上是已知的，且已述于，例如，下列文献中：Winnacker-Kuechler, “Chemische Technologie”, [化学工艺], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4<sup>th</sup> Edition 1986, Wade van Valkenburg, “Pesticide Formulations” [农药配剂], Marcel Dekker, N. Y., 1973; K. Martens, “Spray Drying” Handbook [喷雾干燥手册], 3<sup>rd</sup> Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

所需的调配助剂诸如惰性物质，表面活性剂，溶剂及其他添加剂等同样也是已知的，且已述于，例如，下列文献中：Watkins, “Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers” [杀虫粉剂稀释剂和载体], 2<sup>nd</sup> Ed., Darland Books, Caldwell N. J., H. v. Olphen, “Introduction to Clay Colloid Chemistry”; 2<sup>nd</sup> Ed., J. Wiley & Sons, N. Y.; C. Marsden, “Solvents Guide [溶剂指南]”; 2<sup>nd</sup> Ed., Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's “Detergents and Emulsifiers Annual” [洗涤剂 and 乳化剂年鉴], MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, “Encyclopedia of Surface Active Agents”, Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964; Schoenfeldt, “Grenzflaechenaktive Aethylenoxidaddukte” [表面活性环氧乙烷加合物], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Kuechler, “Chemische Technologie”, Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4<sup>th</sup> Edition. 1986.

此外也可以这些配剂作为基础，而制备与其他农药物质(例如杀虫剂、杀螨剂、除草剂及杀真菌剂)，以及与安全剂、肥料及/或生长调节剂所组成的组合物，例如以现用型的配剂形式或成桶装待混合形式制备。

可湿粉末系为可均匀分散于水中的制剂，其除了活性化合物及稀释剂或惰性物质之外，亦含有离子型及/或非离子型表面活性剂(润湿剂、分散剂)，如聚氧乙烯化烷基酚类，聚氧乙烯化脂肪族醇类，聚氧乙烯化脂肪族胺类，脂肪族醇聚乙二醇醚硫酸盐类，烷磺酸盐类，烷基苯磺酸盐类，木质磺酸钠，2,2' -二萘基甲烷-6,6' -二磺酸钠，



二丁基萘磺酸钠或油酰甲基牛磺酸钠。为制备可湿粉末，需将除草活性物质磨碎，例如在惯用设备如锤磨机、吹磨机及喷气磨机中予以磨碎，并同时或随后与调配助剂混合。

可乳化浓缩物的制法如下，即将活性物质溶于有机溶剂中(例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或是沸点相当高的芳族化合物或烃类或这些有机溶剂的混合物)，并加入一或多种离子型及/或非离子型表面活性剂(乳化剂)。可使用的乳化剂有，例如：烷基芳基磺酸钙诸如十二烷基苯磺酸钙，或非离子性乳化剂诸如脂肪酸聚乙二醇酯类、烷基芳基聚乙二醇醚类、脂肪族醇聚乙二醇醚类、氧化丙烯-氧化乙烯缩合物、烷基聚醚类，脱水山梨糖醇酯类例如脱水山梨糖醇脂肪酸酯类，或聚氧乙烯脱水山梨糖醇酯类例如聚氧乙烯脱水山梨糖醇脂肪酸酯类。

粉尘剂系经由以细碎的固体物质(例如滑石、天然粘土诸如高岭土、皂土及叶蜡石，或硅藻土)碾磨活性物质而制得。

悬浮液浓缩物可以水或油为底质。其制备方法可为，例如，利用市售的珠磨机进行湿式碾磨而得，若需要，可加入表面活性剂，例如前述提及的用于其他类型的配剂中者。

乳化液如水包油型乳化液(EW)，举例而言，可通过搅拌器、胶体磨及/或静态混合器，利用含水有机溶剂而制得，若需要，可加入表面活性剂，例如前述提及的用于其他类型的配剂中者。

粒剂可通过将活性物质喷在吸附性粒状惰性物质上，或利用粘合剂(如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿油类)将活性物质浓缩物施加在载体(诸如砂、高岭土)或粒状惰性物质表面上而制得。若需要与肥料制成混合物，也可通过惯用于制备肥料粒剂的方式将适当的活性物质粒化。

水分散性粒剂通常以下列惯用方法制备，诸如：喷雾干燥、流化床粒化、盘式粒化、使用高速混合器予以混合以及在无固体惰性物质存在下的挤出。

有关盘、流化床、挤出机及喷雾颗粒的制备，可参见例如下述文

献中所记载的方法：“Spray-Drying Handbook” [喷雾干燥手册] 3<sup>rd</sup> ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering [附聚, 化学及工程] 1967, 147 页 ff; “Perry’s Chemical Engineer’s Handbook” [佩雷化学工程师手册], 5<sup>th</sup> Ed., McGraw-Hill, New York 1973, 8-57 页。

有关植物保护剂的调配详情, 可参见例如 G.C. Klingman, “Weed Control as a Science” [杂草控制科学], John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 81-96 页及 J.D. Freyer, S.A. Evans, “Weed Control Handbook” [杂草控制手册], 5<sup>th</sup> Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 101-103 页。

这些农业化学制剂通常含有 0.1 至 99 重量% (尤其是 0.1 至 95 重量%) 的式 (I) 活性物质。在可湿粉末中, 活性物质浓度为例如约 10 至 90 重量%, 达至 100 重量% 所需的余量则为惯用的调配组份。在可乳化浓缩物的情况中, 活性物质浓度可为约 1 至 90 重量%, 优选为 5 至 80 重量%。粉尘形式的配剂含有 1 至 30 重量% 的活性物质, 优选为通常 5 至 20 重量% 的活性物质, 喷洒用溶液含有约 0.05 至 80, 优选为 2 至 50 重量% 的活性物质。在水分散性粒剂的情况中, 活性物质含量系部份取决于活性化合物是液体还是固体以及使用何种粒化助剂、填料等等。在水分散性粒剂的情况中, 活性物质的含量, 举例而言, 可在 1 至 95 重量%, 优选为 10 至 80 重量% 之间。

此外, 这些活性物质的配剂, 视情况需要, 也可含有在各情况中惯用的粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂和溶剂、填料、载体和着色剂、消泡剂、蒸发抑制剂以及 pH 和粘度调节剂。

在混合型配剂或桶装混合物中, 可与本发明活性物质组合的成份为, 例如, 已知的活性物质诸如那些述于下示文献中以及其中所引用的文献中者: Weed Research [杂草研究] 26, 441-445 (1986), 或 “The Pesticide Manual” [农药手册], 11<sup>th</sup> edition, The British Crop

Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1997. 可与式(I)化合物组合的已知除草剂,可提及的有,例如,下列活性物质(请注意:这些化合物系以国际标准化组织(ISO)所定的俗名或以其化学名称表示,若情况适用,亦标明其惯用代码):

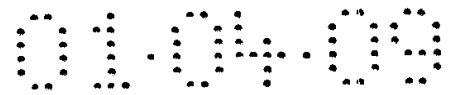
乙草胺;三氟羧草醚;苯草醚;氟草醚,即[[[1-[5-[2-氟-4-(三氟甲基)-苯氧基]-2-硝基苯基]-2-甲氧基亚乙基]氨基]氧基]乙酸及其甲酯;甲草胺;禾草灭;莠灭净;酰嘧磺隆;杀草强;AMS,即氨基磺酸铵;莎稗磷;磺草灵;莠去津;四唑嘧磺隆(DPX-A8947);aziprotryne;燕麦灵;BAS 516H,即5-氟-2-苯基-4H-3,1-苯并噁嗪-4-酮;草除灵;乙丁氟灵;吡草黄;苄嘧磺隆甲酯;地散磷;灭草松;吡草酮;benzofluor;新燕灵乙酯;苯噻隆;双丙氧磷;甲羧除草醚;除草定;溴丁酰草胺;溴酚脞;溴苯脞;bromuron;buminafos;busoxinone;丁草胺;抑草磷;丁烯草胺;buthidazole;仲丁灵;丁草敌;cafenstrole(CH-900);双酰草胺;cafentrazone(ICI-A0051);CDAA,即2-氟-N,N-二-2-丙烯基乙酰胺;CDEC,即二乙基二硫代氨基甲酸2-氟烯丙酯;甲氧除草醚;草灭畏;chlorazifop-butyl;chlormesulon(ICI-A0051);氟溴隆;氟炔灵;chlorfenac;整形醇甲酯;氟草敏;氟嘧磺隆乙酯;草枯醚;chlorotoluron;枯草隆;氟苯胺灵;氟磺隆;氟酞酸二甲酯;氟硫酰草胺;环庚草醚;醚磺隆;烯草酮;clodinafop及其酯衍生物(如clodinafop-炔丙酯);异噁草松;氟甲酰草胺;cloproxydim;二氟吡啶酸;cumyluron(JC 940);氟草津;环草敌;环丙嘧磺隆(AC 104);噻草酮;环莠隆;氟氟草酯及其酯衍生物(如丁酯,DEH-112);cyperquat;环丙津;cyprazole;daimuron;2,4-DB;茅草枯;甜菜安;敌草净;燕麦敌;麦草畏;敌草脞;2,4-滴丙酸;diclofop及其酯类诸如禾草灵;乙酰甲草胺;枯莠隆;野燕枯;吡氟酰草胺;唑隆;二甲草胺;异戊净;二甲吩草胺(SAN-582H);dimethazone;异噁草松,噻节因;dimetrasulfuron;氟氟灵;地乐酚;特乐酚;双苯酰草胺;异丙净;敌草炔;氟硫草定;敌草隆;DNOC;

eglinazine-ethyl; EL 77, 即 5-氟基-1-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺; 茵多酸; EPTC; 戊草丹; 乙丁烯氟灵; 胺苯磺隆甲酯; 磺噻隆; 乙嗪草酮; 乙氧唑草黄; F5231, 即 N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧代-1H-四唑-1-基]苯基]乙磺酰胺; ethoxyfen 及其酯类(如乙酯, HN-252); etobenzanid (HW 52); 2,4,5-涕丙酸; fenoxan; 噁唑禾草灵和精噁唑禾草灵及其酯类, 如精噁唑禾草灵乙酯及噁唑禾草灵乙酯; fenoxymid; 非草隆; 麦草氟甲酯; 啶嘧磺隆; 吡氟禾草灵和精吡氟禾草灵及其酯类, 如吡氟禾草灵丁酯及精吡氟禾草灵丁酯; 氟乙氟灵; 唑嘧磺草胺; 氟草隆; 氟烯草酸及其酯类(如戊酯, S-23031); 丙炔氟草胺(S-482); flumipropyn; 氟胺草唑(KNW-739); 三氟硝草醚; 乙羧氟草醚; flupropacil (UBIC-4243); 氟啶草酮; 氟咯草酮; 氟氯吡氧乙酸; 唑草酮; 氟磺胺草醚; 杀木膦; 氟氧草醚; 草铵膦; 草甘膦; halosafen; 氟吡嘧磺隆及其酯类(如甲酯, NC-319); 氟吡禾灵及其酯类, 精氟吡禾灵(=R-氟吡禾灵)及其酯类; 环嗪酮; 咪草酸甲酯; 咪唑烟酸; 咪唑喹啉酸及其盐类诸如铵盐; imazethamethapyr; 咪唑乙烟酸; 唑吡嘧磺隆; 碘苯腈; 丁咪酰胺; 异丙禾灵; 异丙隆; 异噁隆; 异噁酰草胺; 异噁草醚; 特胺灵; 乳氟禾草灵; 环草定; 利谷隆; MCPA; MCPB; 2甲4氯丙酸; 苯噻酰草胺; 氟磺酰草胺; 苯嗪草酮; 吡唑草胺; 甲基苯噻隆; metham; 灭草唑; 苯草酮; 甲基杀草隆; 吡喃隆; methobenzuron; 溴苯隆; 异丙甲草胺; 磺草唑胺(XRD 511); 甲氧隆; 灭必净; 甲磺隆甲酯; MH; 禾草敌; 庚酰草胺; 单脲二硫酸氢盐(monocarbamide; dihydrogensulfate); 绿谷隆; 灭草隆; MT 128, 即 6-氯-N-(3-氯-2-丙烯基)-5-甲基-N-苯基-3-吡嗪胺; MT 5950, 即 N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺; 萘丙胺; 敌草胺; 萘草胺; NC 310, 即 4-(2,4-二氯苯甲酰)-1-甲基-5-苯甲氧基吡唑; 草不隆; 烟嘧磺隆; 氟氯草胺; 甲磺乐灵; 除草醚; nitrofluorfen; 氟草敏; 坪草丹; 氟磺乐灵; oxadiargyl (RP-020630); 噁草酮; 乙氧氟草醚; 百草枯; 克



草敌; 二甲戊灵; perfluidone; 棉胺宁; 敌草宁; 氯氯吡啶酸; 吡草磷; piributicarb; pirifenop-butyl; 丙草胺; 氯嘧磺隆甲酯; procyazine; 氯乐灵; 环丙氯灵; 甘扑津乙酯; 扑灭通; 扑灭净; 毒草胺; 敌稗; 噁草酸及其酯类; 扑灭津; 苯胺灵; 异丙草胺; 炔苯酰草胺; prosulfalin; 苄草丹; 氯磺隆 (CGA-152005); 丙炔草胺; pyrazolate; pyrazon; 吡嘧磺隆; 苄草唑; 吡草特; pyriothiobac (KIH-2031); pyroxofop 及其酯类 (如炔丙酯); 二氯喹啉酸; 氯甲喹啉酸; quinofop 及其酯衍生物; 喹禾灵和精喹禾灵以及它们的酯衍生物, 如喹禾灵乙酯; 精喹禾灵-tefuryl 及-乙酯; renriduron; 砒嘧磺隆 (DPX-E 9636); S 275, 即 2-[4-氯-2-氟-5-(2-丙炔氧基)苯基-4,5,6,7-四氢-2H-吡啶]; secbumeton; 稀禾定; 环草隆; 西玛津; 西草净; SN 106279, 即 2-[ [7-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-萘基]氧基]丙酸及其甲酯; 甲磺草胺 (FMC-97285, F-6285); sulfazuron; 甲嘧磺隆甲酯; sulfosate (ICI-A0224); TCA; 牧草胺 (GCP-5544); 丁噻隆; 特草定; 特草灵; 特丁草胺; terbumeton; 特丁津; 特丁净; TFH 450, 即 N,N-二乙基-3-[ (2-乙基-6-甲基苯基)磺酰]-1H-1,2,4-三唑-1-羧酰胺; 噻吩草胺 (NSK-850); thiazafluron; 噻唑烟酸 (Mon-13200); thidiazimin (SN-24085); 噻吩磺隆甲酯; 禾草丹; 仲草丹; 三甲苯草酮; 野麦畏; 醚苯磺隆; triazofenamide; 苯磺隆甲酯; 三氯吡氧乙酸; 灭草环; 草达津; 氯乐灵; 氯胺磺隆及酯类 (如甲酯, DPX-66037); trimeturon; tsitodef; 灭草敌; WL 110547, 即 5-苯氧基-1-[3-(三氟甲基)苯基]-1H-四唑; UBH-509; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 及 KIH-2023.

在使用上, 以市售形式存在的配剂可视需要以惯用方式予以稀释, 例如, 在可湿粉末、可乳化浓缩物、分散液及水分散性粒剂的情



况中，可以水稀释。成粉尘、土壤或撒播粒剂及喷洒用溶液形式的制剂，一般并不在使用前以其他惰性物质作进一步的稀释。

式(I)化合物所需的施用量依外在条件诸如温度、湿度、所用除草剂的类型等等而变。其可在广范围内变化，例如，可施加 0.001 至 10.0 公斤/公顷的活性物质，优选为 0.005 至 5 公斤/公顷。

下文中以实施例例示本发明。

## A. 化学实施例

### 1. 2-(2-氯-3-环己基氧基甲基-4-甲基磺酰基-苯甲酰基)

#### 环己烷-1,3-二酮的制备

#### 步骤 1: 2-氯-6-甲硫基甲苯

将 200 克 (1.24 摩尔) 的 2,6-二氯甲苯溶于 600 毫升六甲基磷酰三胺中，并以 130.41 克 (1.86 摩尔) 硫代甲醇钠处理之。然后于 100 °C 下加热该混合物 3 小时。令其静置冷却，加入 88.2 克 (0.5 摩尔) 的碘甲烷，并于室温下予以搅拌 0.5 小时。然后将该混合物加入 3.5 升水中，并以乙酸乙酯萃取之。混合有机相并以水清洗之，以  $\text{MgSO}_4$  加以干燥，并在旋转蒸发器上予以完全浓缩。

产量: 208.85 克 (理论产率的 97%)，黄色油

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.4 (s,3H), 2.42 (s,3H), 7.0-7.18 (m,3H)

#### 步骤 2: 2-氯-3-甲基-4-甲硫基苯乙酮

将在 200 毫升 1,2-二氯乙烷中的 47.36 克 (0.60 摩尔) 乙酰氯，于 15-20 °C 下滴入 90.79 克 (0.68 摩尔) 氯化铝在 200 毫升 1,2-二氯乙烷中所成的悬浮液中。然后将 103.14 克 (0.60 摩尔) 2-氯-6-甲硫基甲苯在 400 毫升 1,2-二氯乙烷中所成的溶液滴入其中。于室温下搅拌该反应混合物过夜，接着将其加入 1 升冰与 300 毫升浓盐酸所成的混合物中。以二氯甲烷予以萃取。混合有机相并以水清洗之，以  $\text{MgSO}_4$  加以干燥，并在旋转蒸发器上予以完全浓缩。对残余物施以



真空蒸馏处理。

产量: 111.24 克(理论产率的 87%), 无色结晶, 熔点: 45.5—46℃

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.42 (s,3H), 2.5 (s,3H), 2.6 (s,3H), 7.05 (d,1H), 7.35 (d,1H)

步骤 3: 2-氯-3-甲基-4-甲基磺酰基苯乙酮

将 223.48 克(1.04 摩尔)的 2-氯-3-甲基-4-甲基磺基苯乙酮溶于 1.8 升冰醋酸中, 并以 27.47 克(0.08 摩尔)钨酸钠处理之。然后将 203.83 克 30%浓度的过氧化氢溶液滴入其中同时予以冷却, 并于室温下搅拌该混合物 1.5 天。以 1.5 升水稀释之, 并将沉淀固体吸滤出来、以水清洗之并予干燥。

产量: 123.35 克(理论产率的 48%), 无色结晶, 熔点: 110—111℃

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.62 (s,3H), 2.8 (s,3H), 3.12 (s,3H), 7.38 (d,1H), 8.08 (d,1H)

步骤 4: 2-氯-3-甲基-4-甲基磺酰基苯甲酸

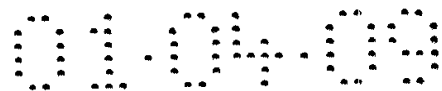
将 60 克(0.24 摩尔)的 2-氯-3-甲基-4-甲基磺酰基苯乙酮溶于 510 毫升二噁烷中, 并以 870 克 13%浓度的次氯酸钠溶液处理之。然后于 80℃下加热该混合物 1 小时。冷却后, 分离出底层相, 以水稀释之并以 HCl 予以酸化。将沉淀固体吸滤出来、以水清洗之并予干燥。

产量: 53.02 克(理论产率的 88%), 无色结晶, 熔点: 230—231℃

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{Me}_2\text{SO}-d_6$ ):  $\delta$  2.75 (s,3H), 3.3 (s,3H), 7.75 (d,1H), 7.98 (d,1H)

步骤 5: 2-氯-3-甲基-4-甲基磺酰基苯甲酸甲酯

将 53.02 克(0.21 摩尔)的 2-氯-3-甲基-4-甲基磺酰基苯甲



酸溶于 400 毫升甲醇中，并在回流温度下通入 HCl 3 小时。然后令该混合物静置冷却，并在旋转蒸发器上予以完全浓缩。

产量：54.93 克(理论产率的 98%)，无色结晶，熔点：107—108℃

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.82 (s,3H), 3.15 (s,3H), 3.98 (s,3H), 7.65 (d,1H), 8.04 (d,1H)

步骤 6: 3-溴甲基-2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酸甲酯

将 44.14 克(0.17 摩尔)的 2-氯-3-甲基-4-甲基磺酰基苯甲酸甲酯溶于 600 毫升四氯化碳中，并以 29.91 克(0.17 摩尔)N-溴琥珀酰亚胺及 0.41 克过氧化二苯甲酰处理之。然后回流加热该混合物，并以 300 瓦灯照射之。过滤该反应混合物，浓缩滤液并以乙醚吸收残余物。以正庚烷处理该溶液，将沉淀的固体吸滤出来并予干燥。

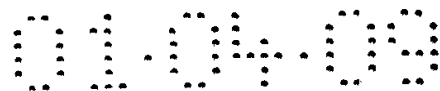
产量：38.82 克(理论产率的 67%)，无色结晶，熔点：74—75℃

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  3.35 (s,3H), 4.00 (s,3H), 5.3 (s,br, 2H), 7.8 (d,1H), 8.15 (d,1H)

步骤 7: 2-氯-3-环己基氧基甲基-4-甲基磺酰基苯甲酸

将 1.0 克(2.93 毫摩尔)的 3-溴甲基-2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酸甲酯溶于 10 毫升环己醇中，并以 0.33 克(2.93 毫摩尔)叔丁醇钾处理之。于室温下搅拌该混合物过夜，然后在旋转蒸发器上予以浓缩。将残余物溶于 16 毫升四氢呋喃及 8 毫升水中，并与 0.55 克 NaOH (13.74 毫摩尔)一起回流加热 4 小时。然后令其静置冷却，接着在旋转蒸发器上予以大幅浓缩，再以 2M HCl 处理含水残余物。然后以二氯甲烷萃取之，混合有机相，以  $\text{MgSO}_4$  干燥之，并在旋转蒸发器上予以完全浓缩。

产量：0.53 克(理论产率的 52%)，无色油，



$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.9 (m,6H), 1.3 (m,4 H), 3.3 (s,3H), 4.75 (m,1H), 5.3 (s,2H), 7.9 (d,1H), 8.1 (d,1H)

步骤 8: 2-氯-3-环己基氧基甲基-4-甲基磺酰基苯甲酸 3-氧代-1-环己烯酯

以两滴  $\text{N,N}$ -二甲基甲酰胺及在 23 毫升二氯甲烷中的 0.59 克 (4.58 毫摩尔) 草酰氯处理 0.53 克 (1.53 毫摩尔) 的 2-氯-3-环己基氧基甲基-4-甲基磺酰基苯甲酸, 并回流加热此混合物 2.5 小时。然后在旋转蒸发器上予以抽提, 以 23 毫升二氯甲烷吸收残余物, 并在  $0^\circ\text{C}$  下以 0.19 克 (1.68 毫摩尔) 环己烷二酮及 0.46 克 (4.58 毫摩尔) 三乙胺处理该混合物。在室温下予以搅拌 4 小时。然后在旋转蒸发器上予以浓缩, 并以层析法 (硅胶, 乙酸乙酯: 己烷=1:1) 纯化之。

产量: 0.1 克 (理论产率的 15%), 无色油

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.9 (m,6H), 1.3 (m,4H), 2.35 (m,2H), 2.5 (m,2H), 2.7 (m,2H), 3.35 (s,3H), 5.4 (s,br, 2H), 6.1 (s,1H), 7.95 (d,2H), 8.2 (d,2H)

步骤 9: 2-(2-氯-3-环己基氧基甲基-4-甲基磺酰基-苯甲酰基) 环己烷-1,3-二酮

将 0.10 克 (0.23 毫摩尔) 的 2-氯-3-环己基氧基甲基-4-甲基磺酰基苯甲酸 3-氧代-1-环己烯酯、1 滴丙酮合氯化氢以及 0.04 克 (0.39 毫摩尔) 三乙胺溶于 5 毫升乙腈中, 并于室温下搅拌此溶液过夜。然后在旋转蒸发器上予以浓缩, 并以 5 毫升水处理残余物, 再以 5M  $\text{HCl}$  酸化之。以乙酸乙酯萃取该混合物, 以水清洗有机相, 以  $\text{MgSO}_4$  干燥之, 并在旋转蒸发器上予以完全浓缩。

产量: 0.1 克 (理论产率的 100%), 无色油,  $R_f=0.07$  ( $\text{SiO}_2$ /乙酸乙酯)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  0.9 (m, 6H), 1.3 (m, 4H), 2.1 (m, 2H), 2.45 (m, 2H), 2.85 (m, 2H), 3.3 (s, 3H), 4.55 (s, 1H), 5.35 (s, br, 2H), 7.3 (d, 2H), 8.15 (d, 2H)

## 2. 2-(2-氯-4-甲基磺酰基-3-苯氧基甲基苯甲酰基)环己烷-1,3-二酮的制备

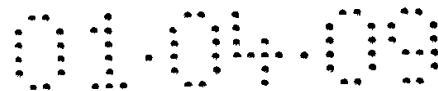
步骤 1: 2-氯-4-甲基磺酰基-3-苯氧基甲基苯甲酸

将 1.0 克 (2.93 毫摩尔) 的 3-溴甲基-2-氯-4-甲基磺酰基苯甲酸甲酯及 0.28 克 (2.93 毫摩尔) 苯酚溶于 20 毫升二甲基甲酰胺中, 并以 0.14 克 (3.51 毫摩尔) 的 60% 浓度氢氧化钠处理之。于室温下搅拌该混合物过夜, 然后在旋转蒸发器上予以高真空浓缩。将残余物溶于 16 毫升四氢呋喃及 8 毫升水中, 并将所得溶液与 0.23 克 NaOH (5.85 毫摩尔) 一起回流加热 4 小时。然后令其静置冷却, 接着在旋转蒸发器上予以大幅浓缩, 再以 2M HCl 处理含水残余物。然后以二氯甲烷萃取之, 混合有机相, 以  $\text{MgSO}_4$  干燥之, 并在旋转蒸发器上予以完全浓缩。产量: 0.67 克 (理论产率的 67%), 无色油

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{Me}_2\text{SO}-d_6$ ):  $\delta$  3.3 (s, 3H), 5.55 (s, 2H), 6.98-7.05 (m, 3H), 7.35 (m, 2H), 7.95 (d, 1H), 8.1 (d, 1H)

## 步骤 2: 2-氯-4-甲基磺酰基-3-苯氧基甲基苯甲酸 3-氧代-1-环己烯酯

以两滴 N,N-二甲基甲酰胺及在 30 毫升二氯甲烷中的 0.76 克 (5.9 毫摩尔) 草酰氯处理 0.67 克 (1.97 毫摩尔) 的 2-氯-4-甲基磺酰基-3-苯氧基甲基苯甲酸, 并回流加热此混合物 2.5 小时。然后在旋转蒸发器上予以抽提, 以 30 毫升二氯甲烷吸收残余物, 并在  $0^\circ\text{C}$  下



以 0.24 克 (2.16 毫摩尔) 环己烷二酮及 0.60 克 (5.9 毫摩尔) 三乙胺处理该混合物。在室温下予以搅拌 4 小时。然后在旋转蒸发器上予以浓缩，并以层析法 (硅胶，乙酸乙酯：己烷=1：1) 纯化之。

产量：0.51 克 (理论产率的 60%)，无色油

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.15 (m, 2H), 2.45 (m, 2H), 2.7 (m, 2H), 3.2 (s, 3H), 5.75 (s, 2H), 6.08 (s, 1H), 7.0-7.1 (m, 3H), 7.35 (m, 2H), 7.98 (d, 1H), 8.25 (d, 1H)

步骤 3: 2-(2-氯-4-甲基磺酰基-3-苯氧基甲基苯甲酰基)环己烷-1,3-二酮

将 0.51 克 (1.17 毫摩尔) 的 2-氯-4-甲基磺酰基-3-苯氧基甲基苯甲酸 3-氧代-1-环己烯酯、1 滴丙酮合氯化氢以及 0.21 克 (2.04 毫摩尔) 三乙胺溶于 20 毫升乙腈中，并于室温下搅拌此溶液过夜。然后在旋转蒸发器上予以浓缩，并以 5 毫升水处理之，再以 5M HCl 酸化之。以乙酸乙酯进行萃取，以水清洗之，以  $\text{MgSO}_4$  加以干燥，并在旋转蒸发器上予以完全浓缩。以乙酸乙酯萃取残余物，以水清洗有机相，以  $\text{MgSO}_4$  干燥之，并在旋转蒸发器上予以完全浓缩。

产量：0.5 克 (理论产率的 98%)，无色油， $R_f=0.22$  ( $\text{SiO}_2$ /乙酸乙酯)

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.08 (m, 2H), 2.45 (m, 2H), 2.85 (m, 2H), 3.2 (s, 3H), 5.7 (s, br, 2H), 7.0 (d, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 3H), 8.18 (d, 2H).

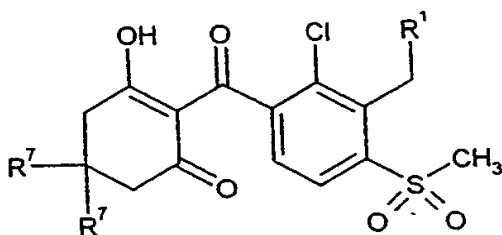
下列表中所列示的实施例化合物通过类似于前述方法的方式制得，或可通过类似于前述方法的方式予以制备。

在这些表中所用的缩略语具有下列定义：

Ac = 乙酰基    Bu = 丁基    Bz = 苯甲酰基  
 Et = 乙基    Me = 甲基    Pr = 丙基  
 c = 环    d = 双重峰    dd = 双双重峰  
 s = 单峰    m = 多重峰    t = 三重峰  
 i = 异    Fp. = 熔点

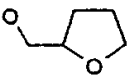
表 1: 其中的取代基及代号具有下述定义的本发明式 (I) 化合物:

$R^2=Cl$                        $R^3=SO_2Me$                        $R^4=H$   
 $R^5=H$                            $R^6=OH$                            $L=CH_2$   
 $Y=CH_2$                        $Z=CH_2$                            $v=1$   
 $w=2$



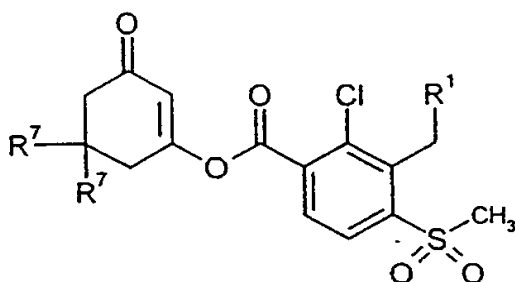
实施例编号	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	物性数据
3	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.8 (m,2H), 3.25 (s,3H), 4.05 (q, 2H), 5.35 (s,2H), 7.35 (d,1H), 8.15 (d,1H)
4	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.2 (t,3H), 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.8 (m,2H), 3.35 (s,3H), 3.45 (q, 2H), 3.58 (m,4H), 3.7 (m,2H), 3.85 (m,2H), 5.2 (s,2H), 7.3 (d,1H), 8.1 (d,1H)
5		H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.55 (m,6H), 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.8 (m,2H), 3.35 (s,3H), 3.6 (m,2H), 3.95 (m,2H), 4.3 (m,1H), 5.15 (m,2H), 7.3 (d,1H), 8.1 (d,1H)
6	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> Me	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.82 (m,2H), 3.28 (s,3H), 5.88 (s,2H), 7.12 (m,1H), 7.35 (m,1H), 7.2 (d,1H), 7.65 (m,1H), 7.85 (m,1H), 8.18 (d,1H)
7	苯甲氧基乙氧基	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 2.05 (m,2H), 2.3 (s,6H), 2.45 (m,2H), 2.8 (m,2H), 3.2 (s,3H), 5.65 (s,2H), 6.65 (s,2H), 6.7 (s,1H), 7.35 (d,1H), 8.18 (d,1H)
8	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H),



实施例编号	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	物性数据
			2.85 (m,2H), 3.2 (s,3H), 4.02 (t,2H), 5.3 (m,2H), 5.9 (m,1H), 7.35 (d,1H), 8.15 (d,1H)
9	O-c-Pentyl	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.5-1.85 (m,8H), 2.16 (m,2H), 2.5 (m,2H), 2.82 (m,2H), 3.3 (s,3H), 4.2 (m,1H), 5.05 (s,2H), 7.25 (d,1H), 8.1 (d,1H)
10	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.82 (m,2H), 3.4 (s,3H), 3.5-3.85 (m,12H), 5.25 (s,2H), 7.35 (d,1H), 8.15 (d,1H)
11	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.82 (m,2H), 3.35 (s,3H), 3.38-3.8 (m,8H), 5.2 (s,2H), 7.3 (d,1H), 8.1 (d,1H)
12	O-c-Bu	Me	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.15 (s,6H), 1.55 (m,1H), 1.75 (m,1H), 2.00 (m,2H), 2.25 (m,2H), 2.3 (s,2H), 2.7 (s,2H), 3.3 (s,3H), 4.12 (m,1H), 5.02 (s,2H), 7.3 (d,1H), 8.15 (d,1H), 16.8 (s,1H)
13		H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.6 (m,1H), 1.8-2.0 (m,3H), 2.1 (m,2H), 2.42 (m,2H), 2.82 (m,2H), 3.35 (s,3H), 3.62 (m,2H), 3.78 (m,2H), 4.05 (m,1H), 5.2 (s,2H), 7.28 (d,1H), 8.12 (d,1H), 16.75 (s,1H)
14	O-c-Bu	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.55 (m,1H), 1.75 (m,1H), 2.0 (m,2H), 2.1 (m,2H), 2.25 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.82 (m,2H), 3.3 (s,3H), 4.12 (m,1H), 5.02 (s,2H), 7.28 (d,1H), 8.1 (d,1H), 16.78 (s,1H)
15	O-CH <sub>2</sub> -c-Pr	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 0.25 (m,2H), 0.6 (m,2H), 0.9 (m,1H), 2.1 (m,2H), 2.42 (m,2H), 2.82 (m,2H), 3.35 (s,3H), 3.45 (d,2H), 5.15 (s,2H), 7.28 (d,1H), 8.1 (d,1H), 16.78 (s,1H)
16	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
17	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
18	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
19	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
20	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	
21	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Me	
22	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	H	
23	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	Me	
24	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	H	
25	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	
26	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	

实施例编号	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	物性数据
27	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	
28	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
29	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	

表 1a: 表 1 化合物的前体



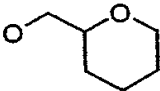
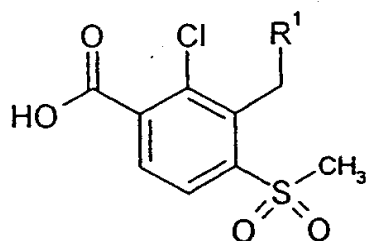
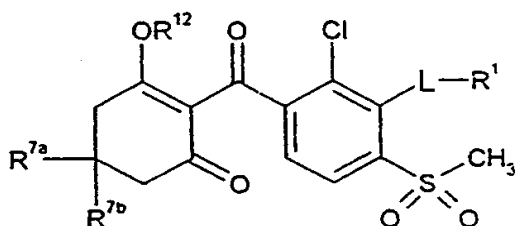
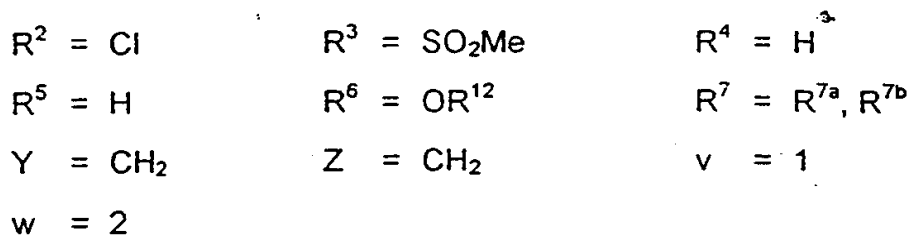
实施例编号	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	物性数据
3a	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 2.15 (m,2H), 2.5 (m,2H), 2.7 (m,2H), 3.25 (s,3H), 4.1 (q, 2H), 5.2 (s,2H), 6.1 (m,1H), 7.95 (d,1H), 8.2 (d,1H)
4a	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.2 (t,3H), 2.15 (m,2H), 2.5 (m,2H), 2.7 (m,2H), 3.38 (s,3H), 3.5 (q, 2H), 3.58 (m,4H), 3.7 (m,2H), 3.85 (m,2H), 5.25 (s,2H), 6.1 (m,1H), 7.9 (d,1H), 8.18 (d,1H)
5a		H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.55 (m,6H), 2.15 (m,2H), 2.5 (m,2H), 2.7 (m,2H), 3.35 (s,3H), 3.6 (m,2H), 3.95 (m,2H), 4.3 (m,1H), 5.2 (s,2H), 6.08 (m,1H), 7.85 (d,1H), 8.18 (d,1H)
9a	0-环戊基	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.5-1.85 (m,8H), 2.15 (m,2H), 2.5 (m,2H), 2.7 (m,2H), 3.3 (s,3H), 4.2 (m,1H), 5.1 (s,2H), 6.1 (s,1H), 7.88 (d,1H), 8.18 (d,1H)

表 1b: 表 1a 化合物的前体



实施例编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物性数据
3b	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H NMR (Me <sub>2</sub> SO- <i>d</i> 6): δ 3.35 (s,3H), 4.3 (q, 2H), 5.22 (s,2H), 7.9 (d,1H), 8.05 (d,1H)
4b	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.2 (t,3H), 3.35 (s,3H), 3.6 (m,4H), 3.7 (m,2H), 3.5 (q, 2H), 3.85 (m,2H), 5.25 (s,2H), 7.9 (d,1H), 8.15 (d,1H)
5b		H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.55 (m,6H), 3.35 (s,3H), 3.65 (m,2H), 4.0 (m,2H), 4.35 (m,1H), 5.12 (s,2H), 7.85 (d,1H), 8.1 (d,1H)
9b	0-环戊基	H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.5-1.85 (m,8H), 3.25 (s,3H), 4.2 (m,1H), 5.1 (s,2H), 7.9 (d,1H), 8.15 (d,1H)

表 2: 其中的取代基及代号具有下列定义的本发明式 (I) 化合物:



实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
30	H	H	Bz	CH <sub>2</sub>	0-环己基
31	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	0-环己基
32	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	0-环己基
33	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
34	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
35	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
36	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	0-环己基
37	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	0-环己基
38	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
39	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
40	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
41	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
42	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
43	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
44	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
45	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
46	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
47	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
48	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
49	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
50	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
51	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
52	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
53	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环己基
54	H	H	Bz	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
55	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
56	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
57	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
58	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
59	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
60	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
61	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
62	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
63	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
64	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
65	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
66	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
67	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
68	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
69	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
70	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
71	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
72	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
73	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
74	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
75	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
76	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
77	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0-环戊基
78	H	H	Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
79	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
80	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
81	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
82	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
83	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
84	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
85	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
86	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
87	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
88	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
89	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
90	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
91	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
92	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
93	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
94	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
95	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
96	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
97	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
98	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
99	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
100	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
101	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
102	H	H	Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
103	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
104	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
105	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
106	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
107	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
108	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
109	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
110	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
111	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
112	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
113	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
114	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
115	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
116	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
117	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
118	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
119	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
120	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
121	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
122	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
123	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
124	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
125	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
126	H	H	Bz	CH <sub>2</sub>	$\overset{\ominus}{\text{O}}\text{CH}_2\text{CF}_3$
127	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
128	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
129	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
130	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
131	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
132	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
133	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
134	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
135	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
136	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
137	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
138	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
139	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
140	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
141	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
142	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
143	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
144	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
145	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
146	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
147	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
148	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
149	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
150	H	H	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
151	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基



实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
152	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
153	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
154	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
155	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
156	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
157	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
158	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
159	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
160	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
161	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
162	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
163	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
164	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
165	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
166	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
167	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
168	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
169	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
170	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
171	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
172	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
173	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
174	H	H	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
175	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
176	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
177	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
178	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
179	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
180	H	H	4-Me-PhC(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
181	H	Me	4-Me-PhC(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
182	Me	Me	4-Me-PhC(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
183	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
184	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
185	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
186	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
187	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
188	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
189	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
190	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
191	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
192	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
193	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
194	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
195	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
196	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
197	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基
198	H	H	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
199	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
200	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
201	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
202	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
203	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
204	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
205	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
206	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
207	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
208	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
209	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
210	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
211	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
212	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
213	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
214	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
215	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
216	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
217	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
218	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
219	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
220	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
221	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu
222	H	H	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
223	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
224	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
225	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
226	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
227	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
228	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
229	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
230	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
231	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
232	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
233	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
234	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>z</sup> O-c-Pr
235	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
236	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
237	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
238	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
239	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
240	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
241	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
242	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
243	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
244	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
245	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Pr
246	H	H	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
247	H	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
248	Me	Me	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
249	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
250	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
251	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
252	H	H	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
253	H	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
254	Me	Me	4-Me-Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
255	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
256	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
257	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
258	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
259	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
260	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
261	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
262	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
263	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
264	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
265	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
266	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
267	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
268	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
269	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
270	H	H	Bz	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基
271	H	Me	Bz	CHMe	0-环己基
272	Me	Me	Bz	CHMe	0-环己基
273	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
274	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
275	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
276	H	H	4-Me-Bz	CHMe	0-环己基
277	H	Me	4-Me-Bz	CHMe	0-环己基
278	Me	Me	4-Me-Bz	CHMe	0-环己基
279	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
280	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
281	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
282	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
283	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
284	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
285	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
286	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
287	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
288	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
289	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
290	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
291	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
292	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
293	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环己基
294	H	H	Bz	CHMe	0-环戊基
295	H	Me	Bz	CHMe	0-环戊基
296	Me	Me	Bz	CHMe	0-环戊基
297	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
298	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
299	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
300	H	H	4-Me-Bz	CHMe	0-环戊基
301	H	Me	4-Me-Bz	CHMe	0-环戊基
302	Me	Me	4-Me-Bz	CHMe	0-环戊基
303	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
304	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
305	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
306	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
307	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
308	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
309	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
310	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
311	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
312	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
313	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基

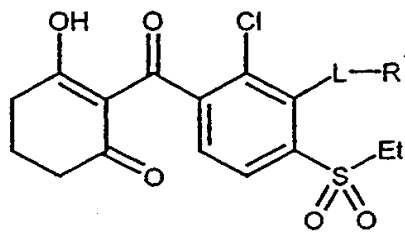
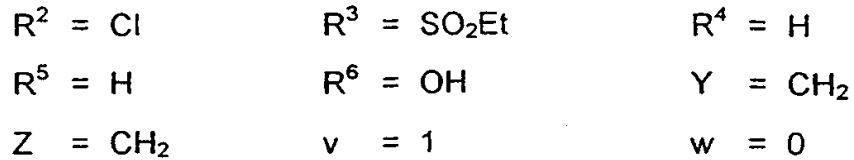
实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
314	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
315	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
316	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
317	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	0-环戊基
318	H	H	Bz	CHMe	O-c-Bu
319	H	Me	Bz	CHMe	O-c-Bu
320	Me	Me	Bz	CHMe	O-c-Bu
321	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
322	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
323	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
324	H	H	4-Me-Bz	CHMe	O-c-Bu
325	H	Me	4-Me-Bz	CHMe	O-c-Bu
326	Me	Me	4-Me-Bz	CHMe	O-c-Bu
327	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
328	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
329	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
330	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
331	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
332	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
333	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
334	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
335	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
336	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
337	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
338	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
339	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
340	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu

实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
341	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Bu
342	H	H	Bz	CHMe	O <sup>3</sup> -c-Pr
343	H	Me	Bz	CHMe	O-c-Pr
344	Me	Me	Bz	CHMe	O-c-Pr
345	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
346	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
347	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
348	H	H	4-Me-Bz	CHMe	O-c-Pr
349	H	Me	4-Me-Bz	CHMe	O-c-Pr
350	Me	Me	4-Me-Bz	CHMe	O-c-Pr
351	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
352	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
353	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
354	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
355	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
356	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
357	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
358	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
359	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
360	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
361	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
362	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
363	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
364	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
365	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	O-c-Pr
366	H	H	Bz	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
367	H	Me	Bz	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

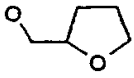
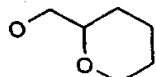
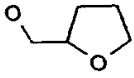
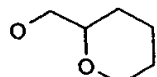


实施例编号	R <sup>7a</sup>	R <sup>7b</sup>	R <sup>12</sup>	L	R <sup>1</sup>
368	Me	Me	Bz	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
369	H	H	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
370	H	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
371	Me	Me	PhC(O)CH <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
372	H	H	4-Me-Bz	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
373	H	Me	4-Me-Bz	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
374	Me	Me	4-Me-Bz	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
375	H	H	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
376	H	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
377	Me	Me	MeSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
378	H	H	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
379	H	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
380	Me	Me	EtSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
381	H	H	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
382	H	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
383	Me	Me	PrSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
384	H	H	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
385	H	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
386	Me	Me	PhSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
387	H	H	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
388	H	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
389	Me	Me	4-Me-PhSO <sub>2</sub>	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

表 3: 其中的取代基及代号具有下列定义的本发明式 (I) 化合物:



实施例编号	L	R <sup>1</sup>	物性数据
390	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.25 (t,3H), 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.85 (m,2H), 3.98 (q,2H), 3.95 (m,2H), 5.25 (s,2H), 5.9 (m,1H), 7.3 (d,1H), 8.15 (d,1H), 16.7 (s,1H)
391	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.3 (t,3H), 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.85 (m,2H), 3.38 (q,2H), 4.0 (q, 2H), 5.35 (s,2H), 7.32 (d,1H), 8.08 (d,1H), 16.75 (s,1H)
392	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.3 (t,3H), 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.85 (m,2H), 3.45 (q,2H), 3.65 (t,2H), 3.78 (t,2H), 5.35 (s,2H), 7.32 (d,2H), 8.1 (d,1H), 16.7 (s,1H)
393	CH <sub>2</sub>	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.3 (t,3H), 2.05 (m,2H), 2.45 (m,2H), 2.82 (m,2H), 3.35 (m,2H), 3.42 (q, 2H), 4.62 (s,2H), 7.25 (d,1H), 8.05 (d,1H), 16.75 (s,1H)
394	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	
395	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	
396	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	
397	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
398	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
399	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	
400	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	

实施例编号	L	R'	物性数据
401	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	
402	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
403	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
404	CHMe	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	
405	CHMe	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	
406	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	
407	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
408	CHMe	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
409	CH <sub>2</sub>	O-c-Bu	
410	CH <sub>2</sub>	0-环戊基	
411	CH <sub>2</sub>	0-环己基	
412	CH <sub>2</sub>		
413	CH <sub>2</sub>		
414	CH <sub>2</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	
415	CH <sub>2</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	
416	CH <sub>2</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-i-Pr	
417	CH <sub>2</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
418	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O-c-Bu	
419	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环戊基	
420	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	0-环己基	
421	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		
422	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		

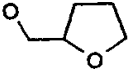
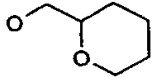
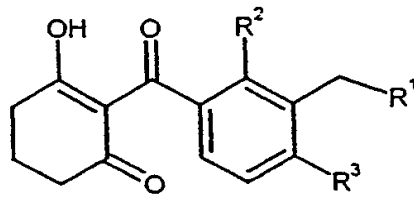
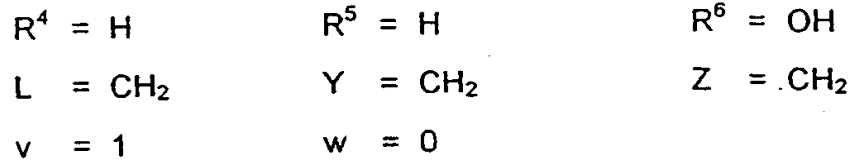
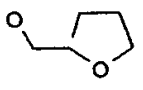
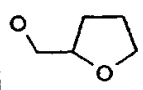
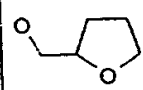
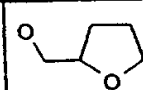
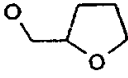
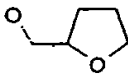
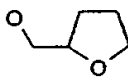
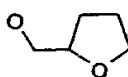
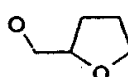
实施例 编号	L	R <sup>1</sup>	物性数据
423	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	
424	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	
425	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-i-Pr	
426	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
427	CHMe	O-c-Bu	
428	CHMe	O-环戊基	
429	CHMe	O-环己基	
430	CHMe		
431	CHMe		
432	CHMe	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	
433	CHMe	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	
434	CHMe	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-i-Pr	
435	CHMe	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	

表 4: 其中的取代基及代号具有下列定义的本发明式 (I)



实施例 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
436	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	SO <sub>2</sub> Me
437	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	SO <sub>2</sub> Et
438	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	Cl
439	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	Cl
440	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
441	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SOMe	CF <sub>3</sub>
442	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	CF <sub>3</sub>
443	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
444	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	Br
445	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	SO <sub>2</sub> Me
446	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	SO <sub>2</sub> Et
447	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SO <sub>2</sub> Me	Cl
448	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SO <sub>2</sub> Et	Cl
449	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
450	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SOMe	CF <sub>3</sub>
451	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SMe	CF <sub>3</sub>

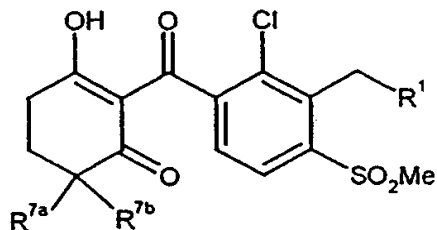
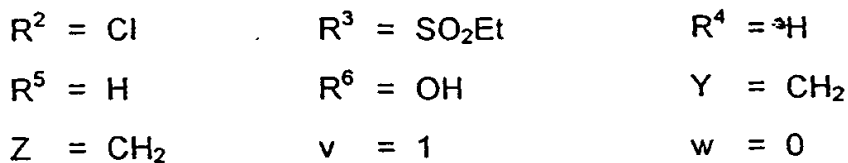
实施例 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
452	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	Cl
453	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	Br
454	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	SO <sub>2</sub> Me
455	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	SO <sub>2</sub> Et
456	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	Cl
457	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	Cl
458	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
459	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SOMe	CF <sub>3</sub>
460	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	CF <sub>3</sub>
461	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
462	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	Br
463	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Me	SO <sub>2</sub> Me
464	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Me	SO <sub>2</sub> Et
465	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	SO <sub>2</sub> Me	Cl
466	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	SO <sub>2</sub> Et	Cl
467	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
468	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	SOMe	CF <sub>3</sub>
469	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	SMe	CF <sub>3</sub>
470	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Cl	Cl
471	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Br	Br
472		Me	SO <sub>2</sub> Me
473		Me	SO <sub>2</sub> Et
474		SO <sub>2</sub> Me	Cl
475		SO <sub>2</sub> Et	Cl

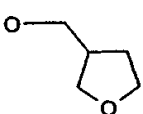
实施例 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
476		SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
477		SOMe	CF <sub>3</sub>
478		SMe	CF <sub>3</sub>
479		Cl	Cl
480		Br	Br
481	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Me	SO <sub>2</sub> Me
482	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Me	SO <sub>2</sub> Et
483	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	Cl
484	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	Cl
485	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
486	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SOMe	CF <sub>3</sub>
487	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	SMe	CF <sub>3</sub>
488	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Cl	Cl
489	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Br	Br
490	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	Me	SO <sub>2</sub> Me
491	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	Me	SO <sub>2</sub> Et
492	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	SO <sub>2</sub> Me	Cl
493	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	SO <sub>2</sub> Et	Cl
494	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
495	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	SOMe	CF <sub>3</sub>
496	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	SMe	CF <sub>3</sub>
497	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	Cl	Cl
498	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	Br	Br

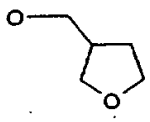
实施例 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
499	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	SO <sub>2</sub> Me
500	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	SO <sub>2</sub> Et
501	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	SO <sub>2</sub> Me	Cl
502	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	SO <sub>2</sub> Et	Cl
503	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
504	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	SOMe	CF <sub>3</sub>
505	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	SMe	CF <sub>3</sub>
506	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Cl	Cl
507	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Br	Br
508	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	Me	SO <sub>2</sub> Me
509	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	Me	SO <sub>2</sub> Et
510	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	SO <sub>2</sub> Me	Cl
511	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	SO <sub>2</sub> Et	Cl
512	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	SO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
513	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	SOMe	CF <sub>3</sub>
514	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	SMe	CF <sub>3</sub>
515	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	Cl	Cl
516	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	Br	Br

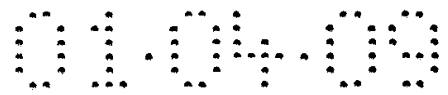


表 5: 其中的取代基及代号具有下列定义的本发明式 (I) 化合物:



实施例编号	R <sup>1</sup>	R <sup>7a</sup> , R <sup>7b</sup>	物性数据
517	0-环戊基	Me, Me	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ): δ 1.5-1.9 (m, 8H), 2.1 (s, 6H), 2.42 (t, 2H), 2.65 (t, 2H), 3.3 (s, 3H), 4.15 (m, 1H), 5.05 (s, 2H), 7.28 (d, 1H), d, 1H), 8.15 (d, 1H)
518	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me, Me	
519	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me, Me	
520	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me, Me	
521	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Me, Me	
522	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	Me, Me	
523	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me, Me	
524		Me, Me	
525	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Me, Me	
526	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	Me, Me	
527	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Me, Me	
528	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	Me, Me	
529	c-Bu	Me, Me	
530	环己基	Me, Me	

实施例编号	R <sup>1</sup>	R <sup>7a</sup> , R <sup>7b</sup>	物性数据
531	0-环戊基	Et, Et	
532	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> I	Et, Et	
533	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Et, Et	
534	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Et, Et	
535	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	Et, Et	
536	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	Et, Et	
537	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et, Et	
538		Et, Et	
539	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Et, Et	
540	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	Et, Et	
541	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	Et, Et	
542	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OEt	Et, Et	
543	c-Bu	Et, Et	
544	环己基	Et, Et	



## B. 配剂实施例

### 1. 粉尘剂

经由将 10 重量份的式 (I) 化合物与 90 重量份的作为惰性物质的滑石混合, 并在锤磨机中粉碎此混合物, 而制得粉尘剂。

### 2. 分散性粉末

经由混合 25 重量份的式 (I) 化合物、64 重量份作为惰性物质的含高岭土石英、作为润湿剂和分散剂的 10 重量份的木质磺酸钾及 1 重量份的油酰甲基牛磺酸钠, 并于棒磨机中碾磨此混合物, 而制得在水中极易分散的可湿粉末。

### 3. 分散液浓缩物

经由将 20 重量份的式 (I) 化合物与 6 重量份的烷基酚聚乙二醇醚 (®Triton X 207)、3 重量份的异十三醇聚乙二醇醚 (8 E0) 及 71 重量份石蜡矿油 (沸腾范围为, 例如, 约 255°C 至 277°C 以上) 混合, 并于球磨机中碾磨此混合物至 5 微米以下的细度, 而制得在水中极易分散的分散液浓缩物。

### 4. 可乳化浓缩物

由 15 重量份的式 (I) 化合物、75 重量份作为溶剂的环己酮及 10 重量份作为乳化剂的乙氧基化壬基酚, 而制得可乳化浓缩物。

### 5. 水分散性粒剂

水分散性粒剂可制备如下:

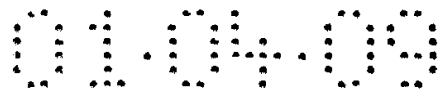
混合

75 重量份的式 (I) 化合物,

10 重量份的木质磺酸钙,

5 重量份的月桂基硫酸钠,

3 重量份的聚乙烯醇及



7 重量份的高岭土，

在棒磨机中予以碾磨，并在流化床中经由将所得粉末通过使用水作为粒化液体喷雾，而将其粒化。

水分散性粒剂亦可制备如下：

在胶体磨中将下列物质均化及预粉碎：

25 重量份的式 (I) 化合物，

5 重量份的 2, 2' - 二萘基甲烷 - 6, 6' - 二磺酸钠，

2 重量份的油酰甲基牛磺酸钠，

1 重量份的聚乙烯醇，

17 重量份的碳酸钙及

50 重量份的水，

然后在珠磨机中予以碾磨，并将所得的悬浮液在喷雾塔中利用单物质喷嘴予以雾化并干燥。

## C. 生物学实施例

### 1. 出土前的除草作用

将单及双子叶杂草植物的种子置于纸板盆内的沙质沃土中，并以土壤覆盖之。然后将调配成可湿粉末或乳化液浓缩物形式的本发明化合物，以换算后水施用量为 600 至 800 升/公顷（其中活性物质剂量换算后为 1 公斤以下/公顷）的方式制成含水悬浮液或乳化液并施加于该覆土表面上。处理后，将该纸板盆置于温室中，并保持在杂草的良好生长条件下。在 3 至 4 周的试验期后于试验植物出土之后，与未经处理的对照组相比较，而进行植物及出土损害的视觉评估。在本试验中，例如，实施例 5, 33 及 19 的化合物显示对繁缕、多花黑麦草及反枝苋有至少 80% 的作用。实施例 2 及 8 的化合物显示对反枝苋、繁缕、及狗尾草有至少 90% 的作用。实施例 2 及 18 的化合物显示对反枝苋及野欧白芥有 100% 的作用。

### 2. 出土后的除草作用

将单及双子叶杂草植物的种子置于纸板盆内的沙质沃土中，以土壤覆盖之并在良好的生长条件下于温室中培养之。播种两至三周后，在三叶期中处理该试验植物。将调配成可湿粉末或乳化液浓缩物的本发明化合物，以换算后水施用量为 600 至 800 升/公顷（其中活性物质剂量换算后为 1 公斤以下/公顷）的方式，喷洒于该试验植物的绿色部份上。在温室中最佳生长条件下静置该试验植物 3 至 4 周后，以和未经处理的对照组相比较的方式，评估各制剂的作用。在出土后的情况中，本发明的组合物也显示出对广范围的经济上重要的禾草及阔叶杂草具有良好的除草活性。例如，实施例 20, 32, 33, 34 及 18 的化合物显示对野欧白芥及反枝苋有至少 80% 的作用。实施例 2, 20, 33 及 34 的化合物显示对繁缕及反枝苋有至少 80% 的作用。实施例 2 及 18 的化合物显示对野欧白芥及繁缕有至少 90% 的作用。

### 3. 对稻米中有害植物的作用

在温室中及水稻田条件下（水深度为 2—3cm）培养稻米作物中典型的有害植物。在以经调制成活性物质剂量换算后为 1 公斤以下/公顷的本发明化合物处理之后，将该试验植物置于温室中及最佳生长条件下，并在整个试验期间中保持于此状态下。在施加后约三周，以和未经处理的对照组相比较的方式，对植物损害进行视觉评估。本发明化合物对有害植物显示极佳的除草作用。在本试验中，例如，实施例 2, 8, 32 及 33 的化合物显示对莎草及稗有至少 80% 的作用。

### 4. 农作物的耐药性

在温室中的进一步试验中，将大量农作物及杂草的种子置于沙质沃土中并以土壤覆盖之。某些培养盆依前述第 1 节试验所述即刻处理，其余的则置于温室中直到植物生出两至三片真叶，然后依前述第 2 节试验所述，以不同剂量的本发明式 (I) 物质喷洒之。施药后静置于温室中四至五周，经视觉评估结果发现，本发明化合物通常即使在高剂量下也不会出土前及出土后损害或几乎不损害双子叶的农作物，例

如，大豆及甜菜。某些活性物质还可保护禾本科的农作物，例如，大麦、小麦及稻米。式(I)化合物在某些情况中显示高选择性，因此适用于控制农作物中所不要的植物生长。