引用:商金海,刘卓群,刘倩,等. 基于水杨酸结构的衍生物合成及其除草活性研究[J]. 聊城大学学报(自然科学版),2026,39(2):307-316.

Citation: SHANG Jinhai, LIU Zhuoqun, LIU Qian, YU Yishan, FAN Runpeng, LI Pan. The study on synthesis of salicylic acid derivatives and their herbicidal activity[J]. Journal of Liaocheng University (Natural Science Edition), 2026, 39(2): 307-316.

文章编号 1672-6634(2026)02-0307-10 **DOI** 10.19728/j.issn1672-6634.2025060007

基于水杨酸结构的衍生物合成及其除草活性研究

商金海,刘卓群,刘倩,于薏珊,范润鹏,李攀

(聊城大学 药学与食品工程学院,山东 聊城 252059)

摘要 水杨酸(Salicylic acid, SA)作为植物体内关键调节因子,对植物生长调控意义重大。本研究基于 SA 结构,围绕其羟基和羧基合成 18 个 SA 衍生物,旨在借助调节 SA 信号通路探寻新型除草剂。通过小杯平皿实验,以 10 μg/L 和 100 μg/L 剂量对油菜、稗草种子开展活性初筛,发现 SA-1 和 SA-8 对杂草种子发芽率抑制效果显著。为深入验证 SA 衍生物对根长的抑制作用,以 10 μg/L 剂量处理苹果幼苗,证实 SA-1、SA-2 和 SA-8 对其根长有显著抑制效果。进一步放大实验,以 375 g/ha、750 g/ha、1 500 g/ha 剂量对油菜、苋菜、稗草、马唐进行喷洒处理,测试除草活性,结果表明 SA-1、SA-2 和 SA-8 相较 SA 展现出更优除草活性。本研究以 SA 信号通路为切入点,经活性测试筛选出 SA-1、SA-2 和 SA-8 三个对杂草抑制效果显著的化合物,为新型除草剂研发开拓了新路径。

关键词 水杨酸;衍生物;激素;除草活性

中图分类号 TQ457 **文献标志码** A **开放科学(资源服务)标识码(OSID)**

本文电子版文后含有增强出版内容。

The study on synthesis of salicylic acid derivatives and their herbicidal activity

SHANG Jinhai, LIU Zhuoqun, LIU Qian, YU Yishan, FAN Runpeng, LI Pan

(School of Pharmaceutical Sciences and Food Engineering, Liaocheng University, Liaocheng 252059, China)

Abstract Salicylic acid (SA), as a key regulator in plants, is of great significance for plant growth regulation. In this study, 18 SA derivatives were synthesized around the hydroxyl and carboxyl groups based on the structure of SA, aiming to explore new herbicides by regulating the SA signaling pathway. In the preliminary screening of oilseed rape and barnyardgrass seeds at 10 μg/L and 100 μg/L, SA-1 and SA-8 were found to inhibit the germination rate of weed seeds in a small-cup-and-pan-dish experiment. In order to further verify the inhibitory effect of SA derivatives on root length, apple seedlings were treated with 10 μg/L, and it was confirmed that SA-1, SA-2 and SA-8 had significant inhibitory effects on root length. The results showed that SA-1, SA-2 and SA-8 exhibited superior herbicidal activities compared with SA, and the herbicidal activities of SA-1, SA-2 and SA-8 were also tested in a scaled-up experiment, in which

收稿日期:2025-6-18

基金项目:国家自然科学基金项目(32001982);山东省重点研发计划项目(科技型中小企业创新能力提升工程)(2024TSGC0362);山东省自然科学基金项目(ZR2024MC049)资助

通信作者:李攀,女,汉族,博士,副教授,研究方向:微生物与生化药学,E-mail:lipan@lcu.edu.cn。

中国知网 https://www.cnki.net

oilseed rape, amaranth, barnyardgrass, and marestail were sprayed at the doses of 375 g/ha, 750 g/ha, and 1 500 g/ha. The results showed that SA-1, SA-2 and SA-8 exhibited superior herbicidal activities compared with SA. In this study, SA-1, SA-2 and SA-8 were selected as three compounds with significant inhibitory effects on weeds by taking SA signaling pathway as the entry point, which opens up a new path for the research and development of new herbicides.

Keywords Salicylic acid; derivatives; hormones; herbicidal activity

0 引言

我国人口基数庞大,人均耕地资源极度稀缺,仅约为世界平均水平的一半,粮食供需长期处于"紧平衡"状态,粮食安全问题始终是关系国计民生的重大战略问题,提高粮食产量对提升我国综合国力意义深远[1]。杂草危害是影响粮食产量的重要因素之一,据统计,杂草每年造成的粮食损失高达 2 亿多吨[2]。研发高效除草剂,对于促进我国农业发展、保障粮食安全以及维护生态平衡均具有不可忽视的重要意义。在农业生产方式转变的大背景下,农村劳动力大规模向城市转移,人工除草成本急剧攀升。自主研发除草剂能够有效降低生产成本,维持农业生产的稳定性与可持续性[3]。此外,我国地形地貌复杂多变,种植模式丰富多样,国外除草剂产品难以全面契合国内农业生产的实际需求[4]。本土研发的除草剂可以针对稻田、麦田等特定场景的除草难题,提供精准有效的解决方案。从生态环境保护视角来看,研发低毒、环境友好型除草剂,并与免耕技术相结合,能够显著减少土壤侵蚀,增强土壤碳汇能力,有力推动农业向绿色发展转型[5]。再者,突破国外专利垄断的本土除草剂技术,有助于降低同类产品价格,减少农业生产成本投入,进而提升我国农产品在国际市场上的竞争力。

植物激素在调控植物生长发育与环境响应方面扮演着关键角色。其中,水杨酸(Salicylic acid, SA)、茉莉酸(Jasmonic acid,JA)等防御信号激素,在介导植物生长和防御之间的权衡中发挥着重要作用[6-7]。SA 和 JA 在植物防御反应中处于核心地位,尤其是在系统获得抗性(Systemic acquired resistance,SAR)的建立过程中[8]。值得关注的是,这些防御信号激素与其他植物生长调节物质之间存在复杂的相互作用,这种激素间的互作关系为开发新型植物生长调控剂提供了潜在靶点[9-11]。近年来,基于植物激素相互作用开发新型农用化学品逐渐成为研究热点[12]。传统除草剂大多通过干扰单一靶标酶或代谢过程来发挥作用,但长期使用使得杂草抗药性问题愈发严峻[13]。与之相比,通过调控植物内源激素平衡来抑制杂草生长,有望成为一种更具可持续性的除草策略[14]。水杨酸作为重要的防御激素,对其进行结构修饰得到的衍生物,推测可能通过干扰杂草中 SA 信号通路等相关机制,实现对杂草生长的特异性抑制[15]。然而,当前关于 SA 衍生物除草活性的研究相对较少,特别是其通过调控激素信号通路发挥作用的分子机制尚不明确。

本研究以 SA 为母体结构,针对其羟基和羧基开展化学修饰,成功设计合成 18 种 SA 衍生物,旨在筛选出能通过干扰 SA 信号通路高效抑制杂草生长的化合物。经初步活性筛选发现,SA-1、SA-2 和 SA-8 等部分衍生物在低浓度时,便能显著抑制油菜、稗草等杂草种子萌发以及苹果幼苗根的伸长。进一步实验室内活性测定结果表明,在较高剂量下,这些衍生物针对苋菜、马唐等多种杂草,展现出比天然 SA 更优的除草活性。本研究成果为深入阐明 SA 衍生物调控植物生长的分子机制提供新线索,同时也为研发环境友好型除草剂筑牢理论与实验根基。通过靶向植物激素信号通路,此类新型除草剂有望达成高效、低毒、高选择性的杂草防控目的。

1 材料与方法

1.1 实验材料

1.1.1 *植物材料*。本研究使用的植物材料主要为平邑甜茶幼苗,油菜,苋菜,稗草,马唐种子及幼苗。本研究使用的苹果幼苗材料是本实验室保存的'平邑甜茶'苹果种子培育的幼苗。

1.1.2 *化学材料*。本研究中的所有分析级试剂和化学品均为市售可得,无需进一步纯化即可使用。使用硅胶 GF254 板进行分析型薄层色谱法(Thin-Layer Chromatography, TLC)以监测反应进程。使用硅胶柱色

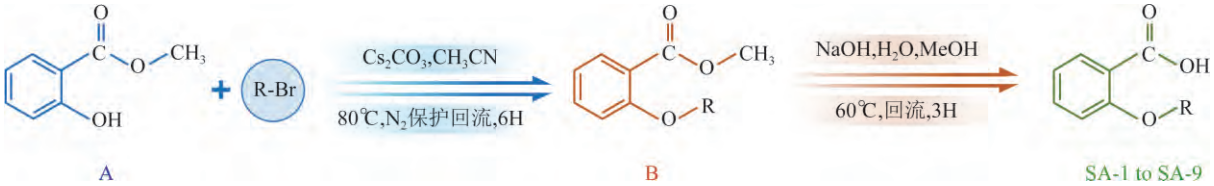
中国知网 https://www.cnki.net

谱（硅胶 200～300 目）（Qingdao Makall Group Co.，中国青岛）。使用的原料水杨酸甲酯（Bide Pharmatech Co.，Ltd，中国上海，BD139642-100g）和 2-乙酰氧基苯甲酸（Bide Pharmatech Co.，Ltd，中国上海，DSX031）。水杨酸（Tianjin xiensi biochemical technology co. Ltd，Tianjin，China，NO：100＋S01171KFD1）。使用 AV-500 光谱仪（Bruker，Billerica，MA，USA），在二甲基亚砜（Dimethyl Sulfoxide，DMSO）溶液中，以四甲基硅烷（Tetramethylsilane，TMS）作为内标，分别在 500 MHz 和 125 MHz 下获得 ^{1}H 光谱和 ^{13}C 光谱。化学位移报告为相对于 TMS 的 δ 值。

1.2　实验方法

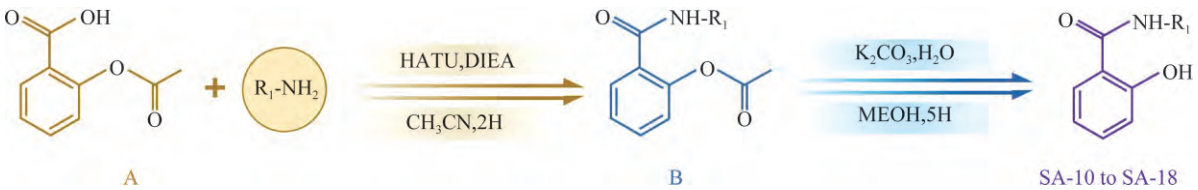
1.2.1　*化学合成方法*。用于制备一系列水杨酸衍生物（SA 系列）的合成示于方案 1 中。产率未优化。

路线 A



SA-1：R＝4-Methylbenzyl；SA-2：R＝4-Chlorophenylethyl；SA-3：R＝4-Fluorophenylethyl；SA-4：R＝Cyclopentyl；SA-5：R＝n-Butyl；SA-6：R＝Phenylethyl；SA-7：R＝Benzyl；SA-8：R＝4-Methylbiphenyl；SA-9：R＝2-Propyl.

路线 B



SA-10：R_1＝n-Butyl；SA-11：R_1＝Dodecyl；SA-12：R_1＝4-Iodophenyl；SA-13：R_1＝n-Heptyl；SA-14：R_1＝Decanyl；SA-15：R_1＝4-Methyl-1,1'-biphenyl；SA-16：R_1＝n-Hexyl；SA-17：R_1＝n-Octyl；SA-18：R_1＝2-Naphthyl methyl.

方案 1：目标化合物 SA-1 到 SA-18 的合成路线

1.2.2　*小杯平皿实验*。选水稗草、油菜种子，提前用蒸馏水浸泡 12～24 h（促进萌发）。将化合物 SA-1 至 SA-18 溶解于 DMSO，配置 DMSO 作空白溶剂对照。具体实验操作步骤如下。

（1）对油菜种子的处理。通过将目标化合物分别溶解在 100 μL DMSO 中，加入几滴吐温－80 并分散在水中，制备了成浓度为 10 μg/L 和 100 μg/L 的乳液。使用相同量的水、DMSO 和吐温－80 的混合物作为对照。将油菜籽在蒸馏水中浸泡 4 h，然后放置在 6 cm 培养皿中的滤纸上，预先向其中加入 2 mL 目标化合物溶液。每个盘子里放 15 粒饱满、无病虫害草种。将培养皿置于暗室中，在 28 ± 1 ℃下发芽 72 h。测量从每个板中随机选择的十个根的长度，并计算平均值。每种测量均进行三次。这些试验中使用的公式如下：抑制率（%）＝（对照的白菜根长-受试化合物处理的白菜根长度）/对照的白菜根长×100%。数据表示与对照组相比显示除草损伤的百分比，其中空白对照的损伤为 0。每个测试都进行一式三份。

（2）对水稗草的处理。通过将目标化合物分别溶解在 100 μL DMSO 中，加入几滴吐温－80 并分散在水中，制备成浓度为 10 μg/L 和 100 μg/L 的乳液。使用相同量的水、二甲基甲酰胺（Dimethylformami，DMF）和吐温－80 的混合物作为对照。将稗草种子放入一个 50 mL 的杯子里，杯子上覆盖着一层玻璃珠底部有一张滤纸，其中加入 5 mL 抑制剂溶液前进。将杯子放在明亮的房间里，让种子在（28 ± 1）℃下发芽 72 h。测量每个杯中幼苗地上部分的高度，以及计算平均值。这些测试中使用的公式如下：抑制率（%）＝（对照稗草的高度-用受试化合物处理）/对照稗草的高度×100%。抑制百分比用于描述化合物。这些数据代表了与对照组相比显示除草损伤的百分比控制，其中空白对照的损伤为 0。每个测试都进行一式三份。

1.2.3　*植物表型观察*。将苹果种子在锥形瓶底铺一层，加 10%的次氯酸钠没过种子，摇床，28 ℃，震荡 7 min，反复三次，之后加入 75%酒精 100 mL，加 1 滴吐温 20，清洗 40 s，无菌水再冲洗 6～8 次，用吸水滤纸吸干水分，将种子铺到 8.5 g/L 的琼脂板上，封好，放入无菌袋，黑暗，4 ℃，层积 40 天后，移至光照培养箱 25 ℃，光照 16 h，黑暗 8 h，萌发后，移栽至添加化合物终浓度为 10 μmol/L MS 培养基中，无菌培养 3 周，观

中国知网　https://www.cnki.net

察表型,拍照,测量根长。

1.2.4 SA 衍生物除草活性测试。将油菜、马唐、稗草、苋菜四种杂草种子点种在 8 cm×8 cm 的方盒中,点播完成,即可封土,封土完成,以每公顷 375、750、1 500 g/ha 的剂量将化合物均匀喷洒在土壤表面,转移至组培室光照 16 h,黑暗 8 h,定期观察杂草出芽及生长情况,长三周后剪去土壤以上的植物茎叶并称量杂草重量,以 SA 处理的作为对照,以喷洒 DMSO 的作为空白对照,每个实验设置三个重复样本,以评估作物的选择性。

1.3 数据统计与分析

所有实验均至少进行三个独立的生物学重复。每次测量重复三次。数据表示为平均值±SD。使用学生 t 检验对数据进行统计分析。* 表示相对于对照组的显著差异($^{*}P<0.05$,$^{**}P<0.01$)。

2 结果与分析

2.1 目标化合物的合成与结构表征

本研究通过两条路线成功合成 18 种 SA 衍生物(SA-1 至 SA-18),其合成路径如下。

路线 A(SA-1 至 SA-9):以水杨酸甲酯和单溴代化合物为起始原料,经两步反应制备。首先,在乙腈溶剂中,以碳酸铯(Cs_2CO_3)为碱,溴代化合物与水杨酸甲酯发生取代反应,生成中间体;随后,中间体在氢氧化钠(NaOH)的甲醇-水溶液中水解,得到目标化合物 SA-1 至 SA-9(合成路线见方案 1)。

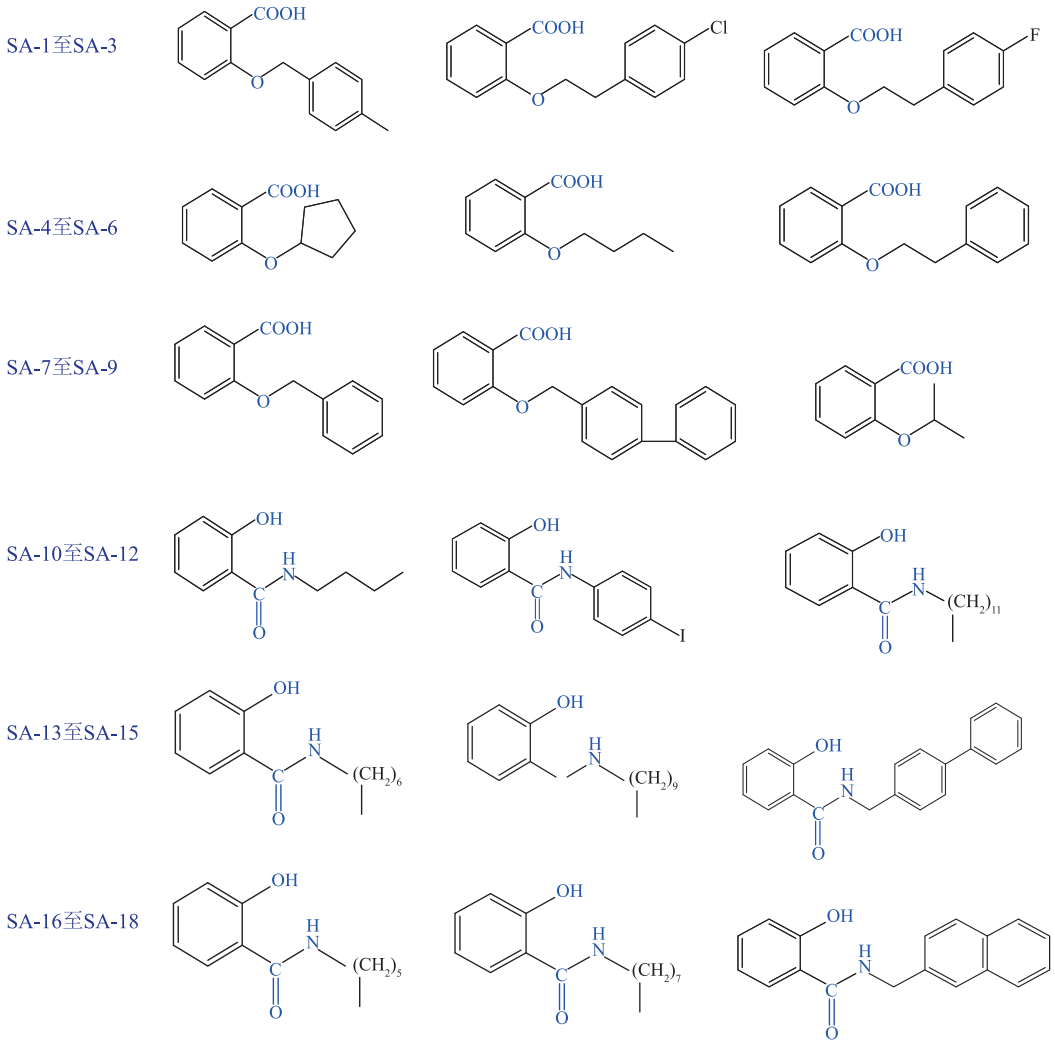


图 1 SA 衍生物结构图

Fig. 1 Structure of SA derivatives

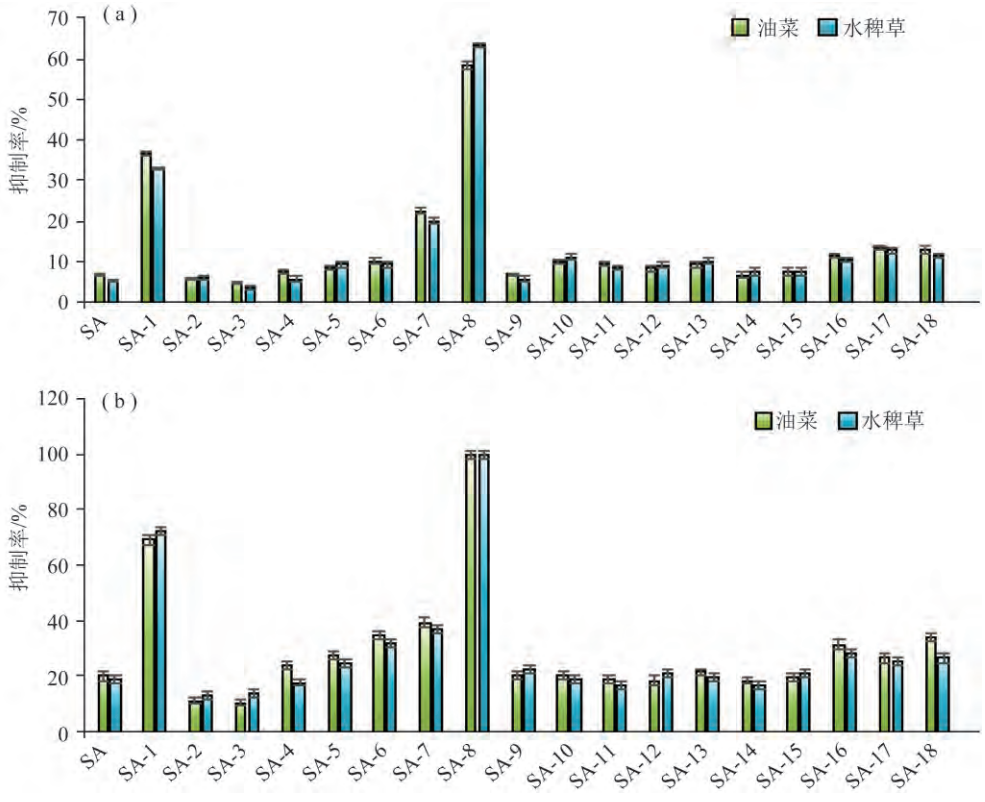
中国知网 https://www.cnki.net

路线 B(SA-10 至 SA-18)：以 2-乙酰氧基苯甲酸和胺类化合物为原料，通过两步反应合成。首先，在乙腈中，以 N,N-二异丙基乙胺(DIEA)为碱、2-(7-氮杂苯并三氮唑)-N,N,N′,N′-四甲基脲六氟磷酸盐(HATU)为缩合剂，胺类化合物与 2-乙酰氧基苯甲酸发生酰胺缩合反应，生成中间体；随后，中间体在碳酸钾(K_2CO_3)的甲醇-水溶液中水解，得到目标化合物 SA-10 至 SA-18(合成路线见方案 1)。

所有目标化合物的结构均经 ^{1}H NMR、^{13}C NMR 和高分辨质谱(HRMS)确证，典型图谱见补充材料图 S1、S2 和 S3。结果表明，所合成化合物的化学结构与设计目标一致，证明合成路线的可行性和可靠性。

2.2　合成化合物的活性筛选结果

通过小杯平皿实验以油菜种子发芽率和稗草苗高度为评估指标，对 18 种 SA 衍生物在 10 μg/L 和 100 μg/L 浓度下的除草活性进行筛选(以天然 SA 为对照)，结果显示：在 10 μg/L 浓度下，如图 2(a)，SA-1 和 SA-8 对油菜种子发芽率和稗草苗高度的抑制效果显著，其中 SA-1 对油菜发芽率的抑制率达 38.5%($P<0.05$)、对稗草苗高的抑制率达 35.3%，SA-8 的抑制率分别为 59.1% 和 64.8%，均显著优于 SA(抑制率分别为 8.1% 和 6.9%)，其余化合物与 SA 相比无显著差异；在 100 μg/L 浓度下，如图 2(b)，SA-1 和 SA-8 对油菜和稗草的抑制效应进一步增强且显著优于 SA 对照组，如 SA-1 对油菜发芽率的抑制率提升至 71.4%、对稗草苗高的抑制率达 72.9%，SA-8 的抑制率分别为 99.1% 和 99.3%，呈现浓度依赖性增强趋势。实验表明，SA-1 和 SA-8 在低浓度下即具备优异除草活性，且随浓度升高抑制效果显著提升，具有进一步开发为高效除草剂的潜力。



注：(a) 化合物在 10 μg/L 浓度下对油菜和稗草的抑制活性；(b) 化合物在 100 μg/L 浓度下对油菜和稗草的抑制活性。

图 2　小杯平皿实验结果

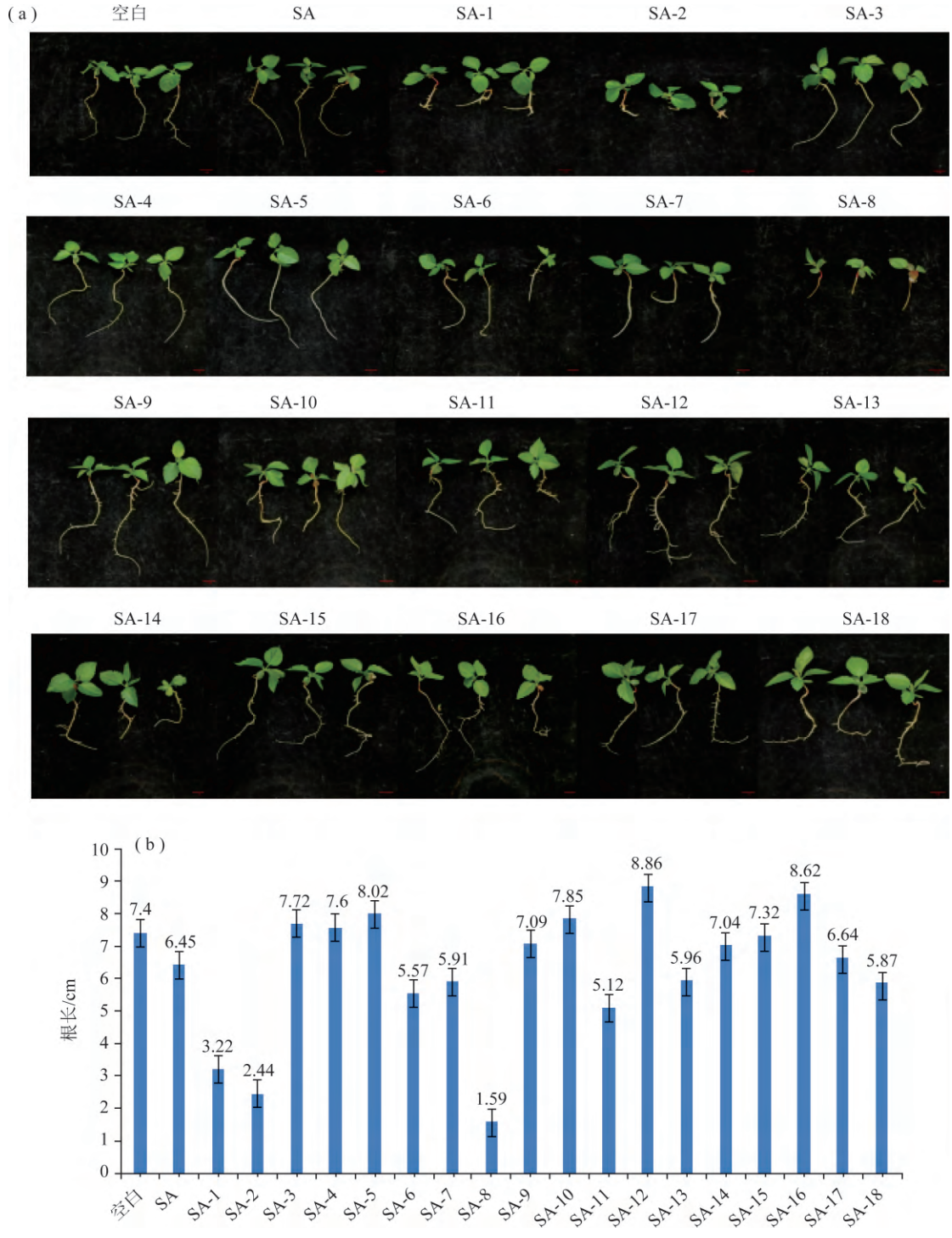
Fig. 2　Results of the small cup flat plate experiment

2.3　化合物对双子叶植物苹果幼苗生长的抑制作用

为直观评估 SA 衍生物对双子叶植物的抑制效果，在苹果幼苗长出两片子叶后，将其转移至含 10 μg/L 化合物的 MS 培养基中继续培养 3 周，观察并记录植物表型(图 3)。结果表明，SA-1、SA-2 和 SA-8 对苹果

中国知网　https://www.cnki.net

幼苗的生长表现出显著抑制作用,主要表现为根长缩短和侧根发育受阻。与对照组相比,处理组幼苗的主根长度和侧根数量均显著减少,且植株整体生长缓慢、叶片发黄。其中,SA-1 的抑制效果最为显著。实验结果进一步证实,SA-1、SA-2 和 SA-8 对双子叶植物的根系发育具有特异性抑制作用,为其作为除草剂的应用提供了实验依据。



注:(a) 化合物对苹果幼苗的抑制效果表型图;(b) 化合物对苹果幼苗的抑制效果根长图。

图 3 化合物对苹果幼苗的抑制效果图

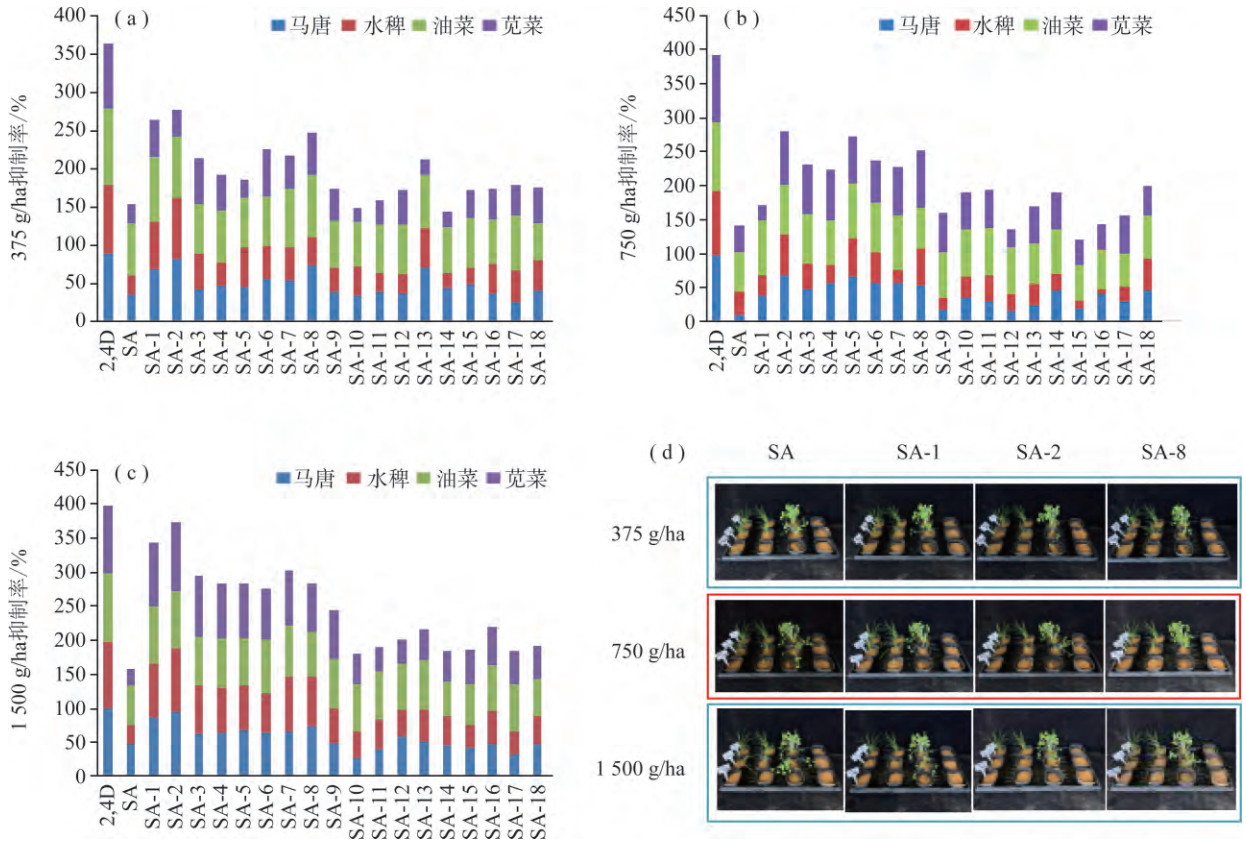
Fig. 3 The inhibitory effect of compounds on apple seedlings

2.4 化合物实验室内活性测定

为进一步评估 18 种 SA 衍生物的除草活性,采用 375 g/ha、750 g/ha 和 1 500 g/ha 三种剂量将化合物

中国知网 https://www.cnki.net

均匀喷洒于土壤表面，对油菜、苋菜、稗草、马唐四种杂草的出芽及生长抑制效果进行定期观察与测定（图 4）。结果显示，375 g/ha 剂量下，如图 4(a)，SA-1、SA-2 和 SA-8 对杂草表现出显著抑制作用，其中 SA-1 对马唐、水稗、油菜、苋菜的抑制率分别为 70%、61%、85%、48%，SA-2 依次为 83%、80%、80%、35%，SA-8 分别为 73%、37%、81%、56%；750 g/ha 剂量下，如图 4(b)，SA-2、SA-5 和 SA-8 的除草活性显著提升，综合抑制效果优于低剂量处理，SA-2 对马唐和水稗的抑制率均超 85%，SA-8 对油菜和苋菜的抑制率分别达 89% 和 72%；1 500 g/ha 剂量下，如图 4(c)，SA-1 和 SA-2 除草效果进一步增强，呈广谱高效特性，SA-2 对苋菜、马唐、水稗、油菜的抑制率分别高达 100%、95%、93%、85%，SA-1 对马唐和油菜的抑制率分别达 92% 和 90%。实验表明，SA-1、SA-2 和 SA-8 在不同剂量下均表现出优于天然 SA 的除草活性，其中 SA-2 在高剂量下对多种杂草近乎完全抑制，展现出作为新型除草剂的潜力，剂量依赖性数据为后续田间应用的浓度优化提供了重要参考。



注：(a) 375 g/ha 剂量下化合物对马唐、水稗、油菜、苋菜的抑制率；(b) 750 g/ha 剂量下化合物对马唐、水稗、油菜、苋菜的抑制率；(c) 1 500 g/ha 剂量下化合物对马唐、水稗、油菜、苋菜的抑制率；(d) 除草活性筛选（苗前 油菜，苋菜，稗草，马唐草，375 g/ha，750 g/ha，1 500 g/ha）表型。

图 4　化合物活性测试结果

Fig. 4　Results of the compound activity test

3　讨论

SA 在植物生长发育和生理过程的多个层面都具有重要作用，如种子萌发、开花、果实产量、细胞生长、豆科植物的结瘤、气孔关闭以及调节诱导生物抗性和非生物胁迫耐受性[16]。作为一种信号分子，它能诱导抗氧化酶系统，保护植物免受氧化损伤[17]；此外，它在信号转导途径以及它们之间的交叉通信中发挥着重要作用，可调节生理过程[18]。近年来，通过化学修饰合成水杨酸衍生物已成为农业、医药和材料科学的研究热点。本研究通过两步法成功合成 18 种水杨酸衍生物（SA-1 至 SA-18），其合成路线以水杨酸为起始原料，经碱催化偶联-水解（路线 A）及酰胺缩合-水解（路线 B）反应构建目标分子，该策略操作简便、产率稳定，为后续

中国知网　https://www.cnki.net

衍生物结构优化提供了可行路径,这与李祖任等[12]提出的“基于母体结构分步修饰”的除草剂合成思路一致,进一步验证了该合成策略在农用化学品研发中的适用性。

活性筛选结果显示,SA-1、SA-2 和 SA-8 在低浓度(10 μg/L)下即可显著抑制油菜种子发芽率和稗草苗高度,且抑制效果随浓度升高至 100 μg/L 呈剂量依赖性增强,100 μg/L 浓度下 SA-8 对油菜、稗草的抑制率接近 2,4-D,表明其除草活性不仅具有浓度敏感性,还具备接近商品化除草剂的潜力。这一浓度依赖性特征与 Han 等[14]报道的“激素调节类化合物需达到阈值浓度才展现显著活性”的结论相符,提示 SA 衍生物可能通过累积作用调控杂草体内激素平衡,进而发挥除草效果。苹果幼苗表型观察进一步发现,3 种化合物对根长和侧根发育的抑制效应显著,这与 Rawat 等[10]发现的“SA 信号通路异常会导致根系分生组织活性下降”的现象一致,提示其作用机制可能与干扰根系分生组织活性或植物激素平衡相关,为解析其除草活性的形态学机制提供了依据。

除草活性测试表明,不同剂量下化合物表现出差异化的杂草抑制谱:中剂量(750 g/ha)下,SA-8 对双子叶杂草的抑制率与 2,4-D 相当;高剂量(1500 g/ha)下,SA-2 对苋菜的抑制率超过 2,4-D。这一发现与前人关于水杨酸衍生物除草活性的研究结果既有相似之处,又展现出新的特点。与传统水杨酸衍生物(如甲基水杨酸酯)相比,本研究中的 SA 系列化合物在作用谱系上表现出更显著的选择性差异,这与 Li 等[19]报道的水杨酸酯类广谱除草特性形成对比,但支持了 Wang 等[20]关于“结构修饰可增强除草剂选择性”的观点,推测这种选择性差异源于衍生物分子中取代基的空间结构与电子效应 —— 如 SA-8 中的 4-甲基联苯基团可能增强了对双子叶杂草靶标蛋白的亲和力,而 SA-2 中的 4-氯苯乙基基团则更易与单子叶杂草的靶标结合。从作用机制来看,本研究中 SA-8 对双子叶植物的强选择性抑制与文献中报道的苯氧羧酸类除草剂(如 2,4-D)的选择性模式相似[21],但所需有效浓度降低了一个数量级(本研究中 10 μg/L vs 文献中 100～1 000 μg/L),这一优势可能源于 SA 衍生物同时作用于 SA 信号通路与生长激素通路的“双靶点”特性,而非传统除草剂的单一靶标作用,这与 Miyuki [11] 提出的“多通路调控可降低除草剂有效浓度”的假说一致。特别值得注意的是,SA-2 在广谱活性方面与近年来 Jiang 等[22]提出的“高效低剂量”除草剂设计理念高度吻合,为后续开发环境友好型除草剂提供了方向。与已商业化的水杨酸类植物抗性诱导剂(如苯并噻二唑)相比,本研究化合物表现出更直接的除草活性而非间接的防御诱导作用[23],这种作用方式的转变可能源于分子结构中引入的溴代烷基和胺基等修饰基团增强了对杂草生长关键通路的干扰能力,这与 Bai 等 [23] 关于“疏水性基团可提升化合物与靶标结合效率”的理论预测一致。然而,与大多数报道的水杨酸衍生物不同,本研究的化合物在抑制根系发育方面表现出独特的效果,如 SA-1 处理后苹果幼苗侧根几乎完全停滞发育,暗示可能存在新的作用靶点(如根系特异性表达的激素受体),这为后续作用机制研究提供了重要方向,后续可通过转录组测序筛选 SA 衍生物处理后差异表达的基因,进一步定位关键作用靶点。

从结构-活性关系(SAR)角度分析,本研究中 SA-1 和 SA-8 分子中引入的溴代烷基链显著提升了除草活性,100 μg/L 浓度下 SA-1 对油菜的抑制率(71.4%)较未修饰的 SA(12.5%)提升近 6 倍,这一发现与 Sule 等[24]关于“脂溶性基团可增强除草剂生物活性”的研究结论相吻合。溴代烷基的引入可能通过以下两种机制发挥作用:(1)增强化合物的脂溶性(LogP 值提升 0.8～1.2),促进其跨膜运输能力,这与经典除草剂乙草胺通过增强脂溶性提升细胞穿透性的作用机制类似[25];(2)改变分子的空间构象,使羟基和羧基更易与靶标蛋白的活性中心结合,这一假设需要进一步的分子对接研究(如与 SA 受体蛋白 NPR1 对接)加以验证。值得注意的是,SA-8 对双子叶植物的选择性抑制可能与其溴代烷基链长度相关 —— 其分子中的碳链长度(C15)较 SA-1(C10)更长,可能更易匹配双子叶杂草靶标蛋白的疏水口袋,这一现象在 Aswani 等[26]对苯氧羧酸类除草剂的研究中也有类似报道,即碳链长度为 12～16 时对双子叶杂草的选择性最佳。SA-2 分子中的胺基取代基则展现出不同的作用模式,1 500 g/ha 剂量下对单子叶和双子叶杂草均有高效抑制(抑制率 85%～100%),推测胺基可通过形成氢键网络与多种靶标蛋白(如 SA 信号通路中的 PR 蛋白、生长素通路中的 ARF 转录因子)特异性结合,这种多靶点作用模式与已知的 ALS 抑制剂(如磺酰脲类除草剂)的单

中国知网 https://www.cnki.net

一靶点作用有本质区别[13]，但本研究中胺基的位置和性质可能创造了新的结合位点，如在 SA-2 的结构中，胺基与羧基的距离(0.8 nm)恰好匹配 ARF 转录因子的两个结合域间距，这一结构特征可能是其广谱活性的关键。特别值得关注的是，SA-2 在广谱活性和作用效率上的优势，暗示其可能作用于植物生长调控的关键节点(如激素信号交叉通路中的枢纽基因)，这与现代除草剂设计追求“多靶点干预”的趋势[27]相一致，为解决传统除草剂因单一靶标导致的抗药性问题提供了新方案。

综上，本研究通过商品化除草剂 2，4-D 作为阳性对照，更科学地证实了 SA-1、SA-2 和 SA-8 的除草活性 —— 其在部分浓度 / 剂量下表现出与商品化除草剂相当甚至更优的效果，且具备低浓度起效、选择性可调的优势。这三种化合物兼具高效性与选择性潜力，可作为新型除草剂开发的重要先导化合物。未来研究可围绕以下方向展开：(1) 结构优化：基于 SAR 分析，进一步调整取代基的类型与位置(如缩短 SA-8 的碳链以提升对单子叶杂草的活性)，增强化合物的靶向性与环境稳定性；(2) 作用机制解析：通过蛋白质组学、代谢组学技术，明确 SA 衍生物与靶标蛋白的相互作用及对杂草代谢通路的影响；(3) 环境风险评估：测试化合物在土壤中的降解速率、对非靶标生物(如蜜蜂、蚯蚓)的毒性，评估其生态安全性。这些研究将加速 SA 衍生物向产业化应用的转化，为解决农业生产中的杂草防控难题提供创新思路与物质基础。

3　结论

本研究以 SA 为母体，针对其羟基与羧基设计两条合成路线，成功制备 18 种 SA 衍生物，且所有化合物结构均经 ^{1}H NMR、^{13}C NMR 及 HRMS 确证。通过多阶段活性测试发现，SA-1、SA-2 和 SA-8 三种衍生物表现突出：低浓度(10 μg/L)下可显著抑制油菜、稗草种子萌发及苹果幼苗根伸长；高剂量(1 500 g/ha)时对油菜、苋菜、稗草、马唐的抑制率达 85%～100%，除草活性优于天然 SA 且部分指标接近或超过商品化除草剂。研究证实，对 SA 进行结构修饰可增强其除草活性与选择性，筛选出的 3 种衍生物为新型高效、低毒除草剂研发提供优质先导化合物，也为靶向植物激素信号通路的除草策略提供实验支撑。

参　考　文　献

[1] 陈静彬. 粮食安全与耕地保护研究-以湖南省为例[D]. 长沙：中南大学，2010.

[2] 柴民杰，李磊，孟祥龙. 北方地区田间机械除草关键技术与装置研究[J]. 南方农机，2017，48(6)：3.

[3] 戴玲玲，梁蓉，谢广乐，等. 抗除草剂作物的研发与应用进展[J]. 杂草学报，2024，42(1)：1-16.

[4] 范莉，王妍，祝好，等. 多种光谱指数联合地形特征对复杂地形区主要粮食作物种植面积的遥感识别[J]. 中国农业气象，2023，44(9)：845-856.

[5] 金凤. 化学除草剂对环境的污染及防治对策[J]. 绿色科技，2018，20(8)：139-140.

[6] MU T，LUO S，LI L，et al. A review of the interaction mechanisms between jasmonic acid (JA) and various plant hormones，as well as the core regulatory role of MYC_2[J]. Plant Science，2025，112407.

[7] NASEEM M，KALTDORF M，DANDEKAR T. The nexus between growth and defence signalling：auxin and cytokinin modulate plant immune response pathways[J]. Journal of Experimental Botany，2015，66(16)：4885-4896.

[8] ROYCHOWDHURY R，HADA A，BISWAS S，et al. Jasmonic acid(JA) in plant immune response：unravelling complex molecular mechanisms and networking of defence signalling against pathogens[J]. Journal of Plant Growth Regulation，2025，44(1)：89-114.

[9] KONG X，ZHANG C，ZHENG H，et al. Antagonistic interaction between auxin and SA signaling pathways regulates bacterial infection through lateral root in arabidopsis[J]. Cell Reports，2020，32(8)：108060.

[10] RAWAT S. S，LAXMI A. Rooted in communication：exploring auxin-salicylic acid nexus in root growth and development[J]. Plant，Cell & Environment，2025，48(6)：4140-4160.

[11] MIYUKI K. Studies on the mechanism of agricultural chemicals focused on plant hormone signals[J]. Journal of Pesticide Science，2019，44(4)：270-274.

[12] 李祖任，马褚健，罗丁峰. 基于靶标结构的除草剂设计与合成研究进展[J]. 生命科学研究，2024，28(6)：583-600.

[13] CHTOUROU M，OSUNA D M，MARÍN M G，et al. Occurrence and mechanisms conferring multiple resistance to ALS-inhibiting and auxins mimics herbicides in papaver rhoeas from tunisia[J]. Agronomy，2024，14(6)：1249.

[14] HAN H W，ZHANG B F，JI X S，et al. Auxin-salicylic acid seesaw regulates the age-dependent balance between plant growth and herbi-

中国知网　https://www.cnki.net

vore defense[J]. Science Advances, 2025, 11(19): eadu5141.

[15] WANG H, TANG G, ZHOU Z, et al. Stable fluorescent nanoparticles based on Co-assembly of acifluorfen and poly(salicylic acid) for enhancing herbicidal activity and reducing environmental risks[J]. ACS Applied Materials & Interfaces, 2023, 15(3):4303-4314.

[16] SPOEL S H, DONG X. Salicylic acid in plant immunity and beyond[J]. The Plant Cell, 2024, 36(5): 1451-1464.

[17] LI A, SUN X, LIU L. Action of salicylic acid on plant growth[J]. Frontiers in Plant Science, 2022, 13: 878076.

[18] KIM T J, LIM G H. Salicylic acid and mobile regulators of systemic immunity in plants: transport and metabolism[J]. Plants (Basel, Switzerland), 2023, 12(5): 1013.

[19] LI J, CHEN C, ZHANG W, et al. Salsalate reverses metabolic disorders in a mouse model of non-alcoholic fatty liver disease through AMPK activation and caspase-6 activity inhibition[J]. Basic & Clinical Pharmacology & Toxicology, 2021, 128(3): 394-409.

[20] WANG Y, MOSTAFA S, ZENG W, et al. Function and mechanism of jasmonic acid in plant responses to abiotic and biotic stresses[J]. International Journal of Molecular Sciences. 2021 Aug 9;22(16):8568.

[21] CAO S, HUANG S, YANG C, et al. ZIF-67-modified magnetic nanoparticles for extraction of phenoxy carboxylic acid herbicides[J]. Analytical Methods, 2023, 15(41): 5483-5491.

[22] JIANG M J, WANG Y F, LI W, et al. Investigating resistance levels to cyhalofop-butyl and mechanisms involved in Chinese sprangletop (Leptochloa chinensis L.) from Anhui Province, China[J]. Pesticide Biochemistry and Physiology, 2022, 186: 105165.

[23] BAI J, ZHAO S Y, FAN X Q, et al. Inhibitory effects of flavonoids on P-glycoprotein in vitro and in vivo: food/herb-drug interactions and structure-activity relationships[J]. Toxicology and Applied Pharmacology, 2019, 369: 49-59.

[24] SULE R O, MORISSEAU C, YANG J, et al. Triazine herbicide prometryn alters epoxide hydrolase activity and increases cytochrome P450 metabolites in murine livers via lipidomic profiling[J]. Scientific Reports, 2024, 14(1): 19135.

[25] SHI X, SUN J, YAO Y, et al. Novel electrochemical aptasensor with dual signal amplification strategy for detection of acetamiprid[J]. Science of the Total Environment, 2020, 705: 135905.

[26] ASWANI M T, YADAV M, KUMAR A V, et al. Ultrasound-acid modified Merremia vitifolia biomass for the biosorption of herbicide 2,4-D from aqueous solution[J]. Water Science and Technology, 2020, 82(3): 468-480.

[27] LIM T Y M, JALADANKI C K, WONG Y H, et al. Tanomastat exerts multi-targeted inhibitory effects on viral capsid dissociation and RNA replication in human enteroviruses[J]. eBioMedicine, 2024, 107: 105277.

(责任编辑:刘庆松)

中国知网 https://www.cnki.net

文章编号 1672-6634(2026)02-0307-10 **DOI** 10.19728/j.issn1672-6634.2025060007

支撑材料

Supporting Information

基于水杨酸结构的衍生物合成及其除草活性研究

商金海,刘卓群,刘倩,于薏珊,范润鹏,李攀

(聊城大学 药学与食品工程学院,山东 聊城 252059)

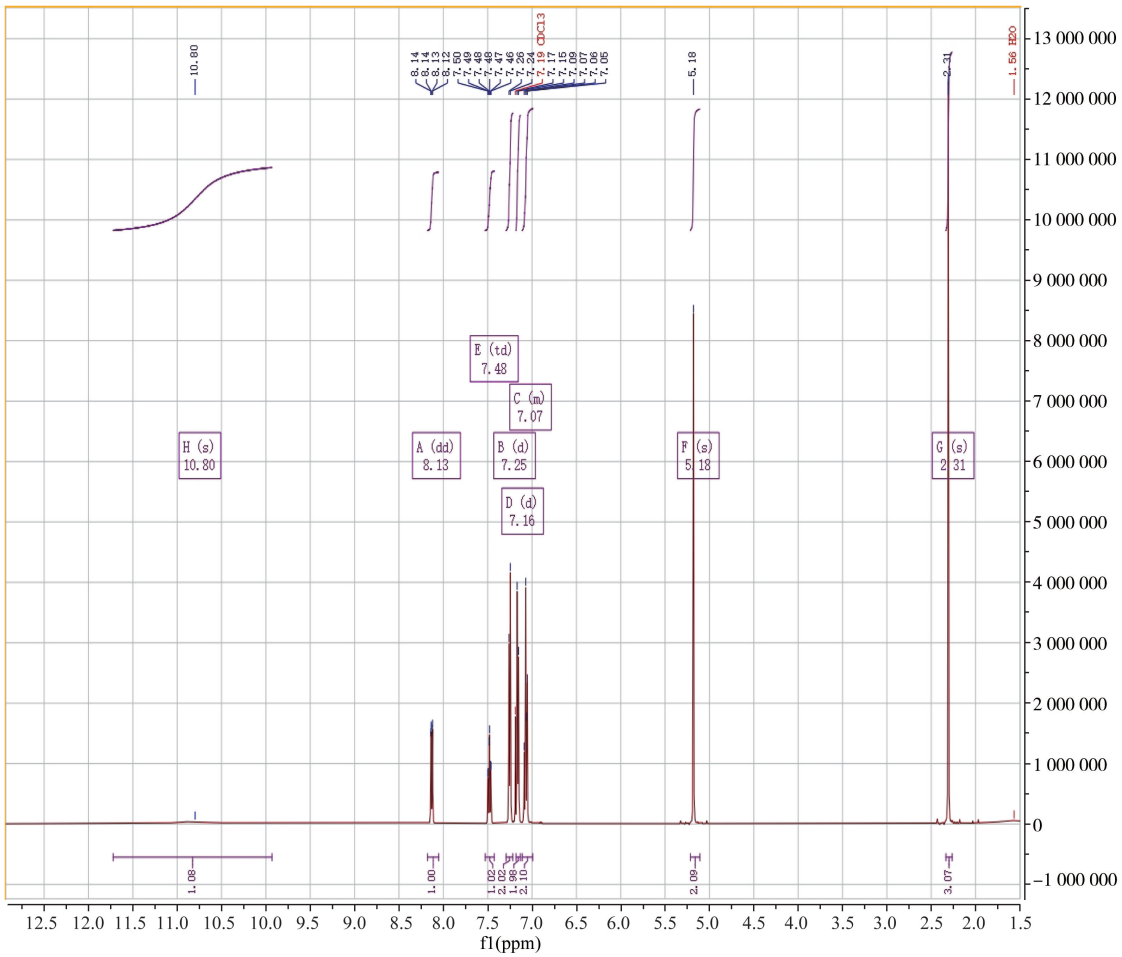
The study on synthesis of salicylic acid derivatives and their herbicidal activity

SHANG Jinhai, LIU Zhuoqun, LIU Qian, YU Yishan, FAN Runpeng, LI Pan

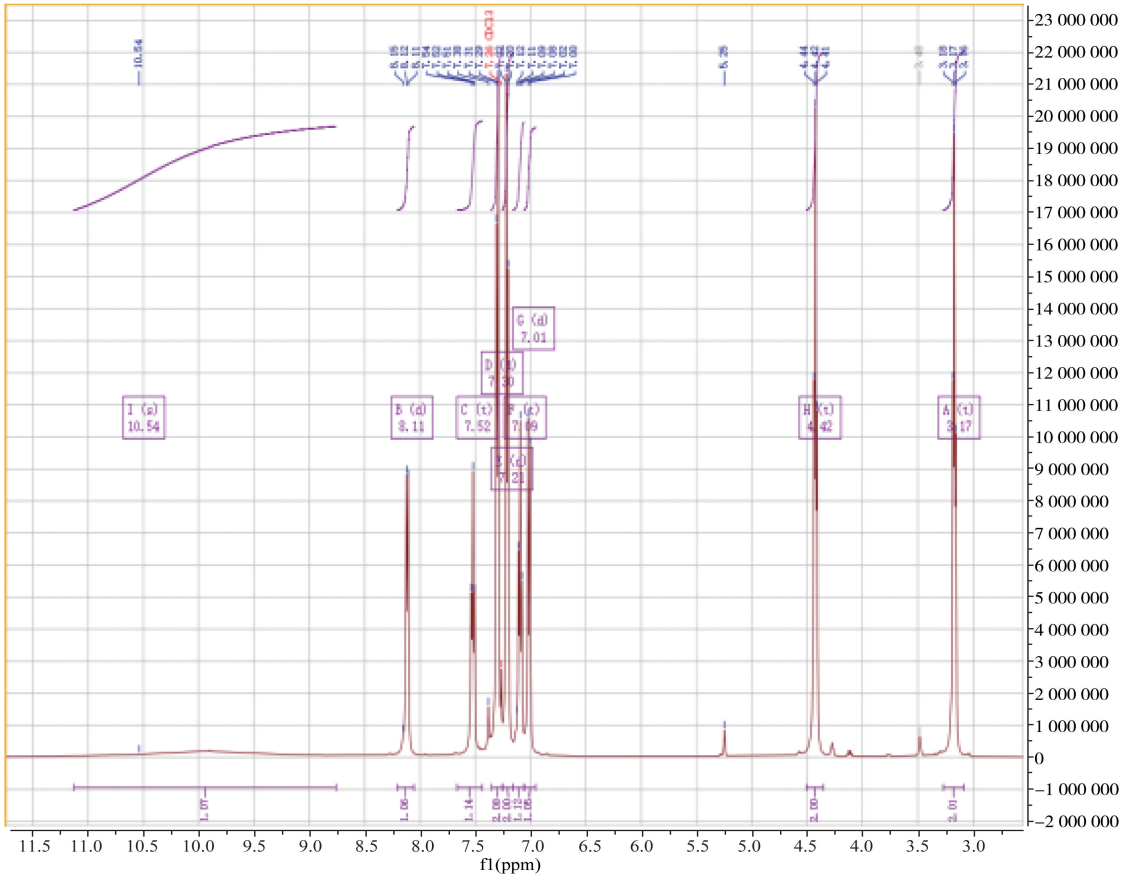
(School of Pharmaceutical Sciences and Food Engineering , Liaocheng University, Liaocheng 252059, China)

图 S1 SA 衍生物的核磁氢谱图(从上到下依次是 SA-1 至 SA-18)

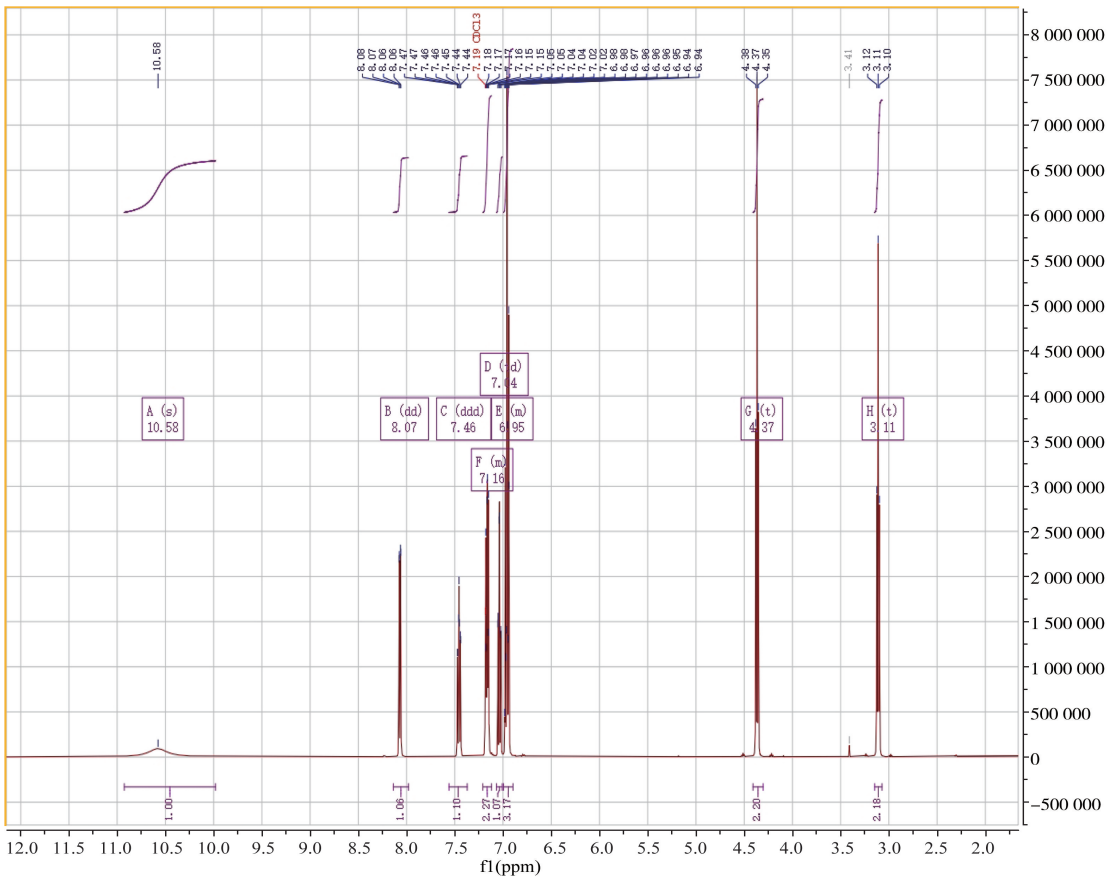
Fig. S1 NMR hydrogen spectra of SA derivatives (From top to bottom, SA-1 to SA-18)



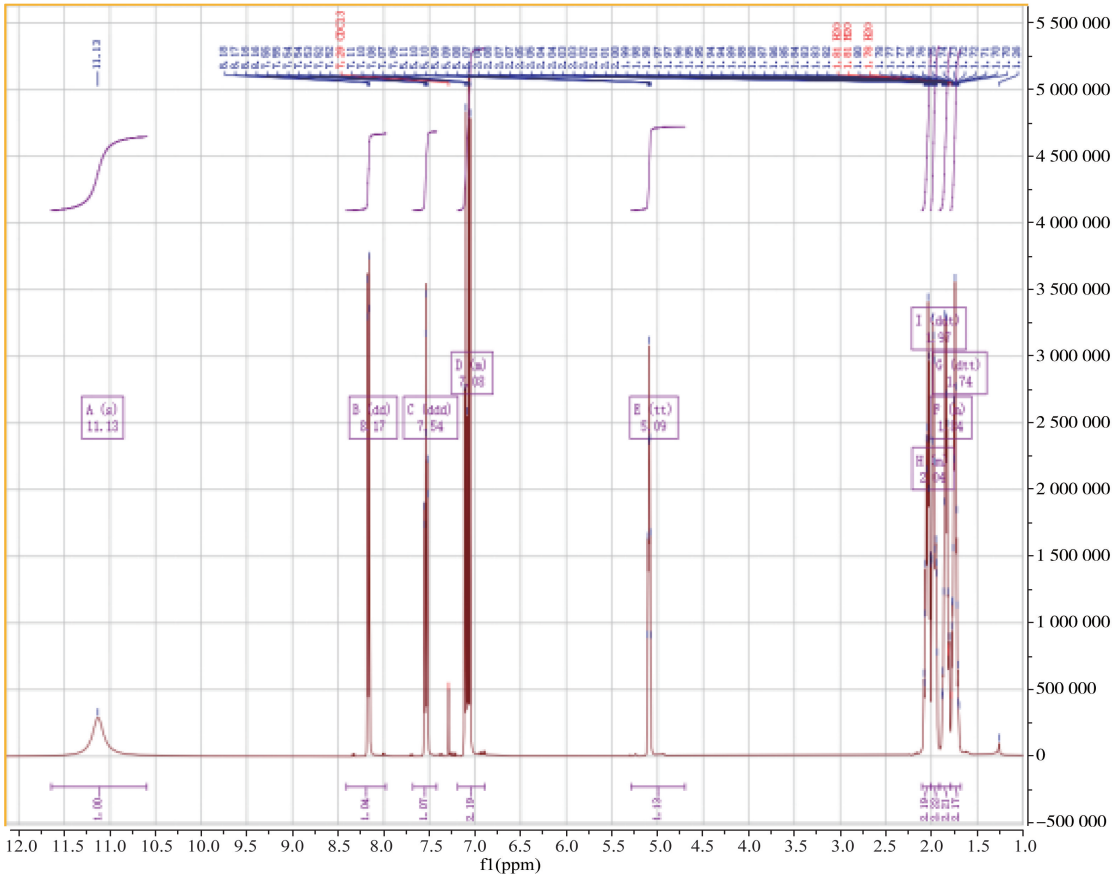
SA-1:2-((4-甲基苄基) 氧基) 苯甲酸(2-((4-methylbenzyl) oxy) benzoic acid)



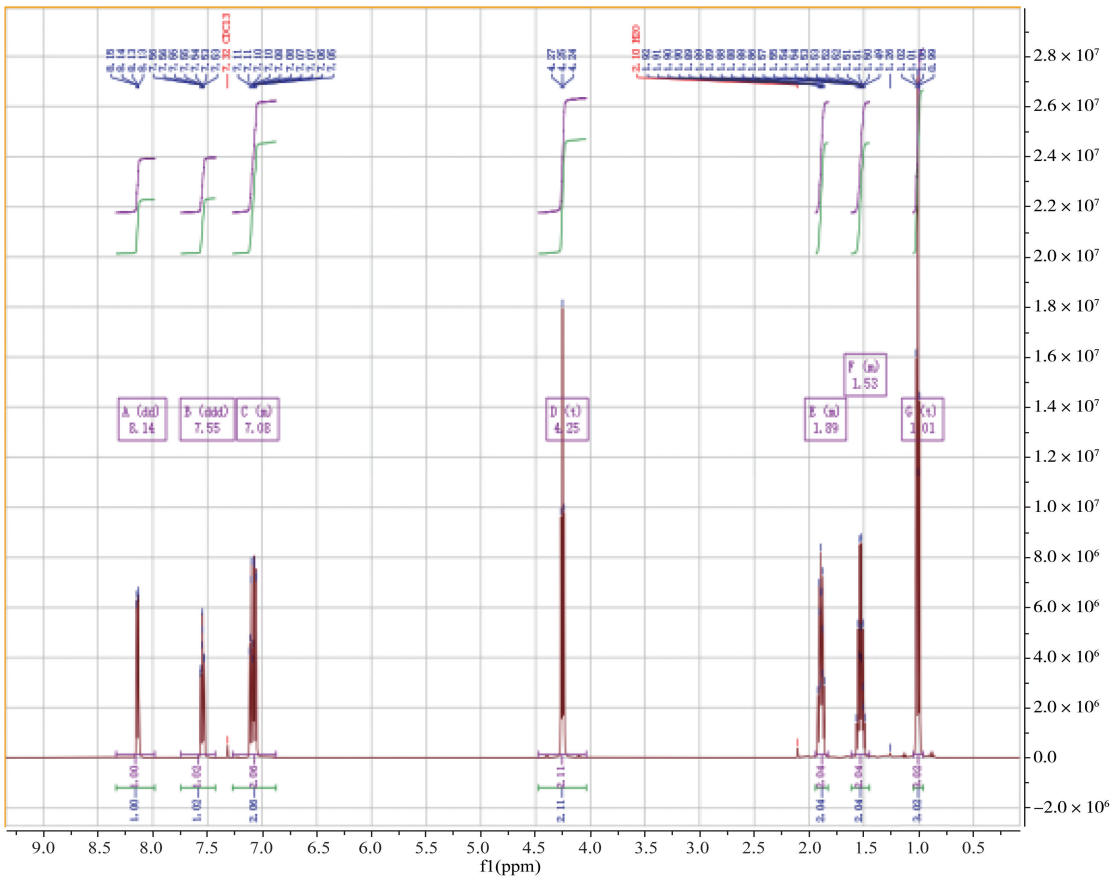
SA-2：2-(4-氯苯乙氧基) 苯甲酸(2-(4-chlorophenethoxy) benzoic acid)



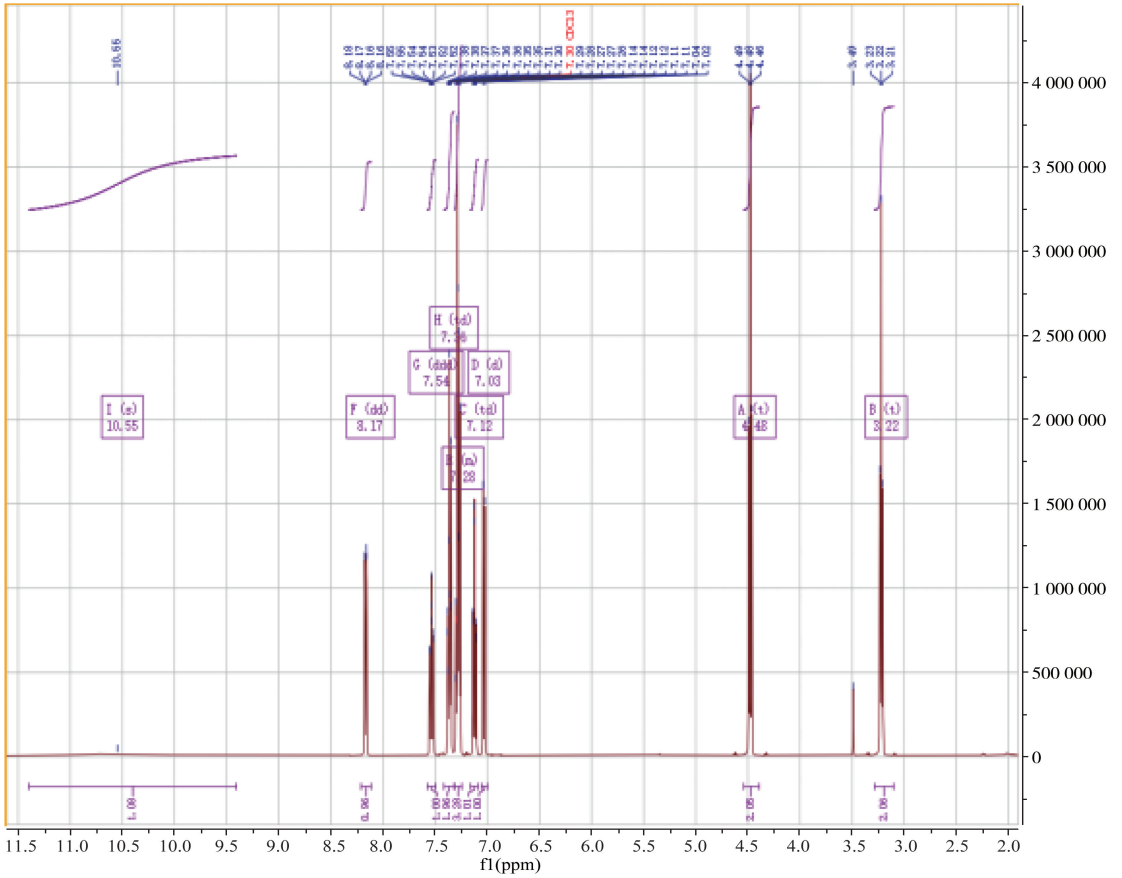
SA-3：2-(4-氟苯乙氧基) 苯甲酸(2-(4-fluorophenethoxy) benzoic acid)



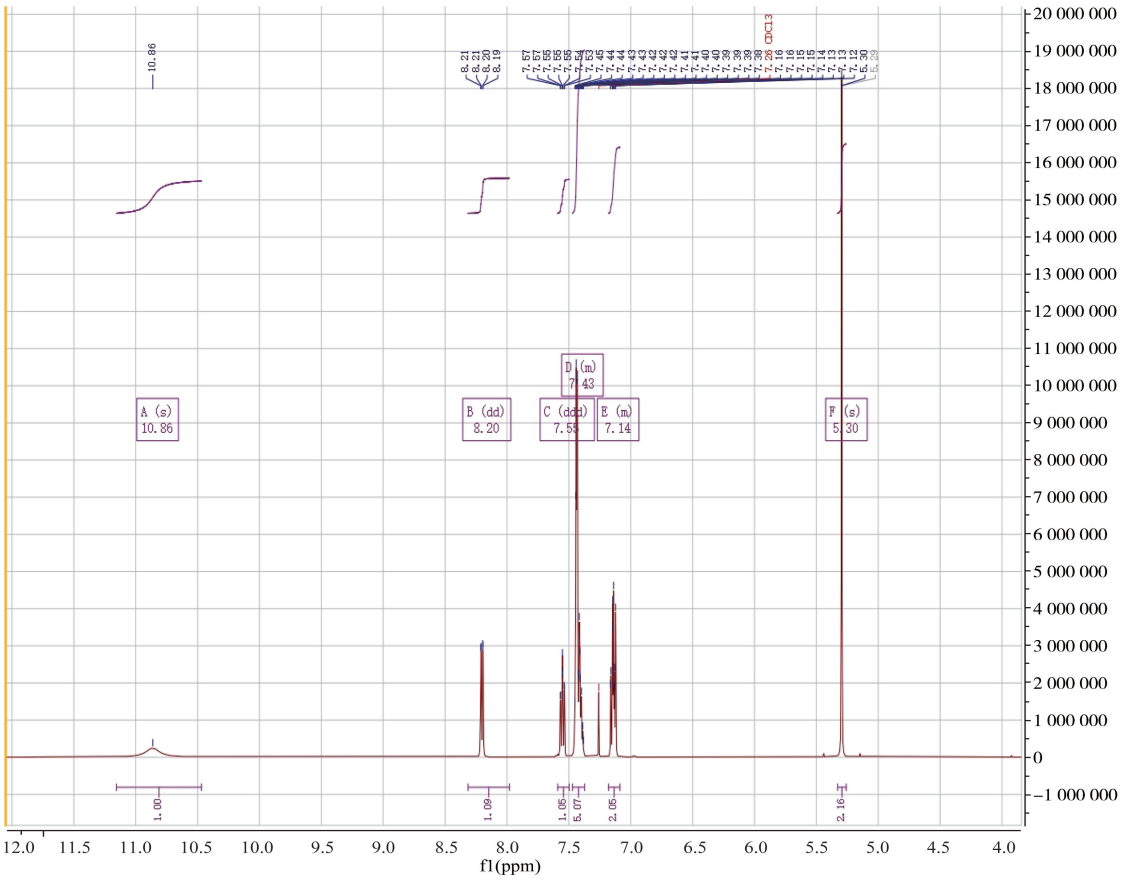
SA-4:2-环戊氧基苯甲酸(2-(cyclopentyloxy) benzoic acid)



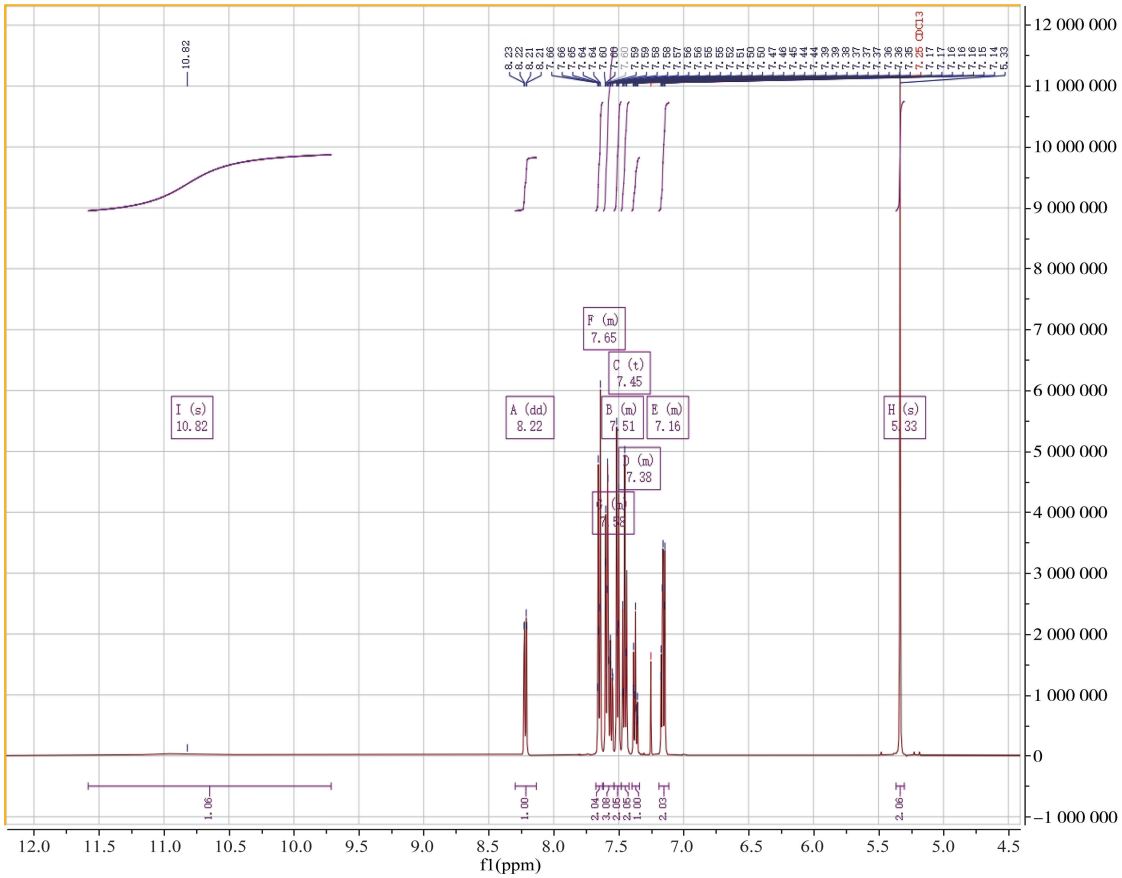
SA-5:2-丁氧基苯甲酸(2-butoxybenzoic acid)



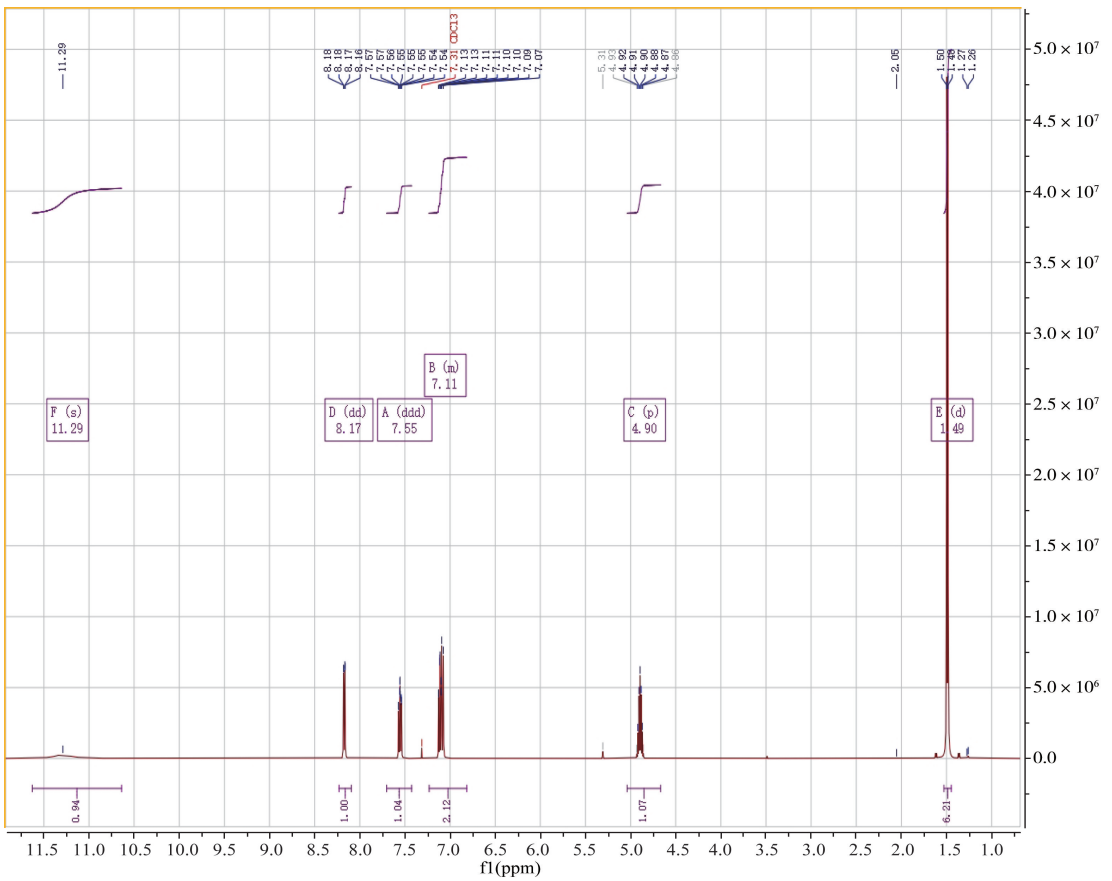
SA-6：2-苯乙氧基苯甲酸（2-phenethoxybenzoic acid）



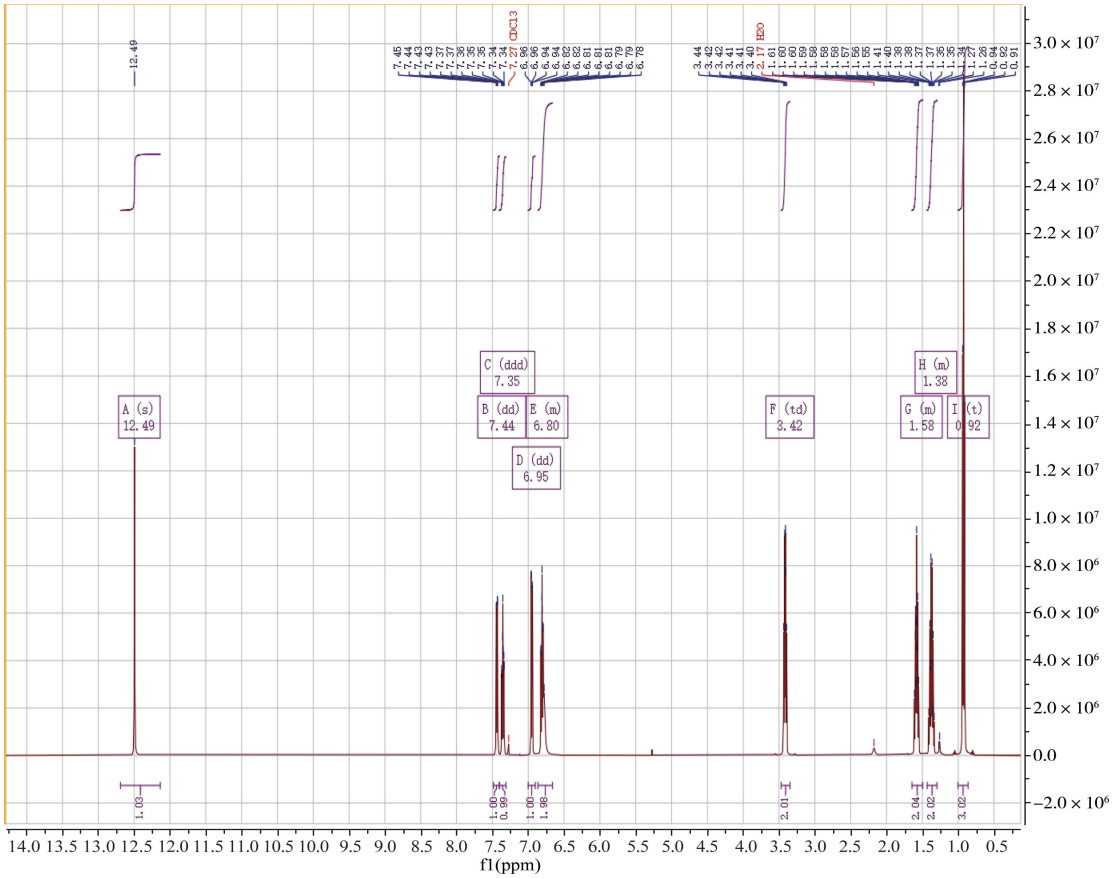
SA-7：2-苄氧基苯甲酸（2-（benzyloxy） benzoic acid）



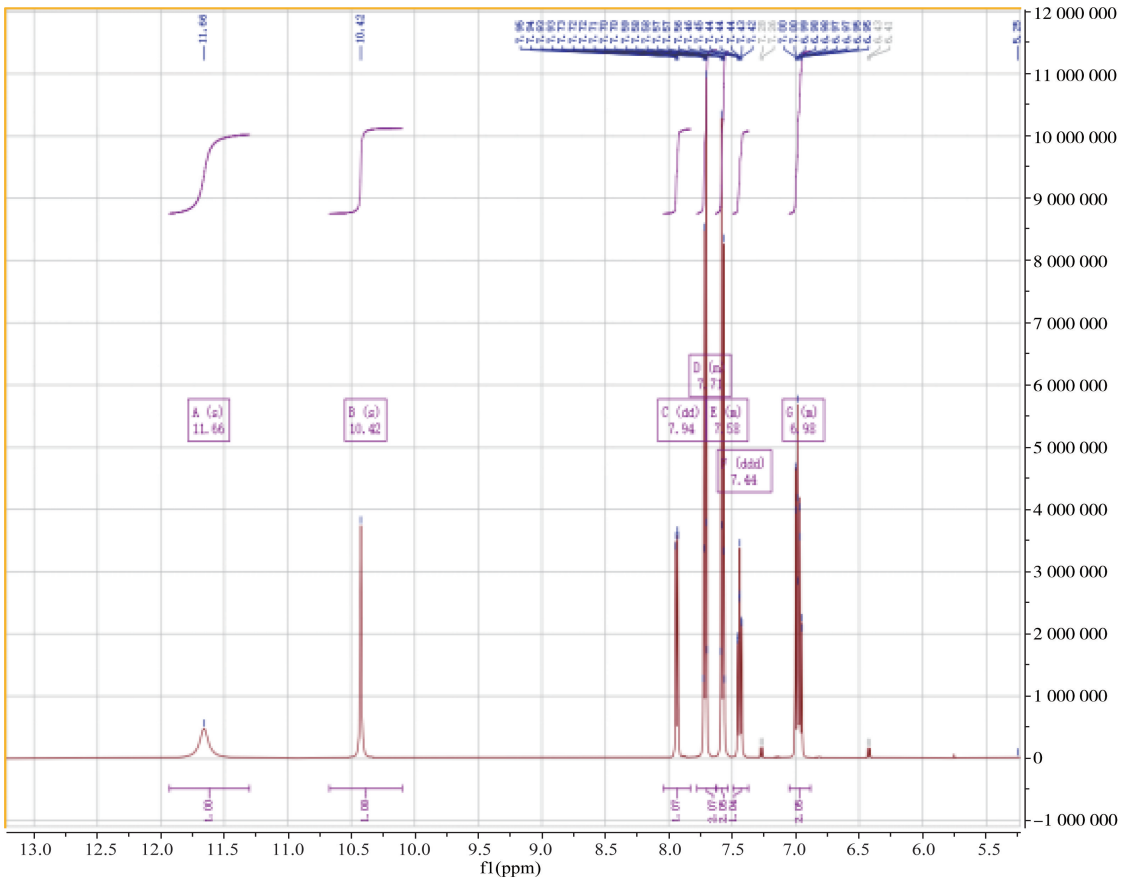
SA-8:2-([1,1′-联苯]-4-基甲氧基) 苯甲酸(2-([1,1′-biphenyl]-4-ylmethoxy) benzoic acid)



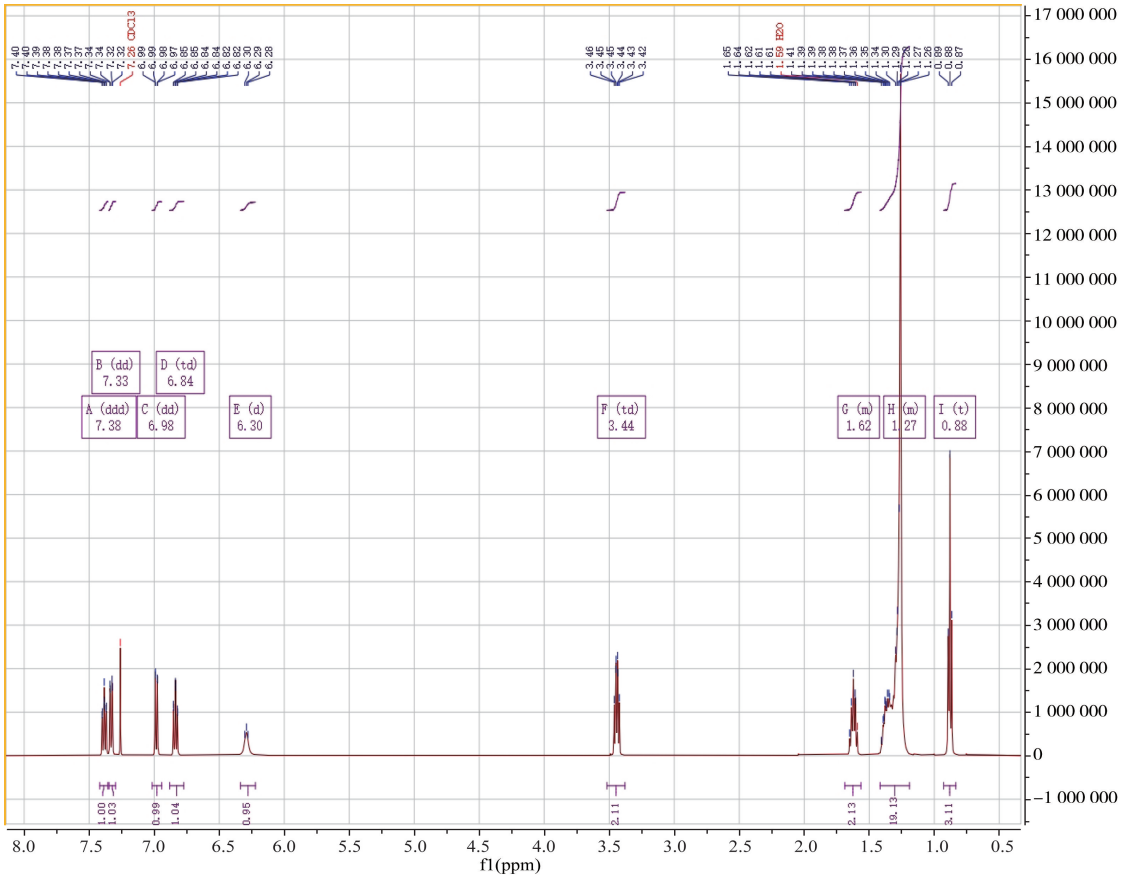
SA-9:2-异丙氧基苯甲酸(2-isopropoxybenzoic acid)



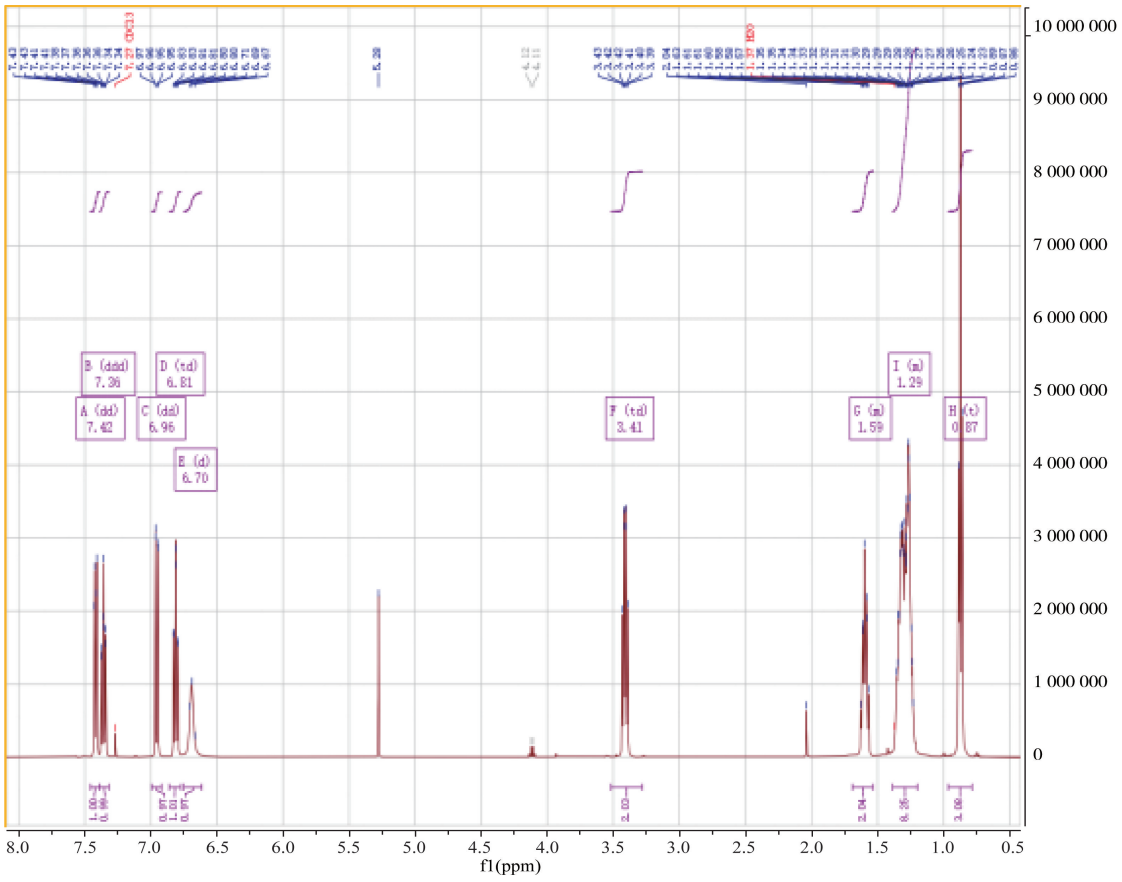
SA-10：2-(丁基氨基甲酰基) 苯甲酸(2-(butylcarbamoyl) benzoic acid)



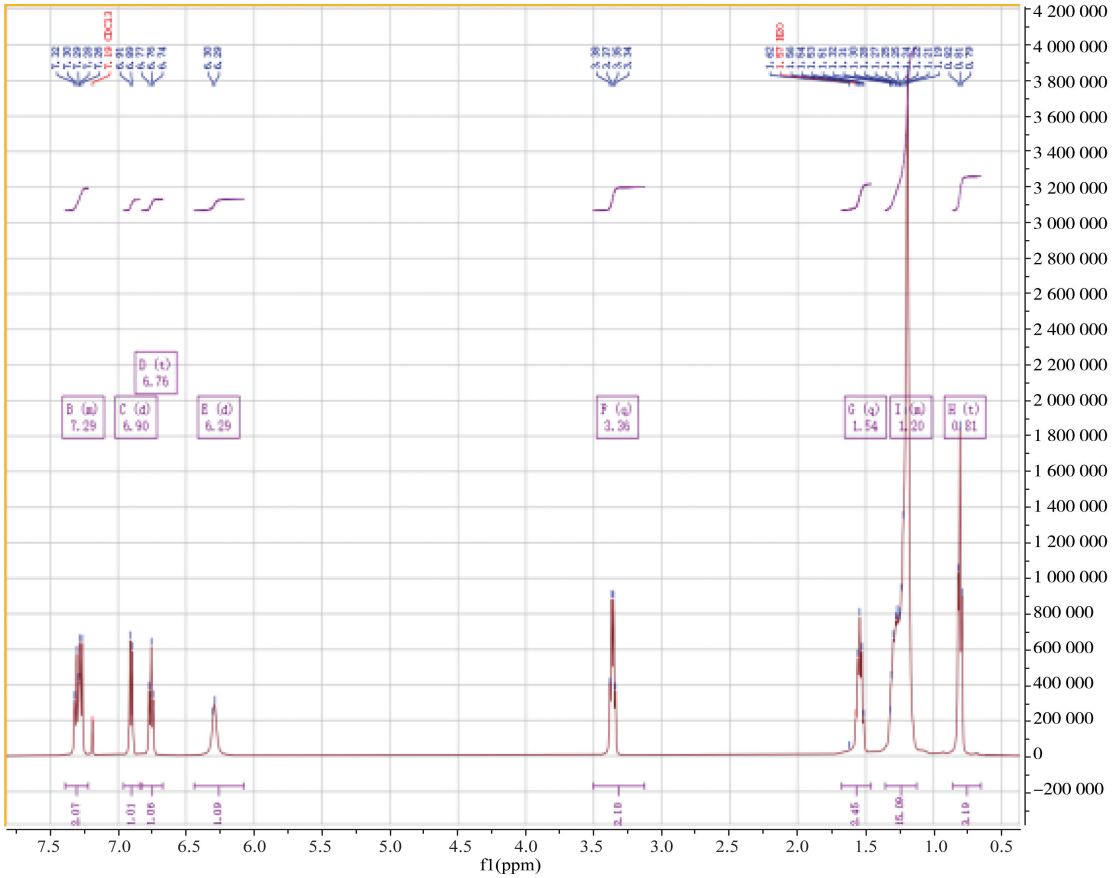
SA-11：2-((4-碘苯基) 氨基甲酰基) 苯甲酸(2-((4-iodophenyl) carbamoyl) benzoic acid)



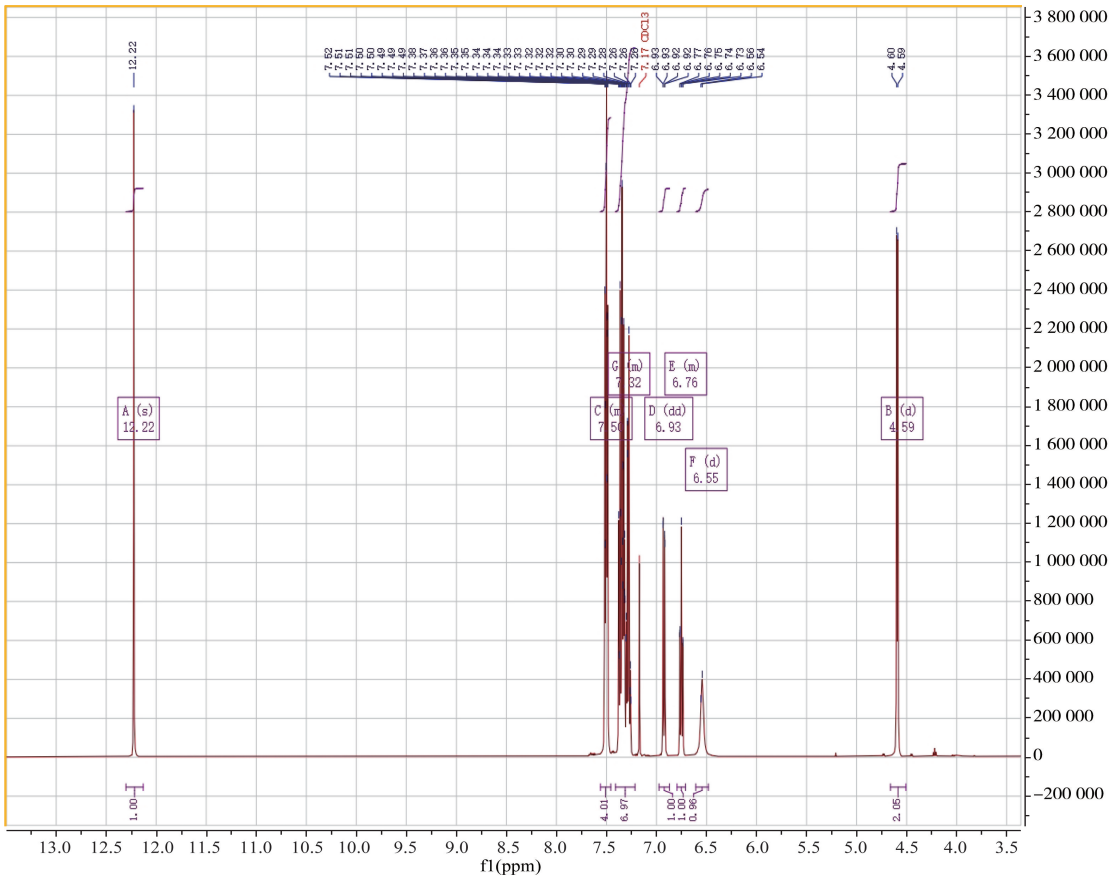
SA-12:2-(十二烷基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(dodecylcarbamoyl) benzoic acid)



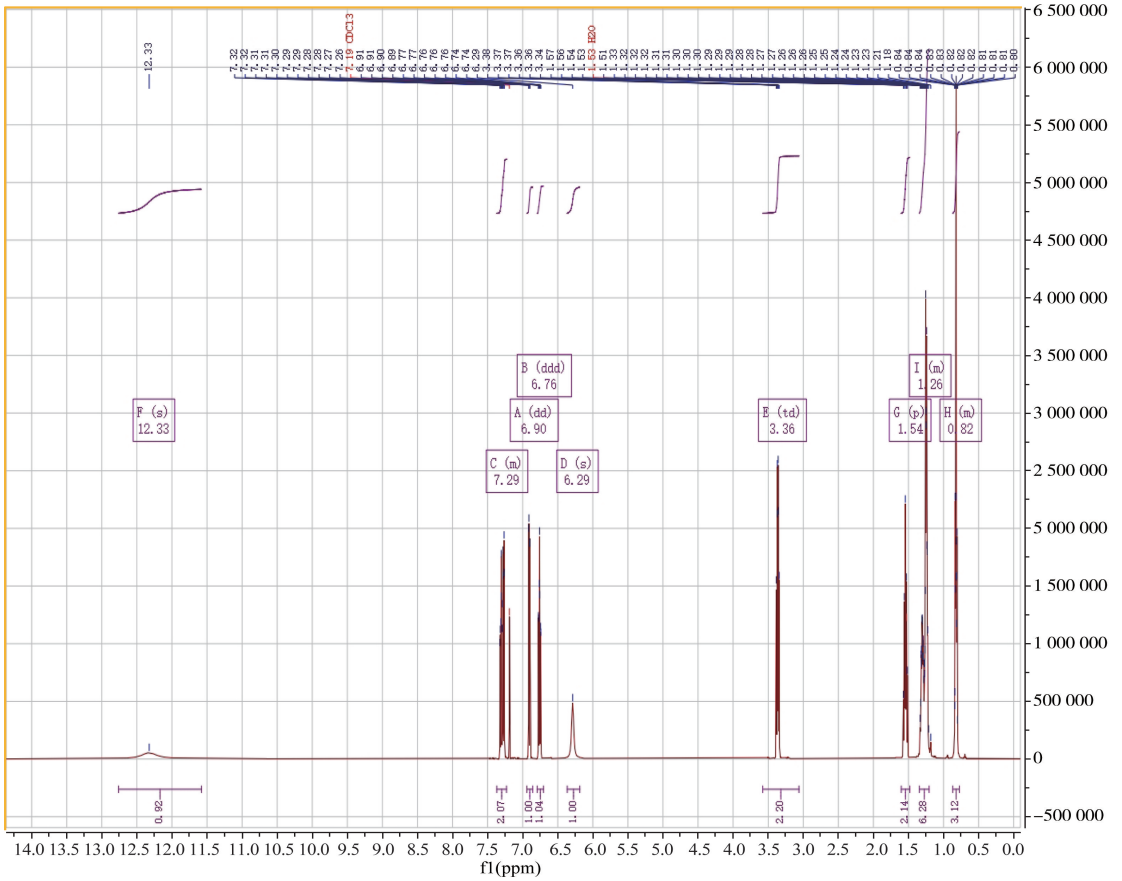
SA-13:2-(庚基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(heptylcarbamoyl) benzoic acid)



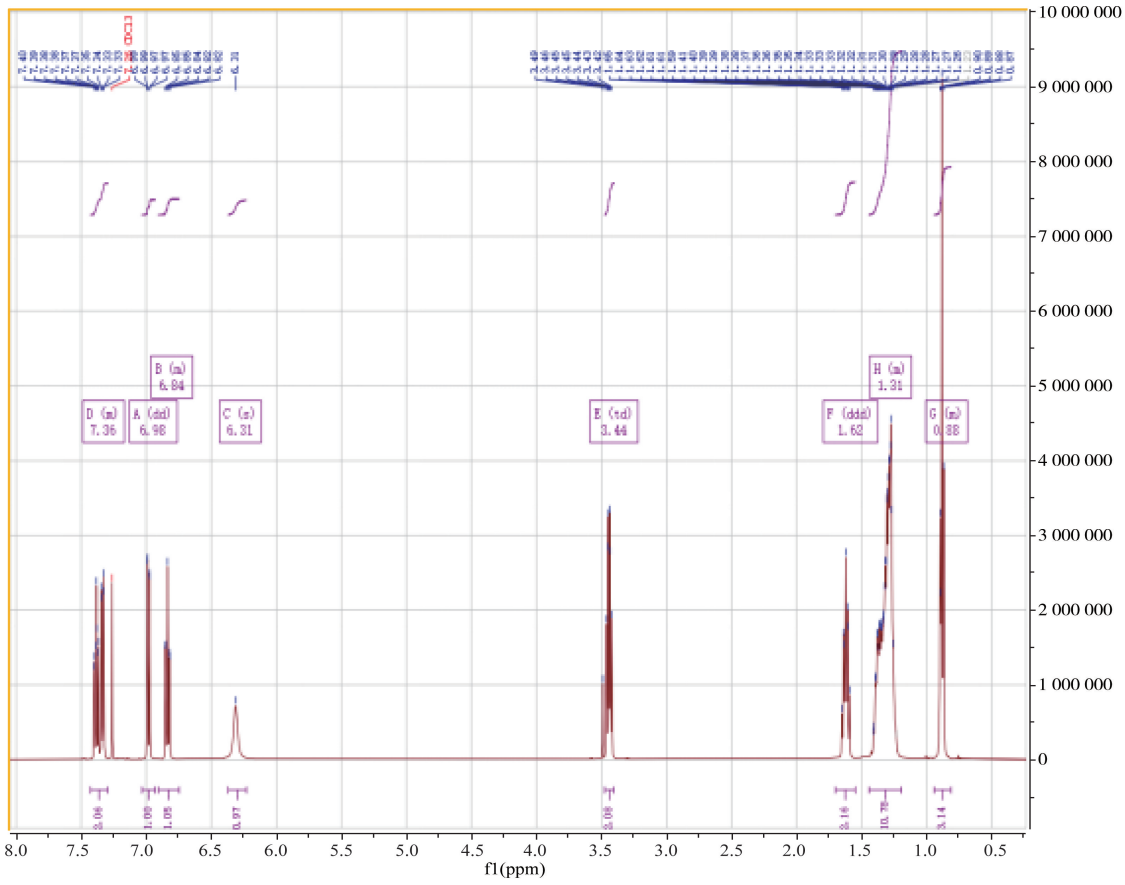
SA-14：2-(癸基氨基甲酰基) 苯甲酸(2-(decylcarbamoyl) benzoic acid)



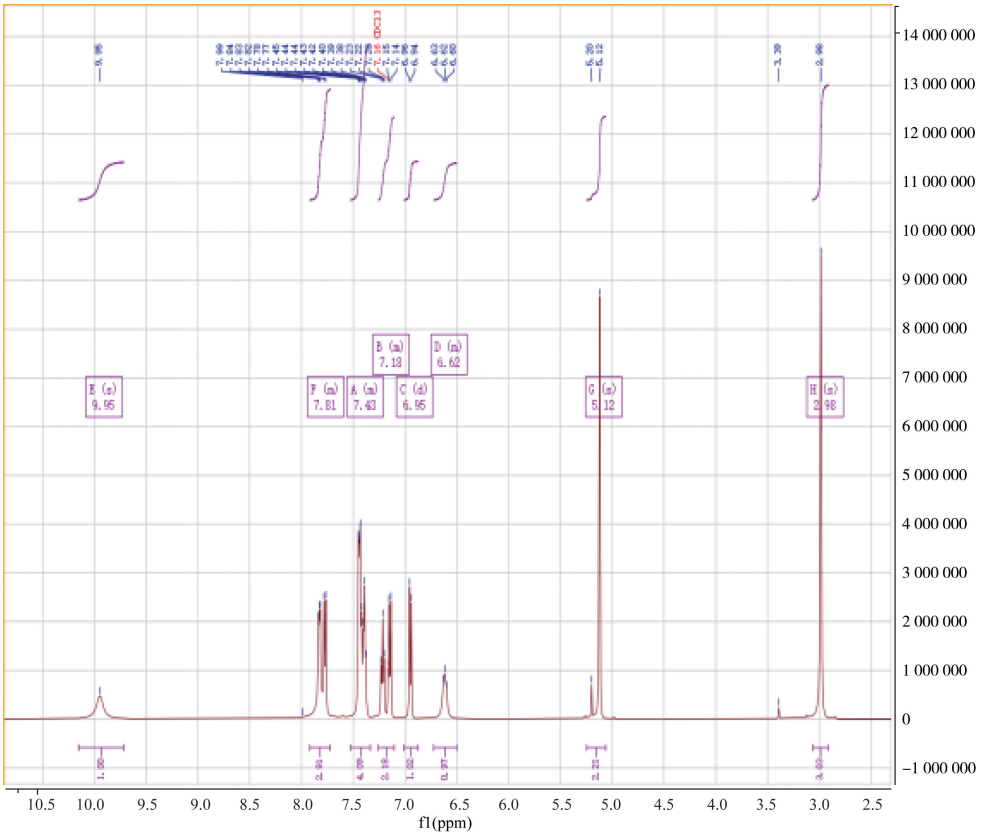
SA-15：2-([1,1′-联苯]-4-基甲基氨基甲酰基) 苯甲酸(2-(([1,1′-biphenyl]-4-ylmethyl) carbamoyl) benzoic acid)



SA-16:2-(己基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(hexylcarbamoyl) benzoic acid)



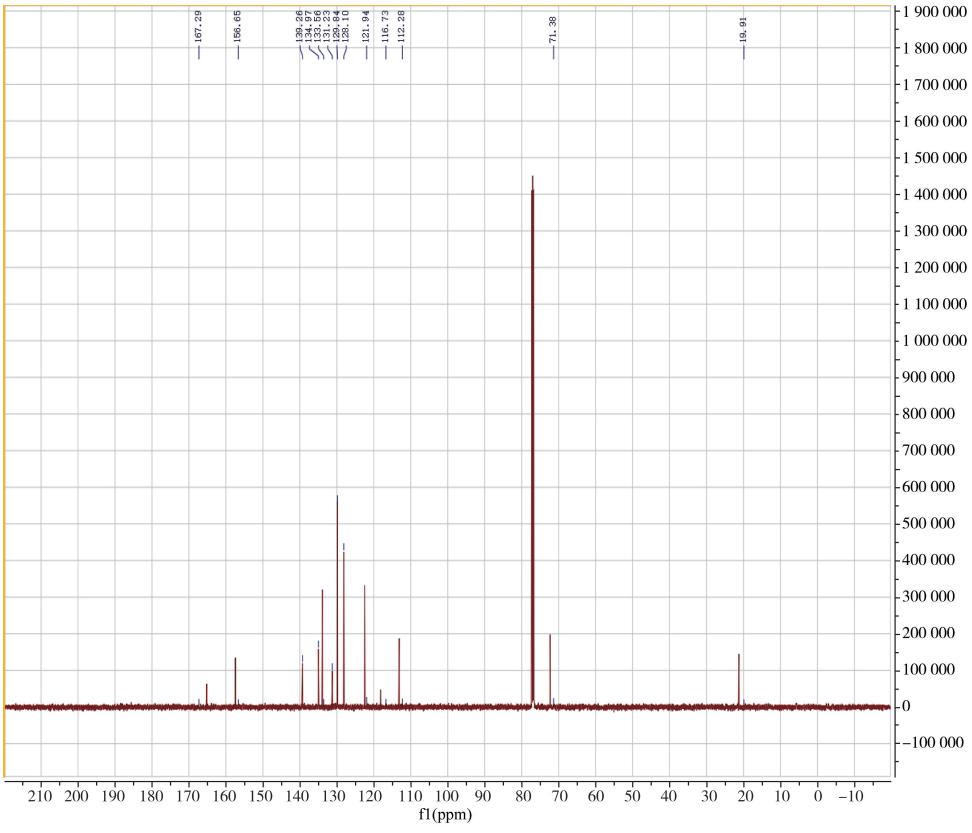
SA-17:2-(辛基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(octylcarbamoyl) benzoic acid)



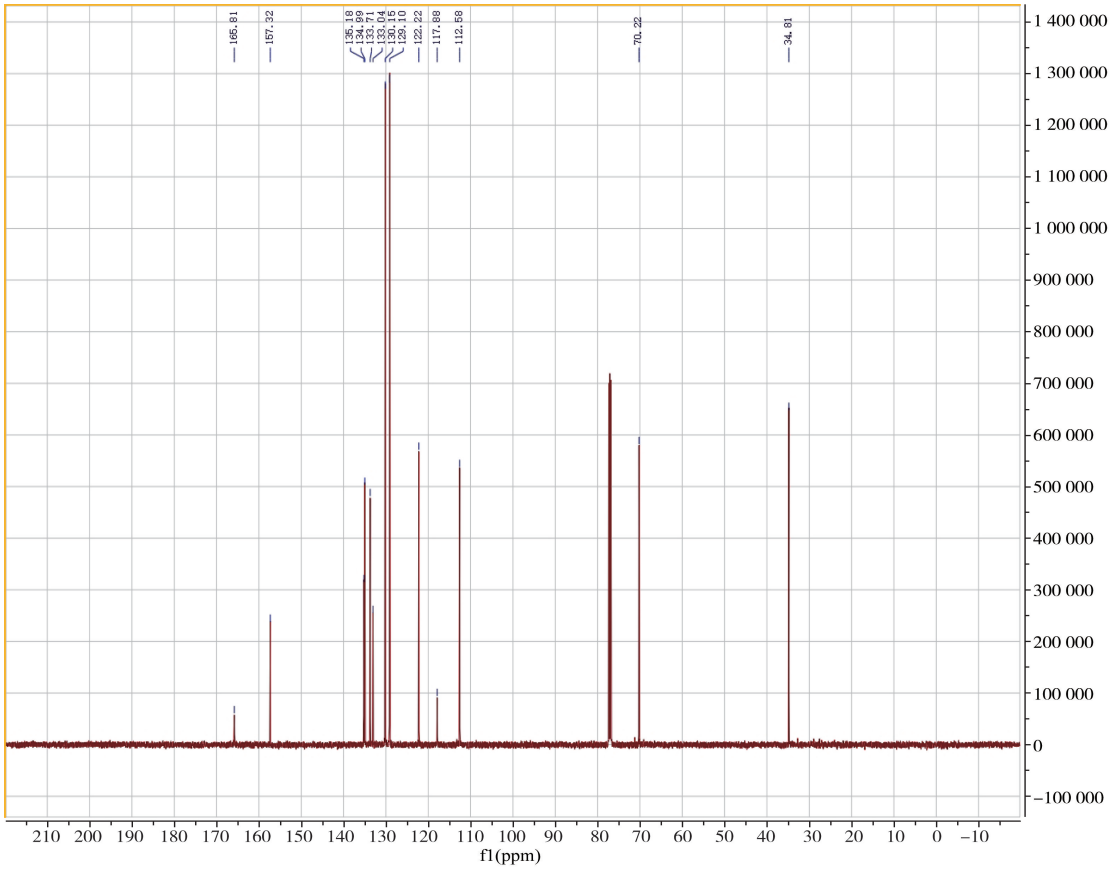
SA-18：2-((2-萘基甲基) 氨基甲酰基) 苯甲酸(2-((naphthalen-2-ylmethyl) carbamoyl) benzoic acid)

图 S2　SA 衍生物的核磁碳谱图(从上到下依次是 SA-1 至 SA-18)

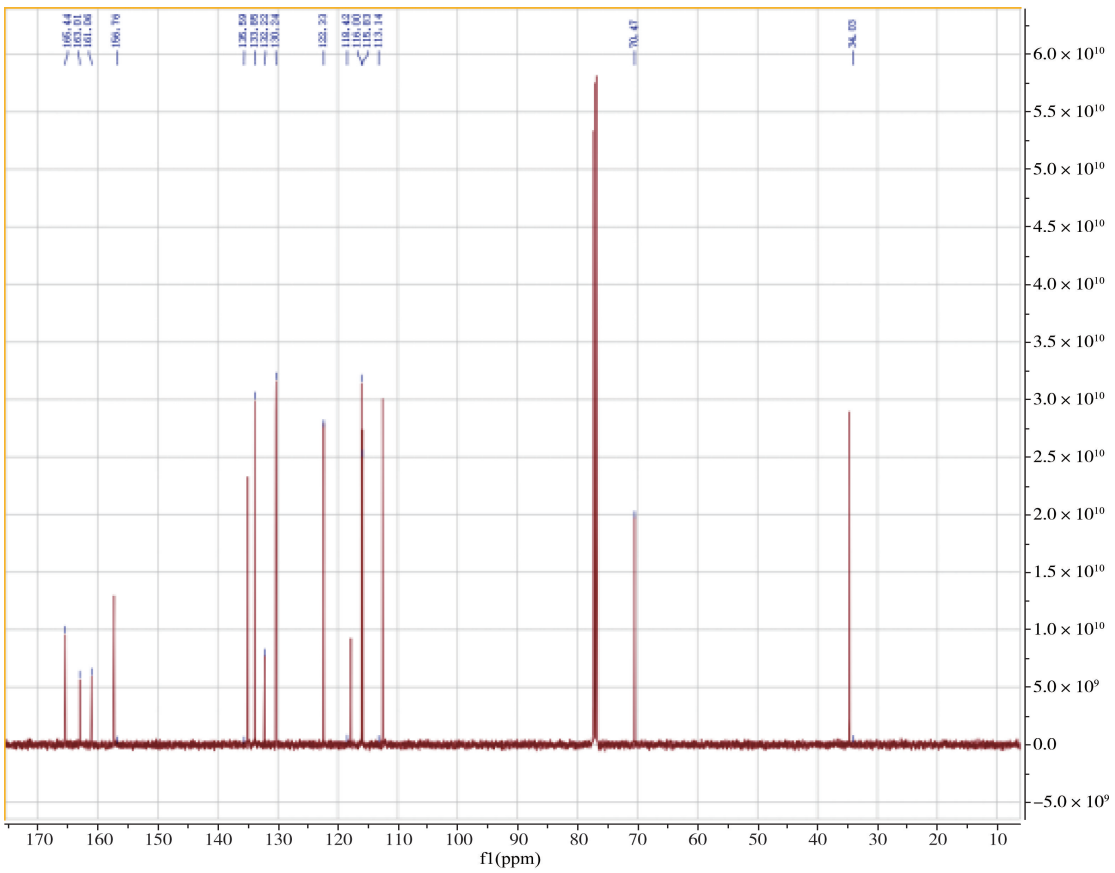
Fig. S2　NMR carbon spectra of SA derivatives (from top to bottom, SA-1 to SA-18)



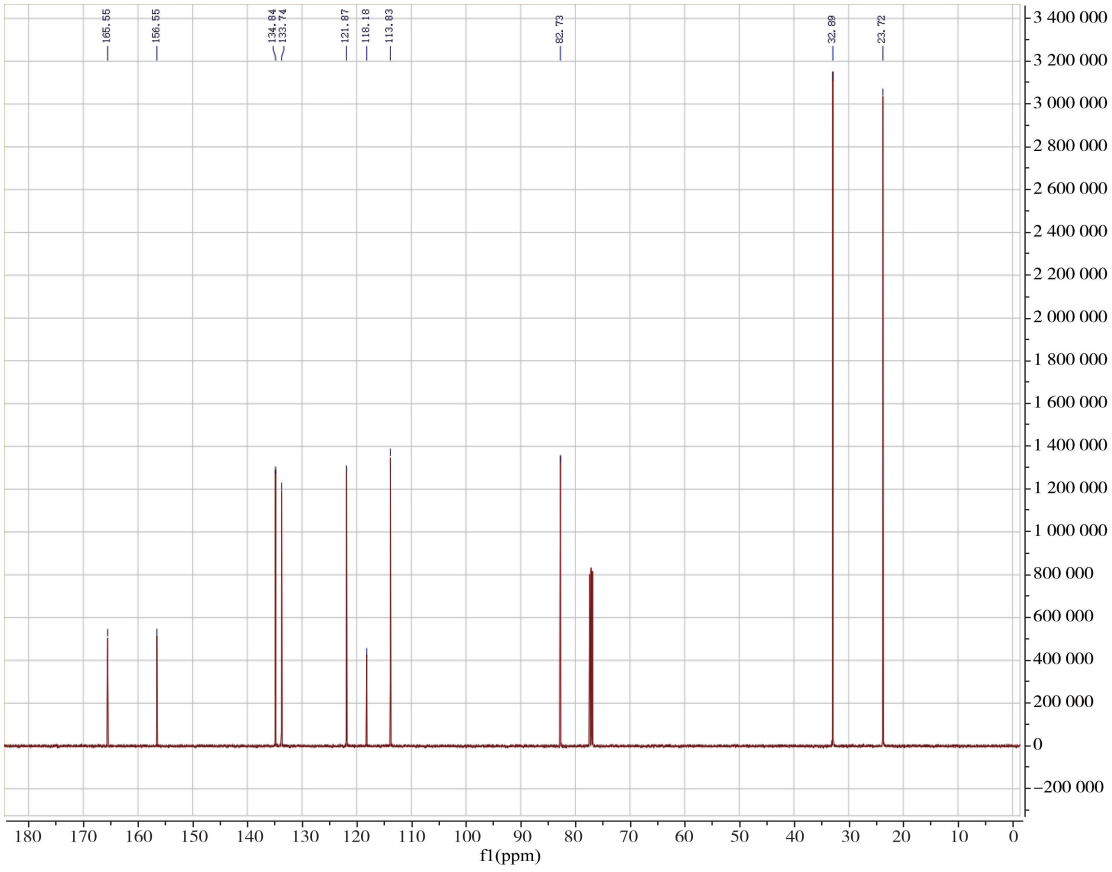
SA-1：2-((4-甲基苄基) 氧基) 苯甲酸(2-((4-methylbenzyl) oxy) benzoic acid)



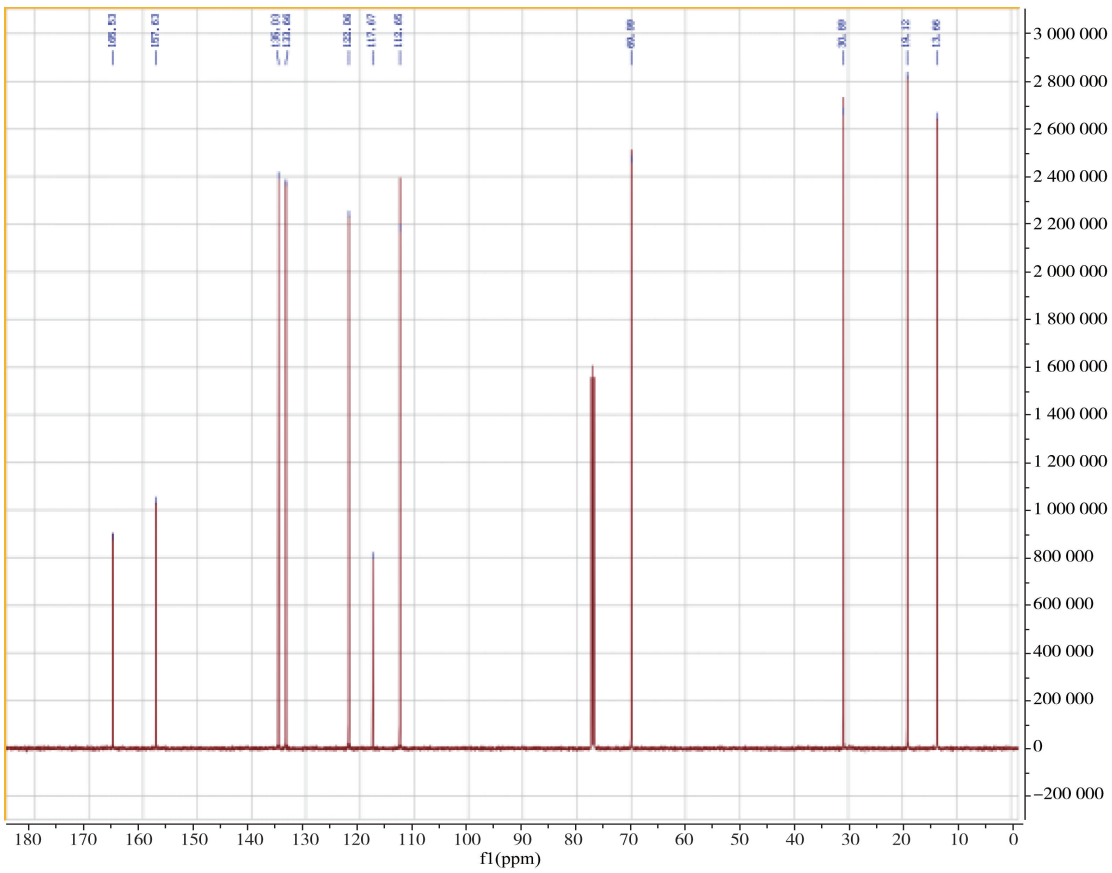
SA-2:2-(4-氯苯乙氧基)苯甲酸(2-(4-chlorophenethoxy) benzoic acid)



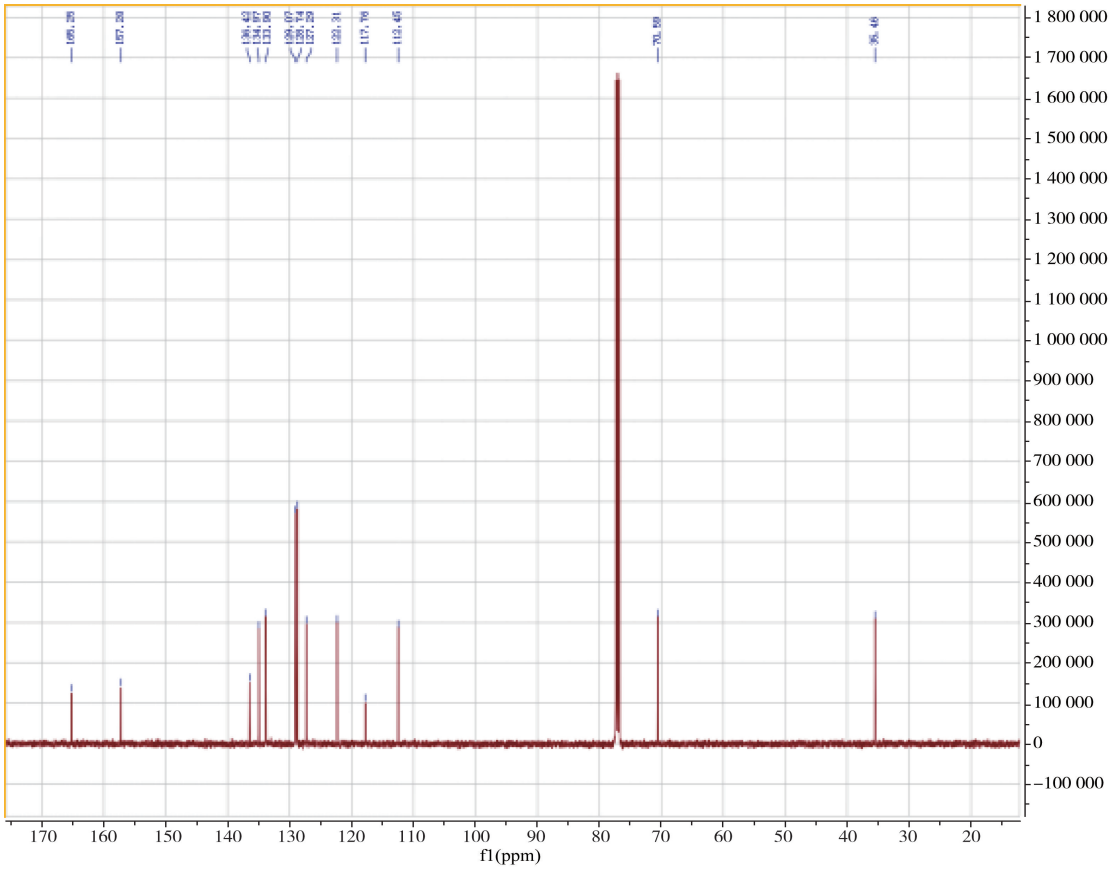
SA-3:2-(4-氟苯乙氧基)苯甲酸(2-(4-fluorophenethoxy) benzoic acid)



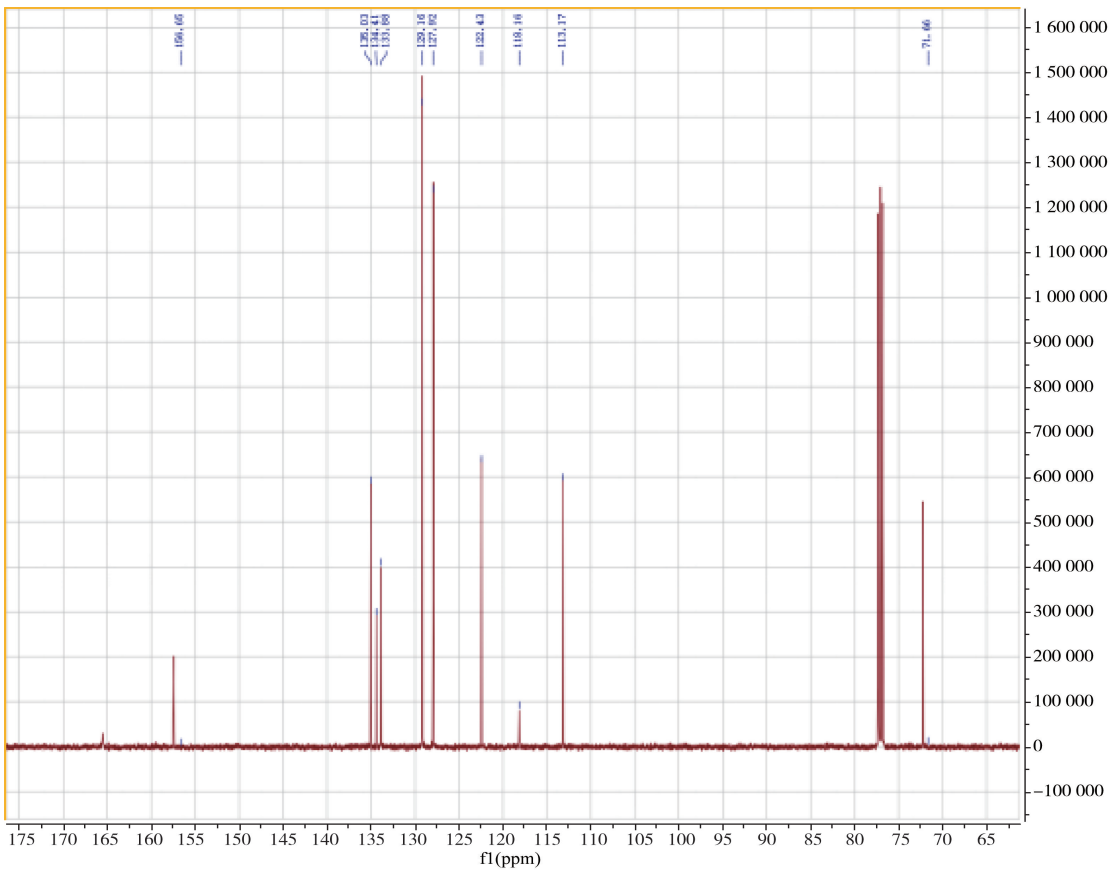
SA-4：2-环戊氧基苯甲酸（2-(cyclopentyloxy) benzoic acid）



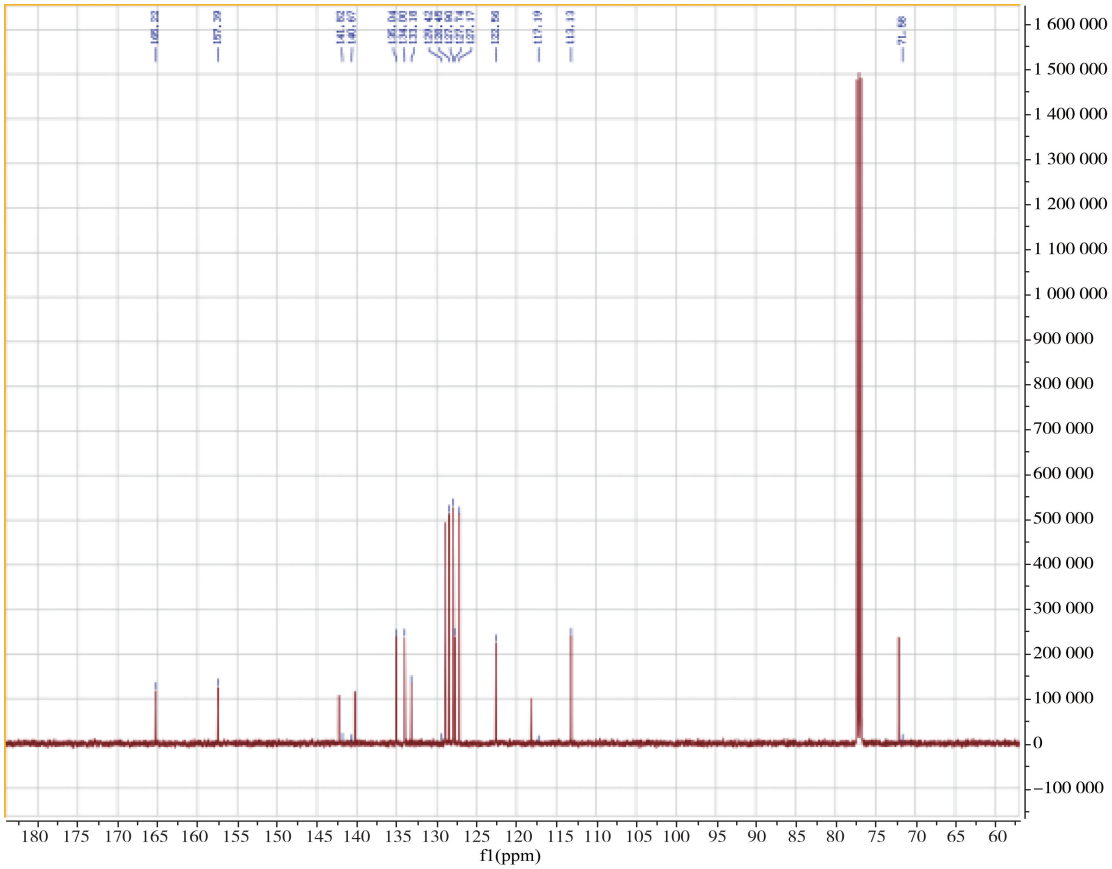
SA-5：2-丁氧基苯甲酸（2-butoxybenzoic acid）



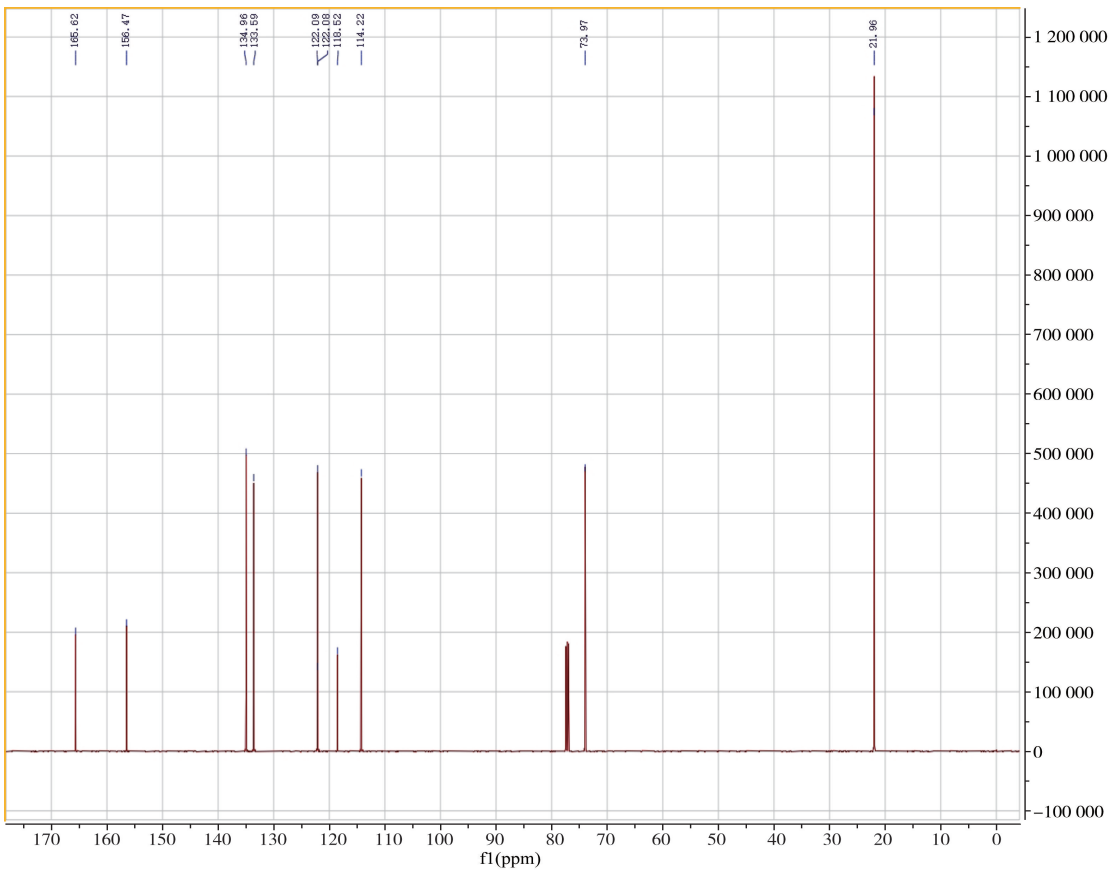
SA-6:2-苯乙氧基苯甲酸(2-phenethoxybenzoic acid)



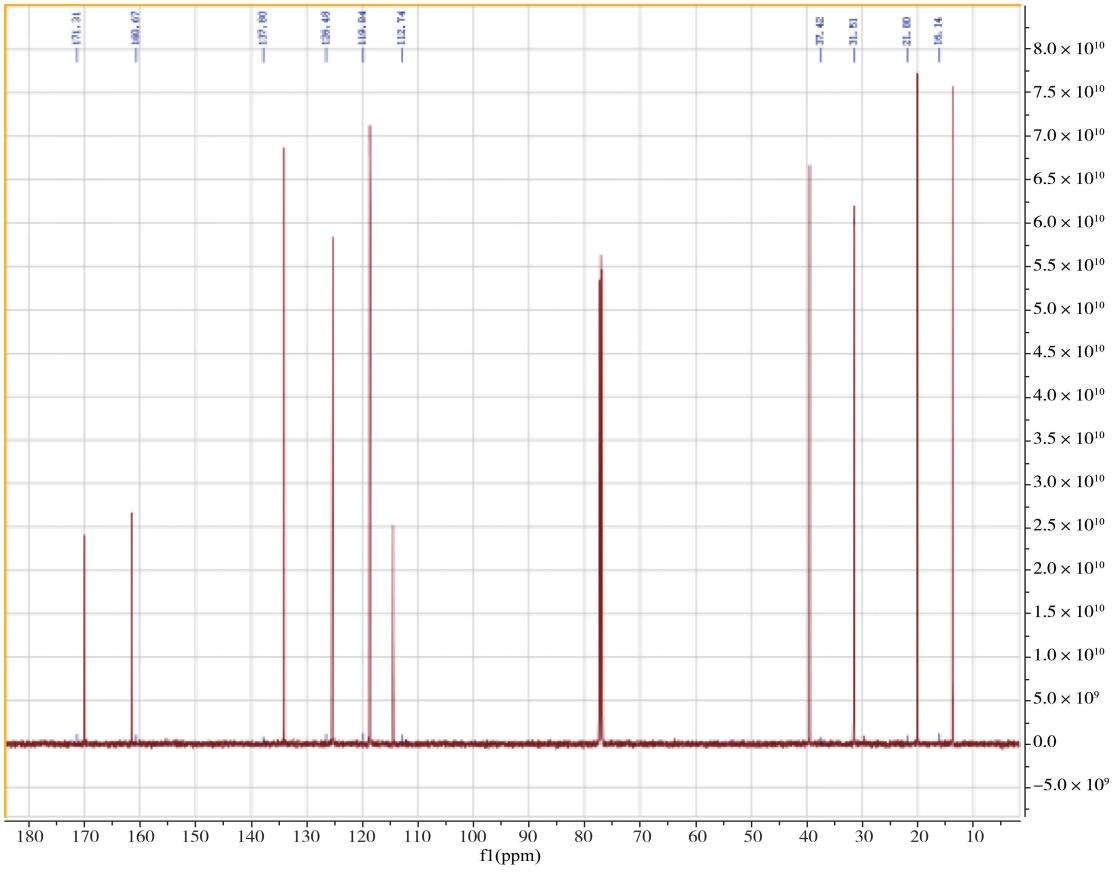
SA-7:2-苄氧基苯甲酸(2-(benzyloxy) benzoic acid)



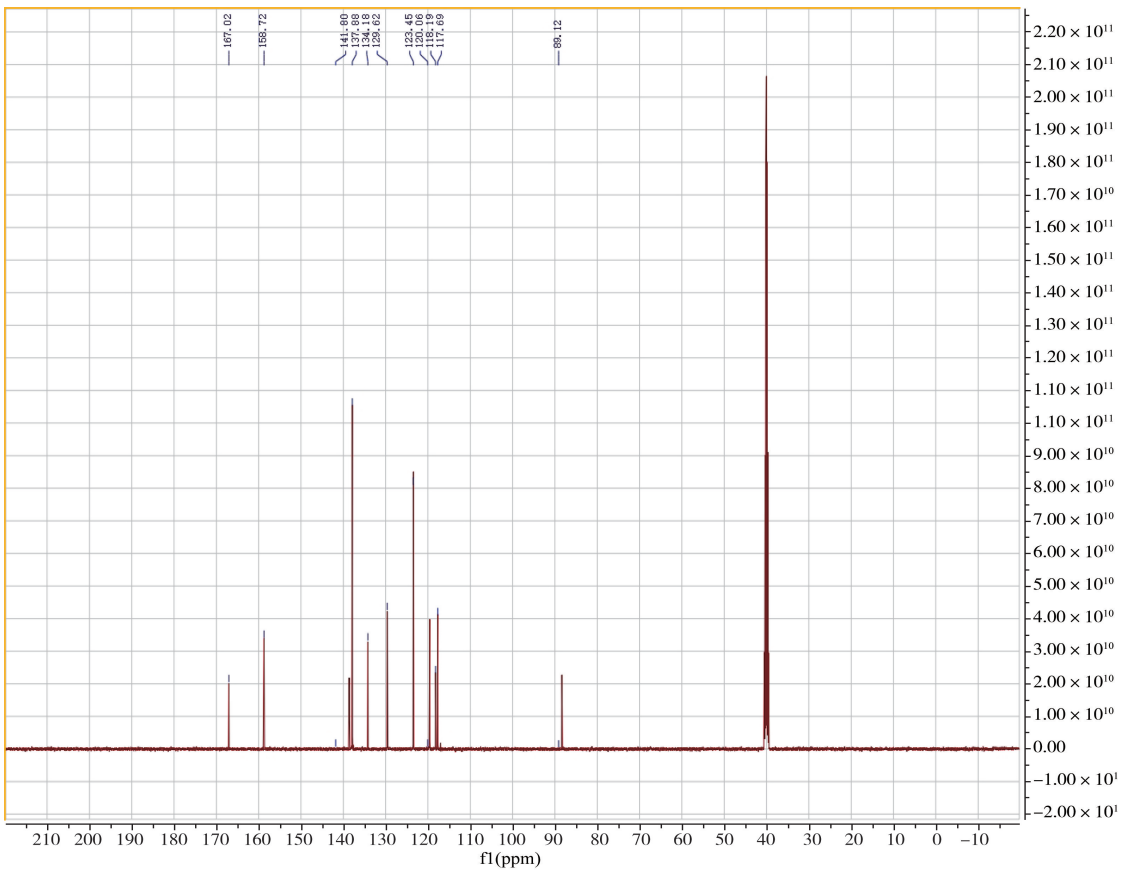
SA-8：2-([1，1′-联苯]-4-基甲氧基) 苯甲酸(2-([1，1′-biphenyl]-4-ylmethoxy) benzoic acid)



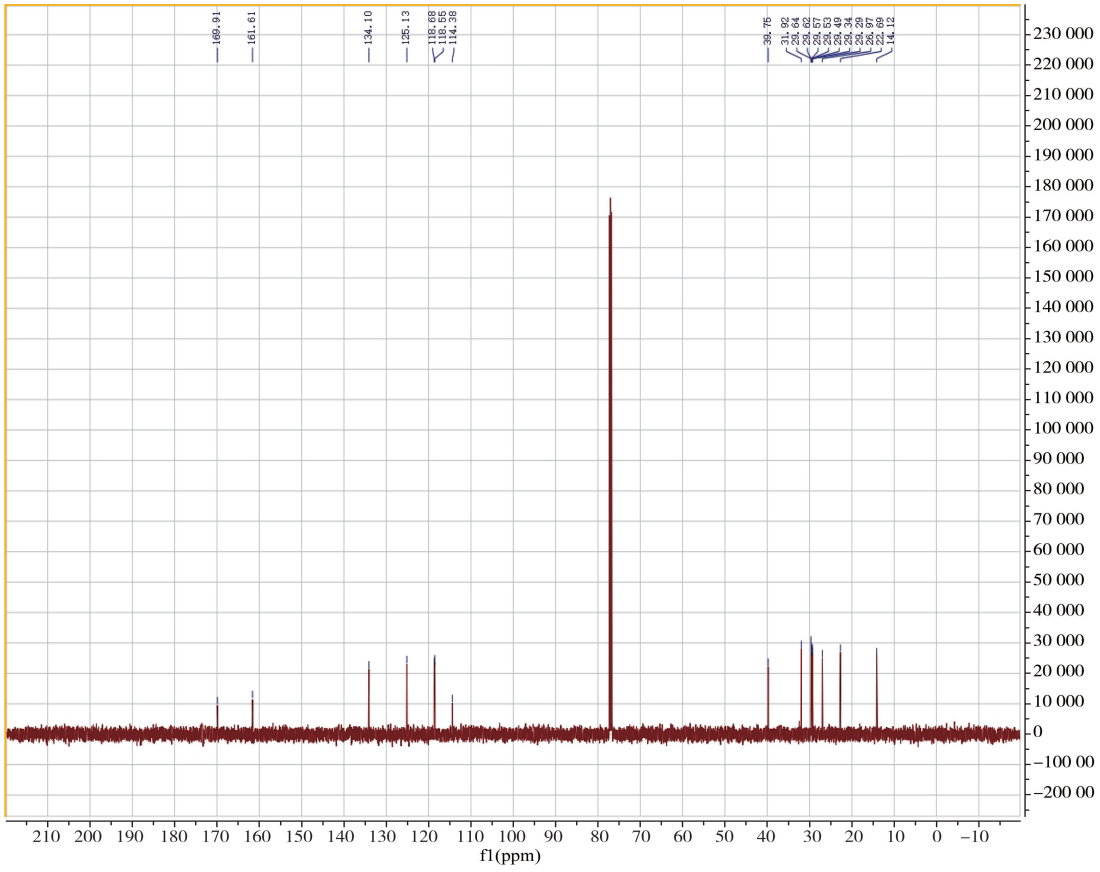
SA-9：2-异丙氧基苯甲酸(2-isopropoxybenzoic acid)



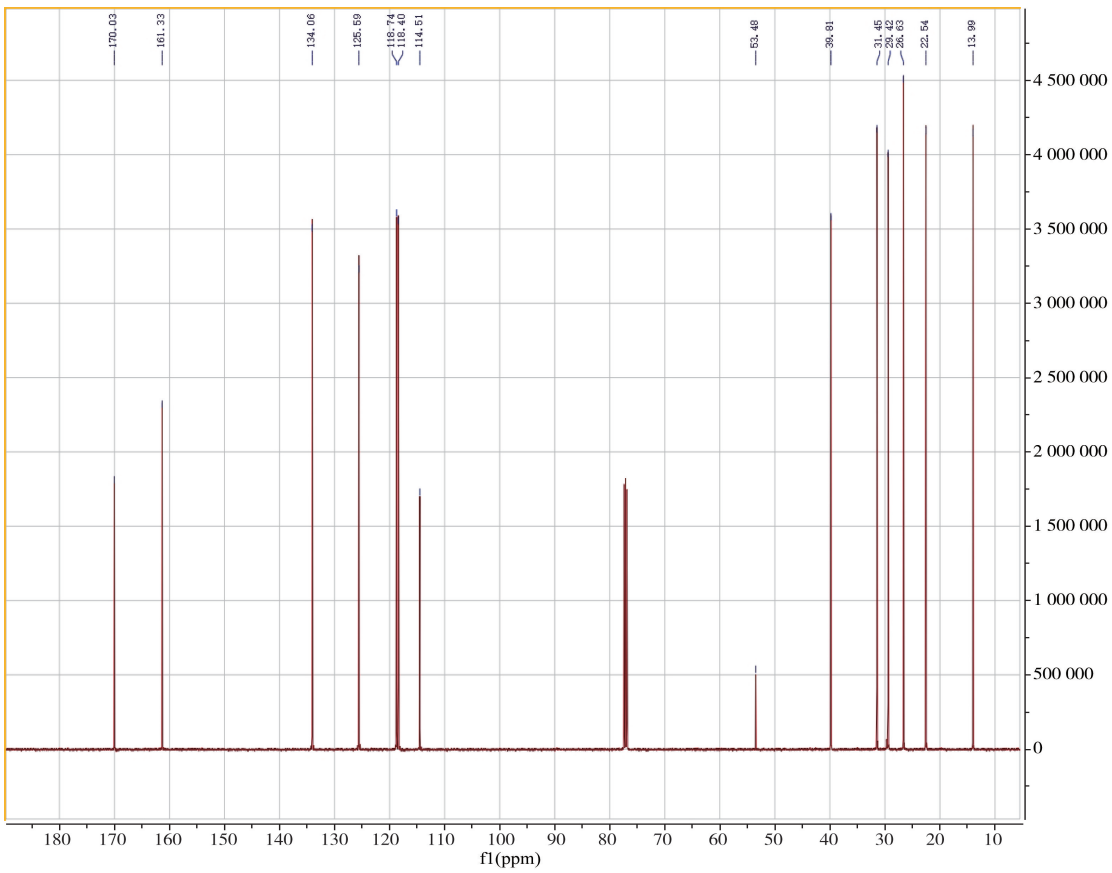
SA-10:2-(丁基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(butylcarbamoyl) benzoic acid)



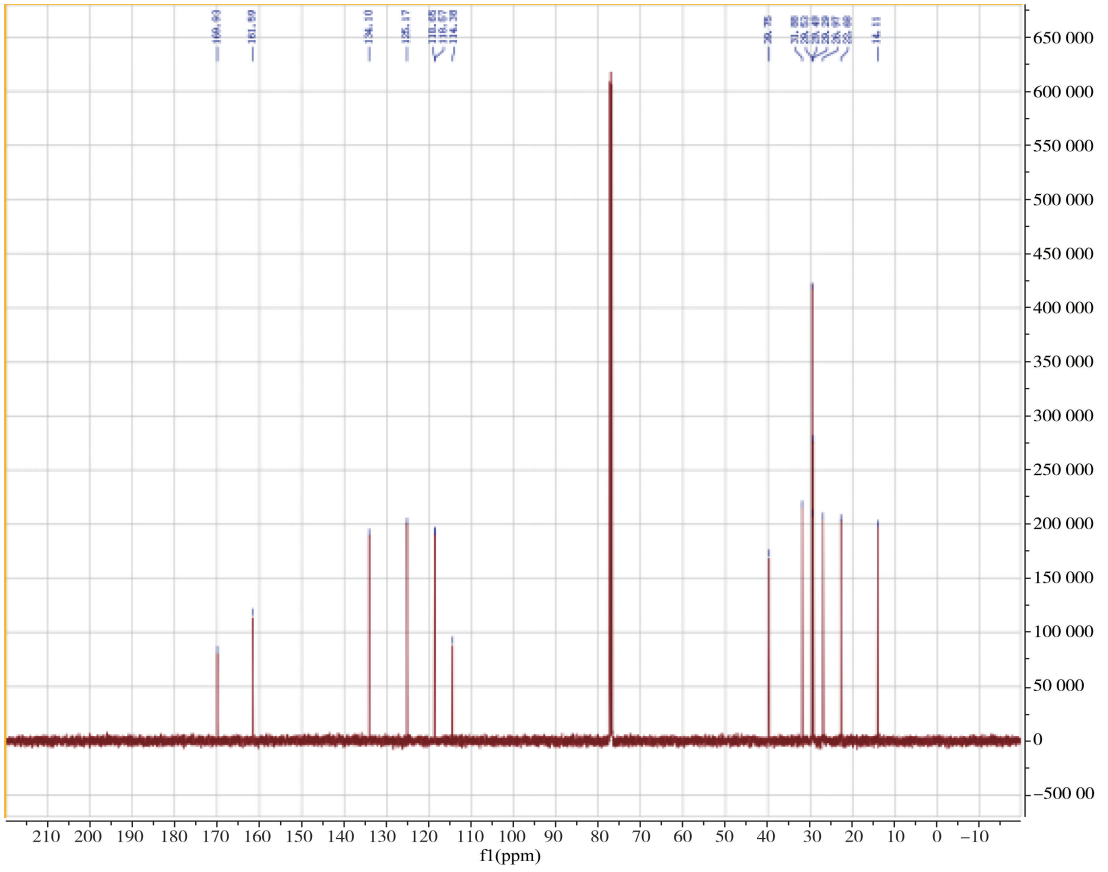
SA-11:2-((4-碘苯基)氨基甲酰基)苯甲酸(2-((4-iodophenyl) carbamoyl) benzoic acid)



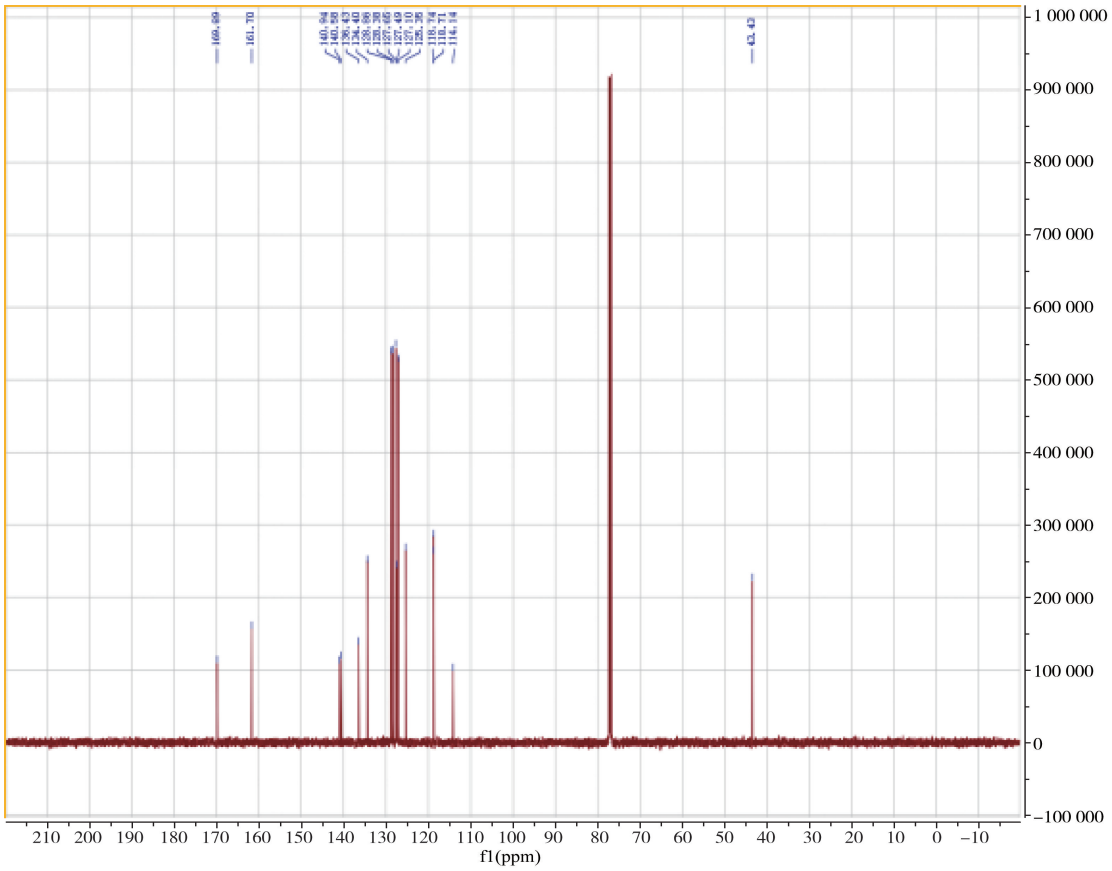
SA-12：2-(十二烷基氨基甲酰基) 苯甲酸(2-(dodecylcarbamoyl) benzoic acid)



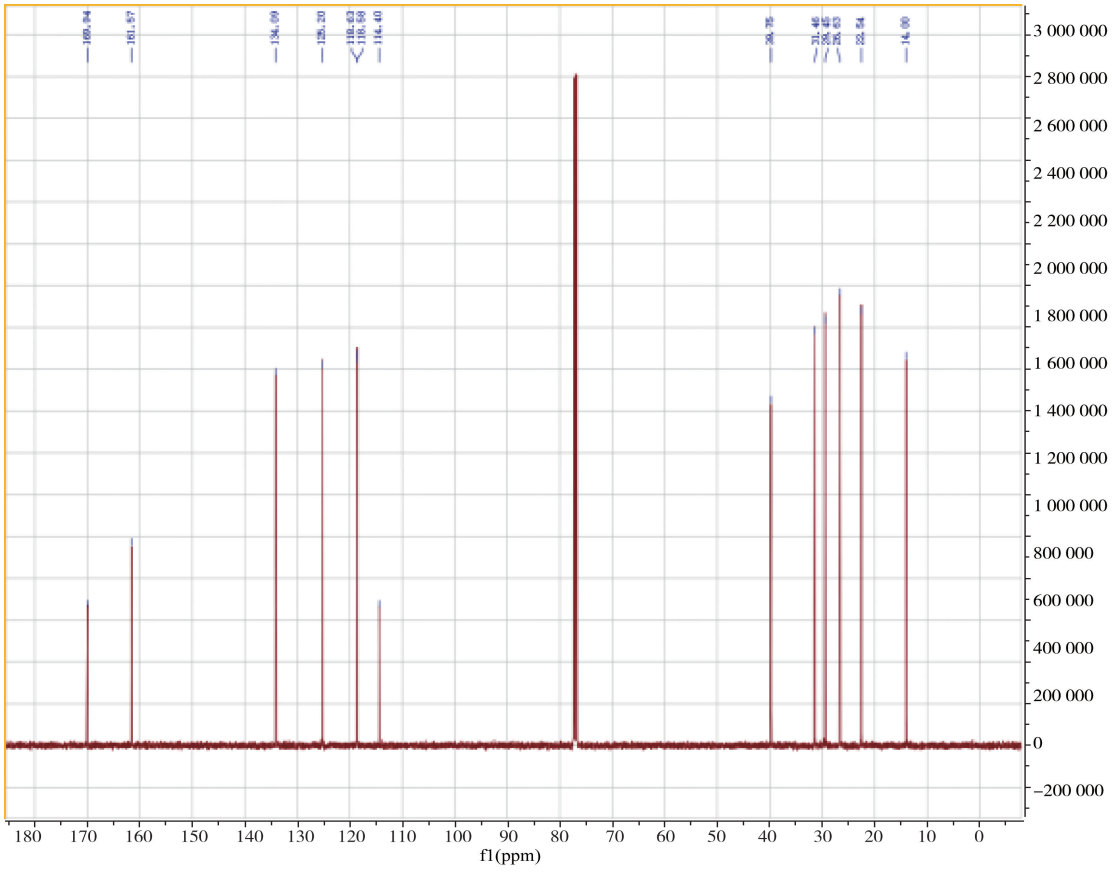
SA-13：2-(庚基氨基甲酰基) 苯甲酸(2-(heptylcarbamoyl) benzoic acid)



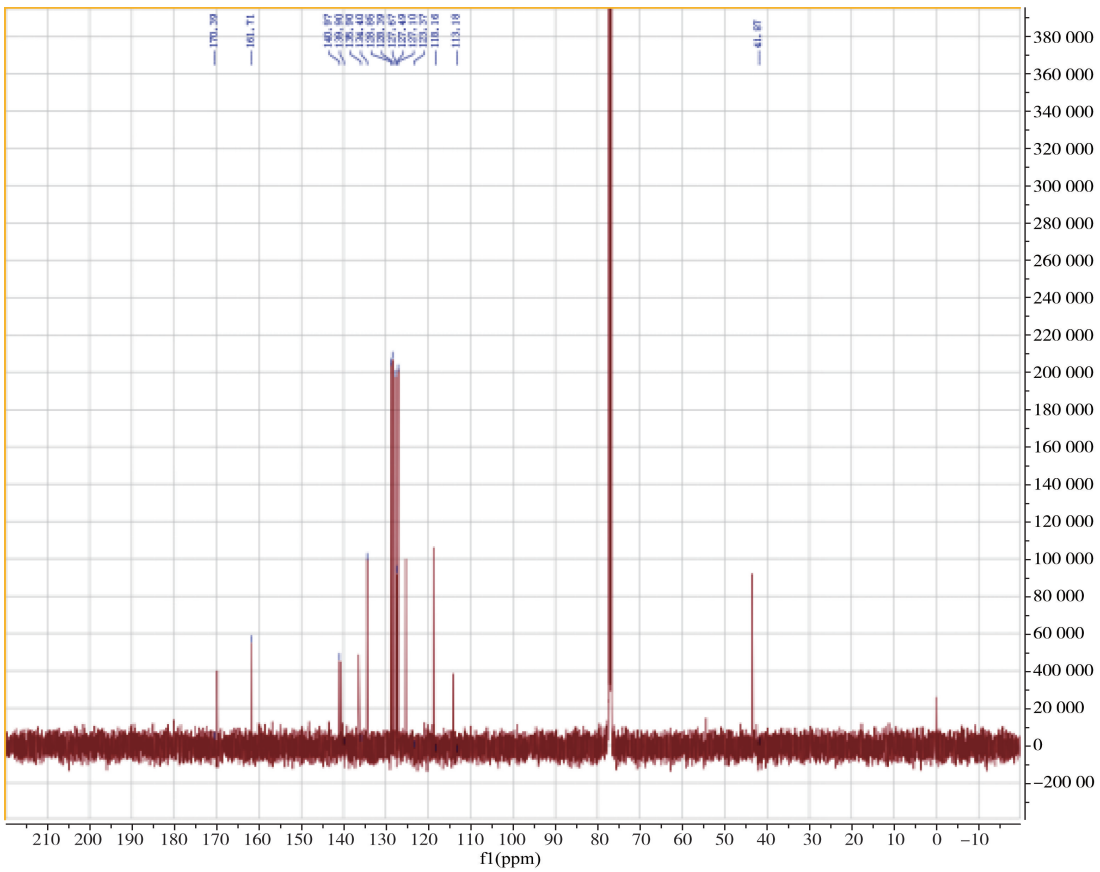
SA-14:2-(癸基氨基甲酰基) 苯甲酸(2-(decylcarbamoyl) benzoic acid)



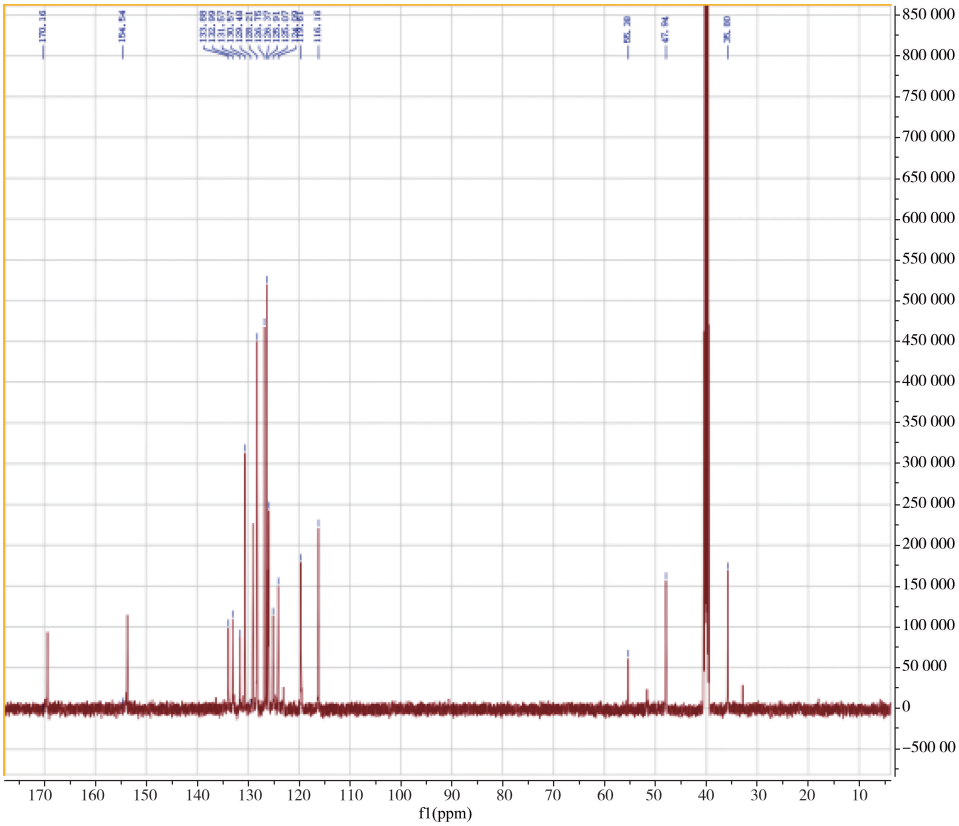
SA-15:2-([1,1′-联苯]-4-基甲基氨基甲酰基) 苯甲酸(2-(([1,1′-biphenyl]-4-ylmethyl) carbamoyl) benzoic acid)



SA-16：2-（己基氨基甲酰基）苯甲酸（2-（hexylcarbamoyl）benzoic acid）



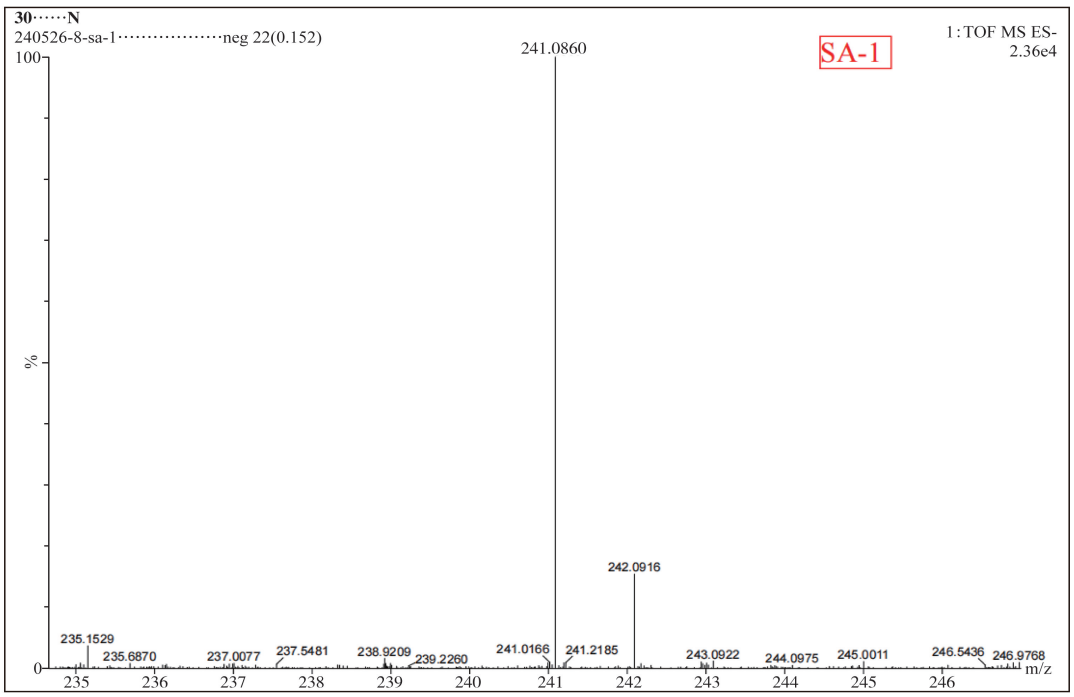
SA-17：2-（辛基氨基甲酰基）苯甲酸（2-（octylcarbamoyl）benzoic acid）



SA-18:2-((2-萘基甲基)氨基甲酰基)苯甲酸(2-((naphthalen-2-ylmethyl) carbamoyl) benzoic acid)

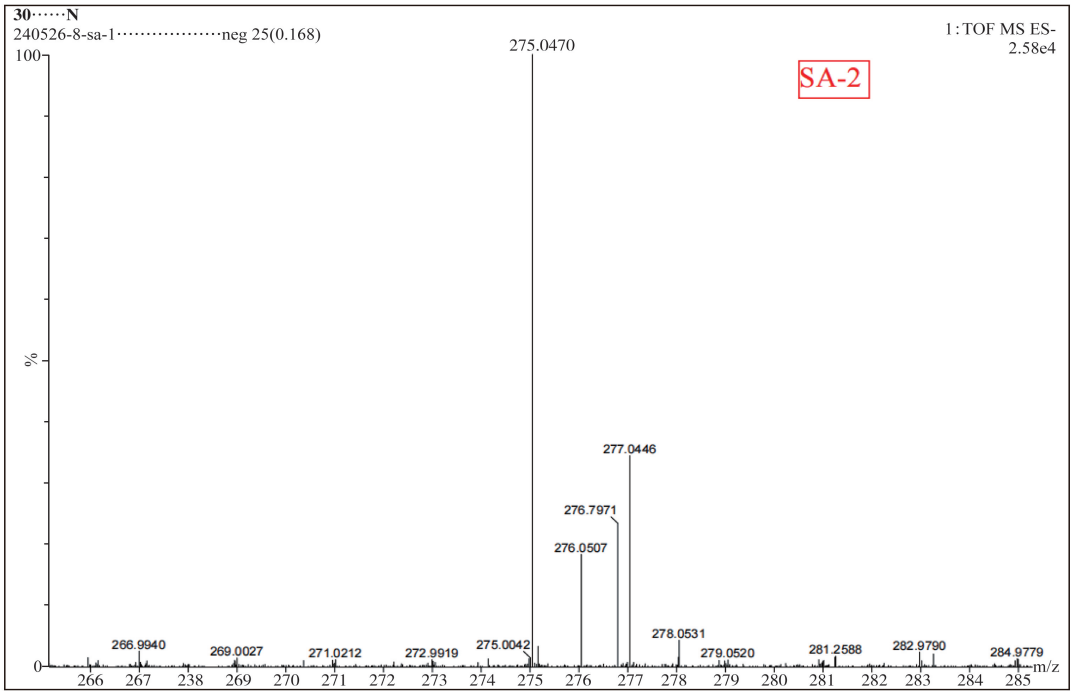
图 S3　SA 衍生物的核磁质谱图(从上到下依次是 SA-1 至 SA-18)

Fig. S3　NMR mass spectra of SA derivatives (from top to bottom, SA-1 to SA-18)



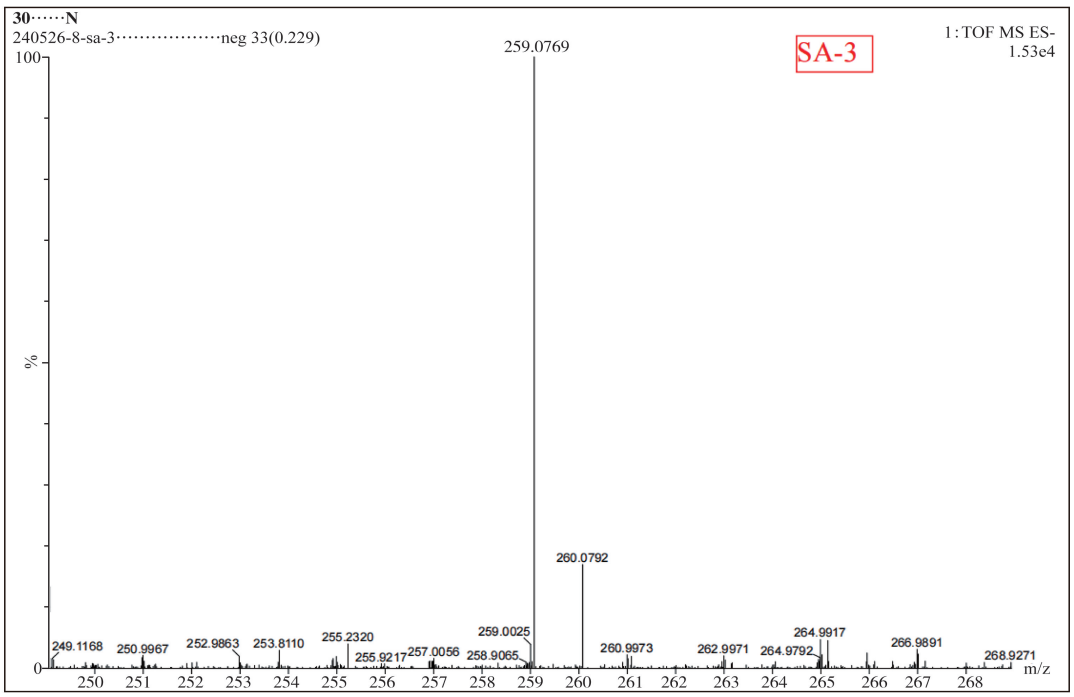
SA-1: 2-((4-甲基苄基) 氧基)苯甲酸(2-((4-methylbenzyl) oxy) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 10.80 (s, 1H), 8.13 (dd, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.48 (td, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.16 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.11～6.99 (m, 2H), 5.18 (s, 2H), 2.31 (s, 3H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 167.29, 156.65, 139.26, 134.97, 133.56, 131.23, 129.84, 128.10, 121.94, 116.73, 112.28, 71.38, 19.91。



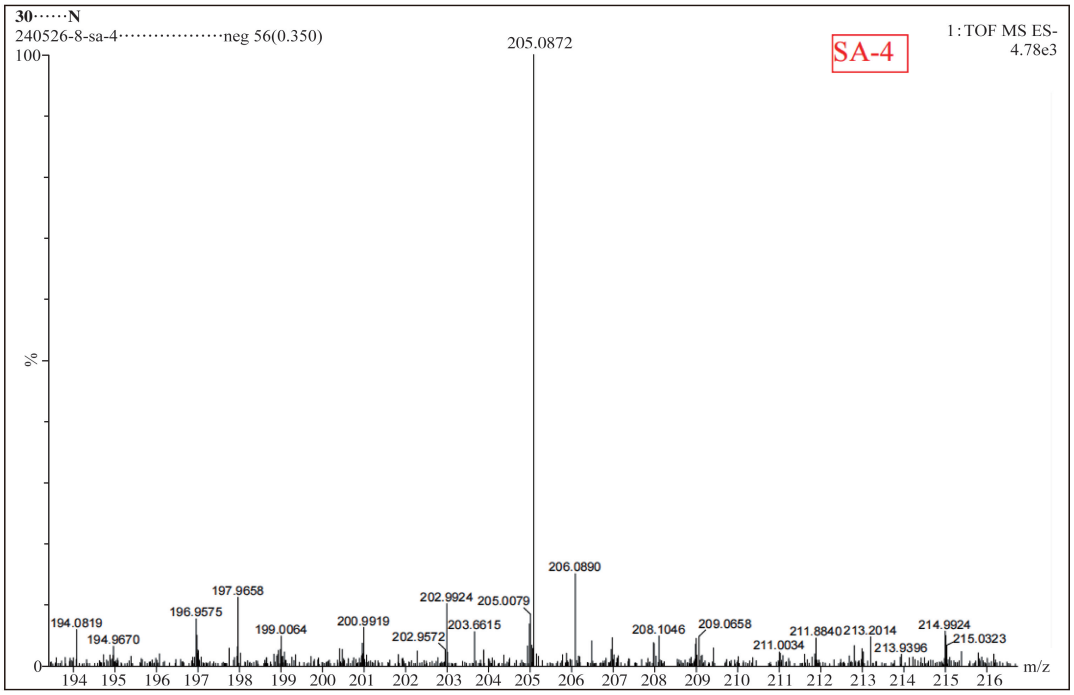
SA-2：2-(4-氯苯乙氧基)苯甲酸(2-(4-chlorophenethoxy) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 10.54 (s, 1H), 8.11 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.52 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.21 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.09 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.42 (t, J = 6.5 Hz, 2H), 3.17 (t, J = 6.5 Hz, 2H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 165.81, 157.32, 135.18, 134.99, 133.71, 133.04, 130.15, 129.10, 122.22, 117.88, 112.58, 70.22, 34.81。



SA-3：2-(4-氟苯乙氧基)苯甲酸(2-(4-fluorophenethoxy) benzoic acid)

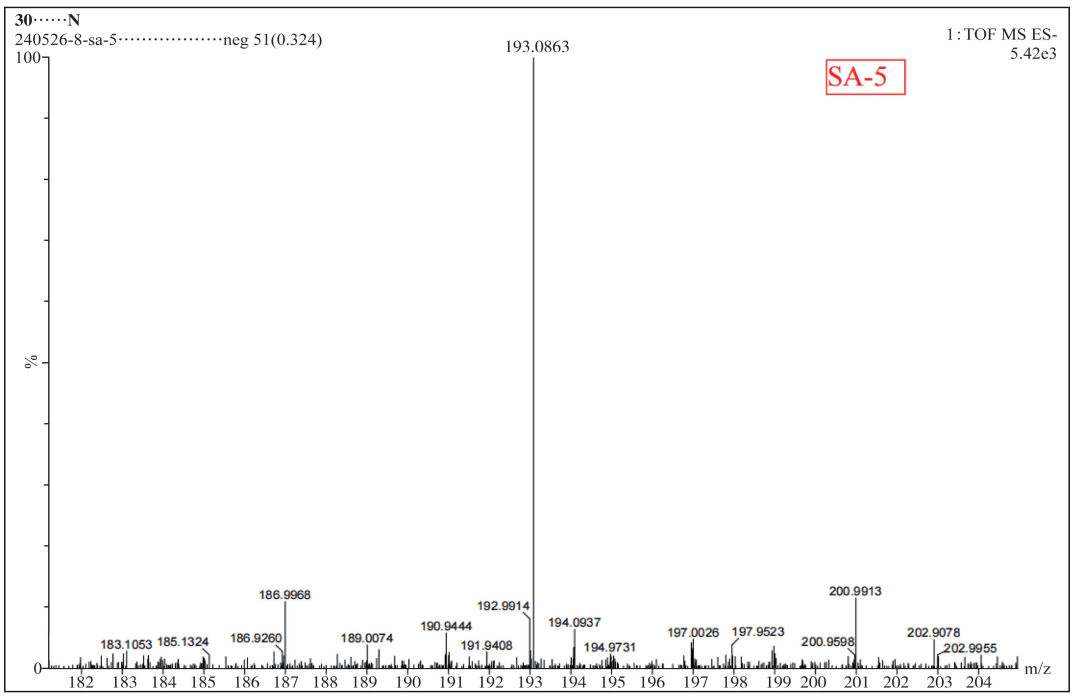
^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 10.58 (s, 1H), 8.07 (dd, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.46 (ddd, J = 8.8, 7.4, 1.9 Hz, 1H), 7.23～7.10 (m, 2H), 7.04 (td, J = 7.6, 1.0 Hz, 1H), 6.99～6.88 (m, 3H), 4.37 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.11 (t, J = 6.6 Hz, 2H). ^{13}C NMR (126 MHz,) δ 165.44, 163.01, 161.06, 156.76, 135.59, 133.85, 132.22, 130.24, 122.33, 118.42, 116.00, 115.83, 113.14, 70.47, 34.03。



SA-4：2-环戊氧基苯甲酸(2-(cyclopentyloxy) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 11.13 (s, 1H), 8.17 (dd, J = 7.9, 1.9 Hz, 1H), 7.54 (ddd, J = 8.7, 7.4, 1.9 Hz, 1H), 7.19～6.89 (m, 2H), 5.09 (tt, J = 5.6, 2.5 Hz, 1H), 2.10～2.00 (m, 2H), 1.97 (ddt, J = 14.2, 7.7, 3.9 Hz, 2H), 1.91～1.79 (m, 2H), 1.74 (dtt, J = 11.9, 7.2, 4.3 Hz, 2H)。

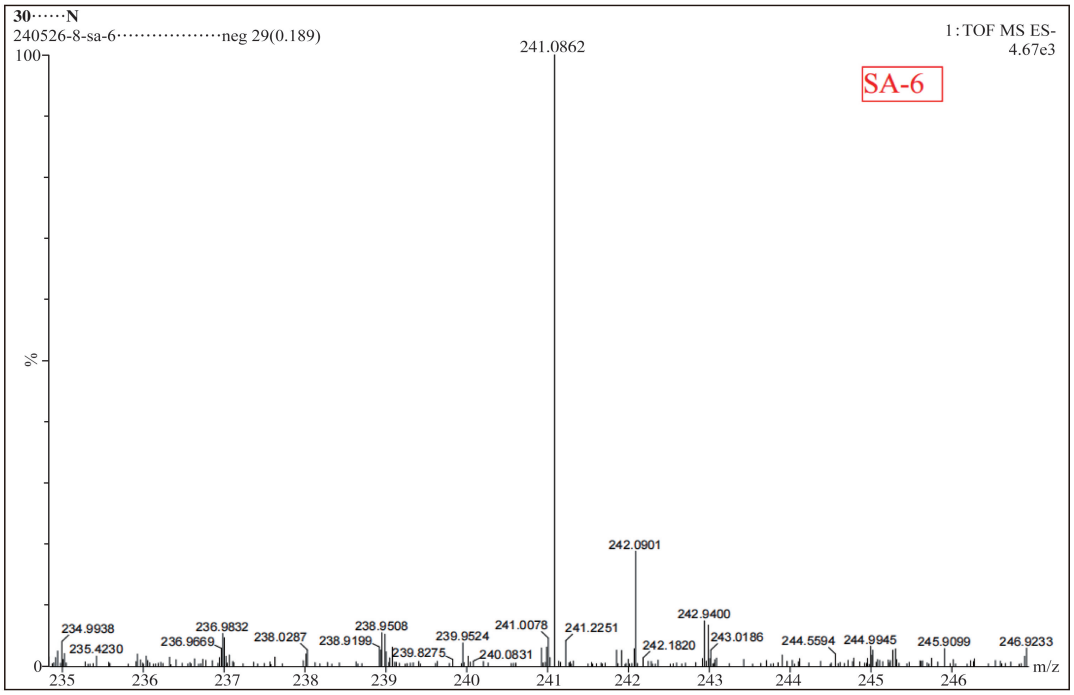
^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 165.55, 156.55, 134.84, 133.74, 121.87, 118.18, 113.83, 82.73, 32.89, 23.72。



SA-5：2-丁氧基苯甲酸(2-butoxybenzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 8.14 (dd, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.55 (ddd, J = 8.9, 7.3, 1.9 Hz, 1H), 7.27～6.87 (m, 2H), 4.25 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 1.94～1.83 (m, 2H), 1.61～1.45 (m, 2H), 1.01 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

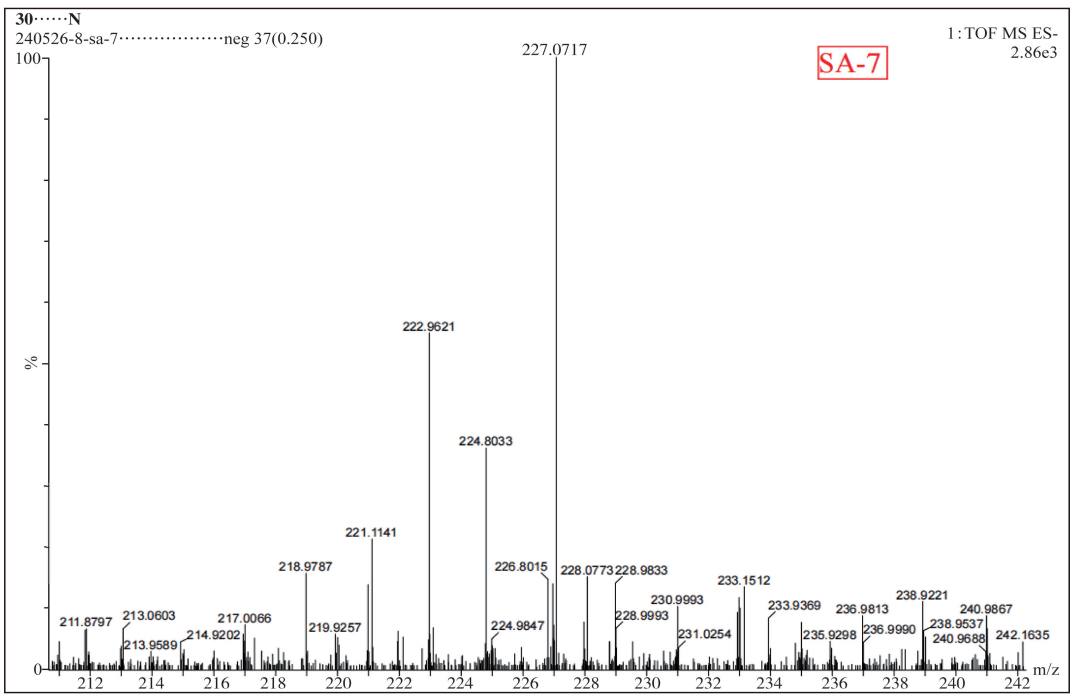
^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 165.53, 157.63, 135.03, 133.66, 122.06, 117.67, 112.65, 69.99, 30.89, 19.12, 13.66。



SA-6：2-苯乙氧基苯甲酸(2-phenethoxybenzoic acid)

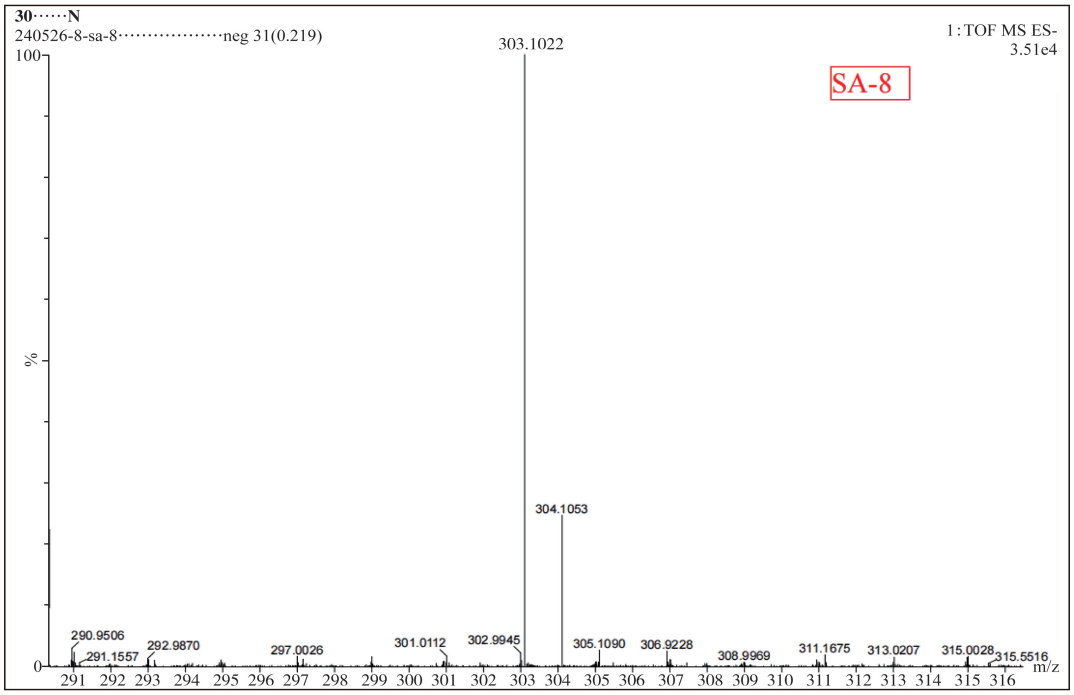
^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 10.55 (s, 1H), 8.17 (dd, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.54 (ddd, J = 8.8, 7.3, 1.9 Hz, 1H), 7.36 (td, J = 6.9, 1.4 Hz, 2H), 7.32～7.24 (m, 3H), 7.12 (td, J = 7.6, 1.0 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.48 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 3.22 (t, J = 6.7 Hz, 2H)。

^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 165.25, 157.28, 136.42, 134.97, 133.90, 129.07, 128.74, 127.29, 122.31, 117.76, 112.45, 70.59, 35.46。



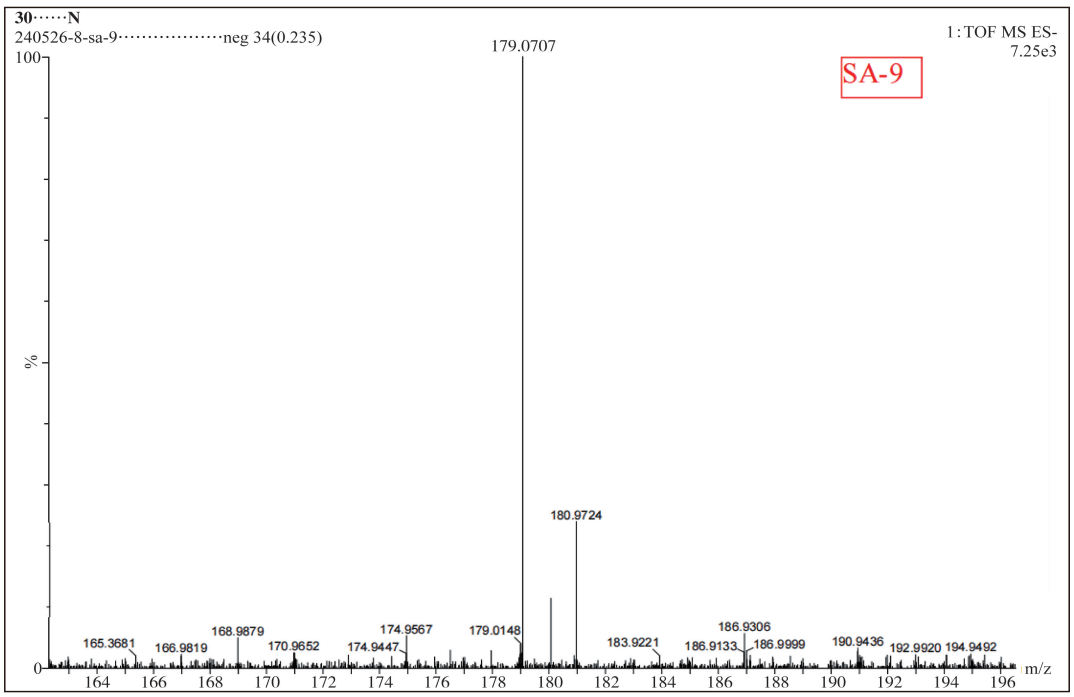
SA-7：2-苄氧基苯甲酸(2-(benzyloxy) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 10.86 (s, 1H), 8.20 (dd, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.55 (ddd, J = 8.7, 7.3, 1.8 Hz, 1H), 7.47～7.37 (m, 5H), 7.18～7.09 (m, 2H), 5.30 (s, 2H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 156.65, 135.03, 134.41, 133.88, 129.16, 127.92, 122.43, 118.16, 113.17, 71.66。



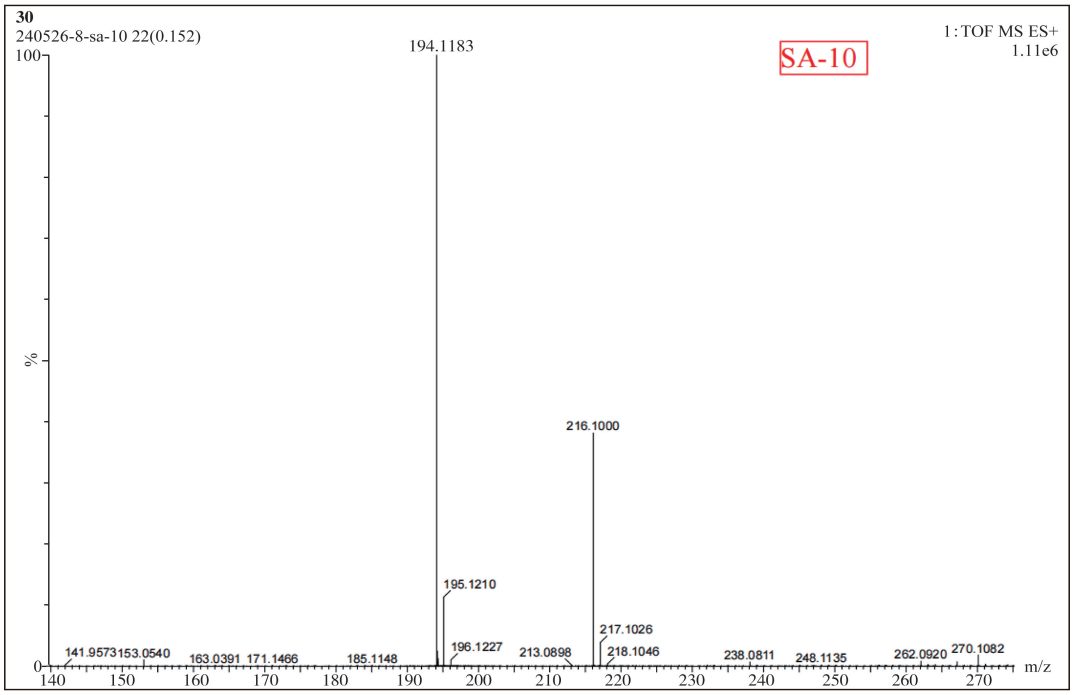
SA-8：2-([1,1′-联苯]-4-基甲氧基)苯甲酸(2-([1,1′-biphenyl]-4-ylmethoxy) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 10.82 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.0, 1.8 Hz, 1H), 7.67～7.62 (m, 2H), 7.62～7.54 (m, 3H), 7.53～7.48 (m, 2H), 7.45 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 7.40～7.34 (m, 1H), 7.19～7.11 (m, 2H), 5.33 (s, 2H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 165.22, 157.39, 141.82, 140.67, 135.04, 134.00, 133.18, 129.42, 128.45, 127.90, 127.74, 127.17, 122.56, 117.19, 113.13, 71.58。



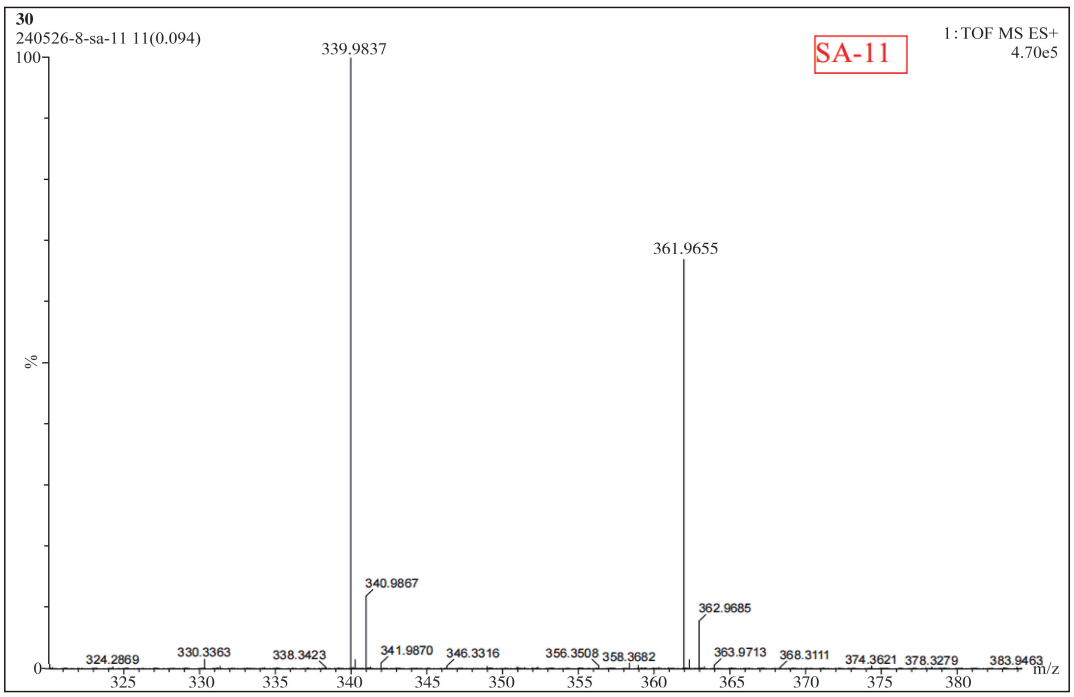
SA-9：2-异丙氧基苯甲酸(2-isopropoxybenzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 11.29 (s, 1H), 8.17 (dd, J = 7.9, 1.9 Hz, 1H), 7.55 (ddd, J = 8.5, 7.3, 1.9 Hz, 1H), 7.23～6.81 (m, 2H), 4.90 (p, J = 6.1 Hz, 1H), 1.49 (d, J = 6.1 Hz, 6H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 165.62, 156.47, 134.96, 133.59, 122.09, 122.08, 118.52, 114.22, 73.97, 21.96。



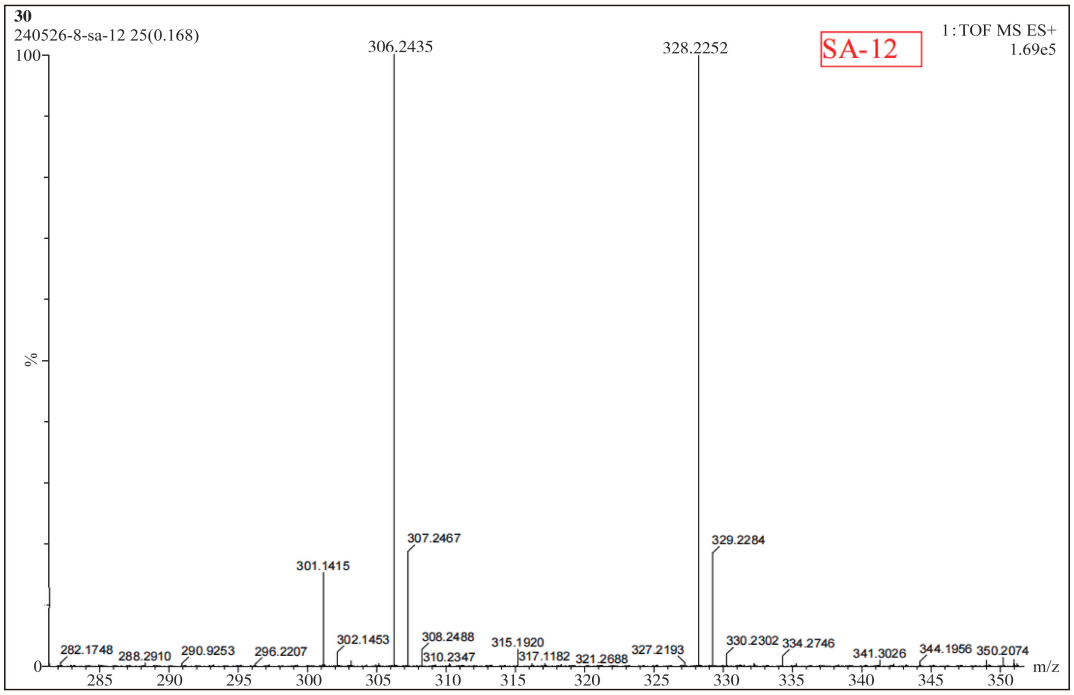
SA-10：2-(丁基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(butylcarbamoyl) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 12.49 (s, 1H), 7.44 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.35 (ddd, J = 8.6, 7.2, 1.6 Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 6.86～6.66 (m, 2H), 3.42 (td, J = 7.3, 5.7 Hz, 2H), 1.64～1.50 (m, 2H), 1.43～1.30 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.4 Hz, 3H). ^{13}C NMR (126 MHz,) δ 171.31, 160.67, 137.80, 126.48, 119.84, 112.74, 37.42, 31.51, 21.80, 16.14。



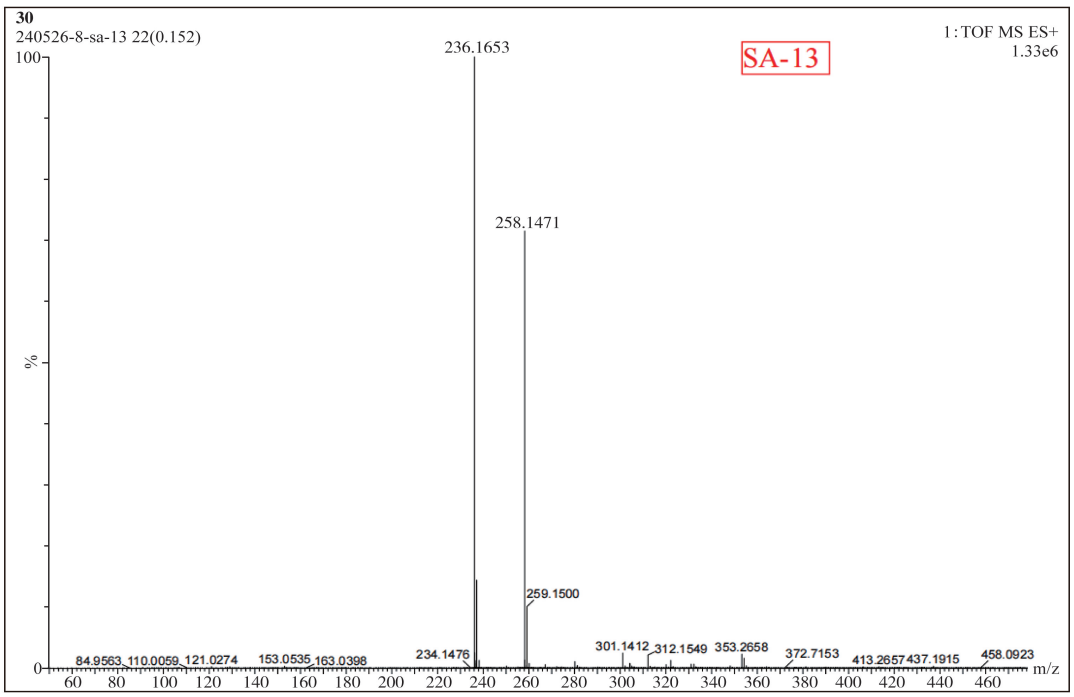
SA-11：2-((4-碘苯基)氨基甲酰基)苯甲酸(2-((4-iodophenyl) carbamoyl) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 11.66 (s, 1H), 10.42 (s, 1H), 7.94 (dd, J = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.78～7.62 (m, 2H), 7.63～7.53 (m, 2H), 7.44 (ddd, J = 8.6, 7.2, 1.7 Hz, 1H), 7.05～6.88 (m, 2H). ^{13}C NMR (126 MHz,) δ 167.02, 158.72, 141.80, 137.88, 134.18, 129.62, 123.45, 120.06, 118.19, 117.69, 89.12。



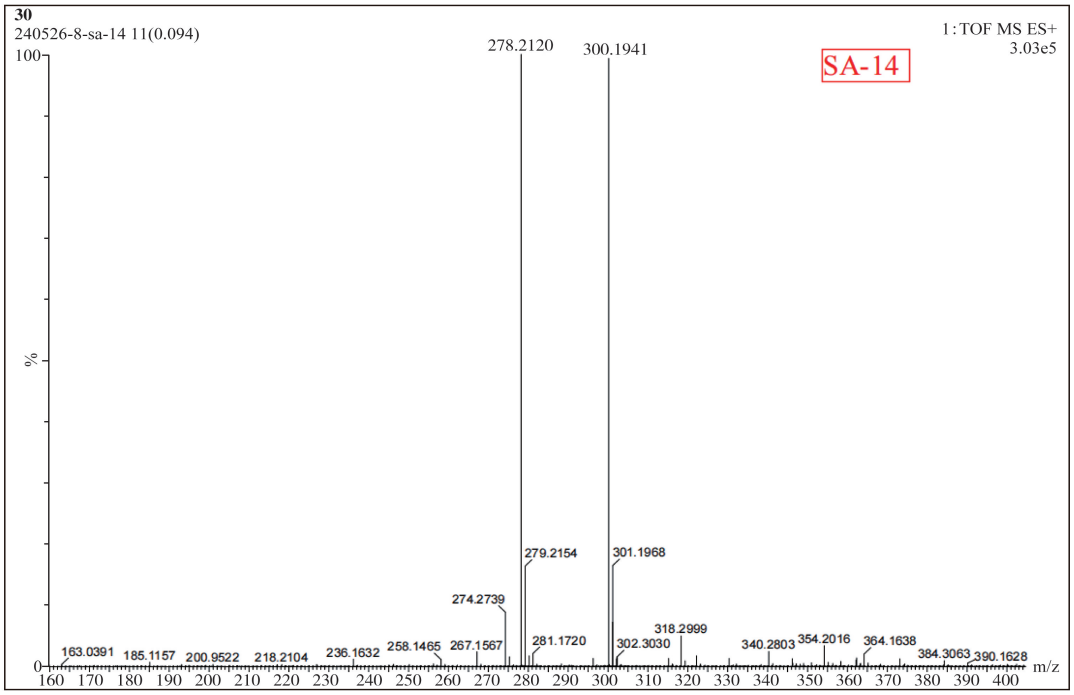
SA-12：2-(十二烷基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(dodecylcarbamoyl) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 7.38 (ddd, J = 8.6, 7.1, 1.5 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.4, 1.2 Hz, 1H), 6.84 (td, J = 7.7, 1.2 Hz, 1H), 6.30 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 3.44 (td, J = 7.3, 5.8 Hz, 2H), 1.69～1.56 (m, 2H), 1.42～1.19 (m, 19H), 0.88 (t, J = 6.9 Hz, 3H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 169.91, 161.61, 134.10, 125.13, 118.68, 118.55, 114.38, 39.75, 31.92, 29.64, 29.62, 29.57, 29.53, 29.49, 29.34, 29.29, 26.97, 22.69, 14.12。



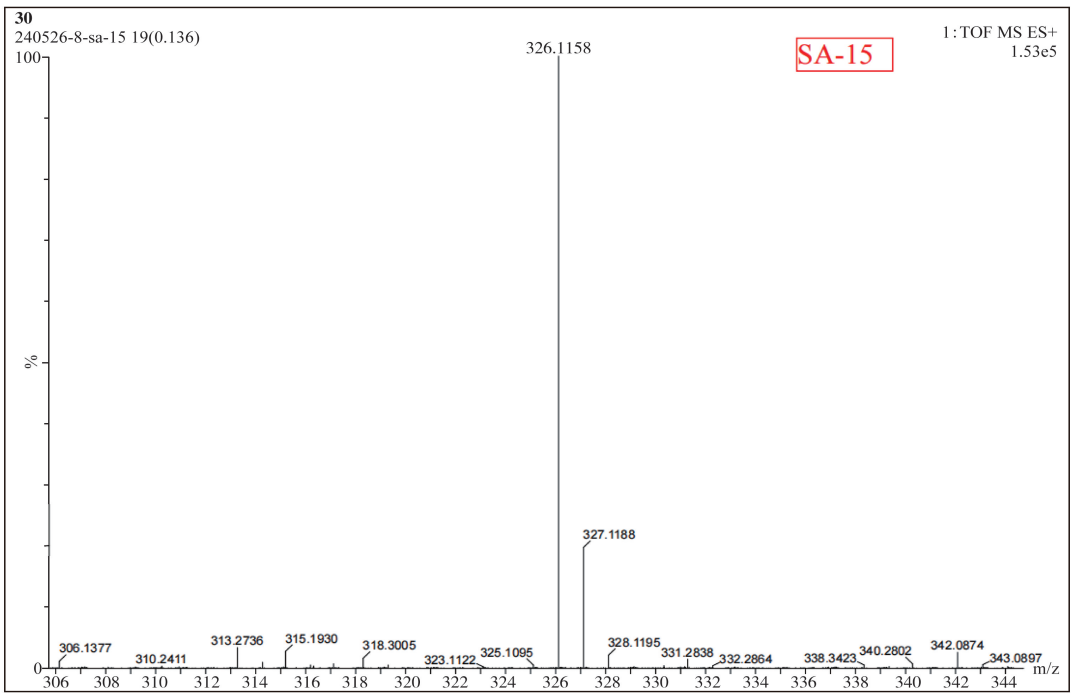
SA-13：2-(庚基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(heptylcarbamoyl) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 7.42 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.36 (ddd, J = 8.6, 7.2, 1.6 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.4, 1.2 Hz, 1H), 6.81 (td, J = 7.7, 1.2 Hz, 1H), 6.70 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 3.41 (td, J = 7.4, 5.8 Hz, 2H), 1.69～1.53 (m, 2H), 1.39～1.20 (m, 8H), 0.87 (t, J = 6.9 Hz, 3H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 170.03, 161.33, 134.06, 125.59, 118.74, 118.40, 114.51, 53.48, 39.81, 31.45, 29.42, 26.63, 22.54, 13.99。



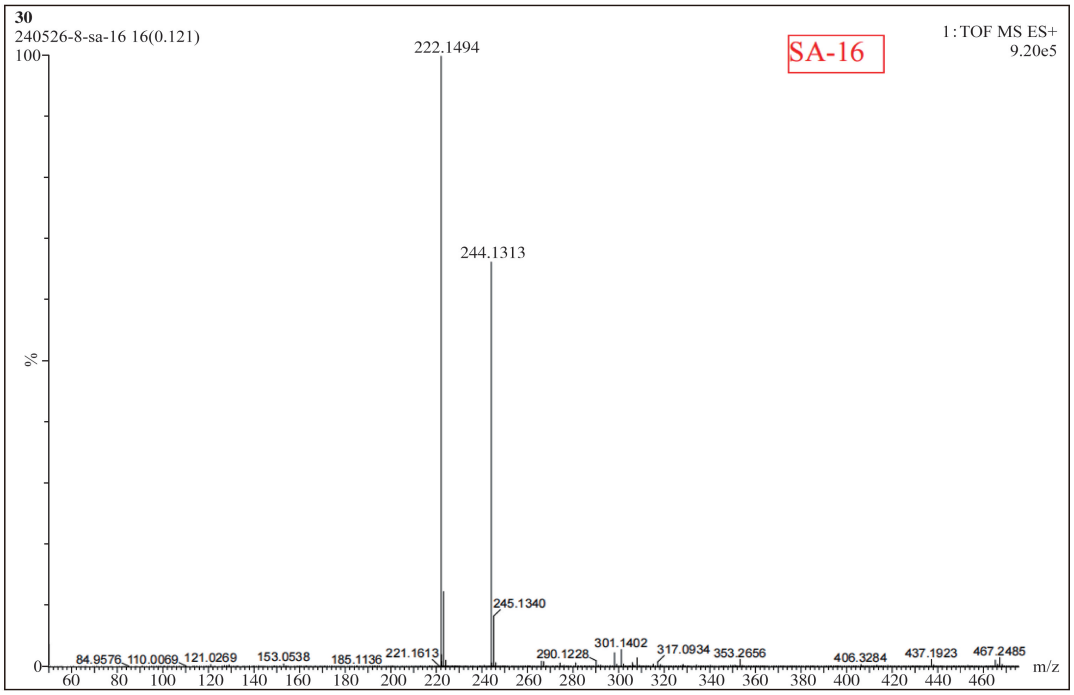
SA-14：2-(癸基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(decylcarbamoyl) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 12.34 (s, 1H), 7.39～7.22 (m, 2H), 6.90 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.76 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.29 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 3.36 (q, J = 6.7 Hz, 2H), 1.54 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.36～1.12 (m, 15H), 0.81 (t, J = 6.7 Hz, 3H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 169.93, 161.59, 134.10, 125.17, 118.65, 118.57, 114.38, 39.75, 31.88, 29.53, 29.49, 29.29, 26.97, 22.68, 14.11。



SA-15：2-([1,1′-联苯]-4-基甲基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(([1,1′-biphenyl]-4-ylmethyl) carbamoyl) benzoic acid)

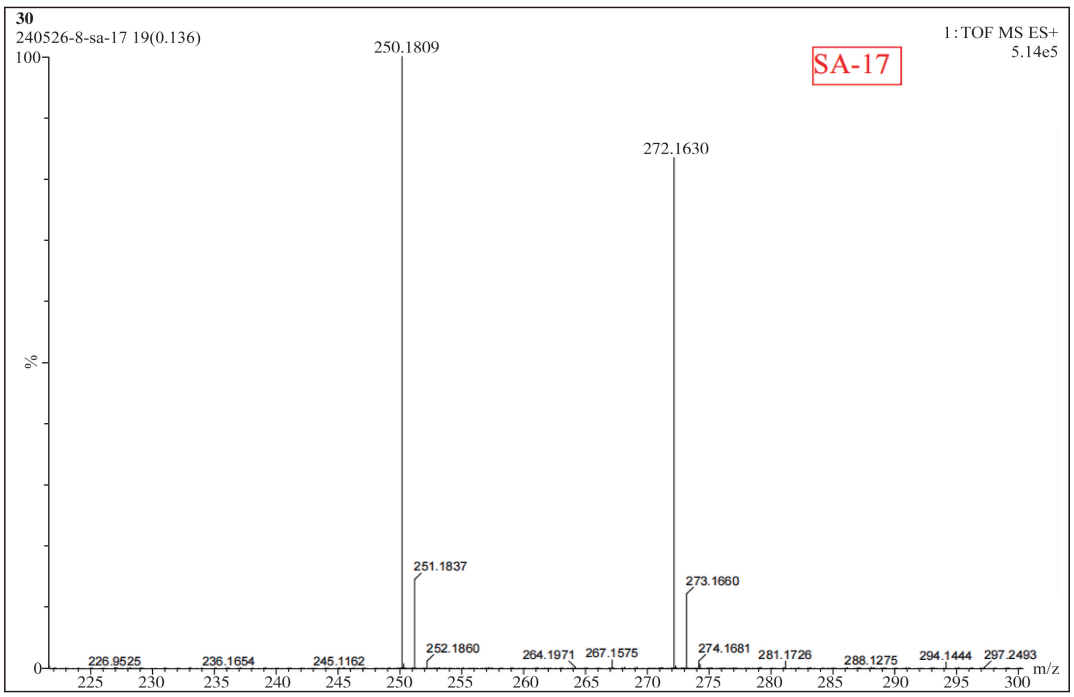
^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 12.22 (s, 1H), 7.56～7.46 (m, 4H), 7.41～7.22 (m, 7H), 6.93 (dd, J = 8.4, 1.2 Hz, 1H), 6.79～6.71 (m, 1H), 6.55 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.59 (d, J = 5.6 Hz, 2H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 169.89, 161.70, 140.94, 140.58, 136.43, 134.40, 128.86, 128.38, 127.65, 127.49, 127.10, 125.35, 118.74, 118.71, 114.14, 43.43。



SA-16：2-(己基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(hexylcarbamoyl) benzoic acid)

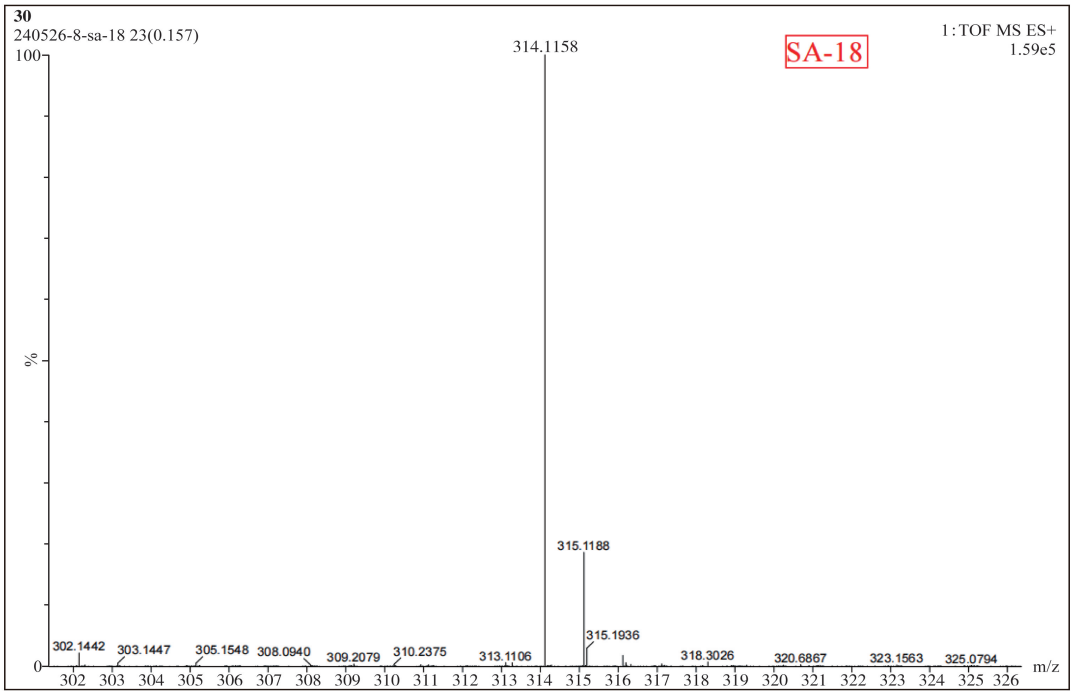
^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 12.33 (s, 1H), 7.37～7.23 (m, 2H), 6.90 (dd, J = 8.4, 1.2 Hz, 1H), 6.76 (ddd, J = 8.2, 7.2, 1.2 Hz, 1H), 6.29 (s, 1H), 3.36 (td, J = 7.3, 5.7 Hz, 2H), 1.54 (p, J = 8.0, 7.6 Hz, 2H), 1.34～1.21 (m, 6H), 0.87～0.78 (m, 3H)。

^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 169.94, 161.57, 134.09, 125.20, 118.63, 118.58, 114.40, 39.75, 31.46, 29.45, 26.63, 22.54, 14.00。



SA-17：2-(辛基氨基甲酰基)苯甲酸(2-(octylcarbamoyl) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 7.43～7.30 (m, 2H), 6.98 (dd, J = 8.4, 1.2 Hz, 1H), 6.91～6.75 (m, 1H), 6.31 (s, 1H), 3.44 (td, J = 7.3, 5.7 Hz, 2H), 1.62 (ddd, J = 14.8, 8.0, 6.5 Hz, 2H), 1.44～1.19 (m, 11H), 0.94～0.81 (m, 3H). ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 170.39, 161.71, 140.97, 139.90, 135.90, 134.40, 128.85, 128.39, 127.67, 127.49, 127.10, 123.37, 118.16, 113.18, 41.87。



SA-18：2-((2-萘基甲基) 氨基甲酰基)苯甲酸(2-((naphthalen-2-ylmethyl) carbamoyl) benzoic acid)

^{1}H NMR (500 MHz, Chloroform-*d*) δ 9.95 (s, 1H), 7.92～7.72 (m, 3H), 7.53～7.33 (m, 4H), 7.26～7.10 (m, 2H), 6.95 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.72～6.50 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 2.98 (s, 3H)。

^{13}C NMR (126 MHz, DMSO) δ 169.37, 153.35, 133.88, 132.99, 131.57, 130.57, 129.55, 127.57, 126.75, 126.37, 125.91, 124.59, 123.68, 120.22, 116.16, 55.79, 47.94, 34.58。

（责任编辑：刘庆松）