



12) 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 90110260.1

[51] Int.Cl⁵

C07D239 / 60

[43] 公开日 1991年7月10日

[22] 申请日 90.12.28

[30] 优先权

[32] 89.12.28 [33] JP [31] 343287 / 89

[32] 90.5.10 [33] JP [31] 120678 / 90

[71] 申请人 库米阿依化学工业株式会社

地址 日本东京

共同申请人 依哈拉化学工业株式会社

[72] 发明人 田丸雅敏 河村典広 佐藤政宏

高部文明 立川重彦 吉田谅

[74] 专利代理机构 上海专利事务所

代理人 全永留

C07D251 / 30 A01N 43 / 54

A01N 43 / 66

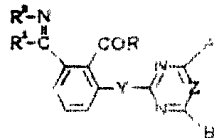
说明书页数: 54

附图页数:

[54] 发明名称 嘧啶或三嗪衍生物及含该类物质的除草剂组合物

[57] 摘要

一种嘧啶或三嗪衍生物及其盐, 所述嘧啶或三嗪衍生物具下式



其中 R 代表式 OR³ 的基团 (其中 R³ 代表氢原子, 烷基等), 式 SR⁶ 的基团 (其中 R⁶ 代表氢原子, 烷基等), 下式的基团



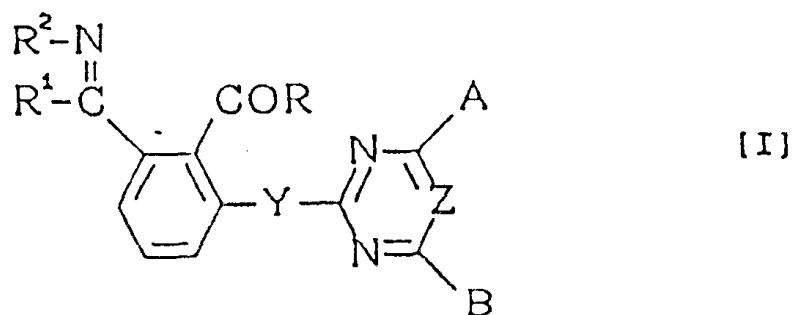
{ 其中 R⁷ 和 R⁸ 代表氢原子, 烷基等 } 或咪唑基, R¹ 代表氢原子, 烷基等; R² 代表羟基, 烷基等; A 和 B 代表烷基等; Y 代表氧原子等; 及 Z 代表次甲基或氮原子。

(BJ) 第1456号

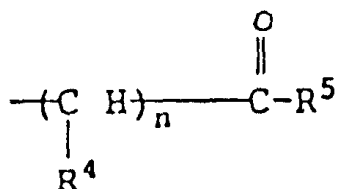
> 20 ^

权 利 要 求 书

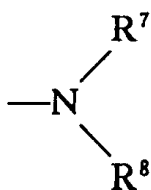
1. 一种嘧啶或三嗪衍生物及其盐，所述嘧啶或三嗪衍生物具下



式：其特征在于其中 R 代表分子式为 OR^3 的基团（其中 R^3 代表氢原子，烷基（它可被卤原子，硝基，氰基，烷氧基，硫代烷基，烷基亚磺酰基，烷基磺酰基，苯硫代基，苯亚磺酰基，苯磺酰基，苄氧基，酰氧基，烷氧基羰基氧基，N,N-二烷基氨基，或苯二甲酰亚氨基取代），链烯基，卤代链烯基，炔基，卤代炔基，苯基（它可由卤原子，烷基，或烷氧基取代），苄基（它可被卤原子，烷基，或烷氧基取代）亚烷基氨基，环亚烷基氨基，下式的基团：



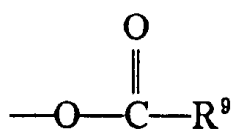
其中 R^4 代表氢原子或烷基， R^5 代表烷基，苯基（它可被卤原子，烷基，或烷氧基取代），氨基，烷基氨基，或二烷基氨基取代，n 代表整数 1 到 3），碱金属原子，碱土金属原子或有机胺正离子}；分子式 SR^6 基团（其中 R^6 代表氢原子，烷基，苯基（它可被卤原子，烷基，或烷氧基取代），苄基（它可被卤原子，烷基，或烷氧基取代），链烯基，卤代链烯基，炔基，或卤代炔基），下式的基团：



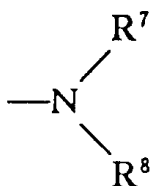
{其中 R⁷ 和 R⁸ 可是同样的或不同的, 代表氢原子, 烷基, 烷氧基, 或苯基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代)}或咪唑基;

R¹ 代表氢原子, 烷基(它可被卤原子, 烷氧基, 烷基硫代基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 酰基, 或氰基取代), 苯基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 或苄基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代);

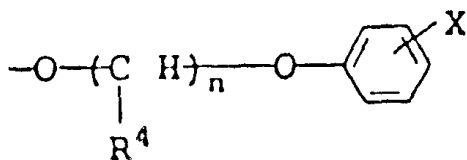
R² 代表羟基, 烷基(它可被一个或二个卤原子取代), 烷氧基烷基, 链烯基, 炔基, 烷氧基(它可被卤原子, 苄氧基, 烷氧基羰基, 环烷基, 酰基, N,N-二烷基氨基, 或烷氧基取代), 苯基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 苄氧基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 链烯氧基(它可被一个或二个卤原子或一个苯基取代), 炔基氧基(它可被一个或二个卤原子或一个苯基所取代), 苄氧基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 三甲基甲硅烷基氧基, 环烷氧基, 下式的基团



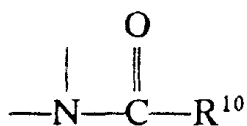
{其中 R⁹ 代表可被一个卤原子取代的烷基, 环烷基, 苯基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 烷氧基, 或下式基团:



(其中 R⁷ 和 R⁸ 如上所定义)}下式的基团

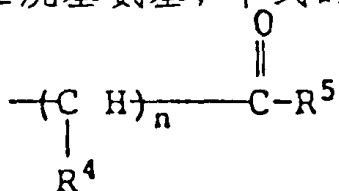


(其中 X 代表卤原子, 烷基, 或烷氧基, n 代表 1 到 3 的整数, R⁴ 如上所定义), 苯基氨基, 烷氧基羰基氨基, 或烷基羰基氨基; A 和 B 可是同样的或不同的, 代表烷基, 烷氧基, 卤原子, 卤代烷基, 卤代烷氧基, 或二烷基氨基; Y 代表氧原子, 硫原子, -NH-基团或下式的基团



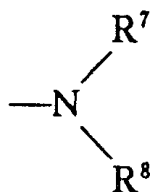
(其中 R¹⁰ 代表氢原子, 烷基, 或烷氧基); 及 Z 代表次甲基或氮原子。

2. 根据权利要求 1 所述的啉或三嗪衍生物及其盐, 其特征在于 R 代表式 OR³ 的基团 { 其中 R³ 代表氢原子, C₁₋₈ 烷基 (它可被卤原子, 硝基, 氰基, C₁₋₈ 烷氧基, C₁₋₈ 硫代烷基, C₁₋₈ 烷基亚磺酰基, C₁₋₈ 烷基磺酰基, 苯硫代基, 苯亚磺酰基, 苯磺酰基, 苄氧基, R'COO— (R' = C₁₋₈ 烷基), C₁₋₈ 烷氧基羰基氧基, N,N-二-C₁₋₄ 烷基氨基, 或苯二甲酰亚氨基取代), C₂₋₈ 链烯基, 卤代 C₂₋₈ 链烯基, C₂₋₈ 炔基, 卤代 C₂₋₈ 炔基, 苯基 (它可被卤原子, C₁₋₆ 烷基, 或 C₁₋₆ 烷氧基取代), 苄基 (它可被卤原子, C₁₋₈ 烷基, 或 C₁₋₈ 烷氧基取代), C₁₋₄ 亚烷基氨基, C₄₋₆ 环亚烷基氨基, 下式的基团



{ 其中 R⁴ 代表氢原子或 C₁₋₃ 烷基, R⁵ 代表 C₁₋₈ 烷基, 苯基 (它可被卤原子, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 烷氧基取代), 氨基, C₁₋₈ 烷基氨基, 或二-C₁₋₄ 烷基氨基取代, n 代表整数 1 到 3), 碱金属原子, 碱土金属原子或有机胺正离子); 分子式 SR⁶ 基团 { 其中 R⁶ 代表氢原子, C₁₋₈ 烷基, 苯基

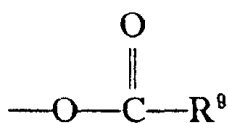
(它可被卤原子, C₁₋₆烷基, 或 C₁₋₆烷氧基取代), 苄基(它可被卤原子, C₁₋₆烷基, 或 C₁₋₆烷氧基取代), C₂₋₈链烯基, 卤代 C₂₋₈链烯基, C₂₋₈炔基, 或卤代 C₂₋₈炔基取代}; 下式的基团;



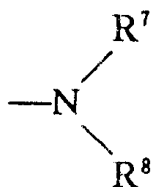
{其中 R⁷ 和 R⁸ 可是同样的或不同的, 代表氢原子, C₁₋₈烷基, C₁₋₈烷氧基, 或苄基(它可被卤原子, C₁₋₆烷基, 或 C₁₋₆烷氧基取代)}, 或咪唑基;

R¹ 代表氢原子, C₁₋₈烷基(它可被卤原子, C₁₋₈烷氧基, C₁₋₈烷基硫代基, C₁₋₈烷基亚磺酰基, C₁₋₈烷基磺酰基, R''CO-(R'' = C₁₋₆烷基, 苯基或苄基), 或氰基取代), 苄基(它可被卤原子, C₁₋₆烷基, C₁₋₆烷氧基取代), 或苄基(它可被卤原子, C₁₋₆烷基, 或 C₁₋₆烷氧基取代);

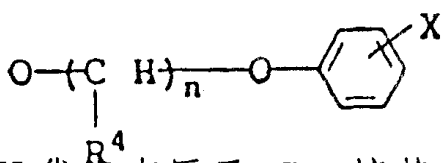
R² 代表羟基, C₁₋₈烷基(它可被一个或二个卤原子取代), C₂₋₈烷氧基烷基, C₂₋₈链烯基, C₂₋₈炔基, C₁₋₈烷氧基(它可被卤原子, 苄氧基, C₁₋₈烷氧基羰基, C₃₋₇环烷基, 酰基, N,N-二-C₁₋₄烷基氨基, 或 C₁₋₈烷氧基取代), 苄基(它可被卤原子, C₁₋₄烷基, 或 C₁₋₄烷氧基取代), 苄氧基(它可被卤原子, C₁₋₄烷基, 或 C₁₋₄烷氧基取代), C₂₋₈链烯基氧基(它可被一个或二个卤原子或一个苄基所取代), C₂₋₈炔基氧基(它可被一个或二个卤原子或一个苄基所取代), 苄氧基(它可被卤原子, C₁₋₄烷基, 或 C₁₋₄烷氧基取代), 三甲基甲硅烷基氧基, C₃₋₇环烷氧基, 下式的基团:



(其中 R^9 代表 C_{1-8} 烷基(它可被一个卤原子取代), C_{3-7} 环烷基, 苯基(它可被卤原子, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代), C_{1-8} 烷氧基, 或下式基团,

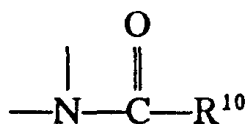


(其中 R^7 和 R^8 如上所定义)), 下式的基团



(其中 X 代表卤原子, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基, n 代表 1 到 3 的整数, R^4 如上所定义), 苯基氨基, C_{1-4} 烷氧基羰基氨基, C_{1-4} 烷基羰基氨基; A 和 B 可是同样的或不同的, 代表 C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, 卤原子, 卤代 C_{1-4} 烷基, 卤代 C_{1-4} 烷氧基, 或二- C_{1-4} 烷基氨基;

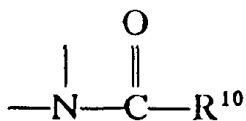
Y 代表氧原子, 硫原子, $-NH-$ 基团或下式的基团



(其中 R^{10} 代表氢原子, C_{1-8} 烷基, 或 C_{1-8} 烷氧基); 及 Z 代表次甲基或氮原子。

3. 根据权利要求 1 所述的嘧啶或三嗪衍生物及其盐, 其特征在于 Y 为氧原子或硫原子。

4. 根据权利要求 1 所述的嘧啶或三嗪衍生物及其盐, 其特征在于 Y 为 $-NH-$ 基, 或下式基团,

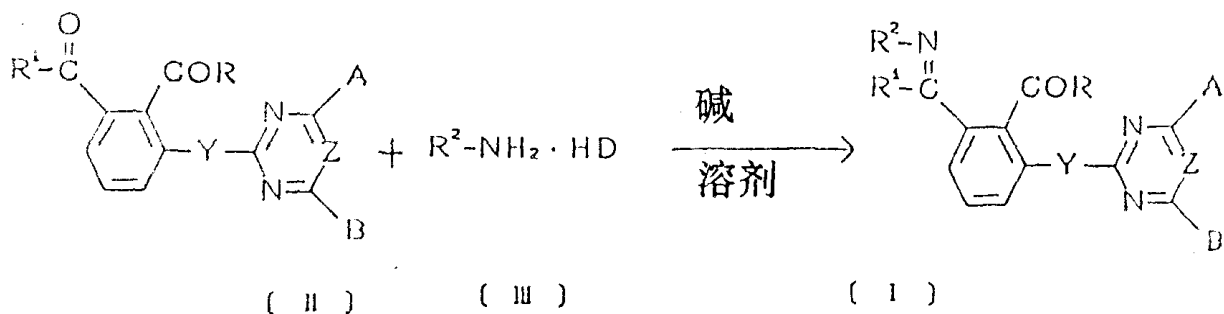


(其中 R^{10} 代表氢原子, 烷基或烷氧基)。

5. 一种制备权利要求 1 的化合物的方法, 其特征在于它包括进

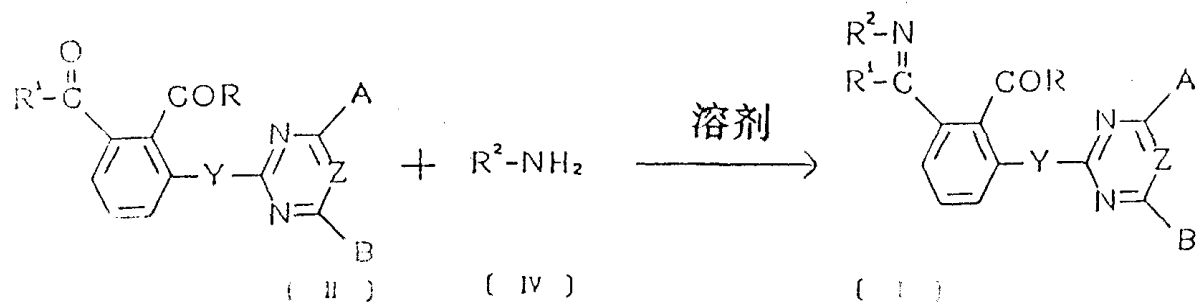
行下列(A)至(C)的反应:

(A)



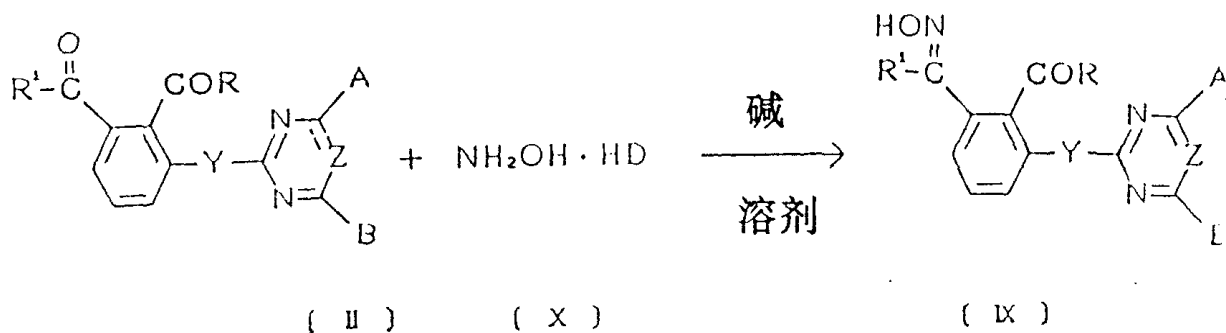
其中 R, R¹, R², A, B, Y 和 Z 如权利要求 1 中所述, HD 代表与胺成盐的酸;

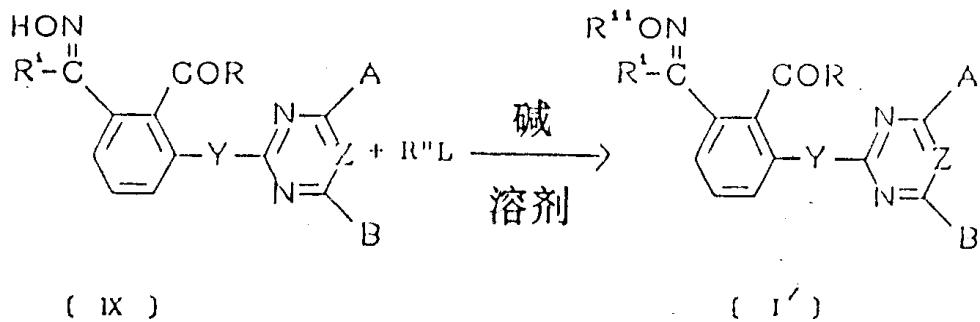
(B)



其中 R, R¹, R², A, B, Y 和 Z 如权利要求 1 中所定义; 和

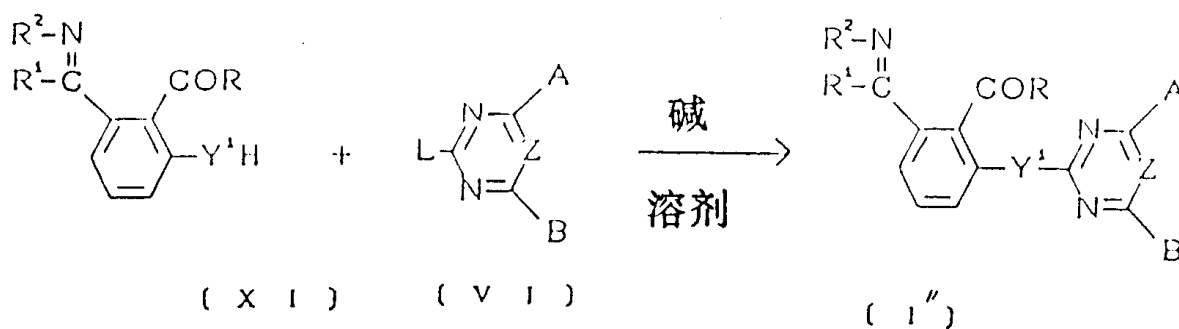
(C)





其中 R, R¹, A, B, Y 和 Z 如权利要求 1 中所定义, HD 代表与胺盐的酸; R¹¹ 代表烷基, 苯基, 链烯基, 炔基, 苄基, 烷氧基羰基烷基或环烷基; 及 L 或代表一可消除的基团。

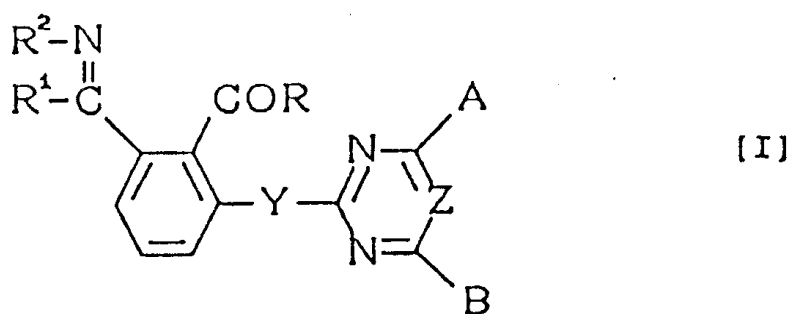
6. 一种制备权利要求 1 的化合物的方法, 其特征在于它包括进行下列反应



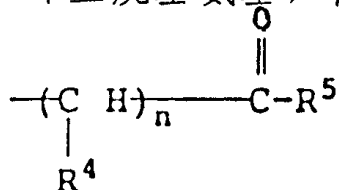
其中 R, R¹, R², A, B 和 Z 如权利要求 1 中所述, 及 Y¹ 是氧原子或硫原子。

7. 一种抑制杂草的方法, 它包括施用除草有效量的权利要求 1 的化合物。

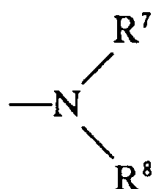
8. 一种含有除草有效量的嘧啶或三嗪衍生物及其盐的除草组合物, 所述嘧啶或三嗪衍生物具下式:



其特征在于其中 R 代表分子式为 OR^3 的基团 { 其中 R^3 代表氢原子, 烷基 (它可被卤原子, 硝基, 氰基, 烷氧基, 硫代烷基, 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 苯硫代基, 苯亚磺酰基, 苯磺酰基, 苄氧基, 酰氧基, 烷氧基羰基氧基, N,N-二烷基氨基, 或苯二甲酰亚氨基取代), 链烯基, 卤代链烯基, 炔基, 卤代炔基, 苯基 (它可由卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 苄基 (它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 亚烷基氨基, 环亚烷基氨基, 下式的基团:



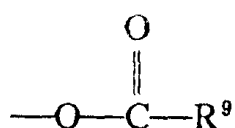
(其中 R^4 代表氢原子或烷基, R^5 代表烷基, 苯基 (它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 氨基, 烷基氨基, 或二烷基氨基取代, n 代表整数 1 到 3), 碱金属原子, 碱土金属原子或有机胺正离子}; 分子式 SR^6 基团 { 其中 R^6 代表氢原子, 烷基, 苯基 (它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 苄基 (它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 链烯基, 卤代链烯基, 炔基, 或卤代炔基}, 下式的基团:



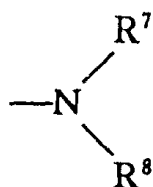
{ 其中 R^7 和 R^8 可是同样的或不同的, 代表氢原子, 烷基, 烷氧基, 或苯基 (它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代)} 或咪唑基;

R^1 代表氢原子, 烷基 (它可被卤原子, 烷氧基, 烷基硫代基, 烷基亚

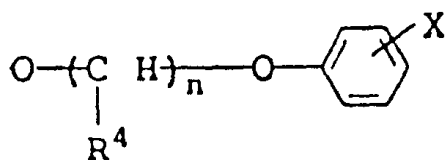
磺酰基, 烷基磺酰基, 酰基, 或氰基取代), 苯基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 或苄基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代); R^2 代表羟基, 烷基(它可被一个或二个卤原子取代), 烷氧基烷基, 链烯基, 炔基, 烷氧基(它可被卤原子, 苄氧基, 烷氧基羰基, 环烷基, 酰基, N,N-二烷基氨基, 或烷氧基取代), 苯基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 苯氧基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 链烯基氧基(它可被一个或二个卤原子或一个苯基取代), 炔基氧基(它可被一个或二个卤原子或一个苯基所取代), 苄氧基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 三甲基甲硅烷基氧基, 环烷氧基, 下式的基团



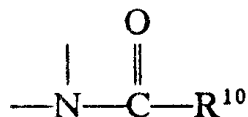
{其中 R^9 代表可被一个卤原子取代的烷基, 环烷基, 苯基(它可被卤原子, 烷基, 或烷氧基取代), 烷氧基, 或下式基团:



(其中 R^7 和 R^8 如上所定义)}, 下式的基团

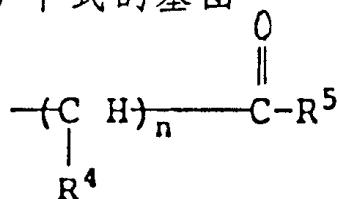


(其中 X 代表卤原子, 烷基, 或烷氧基, n 代表 1 到 3 的整数, R^4 如上所定义), 苯基氨基, 烷氧基羰基氨基, 或烷基羰基氨基; A 和 B 可是同样的或不同的, 代表烷基, 烷氧基, 卤原子, 卤代烷基, 卤代烷氧基, 或二烷基氨基; Y 代表氧原子, 硫原子, -NH-基团或下式的基团

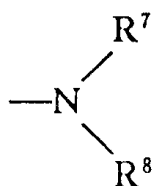


(其中 R^{10} 代表氢原子, 烷基, 或烷氧基); 及 Z 代表次甲基或氮原子, 及农业上载体或稀释剂。

9. 根据权利要求 8 所述的组合物, 其特征在于其中 R 代表式为 OR^3 的基团 { 其中 R^3 代表氢原子, C_{1-8} 烷基 (它可被卤原子, 硝基, 氰基, C_{1-8} 烷氧基, C_{1-8} 硫代烷基, C_{1-8} 烷基亚磺酰基, C_{1-8} 烷基磺酰基, 苯硫代基, 苯亚磺酰基, 苯磺酰基, 苄氧基, $R'COO-$ ($R' = C_{1-8}$ 烷基), C_{1-8} 烷氧基羰基氧基, N,N-二- C_{1-4} 烷基氨基, 或苯二甲酰亚氨基取代), C_{2-8} 链烯基, 卤代 C_{2-8} 链烯基, C_{2-8} 炔基, 卤代 C_{2-8} 炔基, 苯基 (它可被卤原子, C_{1-6} 烷基, 或 C_{1-6} 烷氧基取代), 苄基 (它可被卤原子, C_{1-8} 烷基, 或 C_{1-8} 烷氧基取代), C_{1-4} 亚烷基氨基, C_{4-6} 环亚烷基氨基, 下式的基团



{ 其中 R^4 代表氢原子或 C_{1-3} 烷基, R^5 代表 C_{1-8} 烷基, 苯基 (它可被卤原子, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 烷氧基取代), 氨基, C_{1-8} 烷基氨基, 或二- C_{1-4} 烷基氨基取代, n 代表整数 1 到 3), 碱金属原子, 碱土金属原子或有机胺正离子}; 分子式 SR^6 基团 { 其中 R^6 代表氢原子, C_{1-8} 烷基, 苯基 (它可被卤原子, C_{1-6} 烷基, 或 C_{1-6} 烷氧基取代), 苄基 (它可被卤原子, C_{1-6} 烷基, 或 C_{1-6} 烷氧基取代), C_{2-8} 链烯基, 卤代 C_{2-8} 链烯基, C_{2-8} 炔基, 或卤代 C_{2-8} 炔基取代}; 下式的基团;

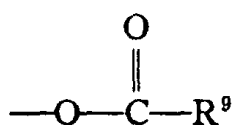


{ 其中 R^7 和 R^8 可是同样的或不同的, 代表氢原子, C_{1-8} 烷基, C_{1-8} 烷

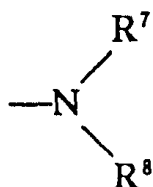
氧基, 或苯基(它可被卤原子, C_{1-6} 烷基, 或 C_{1-6} 烷氧基取代)}, 或咪唑基;

R^1 代表氢原子, C_{1-8} 烷基(它可被卤原子, C_{1-8} 烷氧基, C_{1-8} 烷基硫代基, C_{1-8} 烷基亚磺酰基, C_{1-8} 烷基磺酰基, $R''CO-$ ($R'' = C_{1-6}$ 烷基, 苯基或苄基), 或氰基取代), 苯基(它可被卤原子, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 烷氧基取代), 或苄基(它可被卤原子, C_{1-6} 烷基, 或 C_{1-6} 烷氧基取代);

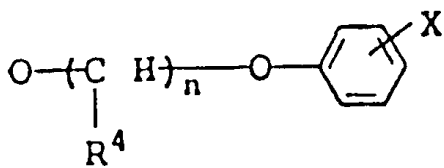
R^2 代表羟基, C_{1-8} 烷基(它可被一个或二个卤原子取代), C_{2-8} 烷氧基烷基, C_{2-8} 链烯基, C_{2-8} 炔基, C_{1-8} 烷氧基(它可被卤原子, 苄氧基, C_{1-8} 烷氧基羰基, C_{3-7} 环烷基, 酰基, N,N -二- C_{1-4} 烷基氨基, 或 C_{1-8} 烷氧基取代), 苯基(它可被卤原子, C_{1-4} 烷基, 或 C_{1-4} 烷氧基取代), 苯氧基(它可被卤原子, C_{1-4} 烷基, 或 C_{1-4} 烷氧基取代), C_{2-8} 链烯基氧基(它可被一个或二个卤原子或一个苯基所取代), C_{2-8} 炔基氧基(它可被一个或二个卤原子或一个苯基所取代), 苄氧基(它可被卤原子, C_{1-4} 烷基, 或 C_{1-4} 烷氧基取代), 三甲基甲硅烷基氧基, C_{3-7} 环烷氧基, 下式的基团:



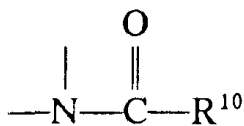
{其中 R^9 代表 C_{1-8} 烷基(它可被一个卤原子取代), C_{3-7} 环烷基, 苯基(它可被卤原子, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代), C_{1-8} 烷氧基, 或下式基团,



(其中 R^7 和 R^8 如上所定义)}, 下式的基团



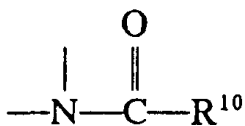
(其中 X 代表卤原子, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄烷氧基, n 代表 1 到 3 的整数, R⁴ 如上所定义), 苯基氨基, C₁₋₄烷氧基羰基氨基, C₁₋₄烷基羰基氨基; A 和 B 可是同样的或不同的, 代表 C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, 卤原子, 卤代 C₁₋₄烷基, 卤代 C₁₋₄烷氧基, 或二-C₁₋₄烷基氨基; Y 代表氧原子, 硫原子, —NH—基团或下式的基团



(其中 R¹⁰代表氢原子, C₁₋₈烷基, 或 C₁₋₈烷氧基); 及 Z 代表次甲基或氮原子。

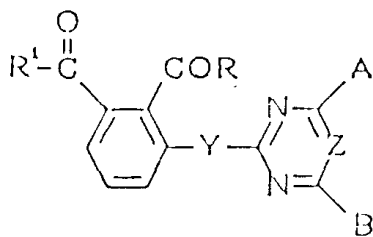
10. 根据权利要求 1 所述的化合物, 其特征在于 Y 是氧原子或硫原子。

11. 根据权利要求 1 所述的组合物, 其特征在于 Y 是—NH—或下式基团



(其中 R¹⁰代表氢原子, 烷基或烷氧基)。

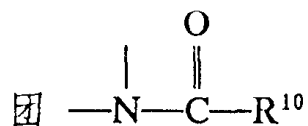
12. 具下式的化合物



其中 R, R¹, A, B, Y 和 Z 如权利要求 1 中所定义。

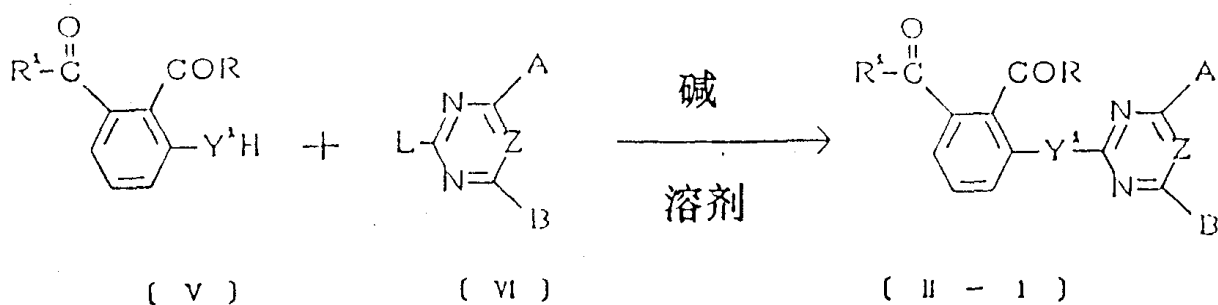
13. 根据权利要求 12 所述的化合物, 其特征在于 Y 是氧原子或硫原子。

14. 根据权利要求 12 所述的化合物, 其中 Y 是 -NH- 或下式基



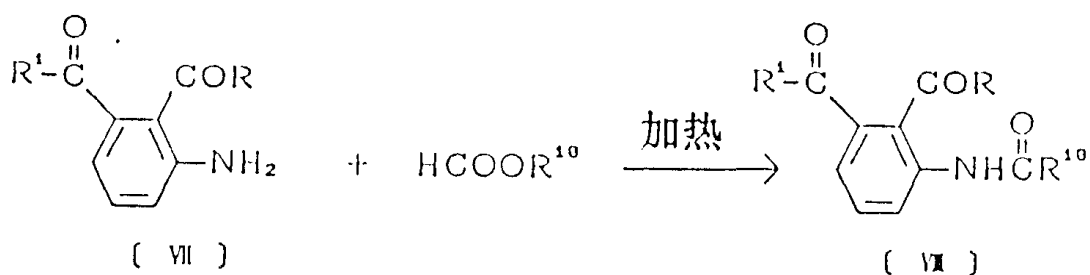
(其中 R¹⁰ 代表氢原子, 烷基或烷氧基)。

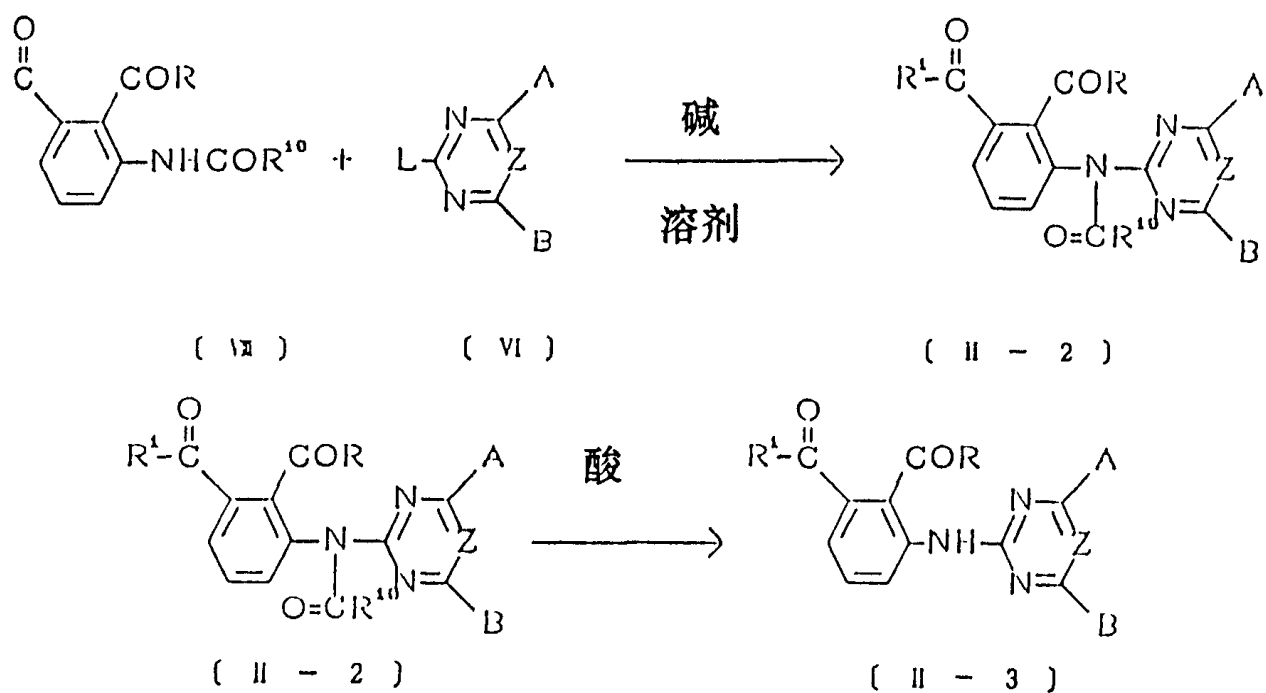
15. 制备权利要求 13 化合物的方法, 其特征在于它包括进行下列反应:



其中 R, R¹, A, B 和 Z 如权利要求 1 所定义; Y¹ 为氧原子或硫原子; 及 L 代表可消除的基团。

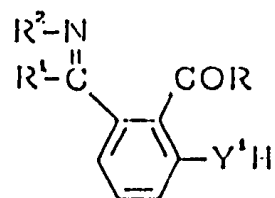
16. 制备权利要求 14 的化合物的方法, 其特征在于它包括进行下列反应:





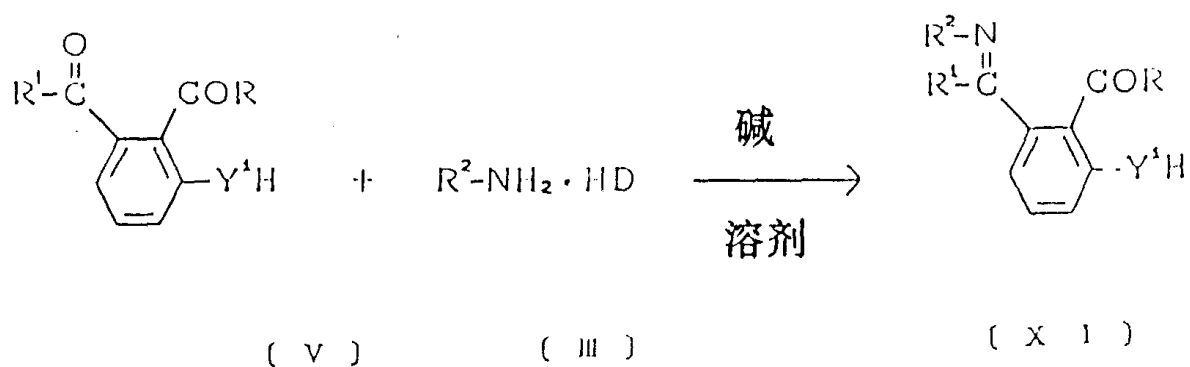
其中 R, R¹, A, B 和 Z 如权利要求 1 中所定义; R¹⁰ 代表氢原子, 烷基或烷氧基; 及 L 代表可消除的基团。

17. 具下列通式的化合物



其中 R, R¹, A, B 和 Z 如权利要求 1 中所定义, Y¹ 为氧原子或硫原子。

18. 制备权利要求 17 的化合物的方法, 其特征在于它包括进行下列反应:



其中 R, R¹, A, B 和 Z 如权利要求 1 中所定义; Y¹ 为氧原子或硫原子; L 代表可消除的基团。

19. 根据权利要求 1 所述的嘧啶衍生物及其盐, 其中 Z 为次甲基。

20. 根据权利要求 1 所述的三嗪衍生物及其盐, 其中 Z 为氮原子。

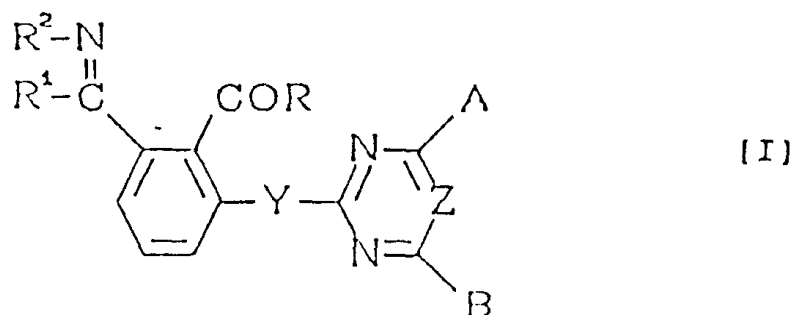
嘧啶或三嗪衍生物及含该类物质的除草剂组合物

本发明涉及新颖的嘧啶或三嗪衍生物及其盐。更特定地，本发明涉及由下面通式 (I) 表示的嘧啶或三嗪衍生物，也涉及含有所述嘧啶或三嗪衍生物或其盐作为活性组分的除草剂组合物，该除草剂组合物可施用于水稻田，高地田或非农业田地。

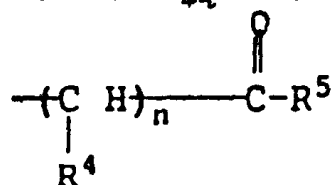
美国专利 4,770,691 (日本未审查专利公开号 174059/1987)，美国专利 4,427,437 (日本未审查专利公开号 55729/1979) 和 *Agr Biol Chem.*, Vol. 30, No. 9, p896 (1966) 公开了 2-苯氧基嘧啶衍生物具有除草活性。

但是，这些专利说明书和参考文献中所公开的化合物就其除草效果来说并不总是令人满意的。本申请案的发明人进行了极度多的研究以发展进一步改进的嘧啶或三嗪型化合物，并且发现具有在嘧啶或三嗪衍生物和苯环上特定位置的取代基的嘧啶或三嗪衍生物不仅对一年生草，并且对多年生草呈现出极好的除草活性，并且对谷类作物，尤其是水稻具有高度的安全性。本发明是在以上发现的基础上完成的。

本发明提供一个嘧啶或三嗪衍生物及其盐，所述嘧啶或三嗪衍生物具有通式 (I)：

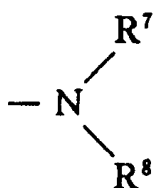


其中 R 代表分子式为 OR³ 的基团 (其中 R³ 代表氢原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基基团, 更佳的为 C₁₋₄ 烷基基团 (它可被下述基团取代, 包括卤原子, 硝基, 氰基, 烷氧基, 较佳为 C₁₋₈ 烷氧基, 更佳为 C₁₋₄ 烷氧基, 硫代烷基, 较佳为 C₁₋₈ 硫代烷基, 更佳为 C₁₋₄ 硫代烷基, 烷基亚磺酰基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基亚磺酰基, 更佳为 C₁₋₄ 烷基亚磺酰基, 烷基磺酰基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基磺酰基, 更佳为 C₁₋₄ 烷基磺酰基, 苯硫代基, 苯亚磺酰基, 苯磺酰基, 苄氧基, 酰氧基, 较佳为 R'COO— (R' = C₁₋₈ 烷基), 烷氧基羰氧基, 较佳为 C 烷氧羰基氧基, N, N-二烷基氨基, 较佳为 N, N-二-C₁₋₄ 烷基氨基, 或苯二甲酰亚氨基), 链烯基, 较佳为 C₂₋₈ 链烯基, 卤代链烯基, 较佳为卤代 C₂₋₈ 链烯基, 炔基, 较佳为 C₂₋₈ 炔基, 卤代炔基, 较佳为卤代 C₂₋₈ 炔基, 苯基 (可由卤原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₆ 烷基, 或烷氧基, 较佳为 C₁₋₆ 烷氧基取代), 苄基 (可由卤原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基, 或烷氧基, 较佳为 C₁₋₈ 烷氧基取代), 亚烷基氨基, 较佳为 C₁₋₄ 亚烷基氨基, 环亚烷基氨基, 较佳为 C₄ 环亚烷基氨基, 下式的基团



(其中 R⁴ 代表氢原子或烷基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基, R⁵ 代表烷基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基, 苯基 (它可被卤原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₆ 烷基, 或烷氧基, 较佳为 C₁₋₆ 烷氧基取代), 氨基, 烷氨基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基氨基, 或二烷基氨基, 较佳为二-C₁₋₄ 烷基氨基, n 代表整数 1 到 3), 碱金属原子, 碱土金属原子或有机胺正离子}; 分子式 SR⁶ 基团 {其中 R⁶ 代表氢原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基, 苯基 (它可被卤原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₆ 烷基, 或烷氧基, 较佳为 C₁₋₆ 烷氧基取代), 苄基 (它可被卤原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₈ 烷基, 或烷氧基, 较佳为 C₁₋₈ 烷氧基取代), 链烯基, 较佳为 C₂₋₈ 链烯基, 卤代链烯基, 较佳为卤代 C₂₋₈ 链

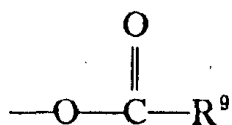
烯基，炔基，较佳为 C₂₋₈炔基，或卤代炔基，较佳为卤代 C₂₋₈炔基}；
下式的基^[1]



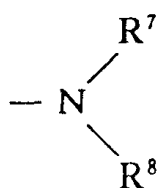
{其中 R⁷ 和 R⁸ 可是同样的或不同的，代表氢原子，烷基，较佳为 C₁₋₈烷基，烷氧基，较佳为 C₁₋₈烷氧基，或苯基（它可被卤原子，烷基，较佳为 C₁₋₆烷基，或烷氧基，较佳为 C₁₋₆烷氧基取代）}；或咪唑基。R¹ 代表氢原子，烷基，较佳为 C₁₋₈烷基（它可被卤原子，烷氧基，较佳为 C₁₋₈烷氧基，烷基硫代基，较佳为 C₁₋₈烷基硫代基，烷基亚磺酰基，较佳为 C₁₋₈烷基亚磺酰基，烷基磺酰基，较佳为 C₁₋₈烷基磺酰基，酰基，较佳为 R''CO-（R''=C₁₋₆烷基，苯基或苄基），或氰基取代），苯基（它可被卤原子，烷基，较佳为 C₁₋₆烷基，或烷氧基，较佳为 C₁₋₆烷氧基取代），或苄基（它可被卤原子，烷基，较佳为 C₁₋₆烷基，或烷氧基，较佳为 C₁₋₆烷氧基取代）；

R² 代表羟基，烷基，较佳为 C₁₋₈烷基（它可被一个或二个卤原子取代），烷氧基烷基，较佳为 C₂₋₈烷氧基烷基，链烯基，较佳为 C₂₋₈链烯基，炔基，较佳为 C₂₋₈炔基，烷氧基，较佳为 C₁₋₈烷氧基（它可被下列基团所取代，包括：卤原子，苄氧基，烷氧羰基，较佳为 C₁₋₈烷氧羰基，环烷基，较佳为 C₃₋₇环烷基，酰基，N, N'-二烷基，较佳为 N, N-二-C₁₋₄烷基，或烷氧基，较佳为 C₁₋₈烷氧基），苯基（它可被卤原子，烷基，较佳为 C₁₋₄烷基，或烷氧基，较佳为 C₁₋₄烷氧基取代）。苯氧基（它可被卤原子，烷基，较佳为 C₁₋₄烷基，或烷氧基，较佳为 C₁₋₄烷氧基取代），链烯基氧基，较佳为 C₂₋₈链烯基氧基（它可被一个或两个卤原子或一个苯基取代），炔基氧基，较佳为 C₂₋₈炔基氧基（它可被一个或二个卤原子或一个苯基所取代），苄氧基（它可被卤原子，烷基，较佳为 C₁₋₄烷基，或烷氧基，较佳为 C₁₋₄烷氧基

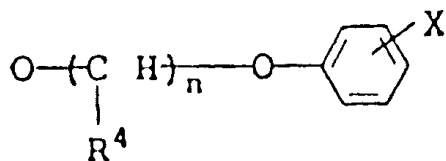
所取代), 三甲基甲硅烷基氧基, 环烷氧基, 较佳为 C₃₋₇环烷氧基, 下式的基团



{其中 R⁹ 代表烷基, 较佳为 C₁₋₈烷基 (它可被一个卤原子取代), 环烷基, 较佳为 C₃₋₇环烷基, 苯基 (它可被卤原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₄烷基, 或烷氧基. 较佳为 C₁₋₄烷氧基取代), 烷氧基, 较佳为 C₁₋₈烷氧基, 或下式基团,

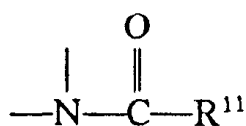


(其中 R⁷ 和 R⁸ 如上所定义)}, 下式的基团



(其中 X 代表卤原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₄烷基, 或烷氧基, 较佳为 C₁₋₄烷氧基, n 代表 1 到 3 的整数, R⁴ 如上所定义), 苯基氨基, 烷氧基羰基氨基, 较佳为 C₁₋₄烷氧基羰基氨基, 或烷基羰基氨基, 较佳为 C₁₋₄烷基羰基氨基; A 和 B 可是同样的或不同的, 代表烷基, 较佳为 C₁₋₄烷基, 烷氧基, 较佳为 C₁₋₄烷氧基, 卤原子, 卤代烷基, 较佳为卤代 C₁₋₄烷基, 卤代烷氧基, 较佳为卤代 C₁₋₄烷氧基, 或二烷基氨基, 较佳为二-C₁₋₄烷基氨基;

Y 代表氧原子, 硫原子, -NH-基团或下式的基团

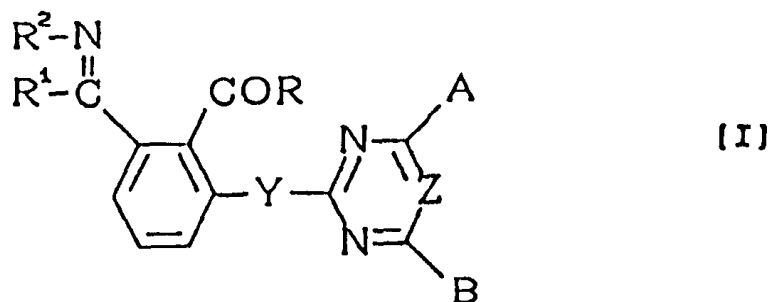


(其中 R¹⁰ 代表氢原子, 烷基, 较佳为 C₁₋₈烷基, 烷氧基, 较佳为 C₁₋₈

烷氧基);及 Z 代表次甲基或氮原子。

由通式 (I) 表达的本发明化合物的典型例子列在下面表 1 中。

表 1







化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
1	OH	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	125-127
2	OH	CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	113-115
3	OH	CH ₃	OC ₃ H ₇₋₁	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5380
4	OCH ₂ -⊙	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5545
5	OCH ₂ -⊙	CH ₃	OC ₂ H ₆	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	80- 82
6	OCH ₂ -⊙	CH ₃	OC ₃ H ₇₋₁	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5472
7	OCH ₂ -⊙	CH ₃	OCH ₂ -⊙	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5817
8	OCH ₃	CH ₃	OH	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	131-132
9	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	105-106
10	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	不能测定
11	OCH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	93- 95
12	OCH ₃	CH ₃	OC ₃ H ₇₋₁	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	74- 75
13	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ -⊙	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5681
14	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	76- 78

注解:化合物第 9 号和第 10 号为结构上的同分异构物

表 1 (续)


化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
15	OC ₂ H ₅	CH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	65-68
16	OC ₃ H ₇	CH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5449
17	OC ₃ H ₇ -i	CH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5301
18	OH	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	109-111.5
19	OC ₂ H ₅	H	OH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5558
20	OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	78-79
21	OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5582
22	OC ₂ H ₅	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCHCOOC}_2\text{H}_5 \end{array}$	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5261
23	OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅ -⊖	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5799
24	OC ₂ H ₅	H	NH-⊖	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	不能测定
25	OC ₂ H ₅	H	NHCOOC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	108-109
26	OC ₂ H ₅	H	NHCOOC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	136-138
27	OC ₂ H ₅	H	NHCOCH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	144-146
28	OC ₂ H ₅	H	-⊖	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	122-124
29	OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5449
30	OC ₃ H ₇ -i	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5450
31	OC ₂ H ₅ (CH ₂) ₂ -CH ₂ OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5430
32	OC ₂ H ₅ -⊖	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	1.5741

表 1 (续)

化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
33	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	S	CH	1.5709
34	OCH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	S	CH	62.5-64
35	OCH ₃	H	O-()	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5849
36	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	O	CH	110-113
37	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	O	CH	1.5587
38	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	O	CH	126-129
39	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	CH	1.5342
40	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	O	CH	79-80
41	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	H	131-135
42	OCH ₂ -()	CH ₃	O-()	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5740
43	OCH ₃	CH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	73-76
44	OCH ₂ -()	CH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	65-66
45	OH	CH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5112
46	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	NH	CH	82-84
47	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	NH	CH	139-141
48	OCH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5290
49	ONa	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	138-150
50	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₂	O	CH	1.5221

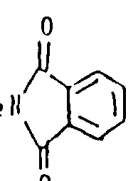
注解: 化合物第 46 号和第 47 号为结构上的同分异构物

表 1 (续)

化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
51	OCH ₃	CH ₃	O-⊙	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5823
52	OCH ₃	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCHCOOC}_2\text{H}_5 \end{array}$	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5290
53	OCH ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	75-77
54	OCH ₃	C ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5343
55	OCH ₃	C ₃ H ₇ -1	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
56	OCH ₃	-⊙	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
57	OCH ₃	CH ₂ -⊙	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
58	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CH	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	77-80.5
59	OCH ₃	CH ₃	O- 	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
60	OCH ₃	CH ₃	OC ₄ H ₉	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5374
61	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ -⊙-Cl	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5772
62	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ -⊙-OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	109-111
63	OH	CH ₃	OC ₂ H ₆	OCH ₃	OCH ₃	S	CH	152-155
64	OH	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	S	CH	144-147
65	OCH ₂ S-⊙	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5687
66	OCH ₂ SO-⊙	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
67	OCH ₂ CH	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5376

* = 三键

表 1 (续)

化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
68	OCH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5408
69	OCH ₂ OCO -C ₆ H ₅ -t	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5248
70	OCH(CH ₃)O -COOC ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5220
71	OCH ₂ OCH ₂ -⊙	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5589
72	-OCH ₂ N 	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	170-172
73	OH=C(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5355
74	OH=C(C ₂ H ₅) ₂	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	103-105
75	OCH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	95-98
76	OCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5465
77	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	0	CH	
78	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl -CH ₂	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	54-56
79	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl ·CHCl	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5468
80	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl -CHCl	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5510
81	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ OC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5210

注解:化合物第79号和第80号为结构上的同分异构物

* = 三键

表 1 (续)







化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
82	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ -()	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5373
83	OCH ₃	CH ₃	OCOCCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5510
84	OCH ₃	CH ₃	OCOC ₄ H ₉ -l	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5291
85	OCH ₃	CH ₃	OCO- 	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	94-96
86	OCH ₃	CH ₃	OCO-()	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	121-125
87	OCH ₃	CH ₃	OCO-()-F	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5377
88	OCH ₃	CH ₃	OCOOCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	122-126
89	OCH ₃	CH ₃	OCONH-()	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5508
90	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ Cl	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
91	OCH ₃	CH ₃	O(CH ₂) ₂ Cl	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5540
92	OCH ₃	CH ₃	O(CH ₂) ₃ Cl	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5539
93	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ C(Br) =CH ₂	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5576
94	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ - 	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5438
95	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CHCl ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5520
96	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH =CH ₂	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5473
97	OCH ₃	CH ₃	OCOC ₂ H ₆	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
98	OCH ₃	CH ₃	OCOC ₃ H ₇	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
99	OCH ₃	CH ₃	OCOCCH ₂ Cl	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	

表 1 (续)






化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
100	OCH ₃	CH ₃	OCOC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
101	OCH ₃	CH ₃	OCN(CH ₃) ₂	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
102	OCH ₃	CH ₃	OCOCF ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	110 - 111
103	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5496
104	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CH-⊖	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5572
105	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CHCl	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5588
106	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CCl ₂	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5579
107	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
108	OCH ₃	CH ₃	OC(CH ₃) ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5339
109	OCH ₃	CH ₃	OSi(CH ₃) ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
110	OCH ₃	CH ₃	O- 	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
111	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5341
112	OCH ₃	CH ₃	OC ₄ H ₉ -s	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5407
113	OCH ₃	CH ₃	- 	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
114	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O -()-OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
115	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ O- 	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
116	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ O- 	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5724

表 1 (续)

化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
117	OC ₂ H ₅	CH ₃	OC ₂ H ₄ CH ₂ CH ₂ O -⊖-Cl	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	
118	OC ₂ H ₅	CH ₃	-⊖	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	158-162
119	OC ₂ H ₅	CH ₃	-⊖ CH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	112-115
120	OC ₂ H ₅	CH ₃	-⊖-Cl	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	169-171
121	OC ₂ H ₅	CH ₃	-⊖-OCH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	133-135
122	OC ₂ H ₅	CH ₃	C ₃ H ₇	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	108-112
123	OC ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	
124	OC ₂ H ₅	CH ₃	C ₃ H ₇ -i	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	
125	OC ₂ H ₅	CH ₃	C ₄ H ₉	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	
126	OC ₂ H ₅	CH ₃	C ₄ H ₉ -t	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	
127	OC ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₄ OCH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	
128	OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	CH	
129	OH	CH ₃	OC ₃ H ₇ -i	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	CH	164-168
130	OH	CH ₃	OC ₂ H ₅ CH-CH ₂	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	CH	123-125
131	OC ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	HClHO	CH	147-149
132	OC ₂ H ₅	CH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	HCOCH ₃	CH	100-102.5
133	OCH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	HCOOCH ₃	CH	95-97
134	OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	CH	

表 1 (续)



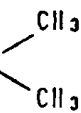
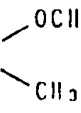
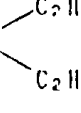
化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
135	OCH ₃	H	OC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	S	CH	
136	OCH ₂ CO-⊖	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	118-121
137		CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	194-199
138	SCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
139	SC ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	73-88
140	S-⊖	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
141	S-⊖-Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
142		CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
143	S-⊖-OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
144	SCH ₂ -⊖	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
145	SCH ₂ -⊖-Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
146		CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	1.5491
147		CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
148		CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
149	NHC ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	

表 1 (续)

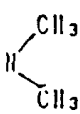







化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
150	NHC ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	103-104.5
151	OCH ₂ CON ₂ 	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	不能测定
152	OCH ₂ COCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5320
153	OCH ₂ CO-(\ominus)	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	118-121
154	OCH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5459
155	OCH ₂ SO ₂ -(\ominus)	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
156	OCH ₂ NO ₂	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
157	O(CH ₂) ₂ Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	不能测定
158	OCH ₂ Cl ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
159	OCH ₂ -(\ominus)-OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
160	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	O	N	1.5378
161	OCH ₃	CH ₂ Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
162	OCH ₃	CH ₂ Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
163	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
164	OCH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5210
165	OCH ₃	CH ₂ SCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
166	OCH ₃	CH ₂ SC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
167	OCH ₃	CH ₂ CH	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	

表 1 (续)

化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
168	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ - $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_2\text{N} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
169	OCH ₂ - $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_2\text{N} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
170	OH- 	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
171	OCH ₂ - $\begin{array}{c} \text{C}=\text{CH}_2 \\ \\ \text{Cl} \end{array}$	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
172	OCH ₂ C=C- $\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
173	OCH ₃	CH ₂  CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
174	OCH ₃	CH ₂  CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
175	OCH ₃	CH ₂  CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
176	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂  -	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	
177	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂  CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	CH	

* = 三键

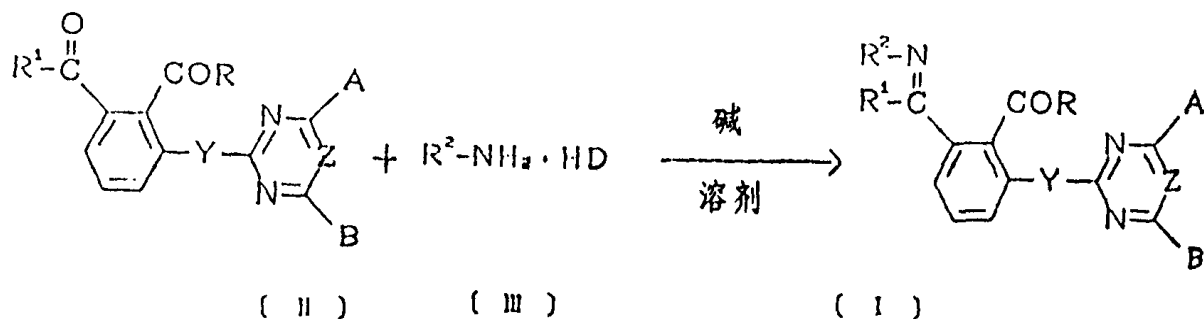
表 1 (续)

化合物 序号	R	R ¹	R ²	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
178	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ C=C- CH ₂ Cl	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
179	O-⊙	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
180	O-⊙-Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
181	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	CF ₃	OCH ₃	O	CH	
182	OCH ₂ $\overset{\text{O}}{\parallel}$ CNH ₂	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	121-125
183	OCH ₃	CH ₃	$\begin{matrix} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCH} \end{matrix}$ 	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	1.5402

* = 三键

本发明的化合物可以例如通过以下 A 到 F 方法制备而得。

方法 A



(其中 R, R¹, R², A, B, Z 和 Y 如上所定义, HD 代表与胺成盐的酸, 好形成硫酸盐, 氯化氢或其类似物的相应的酸)。

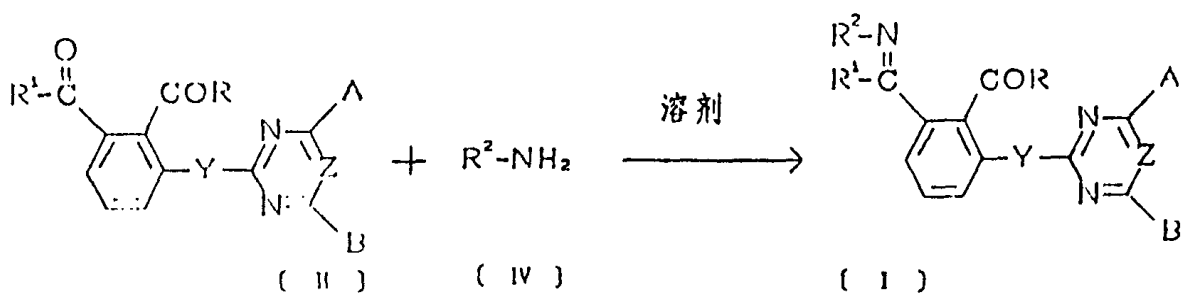
本发明通式 (I) 的化合物可以通过使通式 (II) 的化合物与通式 (III) 的化合物在碱存在下于惰性溶剂中在 0 °C 到溶剂沸点温度间反应 30 分钟到 12 个小时而制备。作为碱, 可用碱金属如钠和钾或碱土金属如镁和钙的碳酸盐, 碳酸氢盐, 乙酸盐, 醇化物, 氢氧化物, 氢化物或氧化物。另外, 可用有机碱, 如吡啶或叔胺如三乙胺。

作为溶剂, 可用碳氢化合物溶剂如甲苯, 苯, 二甲苯或其类似物, 卤代烃溶剂如二氯甲烷, 氯仿或其类似物, 醇溶剂如甲醇, 乙醇或其类似物, 醚溶剂如乙基醚, 异丙醚, 四氢呋喃, 1,4-二噁烷或其类似物, 质子惰性极性溶剂如 N,N-二甲基甲酰胺, N,N-二甲基乙酰胺, 二甲亚砷或其类似物, 酯溶剂如乙酸乙酯或其类似物。

溶剂和碱的较佳组合例子包括甲醇和乙酸钾的组合, 及氯仿和三乙胺的组合。

方法 B

本发明通式 (I) 的化合物也可通过将通式 (II) 的化合物与通式 (IV) 的胺, 如胍, 苯胺, 羟胺或其类似物反应而制备, 反应优先在溶剂中进行, 如下面反方式所表示

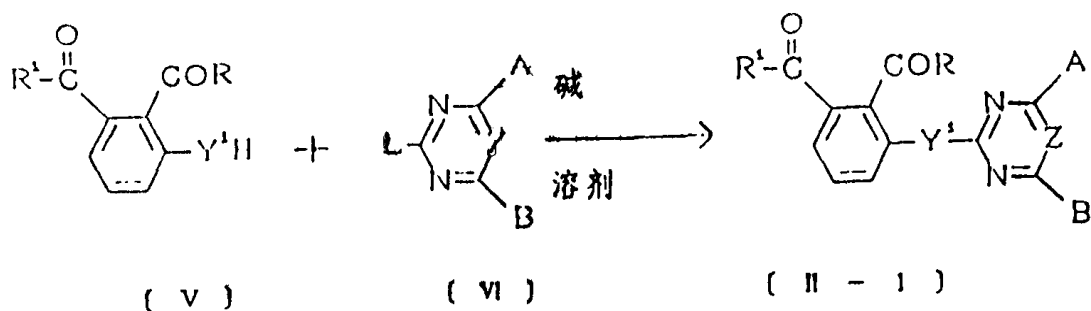


(其中 R, R¹, R², A, B, Y 和 Z 如上所定义)

本方法中所用的溶剂和反应温度可与上述方法 A 中所用的相同。较佳的一个反应条件包括在甲醇溶剂中回流。

在上述方法 A 和 B 中用作起始材料的通式 (II) 化合物也是新穎化合物, 可如下列反应式所述制备。

(a) 通式 (I) 的化合物, 其中 Y 是氧原子或硫原子:



(其中 Y¹ 是氧原子或硫原子, R, R¹, A, B 和 Z 如上所定义, L 代表可消除的基团)。

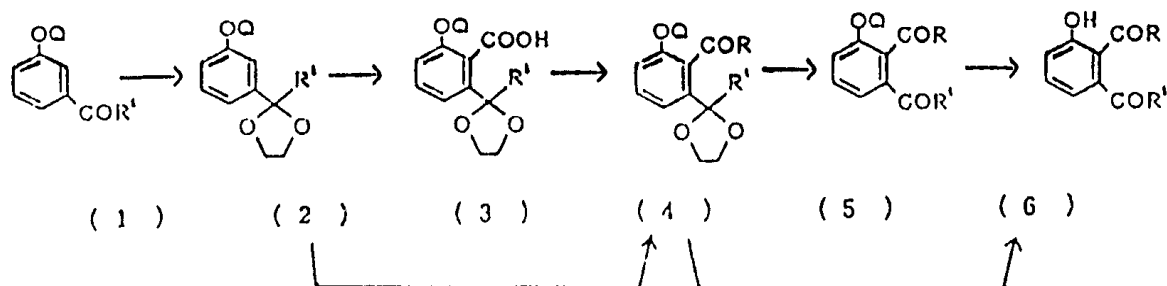
即通式 (II-1) 的化合物可以通过将通式 (V) 的化合物与通式 (VI) 的化合物在碱存在下于惰性溶剂中在 0 °C 到溶剂的沸点温度范围之间反应而制备。此方法中所用的碱和溶剂可如上面所定义。溶剂和碱的较佳组合例子包括二甲基甲酰胺与碳酸钾的组合, 或二甲基甲酰胺与氢化钠的组合。

通式 (V) 的化合物是已知的, 并且能够制备, 例如用 Pharma-

ceutical Journal Vol 74, p466 (1954)中所描述的方法。

通式 (V) 的化合物也可通过下列反应式所表示的两个合成途径而制备。

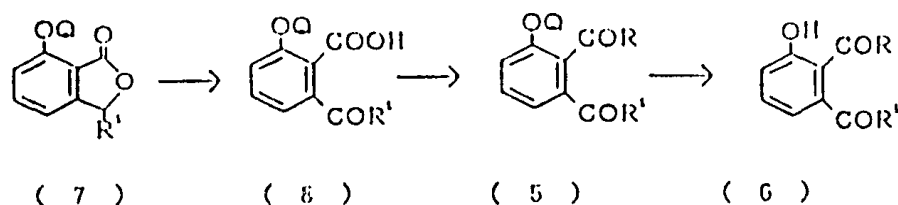
途径 1



(其中 Q 代表烷基, 烷氧基烷基或苄基, R 和 R' 如上所定义。)

通式 (1) 的酰基苯衍生物和 1,2-亚乙基二醇在路易斯酸存在下进行缩醛化, 以获得通式 (2) 的化合物, 通式 (2) 的化合物然后与二氧化碳在有机金属如正丁基锂或苯基锂的存在下在惰性溶剂如正己烷, 甲苯或苯中反应以获得通式 (3) 的化合物。所得化合物然后用常规方法酯化, 然后分步或同时消除缩醛和羟基的保护基。通式 (4) 的化合物也可通过将通式 (2) 的化合物与卤代甲酸酯在有机金属如正丁基锂或苯基锂的存在下在惰性溶剂如正己烷, 甲苯或苯中反应而制备。

途径 2

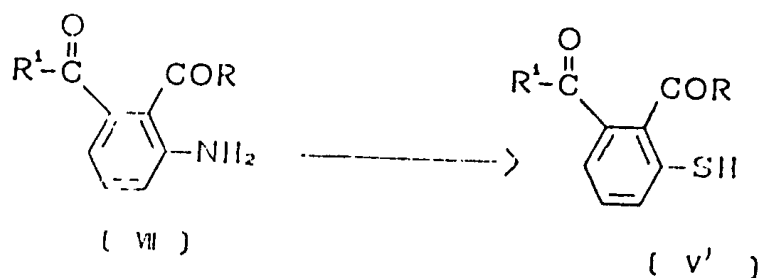


(其中 R, R' 和 Q 如上所定义)。

通式(7)的2-苯并[c]咪喃酮衍生物在氧化条件下于高锰酸钾和硝酸镁存在下水解,以获得通式(8)的水杨酸衍生物。

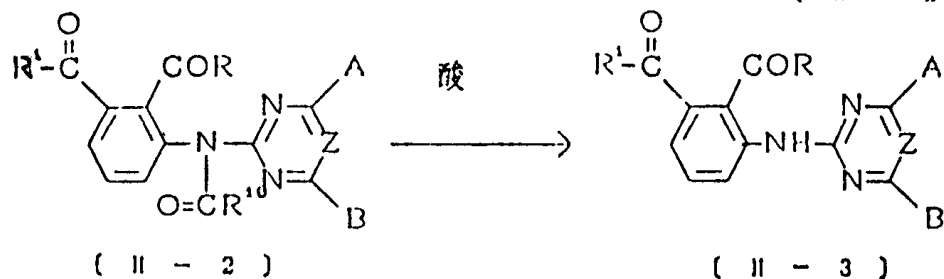
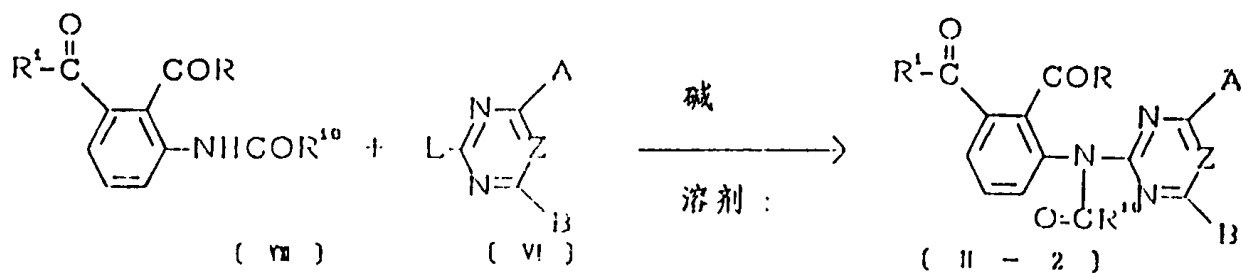
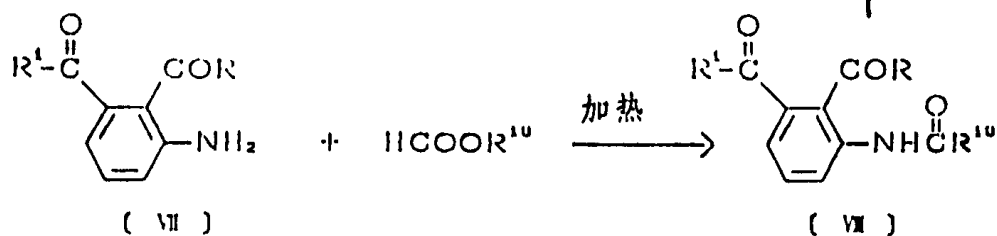
所得化合物然后用常规方法酯化,选择性消除羟基的保护基团以获取目的化合物。

其中Y¹是硫原子的通式(V)的化合物,可通过将上述文献中公开的通式(VI)化合物如下面反应式所示而制备:



(其中R和R¹如上所定义)。

(6)通式(I)的化合物,其中Y代表—NH—基或 $-\text{N}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{R}^{10}$ 基

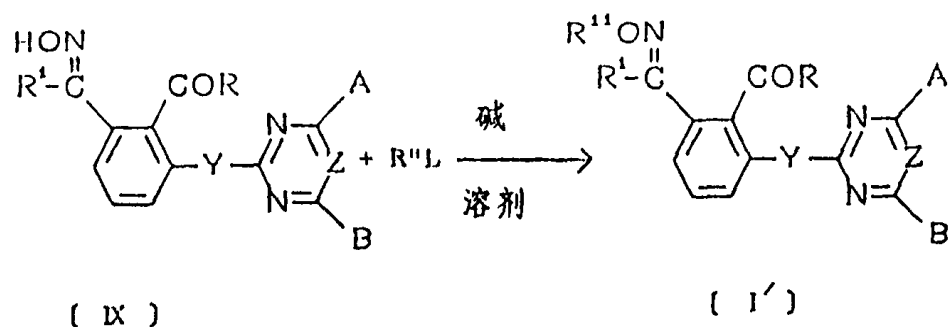


(其中 R, R¹, A, B, Z 和 L 如上所定义)。

即上述文献中公开的通式 (VII) 的邻氨基苯甲酸衍生物的氨基用甲酸甲酰化以获得通式 (VIII) 的化合物。所得化合物与通式 (VI) 的嘧啶或三嗪衍生物反应以获得取通式 (I-2) 的邻氨基苯甲酸衍生物。这个方法中反应条件包括溶剂, 碱, 反应温度和反应时间与方法 A 中所用的那些一致。所得化合物可以进一步去甲酰化以获取通式 (I-3) 的化合物。

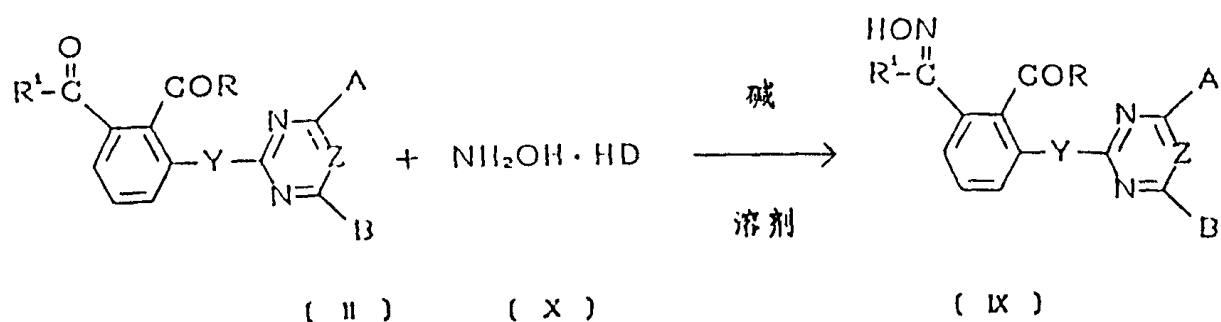
方法 C

本发明的化合物也可通过用如下反应式所述的烷化剂烷化相应的肟而制备。烷化剂的例子包括烷基卤, 卤代烯烃, 苄基卤, 卤代脂肪族酯, 环烷基卤, 烷基硫酸盐或其类似物。



(其中 R, R¹, A, B, Y 和 Z 如上所定义, R^{II}代表烷基, 苯基, 链烯基, 炔基, 苄基, 烷氧基羰基烷基, 或环烷基, L 代表消除基团)。

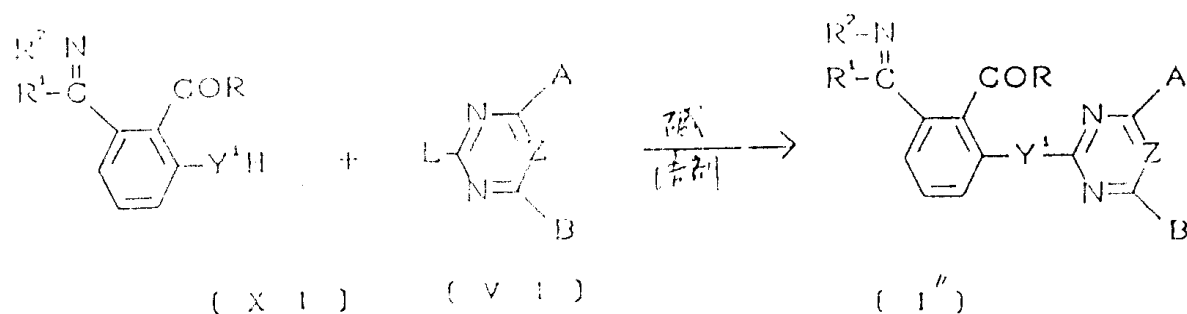
式 (IX) 的化合物可通过, 例如使通式 (II) 的化合物与通式 (X) 的羟胺盐以上述方法 A 的同样方法反应而制备。



(其中 R, R¹, A, B, Z, Y 和 HD 如上所定义)。

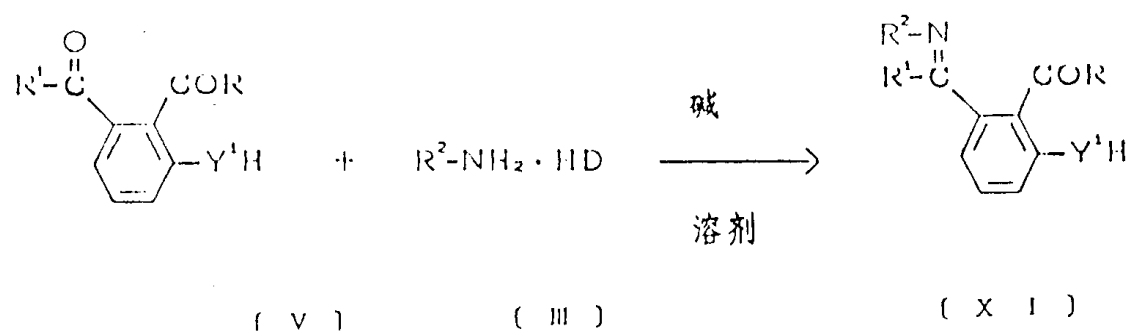
方法 D

本发明的化合物也可通过使通式 (XI) 的化合物与通式 (VI) 的化合物在碱存在下于惰性溶剂中, 在 0 °C 到溶剂的沸点温度之间反应而制备。这方法中所用的碱和溶剂与方法 A 中合成通式 (I) 的物质时所用的一致。



(其中 R, R¹, A, B, Y¹, Z 和 L 如上定义)。

上述反应中用作起始材料的式 (XI) 化合物也是新颖化合物, 可以通过, 例如使上述参考文献中公开的式 (V) 化合物与式 (III) 的胺盐反应而制备, 根据下列反应式以与方法 A 相同的方法式进行反应:

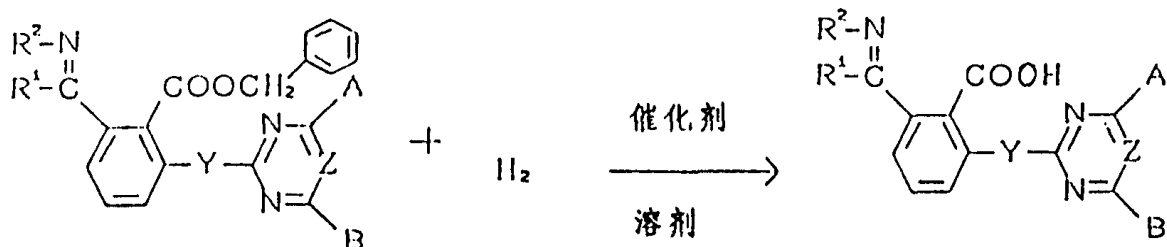


(其中 R, R¹, R², Y 和 HD 如上所定义)。

方法 E

具通式 (I) 其中 R 为羟基的本发明的化合物可通过催化氢还原其中 R 为苄氧基的通式 (I) 化合物而获得, 反应在催化剂例如

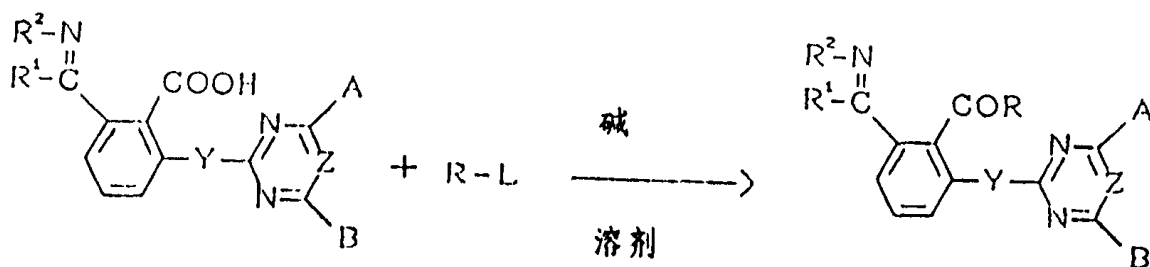
阮内镍，钨碳或其类似物的存在下进行。



(其中 R^1, R^2, A, B, Y 和 Z 如上所定义)。

方法 F

本发明的化合物也可以下述反应式所描述的那样制备：



(I)

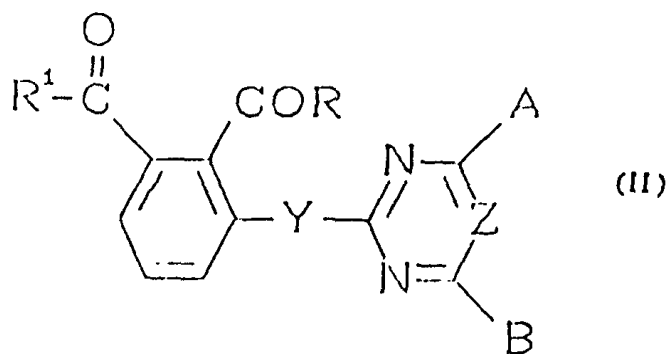
(其中 R, R^1, R^2, A, B, Z, Y 和 L 如上所定义)。

例如本发明的化合物也可通过将方法 E 获得的苯甲酸衍生物与具有相应消除基团的酯残基缩合而获得，反应在合适的碱例如碳酸钾，氢化钠或其类似物存在下，在合适的情性溶剂如二甲基甲酰胺，四氢呋喃，乙腈，甲苯或其类似物中，在室温到 100 °C 的温度范围内进行。

用于本发明的化合物的具通式 (I) 或 (XI) 的中间体产物的典型例子列在下面表 2-1 和 2-2 中。

这些中间体产物也具有优秀的除草活性和选择性。

表 2-1

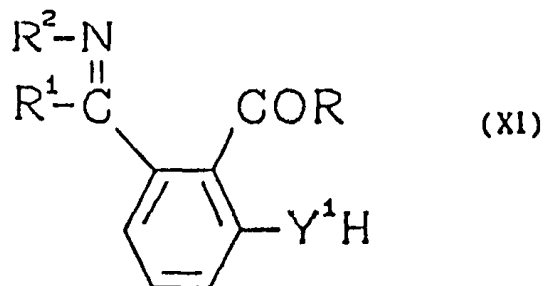


中间体 化合物 序号	R	R ¹	A	B	Y	Z	物理性质, 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
1	OH	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	163-165
2	OCH ₂ -(<i>c</i>)	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	141-143
3	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	164-166
4	OC ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
5	OC ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	84.5-86
6	OC ₃ H _{7-i}	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	
7	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	S	CH	149-151
8	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	O	CH	117.5-120
9	OCH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	O	CH	109-112
10	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	O	CH	127-130
11	OCH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	CH	117-118.5
12	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	CH	138-140
13	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	O	N	151-156
14	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	III	CH	108-110
15	OCH ₃	CH ₃	OCHH ₂	OCH ₃	O	CH	70-73

表 2-1 (续)

中间体 化合物 序 号	R	R ¹	A	B	Y	Z	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
16	OH	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	S	CH	177-180
17	OCH ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	120-122
18	OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	O	CH	91-93
19	OCH ₃	CH ₃	$\begin{matrix} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{N} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{matrix}$	OCH ₃	O	N	145-149
20	OCH ₃	CH ₃	$\begin{matrix} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{N} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{matrix}$	OCH ₃	O	CH	

表 2-2



中间体 化合物 序 号	R	R ¹	R ²	Y ¹	物理性质 熔点(°C)或 折射率(n _D ²⁰)
21	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	O	1.5423
22	OH	CH ₃	OCH ₃	O	79-81
23	OCH ₃	CH ₃	O-(C)	O	
24	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂ -⊙	O	
25	OCH ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	O	

现在，将结合实施例和参考实施例进一步详细地描述本发明的化合物和它的中间体产物的制备方法。但是，必须指出本发明不受这些特定实施例的限制。

实施例 1

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 9)

在 50 毫升氯仿中加入 5 克 2-乙酰-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]苯甲酸甲酯 (熔点 = 164 到 166 °C), 3 克甲醇胺氢氯化物和 3.6 克三乙胺, 混合物在回流下搅拌反应 8 小时。反应液倒入大量水中, 用水洗涤后分离出氯仿层, 干燥后在减压下蒸馏去溶剂。油状产物用柱层析纯化, 用己烷/异丙醚作为展开剂, 在己烷/异丙醚混合溶剂中重结晶, 获得 3.2 克无色透明棱晶形晶体的目的化合物 (熔点 = 105 到 106 °C), 产率为 50%。

实施例 2

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 9)

在 50 毫升的甲醇中加入 3.3 克 2-乙酰-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]苯甲酸甲酯, 4.7 克甲醇胺氢氯化物和 4.9 克乙酸钾, 混合物在回流下加热搅拌反应 2 小时, 反应液倒入大量水中, 在用盐酸使之变酸性后用乙酸乙酯萃取产物, 产物依次用碳酸氢钠水溶液和水洗涤。干燥后, 所获得的浓缩结晶用异丙醚洗涤以获取 3.2 克目的产物 (熔点 = 105 到 106 °C), 产率为 89%。

参考实施例 1

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代]-6-乙酰苯甲酸甲酯 (中间体产物序号 7)

用 14.2 毫升浓盐酸，40 毫升水和 4.3 克亚硝酸钠的混合物将 10.2 克 2-氨基-6-乙酰苯甲酸转变成重氮盐，在 0 °C 到 5 °C 温度之间将重氮盐逐渐加入二硫化钠水溶液中（用 14.3 克 $\text{Na}_2\text{S} \cdot 9\text{H}_2\text{O}$ ，1.9 克硫，4.6 克氢氧化钠和 30 毫升水制备）。滴加完后，反应液在室温搅拌 2 小时以完成反应。反应液倒入大量水中，在加入浓盐酸后，用乙酸乙酯萃取产物。在乙酸乙酯层，加入碳酸氢钠水溶液，萃取溶解于碳酸氢钠的成份。在所得的水溶液中，加入 14.8 克焦硫酸钠，混合物回流 30 分钟以完成反应。在反应液中，加入浓盐酸，用乙酸乙酯萃取产物。干燥萃取液，将溶剂在减压下蒸馏去，以获得 10.1 克 2-巯基-6-乙酰苯甲酸，产率为 90%。

将所获得的 10.1 克 2-巯基-6-乙酰苯甲酸与 7.6 克氢氧化钾溶解于 20 毫升水和 30 毫升 N,N-二甲基甲酰胺混合溶剂中。在所得溶液中加入 13.5 克 4,6-二甲氧基-2-甲基磺酰基嘧啶，所得溶液在室温搅拌反应 2 小时，进一步在 60 °C 搅拌反应 0.5 小时。反应液倒入大量水中，用氯仿萃取中性组份。水相中加入浓盐酸，这样沉淀下来的油状产物用醚萃取，然后干燥。醚溶液然后通过硅酸镁载体 (Florisil) 短柱，蒸馏去醚以获取 6.1 克 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代]-6-乙酰苯甲酸。

使 0.3 克 60% 氢化钠悬浮在 40 毫升 1:1 四氢呋喃和 N,N-二甲基甲酰胺混合溶剂中后，在悬浮液中加入 2.5 克上述获得的 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代]-6-乙酰苯甲酸，然后搅拌 30 分钟。室温下在所得液体中滴加入 1.3 克甲基碘，所得液体加热回流 2 小时以完成反应。反应液倒入水中，用乙酸乙酯萃取。萃取液用水洗涤并干燥，减压下蒸馏去溶剂。所获残余物用色谱法纯化，获得 5.8 克目的化合物（熔点 = 149 到 151 °C），产率为 32%。

实施例 3

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)]

乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 3)

使 1.0 克 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代]-6-苯甲酸乙酰甲酯与 0.5 克甲氧基胺氢氯化物溶解于 6 毫升甲醇中,将所得溶液回流 15 分钟。冷却到室温后,加入 0.8 克碳酸钾,所得液体加热回流 3 小时。反应液倒入大量水中,沉淀下来的油状产物用乙酸乙酯萃取。用水洗涤乙酸乙酯层,干燥并减压蒸馏去除乙酸乙酯。所获得的残留物用色谱层析法纯化,获得 0.65 克目的化合物(折射率=1.5709),产率为 59%。

实施例 4

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-(N'-乙酰亚胍基甲基)苯甲酸甲酯

(化合物序号 27)

将 0.7 克 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-甲酰基苯甲酸甲酯,0.7 克乙酰基胍和 10 毫升甲醇放在 50 毫升茄子形烧瓶中,于室温搅拌 30 分钟。减压蒸馏去甲醇,残留物溶解于乙酸乙酯中。用水,0.5%盐酸和饱和盐溶液洗涤有机层,用无水硫酸镁干燥。过滤后,在最终产物中加入少量硅酸镁载体,并搅拌 5 分钟。过滤去除硅酸镁载体,减压蒸馏去除乙酸乙酯。所获得的固体产物用异丙醚洗涤,获得 0.7 克目的化合物(熔点=144 到 146 °C),产率为 85%。

参考实施例 2

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-甲酰基苯甲酸甲酯(中间体产物序号 18)

将 13.8 克碳酸钾和 50 毫升 DMF 放置在 200 毫升茄子形烧瓶中,然后边搅拌边加入 11.1 克 2-甲酰基-6-羟基苯甲酸甲酯和 14.6 克 4,6-二甲氧基-2-甲磺酰基嘧啶。混合物在 80°C 搅拌 1 小时,所得液体冷却后倒入冰水中。沉淀下来的油状物质用乙酸乙酯萃取,并

用无水硫酸镁干燥。减压蒸馏去除乙酸乙酯，所获得的残留物用柱层析法纯化，获得 11.0 克目的化合物（熔点=91 到 93℃），产率为 52%。

实施例 5

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-(N'-苯基亚胍基甲基)苯甲酸甲酯

(化合物序号 24)

将 0.9 克 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-甲酰基苯甲酸甲酯，0.7 克苯胍氢氯化物，0.4 克乙酸钾和 10 毫升甲醇放置在 50 毫升茄子形烧瓶中，在室温搅拌 10 分钟。减压蒸馏去除甲醇，残留物溶解于乙酸乙酯中。有机层用水，5% 盐酸和饱和盐溶液洗涤，并用无水硫酸镁干燥。过滤后，在所得产物中加入少量硅酸镁载体，所得产物搅拌 5 分钟。过滤去除硅酸镁载体，减压蒸馏去除硫酸乙酯，得到 0.9 克目的化合物（物理性质不能测定），产率为 78%。

实施例 6

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-(羟基亚氨基甲基)苯甲酸甲酯

(化合物序号 19)

将 2.0 克 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-甲酰基苯甲酸甲酯，0.8 克羟基胺氢氯化物，1.1 克乙酸钾和 10 毫升甲醇置于 50 毫升茄子形烧瓶中，于室温搅拌 10 分钟。减压蒸馏去除甲醇，残留物溶解于乙酸乙酯中。有机层用水，5% 盐酸和饱和盐溶液洗涤，用无水硫酸镁干燥。过滤后，在所得产物中加入少量硅酸镁载体，搅拌 5 分钟。过滤去除硅酸镁载体，减压蒸馏去除乙酸乙酯，得到 1.5 克目的化合物（折射率=1.5558），产率为 72%。

实施例 7

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-[(1-乙氧基羰基乙基)氧代

亚氨基甲基) 苯甲酸甲酯

(化合物序号 22)

将 2.0 克 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-羟基亚氨基甲基苯甲酸甲酯, 3 毫升 2-溴代丙酸乙酯和 0.9 克氧化银 (I) 置于 50 毫升茄子形烧瓶中, 使它们在室温过夜。在所得反应液中加入 10 毫升丙酮和 10 克硅胶, 减压蒸馏去丙酮。通过柱层析纯化所得产物, 获得 0.7 克目的化合物 (折射率=1.5261), 产率为 27%。

参考实施例 3

制备 6-[1-(N-甲氧基亚氨基)-乙基]水杨酸甲酯 (中间体产物序号 21)

在 30 毫升甲醇中, 加入 1.2 克 6-乙酰水杨酸甲酯, 1.3 克甲氧基胺氢氯化物和 1.5 克乙酸钾, 在室温搅拌一夜。反应完成后, 将反应液倒入水中, 用盐酸使之成酸性, 用乙酸乙酯萃取反应产物。反应产物依次用碳酸氢钠水溶液和水洗涤, 干燥以获得浓缩油状产物。然后用柱层析纯化, 获得 1.15 克目的化合物 (折射率=1.5423), 产率为 83%。

实施例 8

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯
(化合物序号 9)

在 50 毫升 DMF 中加入 1.15 克 6-[(1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]-水杨酸甲酯, 1.12 克 4,6-二甲氧基-2-甲基磺酰基嘧啶和 0.71 克碳酸钾, 在 100 °C 加热 2 小时。冷却后, 将反应液加入水中, 用乙酸乙酯萃取。用水洗涤萃取产物后, 干燥并浓缩反应产物, 得 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯的粗结晶, 这产物然后用二异丙醚洗涤, 获得 1.35 克目的化合物 (熔点=105 到 106 °C), 产率为 73%。

参考实施例 4

制备 2-乙酰-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)氧]-苯甲酸甲酯 (中间体产物序号 13)

将 1.0 克甲基-6-乙酰水杨酸甲酯加入 0.23 克氢化钠和 30 毫升苯的悬浮液中, 所得混合物在室温下搅拌 10 分钟。在混合物中加入 0.95 克 2-氯代-4,6-二甲氧基三嗪, 混合物于室温搅拌一天一夜。反应完成后, 将反应液倒入水中, 用乙酸乙酯萃取。萃取产物用水洗涤, 干燥并浓缩得到晶体。所获得产物用柱层析法纯化, 得到 1.15 克目的化合物 (熔点=151 到 156 °C), 产率为 67%。

实施例 9

制备 2-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)氧]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 41)

在 30 毫升甲醇中加入 0.9 克 2-乙酰-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)氧]苯甲酸甲酯, 0.68 克甲氧基胺氢氯化物和 0.80 克乙酸钾, 所得混合物在室温搅拌一天一夜。将反应液倒入水中, 用乙酸乙酯萃取。用水洗涤萃取产物后, 干燥并浓缩洗涤产物, 得到油状产物。然后用柱层析法纯化, 获得 0.47 克目的化合物 (熔点=131 到 135 °C), 产率为 48%。

实施例 10

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 1)

在 50 毫升甲醇中, 加入 1.5 克以实施例 1 同样方法制备的 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-[(1-(N-甲氧基亚氨基)乙基)苯甲酸的苄基酯, 以及 0.15 克 10% 钨碳, 在所得混合物中边搅拌边加入 83 毫升氢气。反应完成后, 过滤去除钨碳, 减压蒸馏去溶剂。所

获油状产物用柱层析法纯化，用己烷/乙酸乙酯作为展开剂，获得 1.1 克目的化合物（熔点=125 到 127 °C），产率为 86%。

实施例 11

制备 2-[(4,6-二甲氧基-2-基)氧]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 15)

在 50 毫升 DMF 中，加入 2 克在实施例 8 中获得的 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯，在室温下充分搅拌。在所得液体中加入 0.23 克氢化钠，在停止产生氢气后，加入 1 克溴乙烷，在 60°C 搅拌所得混合物 1 小时。然后将反应液倒入冷水中，由此形成的油状产物用乙酸乙酯萃取。萃取的油状产物用水洗涤，干燥并浓缩。残余油状物质经柱层析法纯化，用己烷/异丙醚(10:1)作为展开剂，得到 1.5 克目的化合物（熔点=65 到 68°C），产率为 69%。

实施例 12

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6--[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 11)

在 30 毫升甲醇中，加入 1.0 克 2-乙酰-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]苯甲酸甲酯，1.18 克乙氧基胺氢氯化物，和 1.18 克乙酸钾，所得混合物回流搅拌 5 小时。反应混合物然后倒入冷水中，用乙酸乙酯萃取。形成的有机相先用稀盐酸洗涤，然后依次用碳酸氢钠水溶液和水洗涤。然后干燥有机相，浓缩获得固体。由此获得的固体产物用正己烷洗涤，获得 0.76 克为无色透明晶体的目的化合物（熔点=93 到 95°C），产率为 67%。

实施例 13

制备 2-[1-(N-烯丙氧基亚氨基)乙基]-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-

基)氧]苯甲酸甲酯

(化合物序号 14)

在 30 毫升甲醇中, 加入 1.0 克 2-乙酰-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]苯甲酸甲酯, 1.0 克烯丙氧基胺氢氯化物和 0.9 克乙酸钾, 回流搅拌 5 小时。反应混合物然后倒入冷水中, 用乙酸乙酯萃取。所形成的有机相先用稀盐酸洗涤, 然后依次用碳酸氢钠和水洗涤。残余油状产物用柱层析法纯化, 获得 0.54 克为无色透明晶体的目的化合物 (熔点 = 76 到 78°C), 产率为 46%。

参考实施例 5

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-丙酰基苯甲酸甲酯

(中间体产物序号 17)

0.78 克 3-羟基-2-甲氧基羰基苯丙酮和 0.85 克 2-甲磺酰基-4,6-二甲氧基嘧啶溶解于 60 毫升 DMF(二甲基甲酰胺)中, 在用冰冷却下, 加入 0.15 克氢化钠 (60% 油分散体)。在室温搅拌所得混合物 8 小时, 在其中加入冰水。所得反应液用乙酸乙酯萃取, 萃取产物用饱和盐溶液洗涤, 用无水硫酸镁干燥。蒸发去除溶剂后, 用柱层析法纯化混合物, 用异丙醚结晶, 获得 0.92 克目的化合物 (熔点 = 120 到 122 °C), 产率为 71.3%。

实施例 14

制备 6-[1-N-甲氧基亚氨基)丙基]-2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]苯甲酸甲酯

(化合物序号 53)

在 80 毫升甲醇中, 加入 0.62 克 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧]-6-丙酰基苯甲酸甲酯, 0.45 克甲氧基胺氢氯化物, 以及 0.53 克乙酸钾, 加热回流 6 小时。过滤沉淀产物, 蒸馏去除溶剂。在产物中加入水, 用乙酸乙酯萃取产物。产物然后用水洗, 并用无水硫酸镁干燥。蒸馏去除溶剂后, 混合物通过柱层析纯化, 用异丙醚/乙酸乙

酯使纯化产物结晶，获得 0.60 克目的化合物（熔点 = 75 到 77℃），产率为 89.5%。

实施例 15

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-N-甲酰基氨基-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 131)

在含 1.68 克氢氧化钠的 100 毫升苯溶液中加入 10 克 2-甲酰基氨基-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯，在室温搅拌所得溶液 10 分钟。在所得混合物中加入 8.7 克 2-甲基磺酰基-4,6-二甲氧基嘧啶，混合物加热回流 6 小时。使之冷却后，将反应液倒入冰水中，用乙酸乙酯萃取。由此形成的有机相用水洗涤，干燥并浓缩。用柱层析法纯化所获得的残留物，得到 8.3 克目的化合物（熔点 = 147 到 149℃），产率为 54%。

实施例 16

制备 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯

(化合物序号 46)

在含 1.34 克 2-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-N-甲酰基氨基]-6-[1-(N-甲氧基亚氨基)乙基]苯甲酸甲酯的 50 毫升甲醇中加入 1 毫升浓盐酸，混合物在室温放置过夜。反应液倒入冰水中，用乙酸乙酯萃取。由此形成的有机相依次用碳酸氢钠水溶液和水洗涤，干燥并浓缩。所获得的残留物用柱层析法纯化，获得 0.87 克目的化合物（熔点 = 82 到 84℃），产率为 70%。

本发明的除草剂含本发明通式(I)的嘧啶或三嗪衍生物及其盐作为有效组份。

当本发明的化合物作为除草剂用于水稻田，高地田，果园，非农业田地或其类似物时，根据其用途目的，有效组份可以以各种制

剂应用。

一般来说，本发明的化合物可以其本来形式使用，或可以制成常用作杀虫剂组合物制剂形式的制剂，例如通过将它与惰性液体或固体载体，表面活性剂，分散剂，或常用在农业化学品制剂中的佐剂一起混合，形成可湿性粉末，颗粒剂，可乳化浓缩物或粉尘。

作为制剂中使用的载体，可以是固体载体如 Jeeklight, 滑石，皂土，陶土，高岭土，硅藻土，白碳，蛭石，熟石灰，二氧化硅沙，硫酸铵或尿素，或是液体载体，如异丙醇，二甲苯，环己酮或甲基萘。作为表面活性剂和分散剂，可以是例如醇—硫酸酯，烷基芳基磺酸酯，木素磺酸盐，聚氧乙烯乙二醇醚，聚氧乙烯烷基芳基醚，或聚氧乙烯山梨醇单烷基脂。作为佐剂，例如，可以是羧甲基纤维素，聚乙二醇，或阿拉伯树胶。除草剂在使用前可以先稀释到合适的浓度，或者可以直接使用。

本发明一般使用时，活性组份的量为 1 克对 10 千克/公顷，较佳为 1 克对 5 千克/公顷，更佳为 1 克对 500 克/公顷。

本发明化合物在制剂中的比例根据剂型，施用方法，施用地点，时间等而改变。因此，它不能一般地被限定。但是，通常在可湿性粉末中，它为 1 到 50 重量百分比，较佳为 10 到 20 重量百分比，在可乳化浓缩物中，它为 0.1 到 90 重量百分比，较佳为 0.5 到 40 重量百分比，在颗粒剂中，它为 0.01 到 10 重量百分比，较佳为 0.1 到 1 重量百分比。

在水稻田中，通过在杂草出现前或后的灌溉土壤处理或通过叶子处理，除草剂能抑制各种杂草。

进一步地，通过在杂草出现前或后的灌溉土壤处理或通过叶子处理，本发明的除草剂在农业田地如高地田或果园中，或在森林中，草地中或其它非农业田地中能抑制各种杂草。

对于土壤处理，本发明的除草剂施用量为每公顷活性组份量为

1 克到 10 千克，较佳的为 1 克到 5 千克，较佳为 10 克到 500 克。对于叶子处理，施用时间被稀释到浓度为 1 到 10,000ppm。更佳地，对于水稻田，施用时间每公顷的活性组份量为 10 到 100 克，对于非农业性田地，施用时间每公顷活性组份量为 500 克到 1 千克。

如果需要的话，本发明的化合物可以同杀虫剂，消毒剂，其它除草剂，植物生长抑制剂，肥料或其类似物一起使用。

可与本发明的化合物一起使用的其它已知除草剂的例子包括 4-硝基苯基-2,4,6-三氯代苯醚(chlornitrofen), 2,4-二氯代苯基-3-甲氧基-4-硝基苯醚(chlomothexynil), 5-(2,4-二氯代苯氧基)-2-硝代苯甲酸甲酯(bifenox), S-4-氯代苄基二乙基硫代甲氨酸酯(thiobencarb), S-乙基全氢化氮杂草-1-硫代羧酸酯(molinate), S-1-甲基-1-苯基乙基哌啶-1-硫代羧酸酯(dimepiperate), S-苄基-N-(1,2-二甲基丙基)-N-乙基硫代甲氨酸酯(esprocarb), 0-(3-叔-丁基苯基)-N-(6-甲氧基-2-吡嗪基)-N-甲基-硫代甲氨酸酯(pyributycarb), 甲基-3,4-二氯代苯基甲氨酸酯(swep), O,O-二异丙基-S-(2-苯基磺酰基氨基乙基)二硫代磷酸酯(bensulfide), S-2-甲基哌啶基羰基甲基-O,O-二丙基二硫代磷酸酯(piperophos), N-(丁氧基甲基)-2-氯代-2',6'-二乙基-N-乙酰苯胺(butachlor), 2-氯代-2',6'-二乙基-N-(2-丙氧基乙基)N-乙酰苯胺(pretilachlor), 2-(苯并噻唑-2-基氧)-N-甲基-N-乙酰苯胺(mefenacet), (RS)-2-溴代-3,3-二甲基-N-(2,2-二甲基苄基)丁酰胺(bromobutide), (2,4-二氯代苯氧基)乙酸(2,4-D)和 2,4-D 乙酯, 4-氯代-O-甲苯氧基乙酸(MCPA)和 MCPA 乙酯, S-乙基-4-氯代-O-甲苯氧基硫代乙酸酯(MCPA-硫代乙基), 4-(4-氯代-O-甲苯氧基)丁酸(MCPB), 2-(2-萘氧基)N-丙酰基苯胺(naproanilide), 2-(2,4-二氯-3-甲基苯氧基)丙酰基苯胺(clomeprop), 2-(1,2-二甲基丙基氨基)-4-乙氨基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪(dimethametryn), 2,4-双(乙基氨基)-6-甲硫基-1,3,5-三嗪(Simetryn), 2,4-双(异丙基氨基)-6-甲硫基-1,3,

5-三嗪(prometryn), 1-(α , α -二甲基苄基)-3-(对甲苯基) 尿素(dymrone), 5-叔丁基-3-(2,4-二氯代-5-异丙氧基苯基)-1,3,4-噁二唑-2(3H)-酮(oxadiazon), 4-(2,4-二氯代安息香酰)-1,3-二甲基-5-吡唑基对甲苯磺酸酯(Pyrazolate), 2-[4-(2,4-二氯代-3-甲基安息香酰)-1,3-二甲基吡唑-5-基氧]-4-甲基乙酰苯甲酮(benzofenap), 2-[4-(2,4-二氯代安息香酰-1,3-二甲基吡唑-5-基氧)乙酰苯甲酮(Pyrazoxyfen), 3-异丙基-1H-2,1,3-苯并硫代二嗪-4(3H)-酮-2,2-二氧化物(bentazone), 2-[[[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氨基羰基]氨基磺酰基]甲基]苯甲酸甲酯(bensulfuron-methyl), 乙基-5-[3-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)酰脲磺酰基]-1-甲基吡唑-4-羧酸酯(Pyrazosulfuron-ethyl)及其类似物。

下面将给出本发明除草剂组合物的配方实施例。但是, 必须明白本发明不受这些特定配方实施例的限制。在这些实施例中, “份”数表示重量份数。

配方实施例 1(可湿性粉末)

10 份序号 11 的化合物, 0.5 份 Emulgen 810(商标, Kao Corporation), 0.5 份 Demol N(商标, Kao Corporation), 20 份 Kunilite 201(商标, Kunimine Kogyo K. K), 和 69 份 Jecklite CA(商标, Jecklite Company Ltd)均匀混合并粉碎, 获得一种可湿性粉末。

配方实施例 2(可湿性粉末)

10 份序号 14 的化合物, 0.5 份 Emulgen 810, 0.5 份 Demol N, 20 份 Kunilite 201, 5 份 Carplex 80 和 64 份 Jecklite CA 均匀混合, 并粉碎以获取可湿性粉末。

配方实施例 3(可乳化浓缩物)

30 份序号 1 的化合物, 60 份二甲苯和异佛尔酮的等量混合物, 及 10 份表面活性剂 Sorpol 800A(商标, Toho Kagaku Kogyo K. K) 均匀地混合并搅拌, 获得可乳化浓缩物。

配方实施例 4(颗粒剂)

10 份序号 9 化合物,80 份增重剂包括滑石和皂土的 1:3 混合物,5 份白碳,5 份表面活性剂 Sorpol 800A,及 10 份水被充分捏和,获得厚浆状物质。然后将厚浆状物质挤压通过直径为 0.7 毫米的筛孔,干燥挤压产物,并将它们切成长度为 0.5 到 1 毫米,得到颗粒剂。

配方实施例 5(混合颗粒剂)

2 份序号 9 的化合物,5 份 bensulfuron-methyl,80 份包括滑石和皂土 1:3 混合物的增重剂,5 份白碳,5 份表面活性剂 Sorpol 800A 和 10 份水被充分捏和,以获得厚浆状物质,然后使厚浆状物质挤压通过直径为 0.7 毫米的筛孔,干燥并切成直径为 0.5 到 1 毫米长度的片段,获得颗粒剂。

由通式(I)表示的本发明的化合物在很少的剂量,从杂草发芽到生长的长段时间内具有良好的除草功能,这些杂草包括一年生和多年生杂草,一年生杂草包括稗(无芒稗),莎草属(*Cyperus difformis*),*monochoria* (*Monochoria vaginalis*)或其类似物,多年生杂草如蔗草属(细蔗草,泽泻,慈姑,莎草,荸荠属,或其生长于水稻田中的类似物。本发明的化合物对各种杂草作为除草剂也有效,如宽叶杂草包括 pale smartweed (大马蓼),细长苋 (*Amaranthus viridis*),藜 (*Chenopodium album*),繁缕 (chickweed) (*Stellaria media*),苘麻 (*Abutilon theophrasti*),多刺黄花稔属 (*Sida spinosa*),牵牛花 (*Ipomea* spp),common cocklebur (*Xanthium strumarium*)或其类似物,多年生和一年生铁荸荠族杂草包括紫香附子莎草(香附子),铁荸荠(*Cyperus esculentus*),green kyllinga (*Cyperus brevifolius*),莎草属(*Cyperus microiria*),稻莎草属(*Cyperus iria*)或其类似物,稻族杂草包括:稗(湖南稗子),马唐 (*Digitaria sanguinalis*),绿石松(狗尾草),一年生早熟禾(早熟禾),宿根高粱(阿刺伯高粱),水石松(看麦娘),小颖花

(乌麦)或其类似物。

另一方面，本发明的除草剂对谷类植物是高度安全的，尤其是对稻，小麦，大麦，玉米，高粱，大豆，棉花，糖甜菜或其类似物。

现在，将结合试验实施例来描述本发明化合物的除草活性。试验实施例 1(通过水稻田土壤处理的除草活性)

在装有水稻田土壤(表面积为 100cm^2)的塑料罐内，在搅和泥浆并平整后播入稗(Ec), *monochoria*(Mo) 和蔗草属(SC)的种子，在上面加水到 3 厘米深。第二天，用水稀释根据配方实施例 1 制备的可湿性粉末，以 1 千克/公顷的量作为活性组份滴加入罐内。然后，使罐在暖房中培养，在处理后的第 21 天进行评估，与下列表 3—1 中的标准对照。结果显示在下列表 4。

表 3—1

指数	除草效果
0	除草效果：大于 0% 而小于 10%
1	除草效果：至少 10% 而小于 30%
2	除草效果：至少 30% 而小于 50%
3	除草效果：至少 50% 而小于 70%
4	除草效果：至少 70% 而小于 90%
5	除草效果：至少 90%

表 3—2

指数	植物毒性
0	植物毒性：大于 0% 而小于 10%
1	植物毒性：至少 10% 而小于 30%
2	植物毒性：至少 30% 而小于 50%
3	植物毒性：至少 50% 而小于 70%
4	植物毒性：至少 70% 而小于 90%
5	植物毒性：至少 90% 至完全枯萎

表 4

化合物序号	除草效果		
	E c	M o	S c
1	5	5	5
2	5	5	5
3	5	5	5
4	5	5	5
5	5	5	5
8	5	5	5
9	5	5	5
1 0	5	5	5
1 1	5	5	5
1 3	5	5	4
1 8	5	5	5
1 9	5	5	5
2 0	5	5	5
2 1	5	5	5
2 2	5	5	4
2 3	5	5	4
2 9	5	5	5
3 3	5	5	5
3 4	5	5	4
3 5	5	5	4
4 2	5	5	5
4 3	5	5	4
4 4	5	5	4
4 5	5	5	4
4 8	5	5	5
4 9	5	5	5
5 0	5	5	5
5 1	5	5	5
5 2	5	5	5
5 3	5	5	5
5 3	5	5	5
6 0	5	5	4
6 1	5	5	4
6 2	5	5	4
6 3	5	5	5

表 4 (续)

化合物序号	除草效果		
	Ec	Mo	Sc
6 4	5	5	5
6 5	5	5	5
6 7	5	5	5
6 8	5	5	5
6 9	5	5	5
7 0	5	5	5
7 1	5	5	5
7 2	5	5	5
7 3	5	5	5
7 4	5	5	5
7 5	5	5	5
7 6	5	5	5
7 8	5	5	5
7 9	5	5	5
8 0	5	5	5
8 1	5	5	5
8 2	5	5	5
8 3	5	5	5
8 4	5	5	5
8 5	5	5	5
8 6	5	5	5
8 7	5	5	5
8 8	5	5	5
9 1	5	5	5
9 2	5	5	5
9 3	5	5	5
1 1 8	5	5	5
1 1 9	5	5	5
1 2 0	5	5	5
1 2 1	5	5	5
1 2 9	5	5	5
1 3 0	5	5	5
1 3 6	5	5	5
1 3 7	5	5	5

试验实施例 2(高地田土壤处理的除草效果试验)

在装有高地田土壤(表面积:120cm²)的塑料罐内,撒下可食稗(Ec),pale smartweed (Po),细长苋(Am),藜(Ch)和稻莎草属(cy)的种子,并盖上土。将预定量的根据配方实施例 1 制备的可湿性粉末用水稀释,用小规模的喷雾器均匀地撒在土壤表面,量为 1000 升/公顷,这样活性组份的剂量为 1 千克/公顷。然后将罐置于暖房中培养,在处理后的 21 天,根据上面表 3—1 中的标准进行评估。表 5 中所列出的化合物作为对比除草剂。试验结果在下面表 6 中显示。

表 5

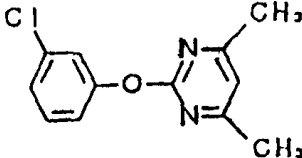
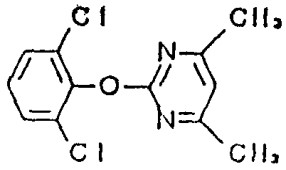
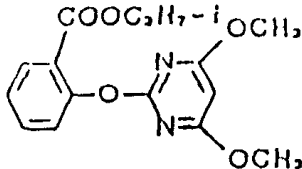
化合结构	参考文献
<p>(A)</p> 	<p>美国专利号 4770691</p>
<p>(B)</p> 	<p>农业和生物学 30,9,896, (1966)</p>
<p>(C)</p> 	<p>美国专利号 4427437</p>

表 6

化合物序号	除草效果				
	E c	P o	A m	C h	C y
1	5	5	5	5	5
2	5	5	5	5	5
3	5	5	5	5	5
4	5	5	5	5	5
5	5	5	5	5	5
6	5	5	5	5	5
7	5	5	5	5	5
8	5	5	5	5	5
9	5	5	5	5	5

表 6 (续)

化合物序号	除草效果				
	Ec	Po	Am	Ch	Cy
1 0	5	5	5	5	5
1 1	5	5	5	5	5
1 2	5	5	5	5	5
1 3	5	5	5	5	5
1 4	5	5	5	5	5
1 5	5	5	5	5	5
1 6	5	5	5	5	5
1 7	5	5	5	5	5
1 8	5	5	5	5	5
1 9	5	5	5	5	5
2 0	5	5	5	5	5
2 1	5	5	5	5	5
2 4	4	5	5	5	5
2 9	5	5	5	5	5
3 0	4	5	5	5	5
3 2	5	5	5	5	5
3 3	5	5	5	5	5
3 4	5	5	5	5	5
3 5	5	5	5	5	5
4 2	5	5	5	5	5
4 3	5	5	5	5	5
4 4	5	5	5	5	5
4 5	5	5	5	5	4
4 8	5	5	5	5	5
4 9	5	5	5	5	5
5 0	5	5	5	5	5
5 1	5	5	5	5	5
5 2	5	5	5	5	5
5 3	5	5	5	5	5
5 8	5	5	5	5	5
6 0	5	5	5	5	5
6 1	5	5	5	5	5
6 3	5	5	5	5	5

表 6 (续)

化合物序号	除草效果				
	Ec	Po	Am	Ch	Cy
6 4	5	5	5	5	5
6 5	5	5	5	5	5
6 7	5	5	5	5	5
6 8	5	5	5	5	5
6 9	5	5	5	5	5
7 0	5	5	5	5	5
7 1	5	5	5	5	5
7 2	5	5	5	5	5
7 3	5	5	5	5	5
7 4	5	5	5	5	5
7 5	5	5	5	5	5
7 6	5	5	5	5	5
7 8	5	5	5	5	5
7 9	5	5	5	5	5
8 0	5	4	5	5	5
8 1	5	5	5	5	5
8 2	5	5	5	5	5
8 3	5	5	5	5	5
8 4	5	5	5	5	5
8 5	5	5	5	5	5
8 6	5	5	5	5	5
8 7	5	5	5	5	5
8 8	5	5	5	5	5
8 9	5	5	5	5	5
9 1	5	5	5	5	5
9 2	5	5	5	5	5
9 3	5	5	5	5	5
1 1 8	5	5	5	5	5
1 1 9	5	5	5	5	5
1 2 0	5	5	5	5	5
1 2 1	5	5	5	5	5
1 2 9	5	5	5	5	5
1 3 0	5	5	5	5	5

表 6 (续)

化合物序号	除草效果				
	Ec	Po	Am	Ch	Cy
1 3 6	5	5	5	5	5
(A)	3	4	4	5	5
(B)	1	0	3	2	1
(C)	2	3	5	5	0

试验实施例 3(高地田叶处理的除草效果试验)

在装有高地田土壤(表面积为 120cm^2)的塑料罐中, 播入可食稗(Ec), pale smartweed (Po), 细长苋(Am), 藜(ch)和稻莎草属(cy)的种子, 在温室中培养 2 周。预先决定量的根据配方实施例 1 制备的可湿性粉末用水稀释, 并用小尺寸的喷雾器施用于叶簇上, 量为 1000 升/公顷, 这样活性组份的量为 1 千克/公顷。植物在温室中培养, 在处理后的第 14 天, 根据表 3—1 中的标准进行评估。在上述表 5 中列出的化合物作为对比除草剂。试验结果在下面表 7 中显示。

表 7

化合物序号	除草效果				
	Ec	Po	Am	Ch	Cy
1	5	5	5	5	5
2	5	5	5	5	5
3	5	5	5	5	5
4	5	5	5	5	5
5	5	5	5	5	5
6	5	5	5	5	5
7	5	5	5	5	5
8	5	5	5	5	5
9	5	5	5	5	5
1 0	5	5	5	5	5
1 1	5	5	5	5	5
1 2	5	5	5	5	5
1 3	5	4	5	5	5
1 4	5	5	5	5	5
1 5	5	5	5	5	5
1 6	5	5	5	5	5
1 7	5	5	5	5	5
1 8	5	5	5	5	5
1 9	5	5	5	5	5
2 0	5	5	5	5	5
2 1	5	5	5	5	5
2 4	4	5	5	5	4
2 9	5	5	5	5	5
3 0	5	5	5	5	5
3 3	5	5	5	5	5
3 5	5	5	5	5	5
4 2	5	5	5	5	5
4 3	5	5	5	5	5
4 4	5	5	5	5	5
4 5	5	5	5	5	5
4 8	5	5	5	5	5
4 9	5	5	5	5	5
5 1	5	5	5	5	5

表 7 (续)

化合物序号	除草效果				
	Ec	Po	Am	Ch	Cy
5 2	5	5	5	5	5
5 8	5	5	5	5	4
6 0	5	5	5	5	4
6 1	5	5	5	5	5
6 3	5	5	5	5	5
6 4	5	5	5	5	5
6 5	5	5	5	5	5
6 7	5	5	5	5	5
6 8	5	5	5	5	5
6 9	5	5	5	5	5
7 0	5	5	5	5	5
7 1	5	5	5	5	5
7 2	5	5	5	5	5
7 3	5	5	5	5	5
7 4	5	5	5	5	5
7 5	5	5	5	5	5
7 6	5	5	5	5	5
7 8	5	5	5	5	5
7 9	5	5	5	5	5
8 0	5	4	5	5	5
8 1	5	5	5	5	5
8 2	5	5	5	5	5
8 3	5	5	5	5	5
8 4	5	5	5	5	5
8 5	5	5	5	5	5
8 6	5	5	5	5	5
8 7	5	5	5	5	5
8 8	5	5	5	5	5
8 9	5	5	5	5	5
9 1	5	5	5	5	5
9 2	5	5	5	5	5
9 3	5	5	5	5	5
1 1 8	5	5	5	5	5

表 7 (续)

化合物序号	除草效果				
	Ec	Po	Am	Ch	Cy
1 1 9	5	5	5	5	5
1 2 0	5	5	5	5	5
1 2 1	5	5	5	5	5
1 2 9	5	5	5	5	5
1 3 0	5	5	5	5	5
1 3 6	5	5	5	5	5
(A)	1	3	1	3	5
(B)	0	0	0	0	0
(C)	2	3	5	5	0

试验实施例 4(通过水稻田土壤处理进行谷类作物选择性试验)在装有水稻田土壤的 Wagner 罐(表面积,1/5000 亩)中,在灌溉,搅和泥浆和平整后,播下稗(Ec),monochoria(Mo)和蔗草(Sc)的种子。在罐中,移植入 2.0 间隔期的二株水稻(Or),移植深度为 2 厘米,并灌水至水深为 3 厘米。第二天,将预定量的根据配方实施例 1 制备的可湿性粉末用水稀释,并滴加入水表面。植物然后在温室中培育,在处理后的第 30 天,根据表 3—1 和表 3—2 的标准进行除草效果和植物毒性的评估。上述表 5 中所列的化合物作为对比除草剂。结果在表 8 中显示。

表 8

化合物序号	剂量 (千克/公顷)	除草效果			植物毒性 O r
		E c	M o	S c	
1	0.25	5	3	3	1
5	1.00	5	5	5	1
9	0.25	5	3	3	0
1 0	0.25	5	3	3	0
1 1	0.25	5	4	3	1
1 3	1.00	5	5	3	1
2 0	0.25	5	5	4	1
2 1	0.25	5	4	4	0
2 3	0.25	5	5	3	0
3 0	1.00	5	5	3	1
3 3	1.00	5	5	5	1
3 5	0.25	5	5	3	0
4 3	0.25	5	5	3	0
5 0	1.00	5	5	5	0
6 2	0.25	5	5	3	0
7 8	0.25	5	5	5	0
7 9	0.25	5	5	5	0
8 0	0.25	5	5	5	0
9 1	1.00	5	5	5	0
9 3	1.00	5	5	5	0
(A)	1.00	0	0	0	2
(B)	1.00	0	0	0	0
(C)	1.00	5	5	3	5

试验实施例 5(通过高地田土壤处理进行谷类作物选择性试验)

在装有高地田土壤的塑料罐中(表面积为 600cm²),播入大豆(GI),棉花(Go),可食稗(Ec),宿根高粱(So),水石松(Al),pale smartweed (Po),细长苋(Am)和藜(ch),并覆盖上土壤。第二天,将预定量的根据配方实施例 1 制备的可湿性粉末用水稀释,然后用小尺寸的喷雾器将它均匀地施在土壤表面,量为 1000 升/公顷。植物然后在温室中培育,在处理后的第 21 天,根据表 3—1 和 3—2 中的标准进行除草效果和植物毒性的评估。在表 5 中所列的化合物用作对比除草剂。结果显示在下面表 9 中。

表 9

化合物序号	剂量 (千克/公顷)	除草效果						植物毒性	
		Ec	So	Al	Po	Am	Ch	GI	Go
4	0.063	4	5	5	5	5	4	1	0
9	0.25	5	5	5	5	5	5	0	0
1 0	0.063	5	5	5	5	5	5	0	1
1 1	0.25	5	5	5	5	5	5	2	0
2 0	0.063	5	5	4	5	5	5	1	0
2 1	0.063	5	5	5	5	5	5	1	0
3 3	0.063	5	5	5	5	5	5	1	0
3 4	0.063	5	5	4	5	5	4	0	0
5 0	0.25	5	4	4	4	5	5	1	0
5 1	0.063	5	4	4	4	5	4	0	0
(A)	0.25	0	0	1	2	2	1	0	0
(B)	0.25	0	0	0	0	1	1	0	0
(C)	0.25	0	0	1	1	3	3	0	0

试验实施例 6(通过高地田叶处理进行谷类作物选择性试验)

在装有高地田土壤的塑料罐(表面积为 600cm²), 播下水稻(Or), 棉花(Go), 可食稗(Ec), pale smartweed (Po), 细长苋(Am)和藜(ch), 在温室中培育 2 周。将预定量的根据配方实施例 1 制备的可温性粉末用水稀释, 用小尺寸的喷雾器施用于叶子上。植物然后在温室中培育, 在处理后的第 14 天进行除草效果的植物毒性的评估。在上面表 5 中所列的化合物作为对比除草剂。结果在下列表 10 中显示。

表 10

化合物序号	剂量 (千克/公顷)	除草效果						植物毒性	
		Ec	So	Al	Po	Am	Ch	Or	Go
5	0.063	4	4	5	4	5	5	0	0
6	0.25	5	5	5	5	5	5	0	1
7	0.25	5	5	5	5	5	5	0	0
1 2	0.063	5	5	4	5	5	5	0	2
1 3	0.25	5	5	5	5	5	5	0	1
1 4	0.063	5	5	5	5	5	5	0	0
3 3	0.25	5	4	5	5	5	5	1	0
5 2	0.063	4	5	5	5	5	5	1	1
(A)	0.25	3	2	0	4	2	1	0	2
(B)	0.25	0	0	0	0	0	1	1	0
(C)	0.25	1	0	0	1	3	3	1	1

试验实施例 7(通过水稻田土壤处理进行除草剂组合的除草效果试验)

在装有水稻田土壤的混凝土罐(表面积为 1/400 亩)中,播入稗(Ec),monochoria(Mo) 蔗草属(Sc),莎草属(cy)和早发山胡椒 Lindermia pyxidaria (Li), 并放入慈姑 pygmaea(Sa)和 Cyperus serot inus (Cs) 块茎。在罐中,进一步移植入 8 株 2.0 间隔期的水稻(Or),移植深度为 2 厘米,灌水至水深为 4 厘米。第二天,将预定量的根据配方实施例 5 制备的颗粒剂均匀施用在上面。植物在室外培育,在处理第 61 天进行除草效果和植物毒性评估,根据表 3—1 和表 3—2 中的标准。结果在下面表 11 中显示。

表 11

化合物序号 +样品	剂量 (千克/公顷)	除草效果							植物毒性	
		Ec	Mo	Sc	Cy	Li	Sa	Cs	Or	
化合物序号 9	0.02+0.05	5	5	5	5	5	5	4	0	
	0.04+0.1	5	5	5	5	5	5	5	0	