



[12]发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 92104403.8

[51] Int.Cl⁵

C07D233 / 84

[43] 公开日 1993 年 1 月 6 日

[22]申请日 92.6.6

[30]优先权

[32]91.6.7 [33]JP [31]232594 / 91

[32]91.6.7 [33]JP [31]232595 / 91

[32]91.6.7 [33]JP [31]232596 / 91

[32]91.6.25 [33]JP [31]248533 / 91

[71]申请人 宇部兴产株式会社

地址 日本山口县

[72]发明人 原田胜正 安部敬章 森吉祐二

松下明生 小嶋干夫 白石郁雄

山本薰 叶山孝司

福田昌平

[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 罗 宏 杨九昌

C07D239 / 38 C07D251 / 26

C07D403 / 12 A01N 43 / 50

A01N 43 / 54 A01N 43 / 68

// (C07D403 / 12, 239 : 38, 251 : 26)

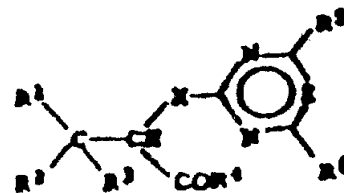
说明书页数: 32 附图页数:

[54]发明名称 嘧啶或三嗪类衍生物、它们的制备方法和应用它们作为除草剂

[57]摘要

本发明公开了式(I)所示的嘧啶或三嗪类化合物、制备它们的方法以及含有它们作为有效成分的除草剂,

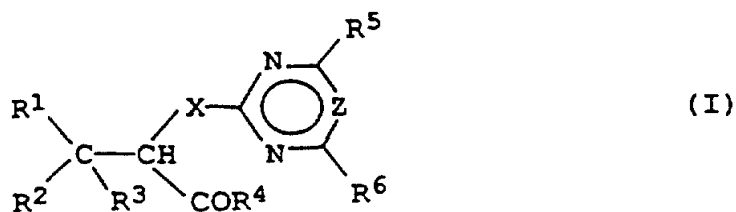
式(I)中 R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、X 及 Z 的定义与说明书中所述的相同。



(I)

<20>

1. 式 (I) 所示的嘧啶或三嗪类化合物,



其中 R^1 代表氟基、卤原子、羟基或 $-O-R^7$, 这里 R^7 代表低级烷基、低级链烯基、低级炔基、卤素-低级烷基或氟基-低级烷基;

R^2 代表氢原子或低级烷基;

R^3 代表氢原子或低级烷基;

R^4 代表 1-咪唑基、 $-NH SO_2 - R^8$ (这里 R^8 代表低级烷基或可以有一个取代基的苯基)、羟基、低级烷氧基或苄氧基 (当 Z 为氮原子时); 或者 1-咪唑基、 $-NH SO_2 - R^8$ (这里 R^8 的定义同上)、羟基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、苄氧基、低级烷硫基、苯硫基或烷基亚磺酰氨基 (当 Z 为 $-CH=$ 基团时);

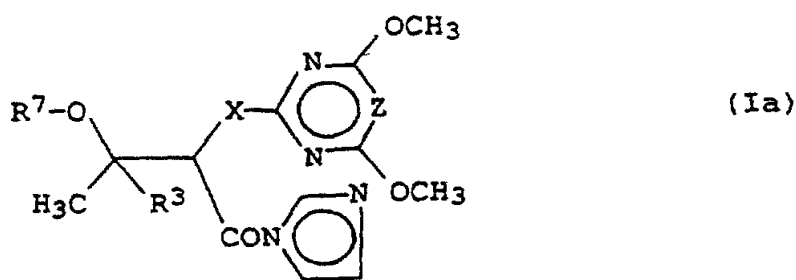
R^5 代表低级烷氧基;

R^6 代表低级烷氧基或低级烷基;

X 代表氧原子或硫原子;

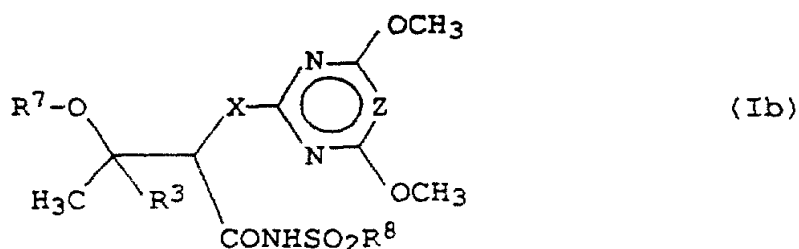
Z 代表氮原子或 $-CH=$ 基团。

2. 根据权利要求 1 所述的化合物, 其中该化合物为式 (I a) 所示的 3-烷氧基丁酰咪唑,



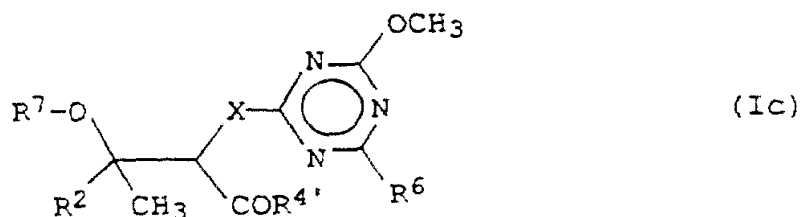
其中 R⁷、R³、X 和 Z 各自的定义同权利要求 1。

3. 根据权利要求 1 所述的化合物，其中该化合物为式 (Ib) 所示的 3-烷氧基链烷酰胺，



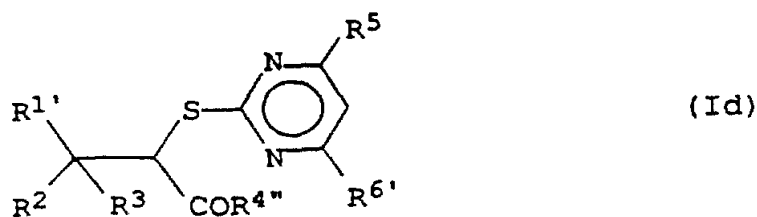
其中 R⁷、R³、R⁸、X 和 Z 各自的定义同权利要求 1。

4. 根据权利要求 1 所述的化合物，其中该化合物为式 (Ic) 所示的三嗪化合物，



其中 R^{4'} 代表羟基、低级烷氧基或苄氧基，R²、R⁶、R⁷ 和 X 各自的定义同权利要求 1。

5. 根据权利要求1所述的化合物，其中该化合物为式(I d)所示的2-噻啉基硫代链烷酸，



其中 R^{1'} 代表氟基或卤原子，

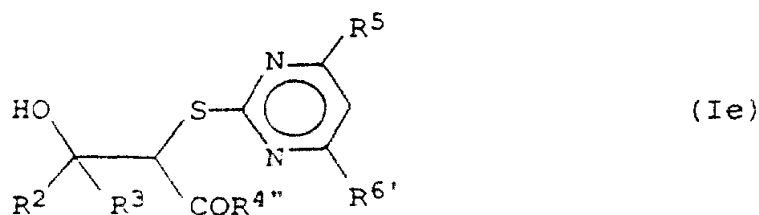
R² 代表低级烷基，

R^{4''} 代表羟基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、苄氧基、低级烷硫基、苯硫基、1-咪唑基或 -NH SO₂ - R⁸，这里 R⁸ 的定义同权利要求1，

R^{6'} 代表低级烷氧基，

R³ 和 R⁵ 各自的定义同权利要求1。

6. 根据权利要求1所述的化合物，其中该化合物为式(I e)所示的3-羟基-2-噻啉基硫代链烷酸，



其中 R² 代表低级烷基，

R^{4''} 代表羟基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链

烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、低级烷硫基、苯硫基、1-咪唑基或 $-NHSO_2-R^8$ ，这里 R^8 的定义同权利要求1，

$R^{8'}$ 代表低级烷氧基，

R^3 和 R^8 各自的定义同权利要求1。

7. 根据权利要求1所述的化合物，其中该化合物系选自

1-(2-(4,6-二甲氧基-2-基)硫代-3-甲氧基-3-甲基丁酰)-咪唑(化合物7)，

1-(3-乙氧基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧-3-甲基丁酰)咪唑(化合物12)，

2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-硫代-3-甲氧基-3-甲基-N-甲磺酰基丁酰胺(化合物47)，

3-乙氧基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧-3-甲基-N-甲磺酰基丁酰胺(化合物67)，

2-(4,6-二甲氧基-S-三嗪-2-基)硫代-3-甲氧基-3-甲基丁酸(化合物148)，

2-(4,6-二甲氧基-S-三嗪-2-基)-氧-3-乙氧基-3-甲基丁酸乙酯(化合物154)，

2-(4,6-二甲氧基-S-三嗪-2-基)-氧-3-乙氧基-3-甲基丁酸苄酯(化合物155)，

2-(4,6-二甲氧基-S-三嗪-2-基)-氧-3-乙氧基-3-甲基丁酸(化合物156)，

3-氨基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-硫代-3-甲基丁酸(化合物181)，

3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸乙酯(化合物183),

3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸丙酯(化合物184),

3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酰-1-咪唑(化合物202),

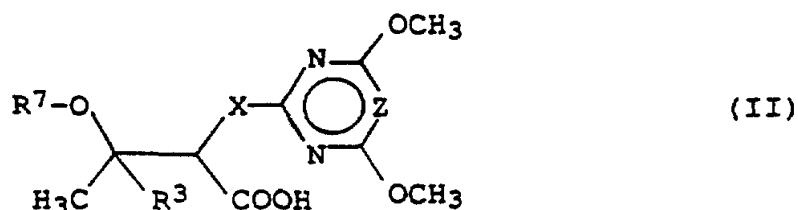
3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基-N-甲磺酰基丁酰胺(化合物203),

3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸钾(化合物207),

3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸(叔丁基羧基甲基)酯(化合物208), 以及

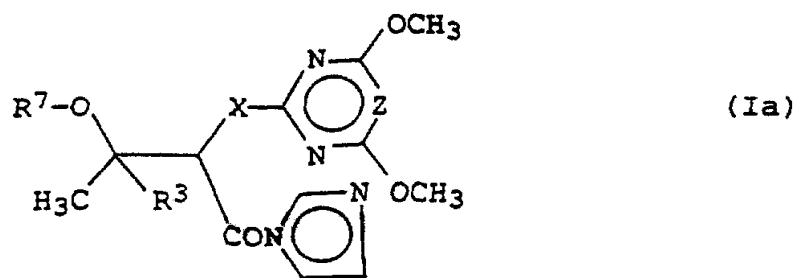
3-氟-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸乙酯(化合物227)。

8. 制备权利要求2所述化合物(Ia)的方法, 该方法包括使式(II)所示化合物与N,N'-羧基二咪唑反应,



其中R⁷、R³、X和Z各自的定义同权利要求1

9. 制备权利要求3所述化合物(Ib)的方法, 该方法包括使式(Ia)所示化合物与式(III)所示化合物反应,

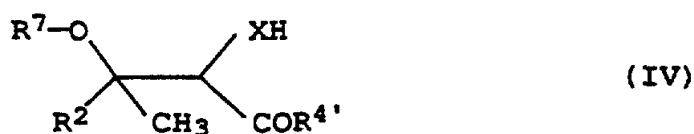


式 (I a) 中 R^7 、 R^3 、 X 和 Z 各自的定义同权利要求 1，

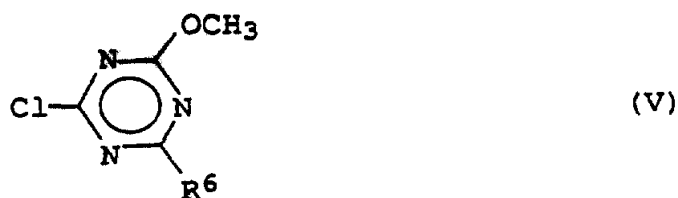


式 (III) 中 R^8 的定义同权利要求 1。

10. 制备权利要求 4 所述化合物 (I c) 的方法，该方法包括使式 (IV) 所示化合物与式 (V) 所示化合物反应，

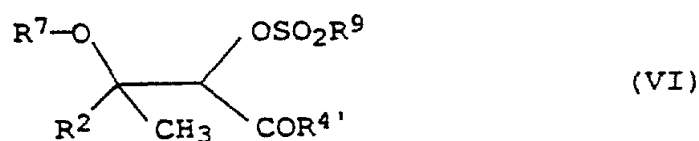


式 (IV) 中 $R^{4'}$ 代表羟基、低级烷氧基或苄氧基， R^2 、 R^7 和 X 各自的定义同权利要求 1，



式 (V) 中 R^6 的定义同权利要求 1。

11. 制备权利要求 4 所述化合物 (I c) 的方法，该方法包括使式 (VI) 所示化合物与式 (VII) 所示化合物反应，

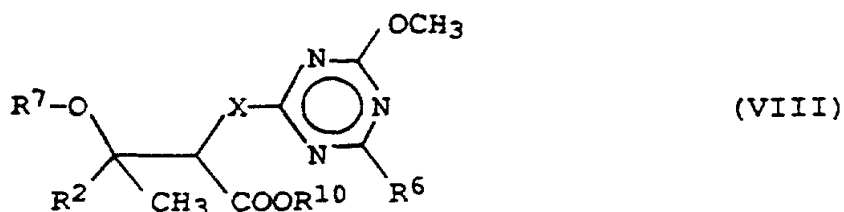


式 (VI) 中 R^{4'} 代表羟基、低级烷氧基或苄氧基, R⁹ 代表低级烷基、取代的苯基或卤素低级烷基, R² 和 R⁷ 各自的定义同权利要求 1,



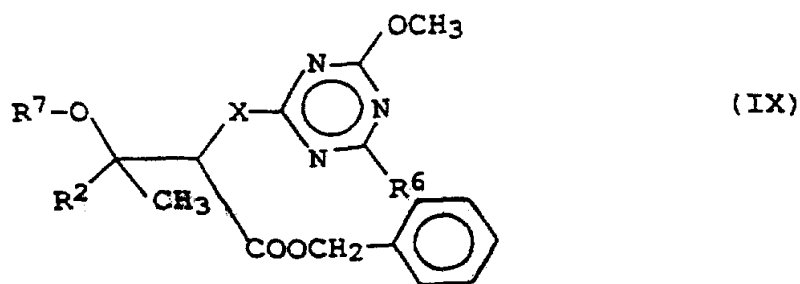
式 (VII) 中 R⁶ 的定义同权利要求 1。

1 2 . 制备权利要求 4 所述化合物 (Ic) 的方法, 该方法包括使式 (VIII) 所示化合物进行酯交换,



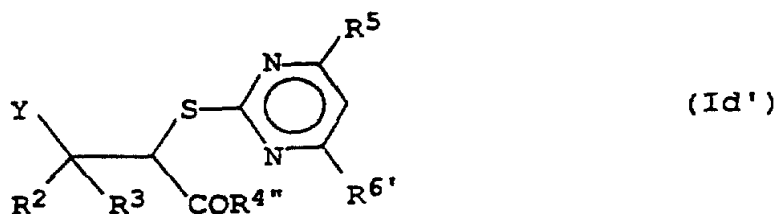
式中 R²、R⁶、R⁷ 和 X 各自的定义同权利要求 1, R¹⁰ 代表低级烷基。

1 3 . 制备权利要求 4 所述化合物 (Ic) 的方法, 该方法包括使式 (IX) 所示化合物进行氢解,



式中 R^2 、 R^6 、 R^7 和 X 各自的定义同权利要求 1。

14. 制备式 (Id') 所示 3-卤代-2-噻唑基硫代链烷酸的方法，



式中 Y 代表卤原子；

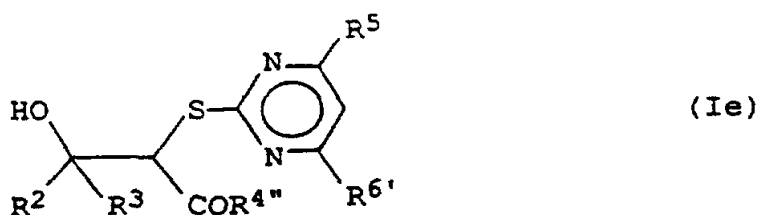
R^2 代表低级烷基；

$R^{4''}$ 代表羟基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、苄氧基、低级烷硫基、苯硫基、1-咪唑基或 $-NH SO_2 - R^8$ ，这里 R^8 的定义同权利要求 1；

$R^{6'}$ 代表低级烷氧基；

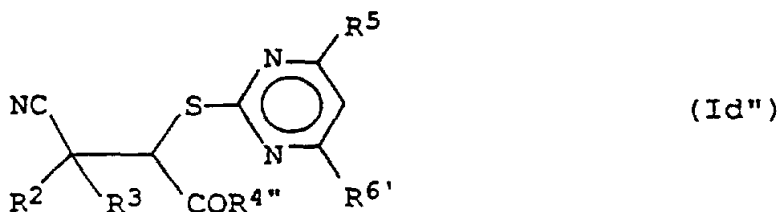
R^3 和 R^5 各自的定义同权利要求 1，

该方法包括使式 (Ie) 所示 3-羟基-2-噻唑基硫代链烷酸与卤代剂反应，



式中 R^2 、 R^3 、 $R^{4''}$ 、 R^5 和 $R^{6'}$ 各自的定义同上。

15. 制备式 (Id'') 所示 3-氰基-2-噻唑基硫代链烷酸的方法，



式中 R^2 代表低级烷基；

$R^{4''}$ 代表羟基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、苄氧基、低级烷硫基、苯硫基、1-咪唑基或 $-NHSO_2-R^5$ ，这里 R^5 的定义同权利要求 1；

$R^{6'}$ 代表低级烷氧基；

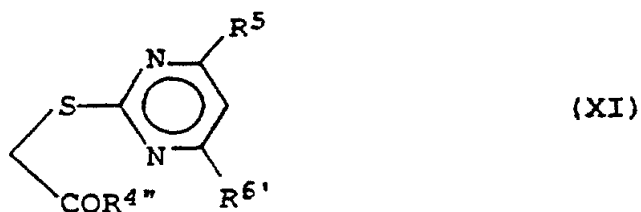
R^3 和 R^5 各自的定义同权利要求 1，

该方法包括使权利要求 14 所述的 3-卤代-2-噻唑基硫代链烷酸与氰化剂反应。

16. 制备权利要求 5 所述化合物 (Ie) 的方法，该方法包括使式 (X) 所示化合物与式 (XI) 所示化合物反应，



式 (X) 中 R^2 和 R^3 各自的定义同权利要求 1,



式 (X I) 中 $\text{R}^{4''}$ 代表羧基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、苄氧基、低级烷硫基、苯硫基、1-咪唑基或 $-\text{NH}\text{SO}_2-\text{R}^8$, 这里 R^8 的定义同权利要求 1;

$\text{R}^{6'}$ 代表低级烷氧基;

R^8 的定义同权利要求 1。

17. 含有作为有效成分的权利要求 1 所述化合物 (I) 和除草上
有用载体的除草剂。

嘧啶或三嗪类衍生物、它们的制备方法和
应用它们作为除草剂

本发明是关于含有新的嘧啶或三嗪类衍生物如3-烷氧基丁酰基咪唑衍生物、3-烷氧基链烷酰胺衍生物、3-烷氧基链烷酸衍生物和2-嘧啶基-硫代链烷酸衍生物作为有效成分的除草剂。

为了促进节省农田劳动和增加农作物产量，迄今已经研制了许多种除草剂。但是，一般的除草剂在除草效果方面不能满足需要，例如对于农作物（如棉花）缺乏选择性除草作用，并且就对生物的安全性来讲也不能十分令人满意。因此，为了解决上述问题，需要研制新的除草剂。

本发明嘧啶或三嗪类的3-烷氧基丁酰基咪唑衍生物、3-烷氧基链烷酰胺衍生物和3-烷氧基链烷酸衍生物是新的化合物，并且它们的除草作用仍未被人们所知。

作为与本发明的2-嘧啶基硫代链烷酸衍生物类似的化合物是已知的，例如日本临时专利公开说明书No. 85262/1990公开的化合物，并且还已知这些化合物具有除草作用。但是，这些化合物的除草效果是不能满足需要的，因此需要研制新的具有更优良活性的除草剂。

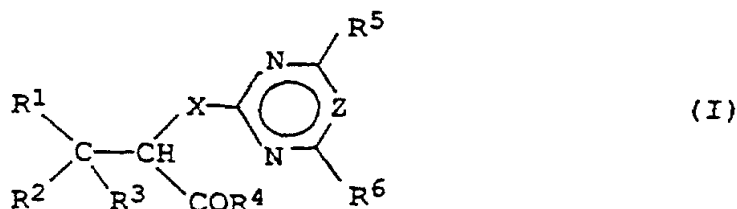
本发明的目的是提供新的嘧啶或三嗪类衍生物、它们的制备方法和含有该类化合物作为有效成分的除草剂。

为了解决上述问题，本发明的发明人进行了广泛的研究，并且最终发现，新的嘧啶或三嗪类衍生物对一年生水稻植物杂草和一年生阔叶杂

草显示出更良好的除草效果，并且对作物（如棉花）显示出选择性，此外还发现，制备它们的方法收率高，结果完成了本发明。

下面叙述本发明。

第一方面，本发明是关于下式（I）所示3-烷氧基链烷酸衍生物，



其中 R^1 代表氨基、卤原子、羟基或 $-O-R^7$ ，这里 R^7 代表低级烷基、低级链烯基、低级炔基、卤素低级烷基或氨基-低级烷基；

R^2 代表氢原子或低级烷基；

R^3 代表氢原子或低级烷基；

R^4 代表 1-咪唑基、 $-NH SO_2 - R^8$ （这里 R^8 代表低级烷基或可以有一个取代基的苯基）、羟基、低级烷氧基或苄氧基（当 Z 为氮原子时）；或者 1-咪唑基、 $-NH SO_2 - R^8$ （这里 R^8 的定义同上）、羟基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、苄氧基、低级烷硫基、苯硫基或烷基亚磺酰氨基（当 Z 为 $-CH=$ 基团时）；

R^5 代表低级烷氧基；

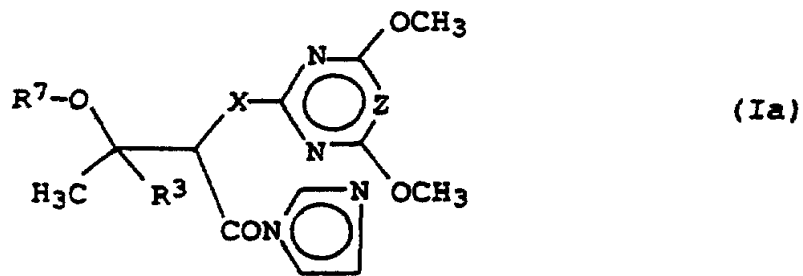
R^6 代表低级烷氧基或低级烷基；

X 代表氧原子或硫原子；

Z 代表氮原子或 $-CH=$ 基团。

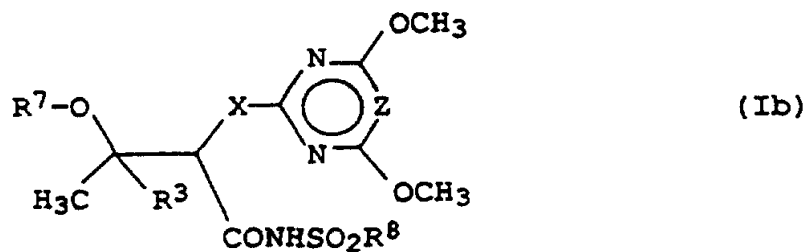
第二方面，本发明是关于下式（Ia）所示 3-烷氧基丁酰基咪唑

衍生物，



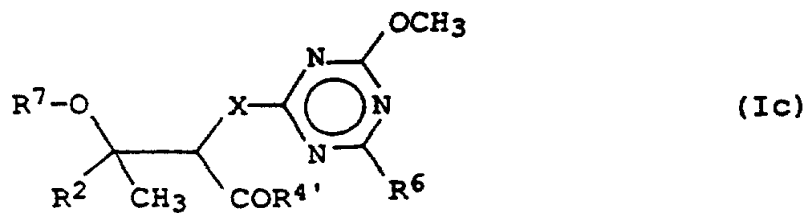
其中 R^7 、 R^3 、 X 和 Z 各自的定义同上。

第三方面，本发明是关于下式 (Ib) 所示 3-烷氧基链烷酰胺衍生物，



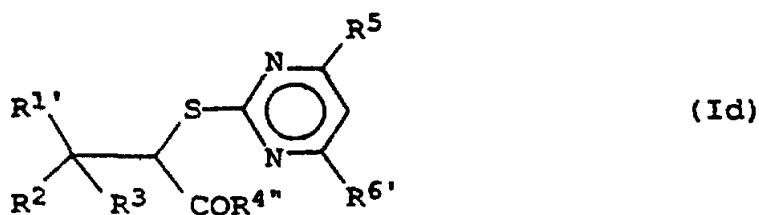
其中 R^7 、 R^3 、 R^8 、 X 和 Z 各自的定义同上。

第四方面，本发明是关于下式 (Ic) 所示三嗪衍生物，



其中 $R^{4'}$ 代表羟基、低级烷氧基或苄氧基； R^2 、 R^6 、 R^7 和 X 各自的定义同上。

第五方面，本发明是关于下式 (Id) 所示 2-噻啉基硫代链烷酸衍生物，



其中 R^{1'} 代表氨基或卤原子；

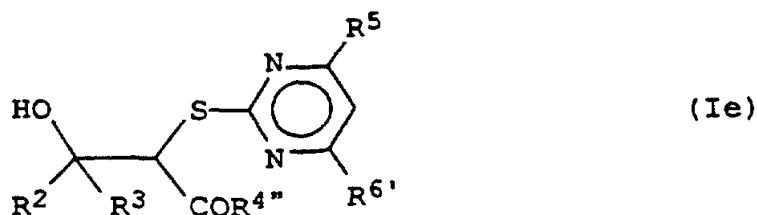
R² 代表低级烷基；

R^{4''} 代表羟基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、苄氧基、低级烷硫基、苯硫基、1-咪唑基或 -NH₂SO₂-R⁶，这里 R⁶ 的定义同上；

R^{6'} 代表低级烷氧基；

R³ 和 R⁵ 各自的定义同上。

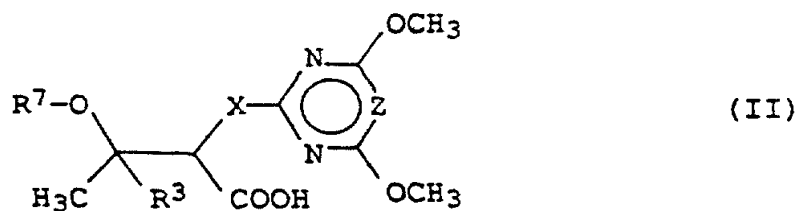
第六方面，本发明是关于下式 (Ie) 所示 3-羟基-2-噻啉基硫代链烷酸衍生物，



其中 R²、R³、R^{4''}、R⁵ 和 R^{6'} 各自的定义同上。

第七方面，本发明是关于制备上述式 (Ia) 所示 3-烷氧基链烷

酸衍生物的方法，该方法包括使下式 (II) 所示化合物与 N, N' - 羰基二咪唑反应，



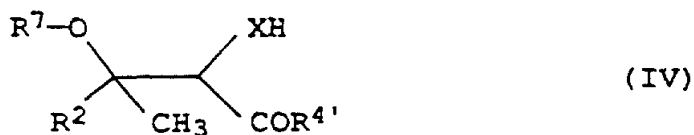
其中 R⁷、R³、X 和 Z 各自的定义同上。

第八方面，本发明是关于制备上述式 (I b) 所示 3-烷氧基链烷酰胺衍生物的方法，该方法包括使上述式 (I a) 所示 3-烷氧基链烷酸衍生物与下述式 (III) 所示化合物反应，

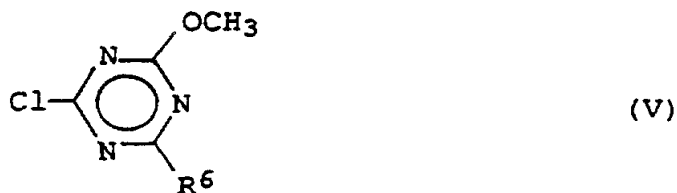


其中 R⁸ 的定义同上。

第九方面，本发明是关于制备上述式 (I c) 所示三唑衍生物的方法，该方法包括使下述式 (IV) 所示化合物与下述式 (V) 所示化合物反应，

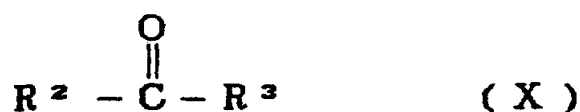


式 (IV) 中，R²、R^{4'}、R⁷ 和 X 各自的定义同上，

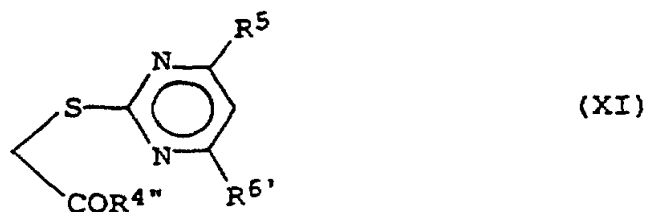


式中 R^2 、 R^3 、 $R^{4''}$ 、 R^5 和 $R^{6'}$ 各自的定义同上。

第十五方面，本发明是关于制备上述式 (Ie) 所示 3-羟基-2-噻啉基硫代链烷酸衍生物的方法，该方法包括使式 (X) 所示化合物与下述式 (XI) 所示化合物反应，



式 (X) 中， R^2 和 R^3 各自的定义同上，



式 (XI) 中， $R^{4''}$ 、 R^5 和 $R^{6'}$ 各自的定义同上。

第十六方面，本发明是关于含有上述式 (I) 所示噻啉或三噻类衍生物作为有效成分的除草剂。

下面详细说明本发明。

新的噻啉或三噻类衍生物 (I) 包括本发明所需的式 (Ia) ~ (Ie) 化合物，以及作为其起始原料的式 (II) ~ (VII) 化合物，下面叙述 R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 $R^{4''}$ 、 R^5 、 R^6 、 $R^{6'}$ 、 R^7 、 R^8 、X、Y 和 Z。

作为 R^1 ，可以提到的有氰基、卤原子（氟、氯、溴和碘原子）、羟基或 $-O-R^7$ 。作为 R^7 ，可以提到的有低级烷基、低级链烯基、低级炔基、卤素-低级烷基和氰基-低级烷基；作为低级烷基，有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的烷基较好，有 1 ~ 4 个碳原子的更好，尤其

好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如甲基、乙基、正丙基和异丙基）；作为低级链烯基，有 2 ~ 6 个碳原子的直链或支链的链烯基较好，有 2 ~ 5 个碳原子的更好，尤其好的是有 2 ~ 3 个碳原子的（如丙烯基）；作为低级炔基，有 2 ~ 6 个碳原子的直链或支链的炔基较好，有 2 ~ 5 个碳原子的更好，尤其好的是有 2 ~ 3 个碳原子的（如丙炔基）；作为卤素—低级烷基，有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的卤素烷基较好（作为卤原子，可以提到的有氟、氯、溴和碘原子，但是氯原子是更好的），有 1 ~ 5 个碳原子的更好，尤其好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如氯乙基和氯丙基）；作为氰基—低级烷基，有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的氰基烷基较好，有 1 ~ 5 个碳原子的更好，尤其好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如氰基乙基）。

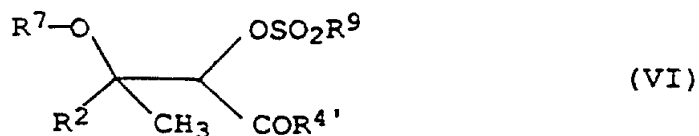
作为 R^2 ，可以提到的有低级烷基，并且有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的低级烷基是较好的，有 1 ~ 4 个碳原子的更好，尤其好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如甲基、乙基、正丙基和异丙基），最好的是甲基。

作为 R^3 ，可以提到的有氢原子和低级烷基，并且有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的低级烷基是较好的，有 1 ~ 4 个碳原子的更好，尤其好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如甲基和乙基）。

当 Z 代表氮原子时，作为 R^4 ，可以提到的有 1-咪唑基（如式 I a 所示）、 $-NH SO_2 - R^5$ （烷基磺酰氨基或芳基磺酰氨基），这里 R^5 代表低级烷基或可以有一个取代基的苯基（如式 I b 所示）、羟基、低级烷氧基或苄氧基（如式 I c 所示）。 R^5 的低级烷基较好的是有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的烷基，有 1 ~ 4 个碳原子的更好（如甲基、乙基、正丙基、异丙基和正丁基）。作为 R^5 的苯基取代基，可以提到的是例如有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的烷基（有 1 ~ 4 个碳原子的更

式 (V) 中, R^6 的定义同上。

第十方面, 本发明是关于制备上述式 (Ic) 所示咪唑衍生物的方法, 该方法包括使下述式 (VI) 所示化合物与下述式 (VII) 所示化合物反应,

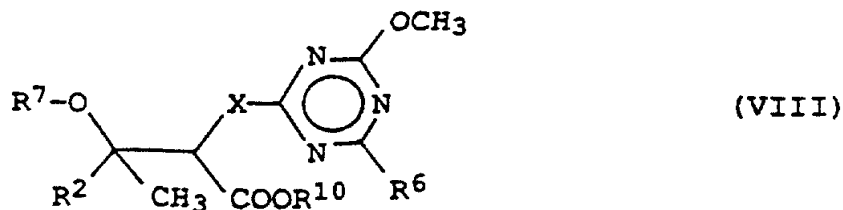


式 (VI) 中, R^2 、 $R^{4'}$ 和 R^7 各自的定义同上, R^9 代表低级烷基、取代的苯基或卤素-低级烷基,



式 (VII) 中, R^6 的定义同上。

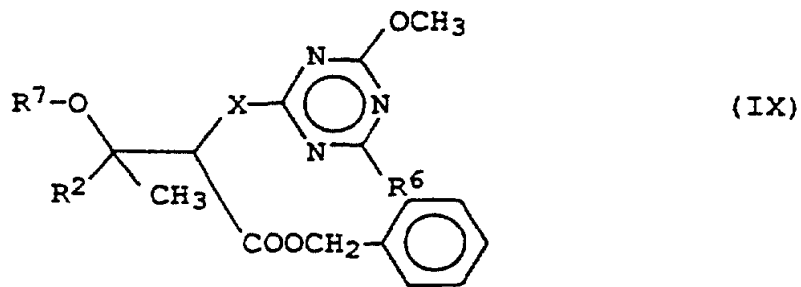
第十一方面, 本发明是关于制备上述式 (Ic) 所示三唑衍生物的方法, 该方法包括使下述式 (VIII) 所示化合物进行酯交换,



其中 R^2 、 R^6 、 R^7 和 X 各自的定义同上, R^{10} 代表低级烷基。

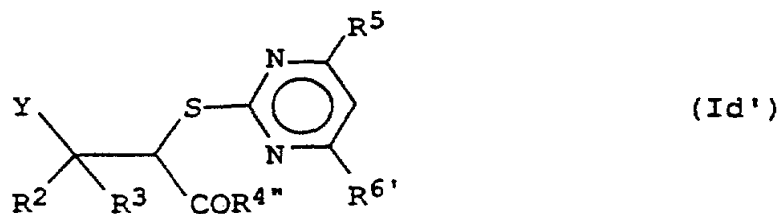
第十二方面, 本发明是关于制备上述式 (Ic) 所示三唑衍生物的

方法，该方法包括使下述式 (IX) 所示化合物进行氢解，



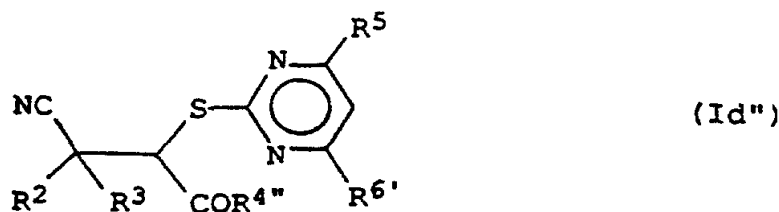
其中 R²、R⁶、R⁷ 和 X 各自的定义同上。

第十三方面，本发明是关于制备下述式 (Id') 所示 3-卤素-2-噻啉基硫代链烷酸衍生物的方法，该方法包括使上述 (Ie) 所示 3-羟基-2-噻啉基硫代链烷酸衍生物与卤化剂反应，



式中 Y 代表卤原子；R²、R³、R^{4''}、R⁵ 和 R^{6'} 各自的定义同上。

第十四方面，本发明是关于制备下述式 (Id'') 所示 3-氰基-2-噻啉基硫代链烷酸衍生物的方法，该方法包括使上述 (Id') 所示 3-卤素-2-噻啉基硫代链烷酸衍生物 (Id') 与氰化剂反应，



好，最好的是甲基)和卤原子(氟、氯、溴和碘原子，氯原子较好)。较好的低级烷氧基是有1~6个碳原子的直链或支链的烷氧基，有1~4个碳原子的更好，尤其好的是有1~3个碳原子的(如甲氧基和乙氧基)。

当Z代表 $-CH=$ 时，作为 R^4 可以提到的有1-咪唑基(如式I a所示)、 $-NH SO_2 - R^5$ (如式I b所示)、羟基、OK、可以有一个取代基的低级烷氧基、低级链烯氧基、低级炔氧基、可以有一个取代基的环烷氧基、苯氧基、苄氧基、低级烷硫基、苯硫基或烷基亚磺酰氨基(如式I d和I e所示)。这里 R^5 同以上所述。作为低级烷氧基、低级烷硫基和烷基磺酰氨基中碳的数目，有1~6个碳原子的直链或支链的较好，有1~4个碳原子的更好，尤其好的是有1~3个碳原子；作为低级烷氧基的取代基，可以提到的是有1~6个(有1~4个较好，有1~3个更好)碳原子的直链或支链的低级烷氧基和低级烷基甲硅烷基(如三甲基甲硅烷基)；作为低级链烯基，有2~6个碳原子的直链或支链的较好，有2~4个碳原子的更好，尤其好的是有2~3个碳原子的(如丙烯基)；作为低级炔基，有2~6个碳原子的较好，有2~4个碳原子的更好，尤其好的是有2~3个碳原子的(如丙炔基)；作为环烷氧基，有3~10个碳原子的较好，有3~8个碳原子的更好，尤其好的是有4~6个碳原子的；作为环烷基的取代基，可以提到的有卤原子，较好的是氯原子。

作为 R^5 ，可以提到的有甲氧基(如式I a~I c所示)，或有1~6个碳原子的直链或支链的低级烷氧基，低级烷氧基中碳原子的数目是1~4个碳原子较好，有1~3个碳原子的更好(如甲氧基)。

作为 R^6 ，可以提到的有甲氧基(如式I a和I b所示)，或低级烷

基或低级烷氧基（如式 I c ~ I e 所示）。作为低级烷基，可以提到的是有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的烷基，有 1 ~ 4 个碳原子的更好，尤其好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如甲基和乙基），较好的低级烷氧基是有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的烷氧基，有 1 ~ 4 个碳原子的较好，尤其好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如甲氧基和乙氧基）。

作为式 (VI) 的 R⁹，可以提到的有低级烷基、取代的苯基和卤素 - 低级烷基，作为低级烷基和卤素 - 低级烷基，较好是有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的，有 1 ~ 4 个碳原子的更好，尤其好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如甲基和乙基）；作为取代苯基的取代基，可以提到的是有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的烷基，有 1 ~ 4 个碳原子的较好，有 1 ~ 3 个碳原子的更好。

作为式 (VII) 中的 R¹⁰，可以提到的有低级烷基，有 1 ~ 6 个碳原子的直链或支链的较好，有 1 ~ 4 个碳原子的更好，尤其好的是有 1 ~ 3 个碳原子的（如甲基和乙基）。

作为 X，可以提到的有氧原子和硫原子。

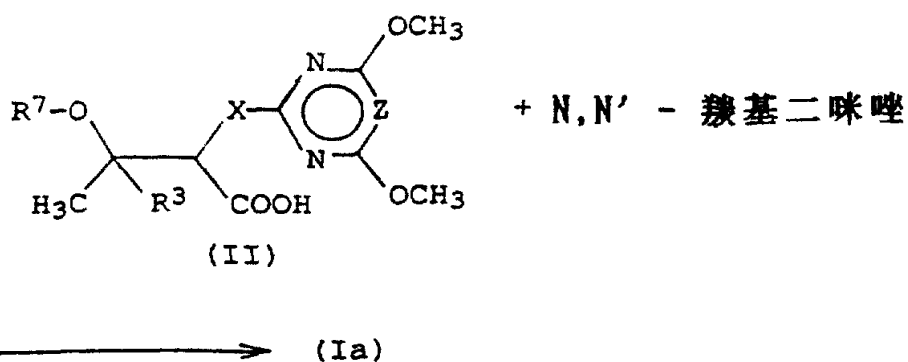
作为 Z，可以提到的有氮原子和 -CH= (methyn, 1 - 基 - 1 - 亚甲基)。

作为式 (Id) 中的 Y，可以提到的有卤原子（如氟、氯、溴和碘原子，但较好的是氯原子）。

基于所需新的嘧啶或三嗪衍生物 (I) 具有不对称碳原子，因此本发明包括其光学异构体。

化合物 (I) 可以按例如下述制备方法 1 ~ 11 进行制备。

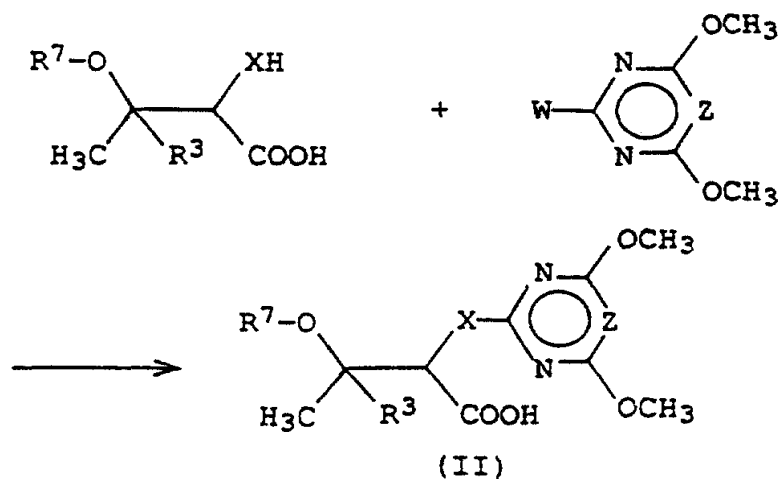
制备方法 1：



其中 R^3 、 R^7 、 X 和 Z 各自的定义同上。

化合物 (Ia) 可以通过在溶剂中将起始化合物 (II) 与 N,N' -羧基二咪唑反应制得。

化合物 (II) 可以容易地制备，例如可以按照日本专利申请 No. 279328 / 1990 所示方法，使 2-羟基链烷酸衍生物或 2-巯基链烷酸衍生物与 2-甲基磺酰基吡啶或 2-氯三嗪反应制得



其中 R^3 、 R^7 、 X 和 Z 各自的定义同上，并且 W 代表氟原子或 CH_3SO_2- 。

作为化合物 (II)，可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 1 ~ 38 各类取代基团的各个化合物 (以化合物 (II)₁ ~ (II)₃₈ 表示)，例如，对应于化合物 No. 1 的化合物 (II) 以化合物 (II)₁ 表示，并且该化合物 (II)₁ 意指化合物 (II) 中 R⁷ 为 CH₃，R³ 为 H，X 为 O 和 Z 为 CH。

溶剂不是特别受限制的，只要该溶剂不直接地参与本反应，并且可以包括例如水；醚类，如乙醚、四氢呋喃和 1, 4 - 二噁烷；酮类，如丙酮、甲乙酮和甲基异丁基酮；腈类，如乙腈；偶极非质子传递溶剂，如 N, N - 二甲基甲酰胺、N, N' - 二甲基 - 2 - 咪唑啉酮和二甲基亚砷；卤代烷类，如氟仿如二氟甲烷；以及上述溶剂的混合液。

制备化合物 (Ia) 的反应可以在反应液浓度为 5 ~ 80 % 的情况下进行。

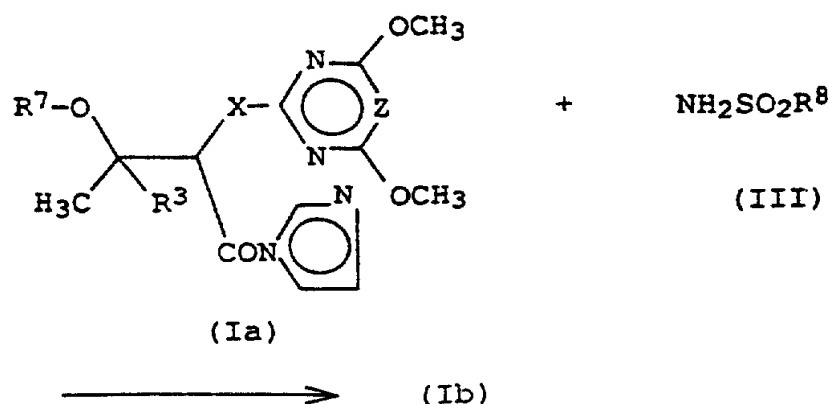
在上述制备方法中，应用的起始化合物 (II) 与 N, N' - 羰基二咪唑的比例为 0.5 ~ 2 摩尔，每摩尔起始化合物 (II) 用 1 ~ 1.5 摩尔 N, N - 羰基二咪唑较好。

反应温度不是特别受限制的，只要温度达到所用溶剂的沸点或低于该沸点，但是反应通常在 0 ~ 80 °C 进行，以 5 ~ 50 °C 较好。

反应时间依上述浓度和温度而变化，但通常在 0.5 ~ 1.0 小时之内完成。

作为化合物 (Ia)，可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 1 ~ 38 各类取代基团的各个化合物 (以化合物 1 ~ 38 表示)，例如对应于化合物 No. 1 的化合物 (I) 以化合物 1 表示，并且该化合物 1 意指化合物 (I) 中 R⁷ 为 CH₃，R³ 为 H，X 为氧和 Z 为 CH。

制备方法 2 :



其中 R^3 、 R^7 、 R^8 、 X 和 Z 各自的定义同上。

化合物 (Ib) 可以在溶剂中于碱存在下, 通过化合物 (Ia) 与式 (III) 所示的烷基磺酰胺或芳基磺酰胺反应制得。

式 (III) 化合物可以通过相应的磺酰氯与氨反应容易地制备。

作为化合物 (III), 可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 39 ~ 140 各类取代基团的各个化合物 (以化合物 (III)₃₉ ~ (III)₁₄₀ 表示), 例如, 对应于化合物 No. 41 的化合物 (III) 以化合物 (III)₄₁ 表示, 并且该化合物 (III)₄₁ 意指化合物 (III) 中 R^8 为 CH_3 。

溶剂不是特别受限制的, 只要该溶剂不直接地参与本反应, 并且可以包括醚类, 如乙醚、四氢呋喃和 1, 4-二噁烷; 酮类, 如丙酮、甲乙酮和甲基异丁基酮; 腈类, 如乙腈; 偶极非质子传递溶剂, 如 N, N -二甲基甲酰胺、 N, N' -二甲基-2-咪唑啉酮和二甲基亚砜; 以及上述溶剂的混合液。

作为碱, 可以提到的有例如无机碱, 如氨基钠、氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钾、碳酸钠和氢化钠。

制备化合物 (Ib) 的反应可以在反应液浓度为 5 ~ 80% 的情况

下进行。

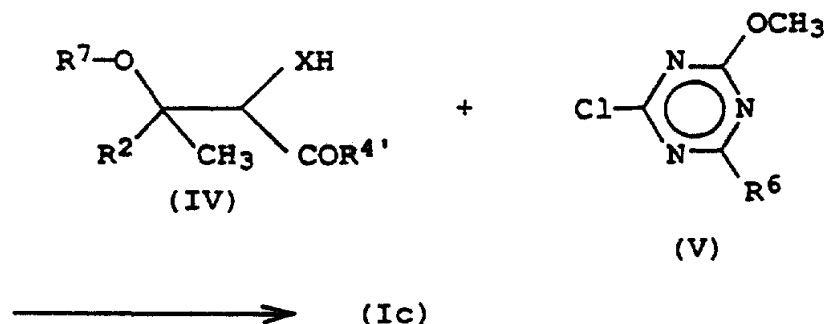
在该制备方法中，应用的起始化合物（Ia）与化合物（III）的比例为0.5~2摩尔，每摩尔起始化合物（Ia）用1~1.5摩尔化合物（III）较好。

反应温度不是特别受限制的，只要温度达到所用溶剂的沸点或低于该沸点，但是反应通常在0~50℃进行。

反应时间依上述浓度和温度而变化，但是通常可以在1~10小时内完成。

作为化合物（Ib），可以提到的有例如包括表1所示相应于化合物No. 39~140各类取代基团的各个化合物（以化合物39-140表示），例如对应于化合物No. 41的化合物（I）以化合物41表示，并且该化合物41意指化合物（I）中R⁷为CH₃，R³为H，R⁶为CH₃，X为硫和Z为CH。

制备方法3：

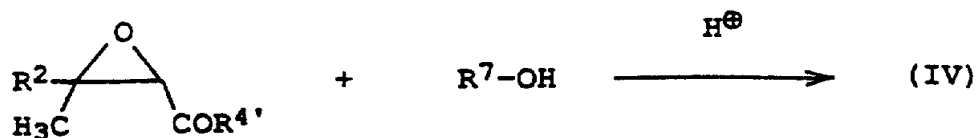


其中R²、R^{4'}、R⁶、R⁷和X各自的定义同上。

化合物（Ic）一般可以在溶剂中于碘存在下，通过起始化合物（IV）与起始化合物（V）反应制得。

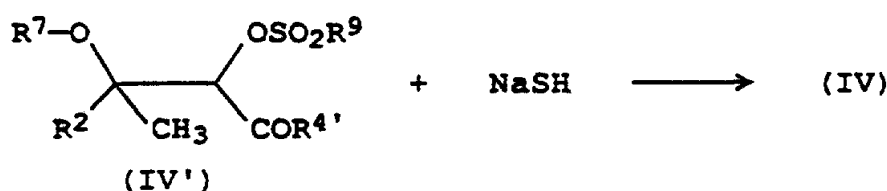
其中X为氧原子的化合物（IV）可以容易地制得，例如，如下所示，

由环氧链烷酸酯（按“Tetrahedron Letter”，第36号，第3761页（1972年）或“Org. Syn.” IV，第459页制备）于醇中在酸催化剂（硫酸或对甲苯磺酸）存在下反应制得，



其中 R^2 、 $\text{R}^{4'}$ 和 R^7 各自的定义同上。

其中 X 为硫原子的化合物 (IV) 也可以按以下所示，通过化合物 (IV') 与氢硫化钠于极性溶剂中反应容易地制得，

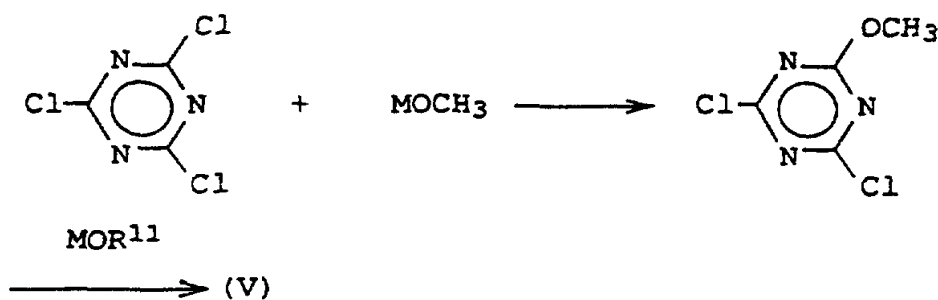


其中 R^2 、 $\text{R}^{4'}$ 、 R^7 和 R^9 各自的定义同上。

作为化合物 (IV)，可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 141、144、145、148、149、150、153、154、157、158、159、162、163、164、165、167、168、169、171、172、175、176、179 和 180 各类取代基团的各个化合物（分别以化合物 (IV)₁₄₁、(IV)₁₄₄、(IV)₁₄₅、(IV)₁₄₈、(IV)₁₄₉、(IV)₁₅₀、(IV)₁₅₃、(IV)₁₅₄、(IV)₁₅₇、(IV)₁₅₈、(IV)₁₅₉、(IV)₁₆₂、(IV)₁₆₃、(IV)₁₆₄、(IV)₁₆₅、(IV)₁₆₇、(IV)₁₆₈、(IV)₁₆₉、(IV)₁₇₁、(IV)₁₇₂、(IV)₁₇₅、(IV)₁₇₆、(IV)₁₇₉ 和 (IV)₁₈₀ 表示），例如，对应于化合物 No. 144 的化合物 (IV) 以化合物 (IV)₁₄₄ 表示，并且该化

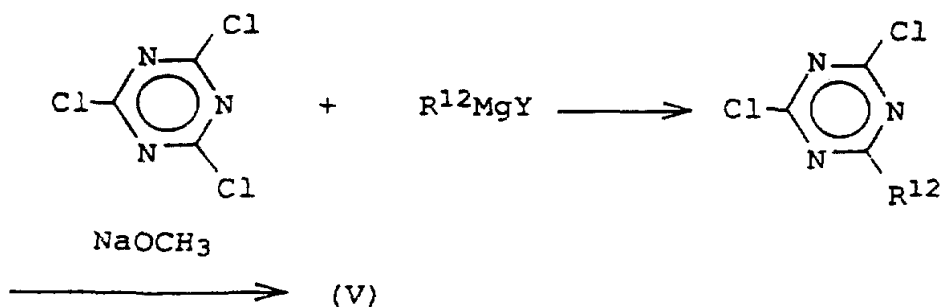
合物 (IV) 144 意指化合物 (IV) 中 R^7 为 CH_3 , R^2 为 H , $R^{4'}$ 为 OH , X 为 S 。

其中 R^6 为烷氧基的化合物 (V) 可以容易地制备, 例如按以下所示通过氰尿酸与烷基醇盐反应制得,



其中 R^{11} 代表烷基, M 代表碱金属。

其中 R^6 为烷基的化合物 (V) 可以容易地制备, 例如按以下所示通过氰尿酸与格利雅试剂反应, 并且再与甲醇钠反应,



其中 R^{12} 代表烷基, Y 代表卤原子。

作为化合物 (V), 可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 141、144、145、148、149、150、153、154、157、158、159、162、163、164、165、167、168、169、171、172、175、176、179

和180各类取代基团的各个化合物(分别以化合物(V)₁₄₁、(V)₁₄₄、(V)₁₄₅、(V)₁₄₈、(V)₁₄₉、(V)₁₅₀、(V)₁₅₃、(V)₁₅₄、(V)₁₅₇、(V)₁₅₈、(V)₁₅₉、(V)₁₆₂、(V)₁₆₃、(V)₁₆₄、(V)₁₆₅、(V)₁₆₇、(V)₁₆₈、(V)₁₆₉、(V)₁₇₁、(V)₁₇₂、(V)₁₇₅、(V)₁₇₆、(V)₁₇₉和(V)₁₈₀表示),例如,对应于化合物No. 144的化合物(V)以化合物(V)₁₄₄表示,并且该化合物(V)₁₄₄意指化合物(V)中R^o为OCH₃。

溶剂不是特别受限制的,只要该溶剂不直接参与本反应,并且可以包括例如水;醚类,如乙醚、四氢呋喃和1,4-二噁烷;酮类,如丙酮、甲乙酮和甲基异丁基酮;腈类,如乙腈;偶极非质子传递溶剂,如N,N-二甲基甲酰胺、N,N'-二甲基-2-咪唑啉酮和二甲基亚砜;以及上述溶液的混合液。

作为碱,可以提到的是有机碱,如三乙胺、吡啶和N,N-二乙基苯胺;无机碱,如氨基钠、氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钾、碳酸钠和氢化钠。

制备化合物(Ic)的反应可以在反应液浓度为5~80%的情况下进行。

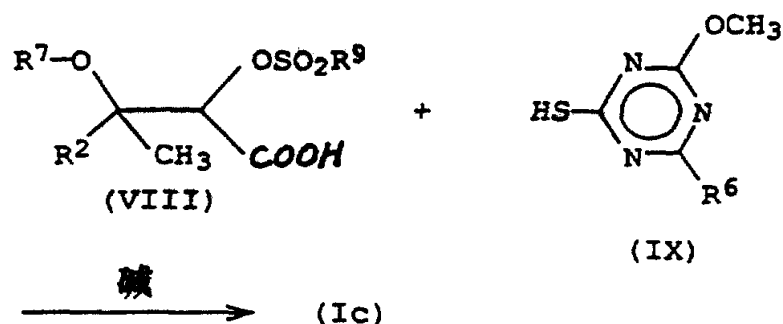
在该制备方法中,应用的起始化合物(IV)和(V)的比例为0.5~2摩尔,每摩尔起始化合物(IV)用1~1.5摩尔起始化合物(V)较好。

反应温度不是特别受限制的,只要达到所用溶剂的沸点或低于该沸点,反应通常在0~50℃进行,加热可以使反应时间缩短。

反应时间依上述浓度和温度而变化,但是通常在0.5~10小时内完成。

作为化合物 (Ic), 可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 141~180 各类取代基团的各个化合物 (以化合物 141~180 表示), 例如, 对应于化合物 No. 144 的化合物 (I) 以化合物 144 表示, 并且该化合物 144 意指化合物 (I) 中 R⁷ 为 CH₃, R² 为 H, R^{4'} 为 OH, R⁹ 为 OCH₃, X 为 S。

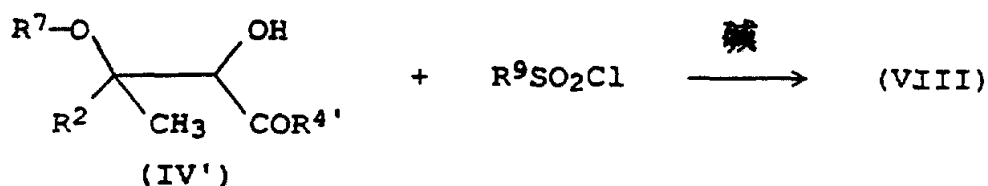
制备方法 4:



其中 R²、R⁹、R⁷ 和 R⁶ 各自的定义同上。

用起始化合物 (VIII) 和 (IX) 代替制备方法 (3) 中的化合物 (IV) 和 (V), 并使化合物 (VIII) 和 (IX) 反应, 可以制得化合物 (Ic)。

化合物 (VIII) 可以按以下所示在合适的溶剂中, 于碱催化剂存在下, 通过化合物 (IV') 与磺酰氯反应容易地制备,



其中 R²、R^{4'}、R⁷ 和 R⁹ 各自的定义同上。

作为化合物 (VIII), 可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 144、148、153、157、158、162、164、167、

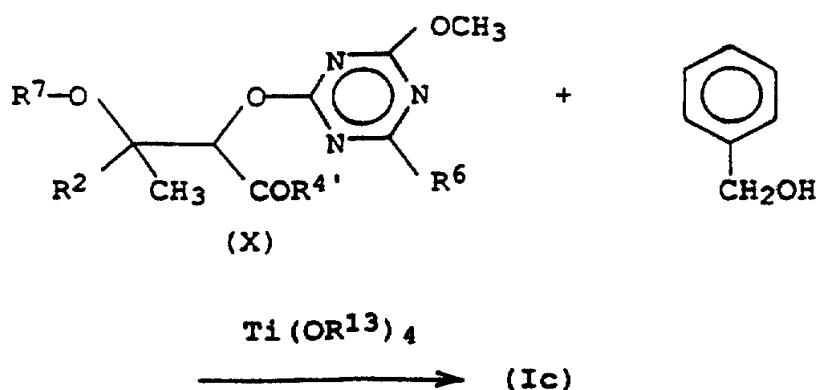
168、171、175、179和180各类取代基团的各个化合物（分别以化合物(VI)₁₄₄、(VI)₁₄₈、(VI)₁₅₃、(VI)₁₅₇、(VI)₁₅₈、(VI)₁₆₂、(VI)₁₆₄、(VI)₁₆₇、(VI)₁₆₈、(VI)₁₇₁、(VI)₁₇₅、(VI)₁₇₉和(VI)₁₈₀表示），例如，对应于化合物No. 148的化合物(VI)以化合物(VI)₁₄₈表示，并且该化合物(VI)₁₄₈意指化合物(VI)中R²和R⁷均为CH₃，R⁶为相应的4-甲基苯基。

化合物(IX)可以在水或醇中，在加热和搅拌的条件下，通过将氢硫化钠加到化合物(VI)中容易地制得。

作为化合物(IX)，可以提到的有例如包括表1所示相应于化合物No. 144、148、153、157、158、162、164、167、168、171、175、179、180各类取代基团的各个化合物（分别以化合物(IX)₁₄₄、(IX)₁₄₈、(IX)₁₅₃、(IX)₁₅₇、(IX)₁₅₈、(IX)₁₆₂、(IX)₁₆₄、(IX)₁₆₇、(IX)₁₆₈、(IX)₁₇₁、(IX)₁₇₅、(IX)₁₇₉和(IX)₁₈₀表示），例如，对应于化合物No. 148的化合物(IX)以化合物(IX)₁₄₈表示，并且该化合物(IX)₁₄₈意指化合物(IX)中R⁶为OCH₃。

可以用制备方法3中相同的溶剂、碱、反应温度和时间进行本反应。

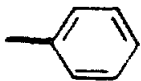
制备方法5：



其中 R^2 、 $R^{4'}$ 、 R^6 和 R^7 各自的定义同上，并且 R^{13} 代表低级烷基。

一般来讲，化合物 (Ic) 可以在溶剂中，用四烃氧基钛作为催化剂，通过化合物 (X) 与苄醇进行酯交换反应容易地制备。

化合物 (X) 例如可以按上述制备方法 3 容易地制备。

作为化合物 (X)，可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 142、146、151、155、160、166、170、173 和 177 各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (X)₁₄₂、(X)₁₄₆、(X)₁₅₁、(X)₁₅₅、(X)₁₆₀、(X)₁₆₆、(X)₁₇₀、(X)₁₇₃ 和 (X)₁₇₇ 表示)，例如，对应于化合物 No. 151 的化合物 (X) 以化合物 (X)₁₅₁ 表示，并且该化合物 (X)₁₅₁ 意指化合物 (X) 中 R^2 为 CH_3 ， R^7 为 C_2H_5 ， $R^{4'}$ 为 $-OCH_2$  和 R^6 为 OCH_3 。

溶剂不是特别受限制的，只要该溶剂不直接地参与该反应，并且可以包括例如芳香烃类，如苯、甲苯和二甲苯。

作为催化剂，可以提到的有四异丙氧基钛和四正丙氧基钛。

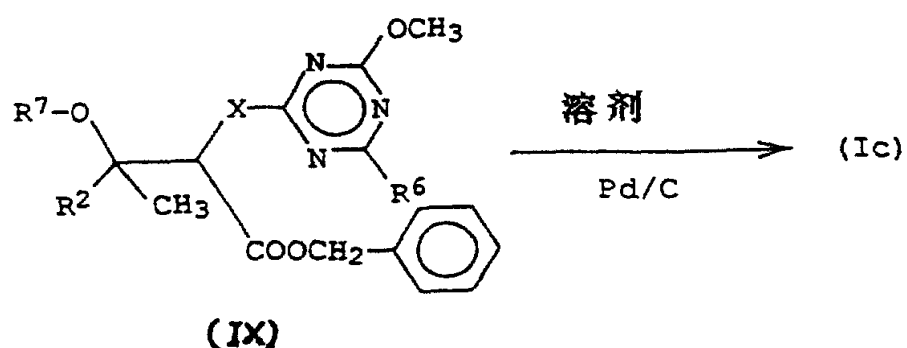
可以在反应液浓度为 5 ~ 80% 的情况下制备化合物 (Ic)。

在该制备方法中，应用的起始化合物 (X) 和苄醇的比例为 1 ~ 3 摩尔，每摩尔起始化合物 (X) 用 1.5 ~ 2 摩尔苄醇较好。

反应温度不是特别受限制的，只要达到所用溶剂的沸点或低于该沸点，但是反应通常可以在 70 ~ 150 °C 下进行。

反应时间依上述浓度和温度而改变，但是一般在 2 ~ 20 小时内完成。

制备方法 6 :



其中 R^2 、 R^6 、 R^7 和 X 各自的定义同上。

化合物 (Ic) 可以通过在常压下, 应用钯-炭作为催化剂, 使化合物 (IX) 进行氢解容易地制得。

化合物 (IX) 可以例如按照制备方法 5 容易地制备。

作为化合物 (IX), 可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 143、147、152、156、161、174 和 178 各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (IX)₁₄₃、(IX)₁₄₇、(IX)₁₅₂、(IX)₁₅₆、(IX)₁₆₁、(IX)₁₇₄ 和 (IX)₁₇₈ 表示), 例如对应于化合物 No. 147 的化合物 (IX) 以化合物 (IX)₁₄₇ 表示, 并且该化合物 (IX)₁₄₇ 意指化合物 (IX) 中 R^2 为 CH_3 , R^6 为 OCH_3 , R^7 为 CH_3 。

溶剂不是特别受限制的, 只要该溶剂不直接地参与该反应, 并且可以包括例如氯化或未氯化的芳香烃, 如苯、甲苯、二甲苯和氯苯; 醚类, 如四氢呋喃; 醇类, 如甲醇和乙醇。

作为催化剂, 可以提到的有钯-炭。

制备化合物 (Ic) 可以在反应液浓度为 5 ~ 80% 的情况下进行。

反应温度不是特别受限制的，只要达到所用溶剂的沸点或低于该沸点，但是反应通常可以在 10 ~ 80 °C 进行，在 20 ~ 50 °C 进行更好。

反应时间依上述浓度和温度而改变，但是通常可以在 0.5 ~ 1.2 小时内完成。

制备方法 7 :

在式 (I) 中其中 R¹ 代表 Y 的化合物 (I d') 可以通过 3 - 羟基 - 2 - 噻啉基硫代链烷酸衍生物 (I e) 与卤化剂反应制备。

化合物 (I e) 可以在溶剂中于锂存在下，通过式 (X) 相应的酮与式 (XI) 的 2 - 噻啉基硫代乙酸酯反应制得。

作为化合物 (X) ，可以应用市场上购买的。

作为化合物 (X) ，可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 181 ~ 195 各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (X)₁₈₁ ~ (X)₁₉₅ 表示) ，例如，对应于化合物 No. 181 的化合物 (X) 以化合物 (X)₁₈₁ 表示，并且该化合物 (X)₁₈₁ 意指化合物 (X) 中 R² 和 R³ 均为 CH₃ 的化合物。

化合物 (XI) 可以于溶剂中，在碱存在下，通过巯基乙酸酯与 4, 6 - 二甲氧基 - 2 - 甲磺酰基噻啉制备。

作为化合物 (XI) ，可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 181 ~ 195 各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (XI)₁₈₁ ~ (XI)₁₉₅ 表示) ，例如，对应于化合物 No. 181 的化合物 (XI) 以化合物 (XI)₁₈₁ 表示，并且该化合物 (XI)₁₈₁ 意指化合物 (XI) 中 R⁴ 和 R^{4'} 均为 OCH₃ ， R^{4''} 为 OC₂H₄Si(CH₃)₃ 。

可以在反应液浓度为 10 ~ 80 % 的情况下制备化合物 (I e) 。在该制备方法中，应用的起始化合物 (X) 和 (XI) 的比例为 1 ~ 2 摩

尔，每摩尔起始化合物 (X) 用 1.1 ~ 1.2 摩尔起始化合物 (XI) 较好。溶剂可以包括例如二噁烷、四氢呋喃 (THF)、乙醚和己烷。反应温度为 $-60^{\circ} \sim -20^{\circ}\text{C}$ 较好。在氮气流和搅拌的情况下，反应时间可以为 1 ~ 3 小时。

作为化合物 (Ie)，可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 181 ~ 195 各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (Ie)₁₈₁ ~ (Ie)₁₉₅ 表示)，例如，相应于化合物 No. 181 的化合物 (Ie) 以化合物 (Ie)₁₈₁ 表示，并且该化合物 (Ie)₁₈₁ 意指化合物 (Ie) 中 R² 和 R³ 均为 CH₃，R⁵ 和 R^{6'} 均为 OCH₃ 和 R^{4''} 为 OC₂H₅。

制备化合物 (Id') 方法中，作为卤化剂可以提到的有亚硫酸氯、亚硫酸溴、三氯化磷、三溴化磷、三碘化磷、氢碘酸、1,1,2,2-四氟乙二胺、二氢三氟化四丁基磷、三氟化二甲氨基硫和草酰氯。反应可以在反应液浓度为 5 ~ 80% 进行。起始化合物 (Ie) 与卤化剂的比例为 1 ~ 3 摩尔，每摩尔起始化合物 (Ie) 用 1.1 ~ 1.5 摩尔卤化剂较好。应用溶剂时，溶剂不是特别受限制的，只要该溶剂不与卤化剂反应，并且可以包括例如醚类，如乙醚、THF 和二噁烷；卤代脂肪烃，如二氯甲烷和氯仿。反应温度不是特别受限制的，但通常为 0 ~ 100°C，以 0 ~ 50°C 较好。反应时间可以依上述浓度和温度而变化，但在搅拌情况下通常为 0.5 ~ 3 小时。

作为化合物 (Id')，可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 196 ~ 218 各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (Id')₁₉₆ ~ (Id')₂₁₈ 表示)，例如，对应于化合物 No. 196 的化合物 (Id') 以化合物 (Id')₁₉₆ 表示，并且该化合物 (Id')₁₉₆

意指化合物 (I d') 中 R^2 和 R^3 均为 CH_3 , R^5 和 R^6 均为 OCH_3 , $R^{4'}$ 为 OC_2H_5 和 X 为 F 。

制备方法 8 :

在式 (I) 中 R^1 代表 CN 的化合物 (I d'') 可以通过 3 - 卤代 - 2 - 嘧啶基硫代链烷酸衍生物 (I d') 与氰化剂反应制备。

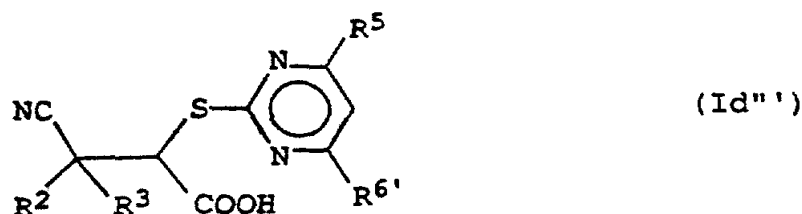
在制备化合物 (I d'') 的方法中, 作为氰化剂可以提到的有氰化钠、氰化钾和氰化铜。反应可以在反应液浓度为 10 ~ 80 % 的情况下进行。起始化合物 (I d') 和氰化剂的比例为 1 ~ 2 摩尔, 每摩尔起始化合物 (I d') 用 1.1 ~ 1.5 摩尔氰化剂较好。溶剂不是特别受限制的, 只要它能与少量水混溶, 并且可以包括例如 DMF (N, N - 二甲基甲酰胺)、DMSO (二甲基亚砷)、DMAC (N, N - 二甲基乙酰胺)、1, 3 - 二甲基 - 2 - 咪唑啉酮、丙酮、乙腈、甲醇和乙醇。反应温度不是特别受限制的, 但以 0 ~ 50 °C 较好。反应时间可以依上述浓度和温度而变化, 但是在搅拌的情况下通常为 0.5 ~ 3 小时。

作为用以上方法制备的化合物 (I d'') , 可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 220 到 232、234、235、241 到 243、247、248、253 到 254、257、258、261、262、264 到 267、269 到 271、290 到 293 以及 306 各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (I d'')₂₂₀₋₂₃₂、(I d'')₂₃₄₋₂₃₅、(I d'')₂₄₁₋₂₄₃、(I d'')₂₄₇₋₂₄₉、(I d'')₂₅₃₋₂₅₄、(I d'')₂₅₇₋₂₅₈、(I d'')₂₆₁₋₂₆₂、(I d'')₂₆₄₋₂₆₇、(I d'')₂₆₉₋₂₇₁、(I d'')₂₉₀₋₂₉₃ 和 (I d'')₃₀₆ 表示), 例如, 对应于化合物 No. 220 的化合物 (I d'') 以化合物 (I d'')₂₂₀ 表示, 并且该化合物 (I d'')₂₂₀ 意

指 (I d'') 中 R² 和 R³ 均为 CH₃ , R^{4''}、R⁵ 和 R^{6'} 均为 OCH₃ 。

制备方法 9 :

下式 (I d''') 所示化合物,



式 (I) 中 R¹ 代表 CN 和 R⁴ 代表羟基的化合物 (I d''') 可以在溶剂中, 通过 3 - 氰基 - 3 - 噻啉基硫代链烷酸酯衍生物 (I d'') 与碱反应制得。

在制备化合物 (I d''') 中, 作为碱, 可以提到的有氢氧化钠和氢氧化钾。可以在反应液浓度为 10 ~ 80 % 的情况下进行反应。起始化合物 (I d'') 与碱的比例为 1 ~ 2 摩尔, 每摩尔起始化合物 (I d'') 用 1 ~ 1.2 摩尔碱较好。溶剂不是特别受限制的, 只要该溶剂能与少量水混溶, 并且可以包括例如 DMF、DMSO、DMAC、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮、丙酮、乙腈、甲醇和乙醇。反应温度不是特别受限制的, 但在 0 ~ 60 °C 较好。反应时间可以依上述浓度和温度而变化, 但是在搅拌情况下通常为 1 ~ 6 小时。

作为用以上方法制得的化合物 (I d''') , 可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 219、252 和 260 各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (I d''')₂₁₉、(I d''')₂₅₂ 和 (I d')₂₆₀ 表示) , 例如, 对应于化合物 No. 219 的化合物 (I d''') 以化合物 (I d''')₂₁₉ 表示, 并且该化合物 (I d''')₂₁₉ 意指化合物 (Id''')

中 R^2 和 R^3 均为 CH_3 ， R^5 和 $R^{6'}$ 均为 OCH_3 和 $R^{4''}$ 为 OH 。

制备方法 10：

化合物 (Id) 可以在溶剂中，于缩合剂存在下，在有或没有碱及有氰化剂存在的情况下，通过化合物 (Id''') 与醇、硫醇或胺反应制得。

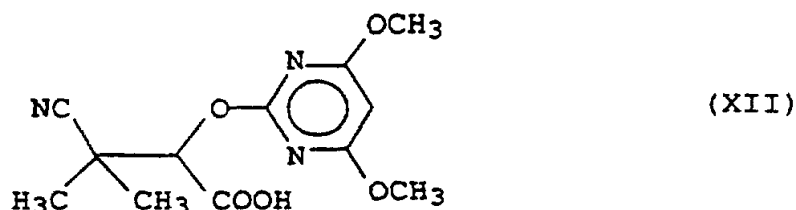
在制备化合物 (Id) 中，作为缩合剂，可以提到的有 DCC (二环己基碳二亚胺)、WSC (1-乙基-3-(3-二甲氨基丙基)碳二亚胺盐酸盐、羰基二咪唑和氰基磷酸二乙酯。反应可以在反应液浓度为 10~80% 的情况下进行。起始化合物 (Id''') 和缩合剂的比例为 1~2 摩尔，每摩尔起始化合物 (Id''') 用 1~1.1 摩尔缩合剂较好。作为碱，可以提到的有三乙胺和氢氧化钠，可以将它们加到起始化合物 (Id''') 中，其量为 1~2 摩尔，每摩尔起始化合物 (Id''') 用 1~1.2 摩尔较好。溶剂不是特别受限制的，只要该溶剂是非水溶剂，其中较好的是二氯甲烷、氯仿、甲苯、苯、THF 和乙醚。反应温度不是特别受限制的，但是最好为 0℃~室温。反应时间可以依上述浓度和温度而变化，但是在搅拌的情况下通常为 0.5~6 小时。

作为用上述制备方法得到的化合物 (Id)，可以提到的有例如表 1 所示相应于化合物 No. 220~243、247~248、251、253~258、261~267、269~273、276~281 以及 289~304、各类取代基团的各个化合物 (分别以化合物 (Id)₂₂₀₋₂₄₃、(Id)₂₄₇₋₂₄₈、(Id)₂₅₁、(Id)₂₅₃₋₂₅₈、(Id)₂₆₁₋₂₆₇、(Id)₂₆₉₋₂₇₃、(Id)₂₇₆₋₂₈₁、(Id)₂₈₉₋₃₀₄ 表示)，例如，对应于化合物 No. 241 的化合物 (Id) 以化合物 (Id)₂₄₁ 表示，并且该化合物 (Id)₂₄₁ 意指化合物 (Id) 中 R^1

为CN, R²和R³均为CH₃, R^{4'}为NHCO₂CH₃, R⁵和R^{6'}均为OCH₃。

制备方法 11:

在有或没有催化剂存在下, 在有碱存在时, 通过式 (XII) 所示化合物的金属盐或胺盐与卤素取代的烷基化合物反应, 可以制得化合物 (Id),



在该制备方法中, 作为催化剂, 可以提到的有冠醚 (如 18-冠-6-醚) 和季胺盐 (如溴化四丁基铵); 作为碱, 可以提到的有氢氧化钠、氢氧化钾、氢化钠、金属钠和三乙胺。作为卤素取代的烷基化合物, 可以提到的有甲氧基甲基氯化物、甲氧基乙氧基甲基氯化物、新戊酰氧甲基氯化物以及甲基硫甲基氯化物。反应可以在反应液浓度为 10~80% 的情况下进行。起始化合物 (XII) 和碱的比例为 1~2 摩尔, 每摩尔起始化合物 (XII) 用 1~1.1 摩尔碱较好。溶剂不是特别受限制的, 可以包括例如 DMF、DMSO、甲苯、苯、二氯甲烷、氯仿、乙腈、THF 和乙醚。反应温度不是特别受限制的, 但 0~100℃ 较好。反应时间可以依上述浓度和温度而变化, 但是在搅拌下通常为 0.5~6 小时。

作为以上方法制得的化合物 (Id), 可以提到的有例如包括表 1 所示相应于化合物 No. 244~246、249~250、268、274~275、282~287 以及 305 各类取代基团的各个化合

物（分别以化合物（I d）₂₄₄₋₂₄₆、（I d）₂₄₉₋₂₅₀、（I d）₂₆₈、（I d）₂₇₄₋₂₇₅、（I d）₂₈₂₋₂₈₇、以及（I d）₃₀₅表示），例如对应于化合物No. 244的化合物（I d）以化合物（I d）₂₄₄表示，并且该化合物（I d）₂₄₄意指化合物（I d）中R^{1'}为CN，R²和R³均为CH₃、R^{4''}为OCH₂OCH₃，R⁵和R^{6'}均为OCH₃。

含有化合物（I）作为有效成分的除草剂具有高度的选择性，并且还显示出良好的除草效果。

即本发明的除草剂对生长在稻田和旱田的一年生杂草和多年生杂草具有良好的除草效果，并且对于一年生杂草如蟋蟀草（甜茅禾草）、稗和狗尾草（绿黍），一年生阔叶杂草如圆叶牵牛、藜（白藜）、苋和绒毛草以及多年生杂草，如阿拉伯高粱、蔗草及沙草的除草效果尤为显著。

本发明的除草剂对上述杂草具有良好的除草效果，但是在上述处理浓度下对农作物（如棉花）却无化学伤害。

本发明的除草剂含有化合物（I）作为有效成分。

化合物（I）可以单独地应用，但是按照一般的方法与载体、表面活性剂、分散剂和辅助剂混合配制成组合物，如粉剂、乳化剂、细颗粒剂、颗粒剂、可湿性粉剂、油悬浮剂或气溶胶剂应用较好。

作为载体，可以提到的有例如固体载体，如滑石、云母、膨润土、粘土、高岭土、硅藻土、白炭黑、蛭石、白云石、沸石、熟石灰、硅砂、硅酐、硫酸铵、尿素、木屑、淀粉和纤维素；液体载体有例如烃类（煤油和矿物油）、芳香烃类（苯、甲苯和二甲苯）、氯化烃类（氯仿和四氯化碳）、醚类（二噁烷和四氢呋喃）、酮类（丙酮、环己酮和异佛尔酮）、酯类（乙酸乙酯、乙二醇乙酸酯和马来酸二丁酯）、醇类（甲醇、正己醇和乙二醇）、极性溶剂（二甲基甲酰胺和二甲基亚砷）及水；气

载体如空气、氮气、二氧化碳和氟利昂（在气体载体的情况下，可以进行混合喷雾）。

应用表面活性剂以改进植物对本发明除草剂的附着和吸收，改进本发明除草剂的分散、乳化和扩散特征，作为表面活性剂可以提到的有非离子的、阳离子的、阴离子的或两性的表面活性剂（如醇硫酸酯、烷基磺酸酯、木素磺酸酯和聚氧乙烯乙二醇醚）。此外，为了改进制剂的性质，可以应用羧甲基纤维素、聚乙二醇或阿拉伯树胶作为辅助剂。

在本发明除草剂的配制中，除了上述载体、表面活性剂、分散剂和辅助剂之外，还可以根据有关的目的各别地应用其他农用化学品（杀菌剂和杀虫剂）、肥料和土壤调节剂，也可以组成合适的组合物。

当将本发明化合物（I）配制成制剂时，有效成分的浓度（按重量计）通常为：乳剂，1～50%；粉剂，0.3～25%；可湿性粉剂，1～90%；颗粒剂，0.5～5%；油分散剂，0.5～5%；气溶胶剂，0.1～5%。

上述制剂可以提供各种用途，根据各自的目的，将上述制剂稀释到合适的浓度，并且将它们喷雾到植物的茎和/或叶上、土壤和稻田表面，或者直接施用。

实例

通过下面的实例详细叙述本发明，但是本发明的范围不受这些实例的限制。

实例 1

(1) 1 - (3 - 乙氧基 - 2 - (4, 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) 氧 - 3 - 甲基丁酰) 咪唑 (化合物 12) 的合成

将 19.4 克 (0.12 摩尔) N, N - 羧基二咪唑溶于 100 ml

二氯甲烷中，混合物保持在 5℃。向混合物中滴加 30.0 克 (0.1 摩尔) 3-乙氧基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧-3-甲基丁酸溶于 100 ml N, N-二甲基甲酰胺 (DMF) 中的溶液，混合物于室温搅拌 0.5 小时。

搅拌完毕，二氯甲烷层用水洗涤，并经硫酸钠干燥，在减压下除去二氯甲烷。所得的结晶用正己烷洗涤，得到 29.8 克 (产率 85%) 标题化合物，为白色结晶。

(2) 1-(2-(4,6-二甲氧基-2-基)硫代-3-甲氧基-3-甲基丁酰)咪唑 (化合物 7) 的合成

将 19.4 克 (0.12 摩尔) N, N-羰基二咪唑溶于 150 ml 二氯甲烷中，混合物保持在 5℃。向混合物中滴加 30.2 克 (0.1 摩尔) 2-(4,6-二甲氧基-2-基)硫代-3-甲氧基-3-甲基丁酸溶于 100 ml DMF 中的溶液，混合物于 5℃ 搅拌 1 小时。

搅拌完毕，将反应混合物加到 100 ml 水中，并用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用饱和盐水溶液洗涤，并经硫酸钠干燥，在减压下除去乙酸乙酯。所得的结晶用正己烷洗涤，得到 30.0 克 (产率 85%) 标题化合物，为白色结晶。

(3) 2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-硫代-3-甲氧基-3-甲基-N-甲磺酰基丁酰胺 (化合物 47) 的合成

将氢氧化钠 (0.1 摩尔, 4 克 60% 氢氧化钠的油溶液) 悬浮于 50 ml N, N-二甲基甲酰胺 (DMF) 中，向悬浮液中滴加 9.5 克 (0.1 摩尔) 甲磺酰胺溶于 50 ml DMF 中的溶液。混合物搅拌 2 小时。搅拌完毕，向混合物中滴加 35.2 克 (0.1 摩尔) 1-(2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲氧基-3-甲基丁酰)咪唑

溶于100 ml DMF中的溶液。滴加完毕将混合物于室温搅拌1小时。

向反应混合物中加入水和1 N盐酸(300 ml)，混合物用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用饱和盐水溶液洗涤，并经硫酸钠干燥，在减压下除去乙酸乙酯。所得的残余物经柱(Wako gel C-200(商品名)，由Wako Junyaku K.K.制造)层析分离，用正己烷：乙酸乙酯：甲醇=1：1：0.1洗脱，得到28.4克(产率75%)标题化合物，为白色结晶。

(4) 3-乙氧基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧-3-甲基-N-甲磺酰基丁酰胺(化合物67)的合成

将19.4克(0.12摩尔)羧基二咪唑溶于50 ml N,N-二甲基甲酰胺(DMF)中，混合物保持在5℃。向混合物中滴加30克(0.1摩尔)3-乙氧基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧-3-甲基丁酸酯溶于100 ml DMF中的溶液。滴加完毕，将混合物搅拌0.5小时。于0℃向混合物中加入9.5克(0.1摩尔)甲磺酰胺和氢氧化钠(0.1摩尔，4克60%氢氧化钠的油溶液)。将混合物搅拌1小时。

向反应混合物中加入水和1 N盐酸(300 ml)，混合物用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用饱和盐水溶液洗涤，并经硫酸钠干燥，在减压下除去乙酸乙酯。所得的残余物经柱(Wako gel C-200(商品名)，由Wako Junyaku K.K.制造)层析分离，用正己烷：乙酸乙酯：甲醇=1：1：0.1洗脱，得到30.0克(产率80%)标题化合物，为白色结晶。

(5) 2-(4,6-二甲氧基-S-三嗪-2-基)氧-3-乙氧基-3-甲基丁酸乙酯(化合物154)的合成

按制备方法 3 所述的方法合成本发明化合物 (Ic)

将 14.4 克 (0.1 摩尔) 2,3-环氧-3-甲基丁酸乙酯溶于 40 ml 乙醇中, 然后向其中加入 0.5 ml 硫酸 (作为催化剂)。混合物于 30 °C 搅拌 2 小时。

随后在减压下除去过量的乙醇, 残余物经柱 (Wako gel C-200 (商品名), 由 Wako Junyaku K.K. 制造) 层析, 用正己烷: 乙酸乙酯 = 7:3 洗脱, 得到 3-乙氧基-2-羟基-3-甲基丁酸乙酯。于 5 °C 将该产物加到 0.1 摩尔氢氧化钠 (4 克 60% 氢氧化钠的油溶液) 在 100 ml 四氢呋喃的悬浮液中, 混合物搅拌 30 分钟。搅拌完毕, 向混合物中滴加 17.5 克 (0.1 摩尔) 2-氯-4,6-二甲氧基-S-三嗪溶于 50 ml 四氢呋喃中的溶液, 混合物于 20 °C 搅拌 1 小时。

将反应混合物加到水中, 并用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用饱和盐水溶液洗涤, 并经硫酸钠干燥, 在减压下除去乙酸乙酯。所得残余物经柱 (Wako gel C-200 (商品名), 由 Wako Junyaku K.K. 制造) 层析分离, 用正己烷: 乙酸乙酯 = 3:1 洗脱, 得到 26.3 克 (产率 80% 标题化合物, 为无色油状产物。

(6) 2-(4,6-二甲氧基-S-三嗪-2-基)氧-3-乙氧基-3-甲基丁酸苄酯 (化合物 155) 的合成

按制备方法 5 所述方法合成标题化合物 (Ic)。

将 32.9 克 (0.1 摩尔) 化合物 154 (由上面合成方法 (5) 制得) 和 16.2 克 (0.15 摩尔) 苄醇溶于 200 ml 甲苯中。向该溶液中加入 3 ml 四异丙氧基钛作为催化剂。混合物加热回流 6 小时, 同时除去回流期间释出的乙醇。

然后将反应混合物冷却至室温。甲苯层用水洗涤, 在减压下除去甲

苯。所得残余物经柱 (Wako gel C-200 (商品名), 由Wako Junyaku K.K制造) 层析分离, 用正己烷: 乙酸乙酯 = 3 : 1 洗脱, 得到33.3克 (产率 85%) 标题化合物, 为无色油状产物。

(7) 2 - (4, 6 - 二甲氧基 - S - 三嗪 - 2 - 基) 氧 - 3 - 乙氧基 - 3 - 甲基丁酸 (化合物 156) 的合成

按制备方法 6 所述方法合成本发明化合物 (Ic)。

将 39.2 克 (0.1 摩尔) 化合物 155 (由上面合成方法 (6) 制得) 溶于 200 ml 乙醇中, 加入 0.5 克钯炭作为催化剂。混合物于室温 (20°C) 搅拌 1 小时, 同时通入氢气。然后滤除催化剂, 浓缩母液, 得到 28.6 克 (产率 95%) 标题化合物, 为无色油状产物。

(8) 2 - (4, 6 - 二甲氧基 - S - 三嗪 - 2 - 基) 硫代 - 3 - 乙氧基 - 3 - 甲基丁酸 (化合物 157) 的合成

按制备方法 3 所述的方法合成标题化合物 (Ic)

将 17.8 克 (0.1 摩尔) 3 - 乙氧基 - 2 - 巯基 - 3 - 甲基丁酸溶于 1 N 氢氧化钠中。向溶液中加入 17.5 克 (0.1 摩尔) 2 - 氧 - 4, 6 - 二甲氧基 - S - 三嗪溶于 100 ml 丙酮中的溶液, 混合物于室温 (20°C) 搅拌 1 小时。

将反应混合物加到 100 ml 5 N 盐酸水溶液中, 并用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用饱和盐水溶液洗涤, 并经硫酸钠干燥, 在减压下除去乙酸乙酯。所得的残余物经柱 (Wako gel C-200 (商品名), 由 Wako Junyaku K.K. 制造) 层析分离, 用正己烷: 乙酸乙酯: 乙酸 = 1 : 1 : 0.1 洗脱, 得到 23.7 克 (产率 75%) 标题化合物, 为无色透明的油状产物。

(9) 2 - (4, 6 - 二甲氧基 - S - 三嗪 - 2 - 基) 硫代 - 3 -

甲氧基-3-甲基丁酸（化合物 148）的合成

按制备方法 4 所述的方法合成标题化合物（1c）。

向 150 ml N, N'-二甲基甲酰胺中加入 30.2 克（0.1 摩尔）3-甲氧基-3-甲基-2-对甲苯磺酰氧基丁酸和 17.3 克（0.1 摩尔）4,6-二甲氧基-2-巯基-S-三嗪，然后向其中再加入 13.8 克（0.1 摩尔）碳酸钾。混合物于 50℃ 搅拌 2 小时。

将反应混合物加到水中，并用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用饱和盐水溶液洗涤，并经硫酸钠干燥，在减压下除去乙酸乙酯。所得的残余物经柱（Wako gel C-200（商品名），Wako Junyaku K.K. 制造）层析分离，用正己烷：乙酸乙酯：乙酸 = 1 : 1 : 0.1 洗脱，得到 24.2 克（产率 80%）标题化合物，为白色结晶。

(10) 2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-羧基-3-甲基丁酸乙酯（化合物（1e）₁₅₁）的合成

按制备方法 7 所述合成化合物（1e）的方法合成标题化合物。

将 25.8 克（0.1 摩尔）（4,6-二甲氧基嘧啶-2-基）硫代乙酸乙酯溶于 300 ml 四氢呋喃（THF）中。在氮气流下于 -78℃ 向溶液中滴加 110 ml（0.11 摩尔）双（三甲基甲硅烷基）氨基锂-1 M THF 溶液，然后再各其中加入 6.4 克（0.11 摩尔）丙酮。将混合物搅拌 1 小时。随后，将反应混合物升温至 0℃。混合物倒入水中，向其中加入 500 ml 乙酸乙酯。乙酸乙酯层经萃取、用水洗涤和干燥。在减压下除去 THF 和乙酸乙酯，所得残余物经柱（Wako gel C-200（商品名），由 Wako Junyaku K.K. 制造）层析分离，用正己烷：乙酸乙酯 = 5 : 1 洗脱，得到 24.6 克（产率 78%）标题化合物，为无色透明粘稠状液体。

物理性质：反射光系数为 1.5230 (20°C)

(11) 3-氯-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸乙酯的合成(化合物 215)

按制备方法 7 合成化合物 (Id)。

将 16.8 克 (53 毫摩尔) 化合物 (Ie)₁₈₁ (由上面合成方法 (10) 制得) 溶于 100 ml 乙酸乙酯中, 于室温下向溶液中滴加 6.5 克 (55 毫摩尔) 亚硫酸氯。将混合物搅拌 1 小时。随后, 反应混合物倒入冰水中, 用水洗涤, 进一步用水洗涤 2 次, 然后干燥。减压下除去乙酸乙酯, 所得残余物经柱 (Wako gel C-200 (商品名), 由 Wako Junyaku K.K. 制造) 层析分离, 用正己烷: 乙酸乙酯 = 8:1 洗脱, 得到 14.2 克 (产率 80%) 标题化合物, 为白色结晶。

(12) 3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸乙酯(化合物 221)的合成

按制备方法 7 合成化合物 (Id)。

将 3.4 克 (10 毫摩尔) 化合物 215 (由上面合成方法 (11) 制得) 溶于 30 ml DMF 中, 向该溶液中加入 12 毫摩尔氟化钠溶液 (0.6 克氟化钠溶于 2 ml 水的溶液)。混合物于 60°C 搅拌 3 小时。随后, 反应混合物倒入水中, 并用 100 ml 甲苯萃取。甲苯层用水洗涤 5 次, 并干燥, 在减压下除去甲苯。

所得的油状产物经柱 (Wako gel C-200 (商品名), 由 Wako Junyaku K.K. 制造) 层析分离, 用正己烷: 乙酸乙酯 = 8:1 洗脱, 得到 2.1 克 (产率 65%) 标题化合物, 为白色结晶。

(13) 3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸(化合物 219)的合成

按制备方法 9 合成化合物 (1 d)。

将 1.0 克 (3 毫摩尔) 化合物 2 2 1 (由上面合成方法 (1 2) 制得) 溶于 10 ml 丙酮中, 向该溶液中加入氢氧化钠溶液 (0.2 克氢氧化钠溶于 10 ml 水的溶液)。混合物于室温搅拌 5 小时。随后, 将反应混合物倒入水中, 用 1 N 盐酸溶液中和, 并用乙醚萃取。乙醚层用水洗涤并干燥, 在减压下除去乙醚, 得到 0.7 克 (产率 7.8 %) 标题化合物, 为白色结晶。

(1 4) 3 - 氟基 - 2 - (4, 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) 硫代 - 3 - 甲基丁酸丙酯 (化合物 2 2 2) 的合成

按制备方法 1 0 合成化合物 (1 d)。

将 0.6 克 (2 毫摩尔) 化合物 2 1 9 (由上面合成方法 (1 3) 制得) 和 0.2 克 (3 毫摩尔) 丙醇溶于 30 ml 无水二氯甲烷中, 于 5 °C 向溶液中加入 0.4 克 (2 毫摩尔) W S C。混合物搅拌 30 分钟。随后, 将反应混合物倒入水中, 用水洗涤并干燥, 在减压下除去二氯甲烷。

所得油状产物经柱 (Wako gel C-200 (商品名), 由 Wako Junyaku K.K. 制造) 层析分离, 用正己烷 : 乙酸乙酯 = 8 : 1 洗脱, 得到 0.5 克 (产率 7.4 %) 标题化合物, 为白色结晶。

(1 5) 3 - 氟基 - 2 - (4, 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) 硫代 - 3 - 甲基丁酰 - 1 - 咪唑 (化合物 2 4 0) 的合成

按制备方法 1 0 合成化合物 (1 d)。

将 1.0 克 (3.4 毫摩尔) 化合物 2 1 9 (由上面合成方法 (1 3) 制得) 溶于 30 ml 无水二氯甲烷中。于室温向溶液中加入 0.6 克 (3.4 毫摩尔) 羧基咪唑, 混合物搅拌 30 分钟。再向其中加入

5 ml水，将混合物搅拌5分钟。随后，用滤纸从反应混合物中分离除去水，在减压下除去二氯甲烷，得到1.1克（产率90%）标题化合物，为淡棕色结晶。

(16) 3-氨基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基-N-甲磺酰基丁酰胺（化合物241）

按制备方法10合成化合物（Id）。

将0.8克（2.2毫摩尔）化合物240（由上面合成方法（13）制得）和0.3克（3毫摩尔）甲磺酰胺溶于20 ml DMF中，于5℃向溶液中加入0.1克（2.5毫摩尔）氢氧化钠。混合物于室温搅拌1小时。随后，反应混合物倒入水中，用柠檬酸水溶液中和，用80 ml氯仿萃取。氯仿层用水洗涤5次并干燥，在减压下除去氯仿，得到半固体状物质。

向该半固体状物质中加入30 ml己烷，将混合物静置。过滤收集所得的结晶，并干燥，得到7.1克（产率87%）标题化合物，为白色结晶。

(17) 3-氨基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸钾（化合物245）的合成

按制备方法11合成化合物（Id）。

将0.23克磨碎的氢氧化钾溶于20 ml甲醇中，向溶液中加入1.0克（3.4毫摩尔）化合物219（由上面合成方法（13）制得）溶于20 ml甲醇的溶液。混合物于室温搅拌30分钟。随后，在减压下除去甲醇，得到白色固体状物质。

将该固体物质加到30 ml甲苯中，并充分洗涤。滤除去甲苯，残余物经干燥得到1.0克（产物98%）标题化合物，为白色结晶。

(18) 3-氟基-2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)硫代-3-甲基丁酸(叔丁基羧氧基甲基)酯(化合物246)的合成

按制备方法11合成化合物(I d)。

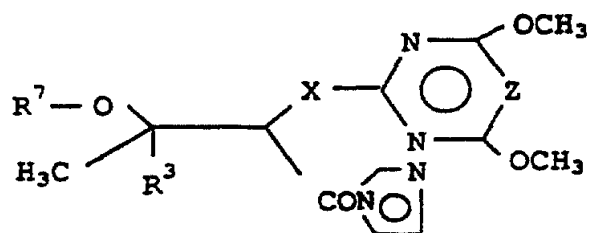
将1.0克(3毫摩尔)化合物245(由上面合成方法(17)制得)、0.5克(3.3毫摩尔)新戊酸氟甲基酯、1.0克(6毫摩尔)碘化钾和0.1克冠醚溶于50 ml甲苯中,使混合物沸腾回流5小时。随后,将反应混合物倒入水中,用水洗涤,并干燥,在减压下除去甲苯,得到淡黄色油状产物。

所得的油状产物经柱(Wako gel C-200(商品名),由Wako Junyaku K.K.制造)层析分离,用正己烷:乙酸乙酯=1:8洗脱,得到0.9克(产率73%)无色透明的油状产物。

(19) 合成表1中其他的化合物(I)

按合成方法(1)~(11)中任何一个相同的方法制备表1所示的标题化合物(I)。

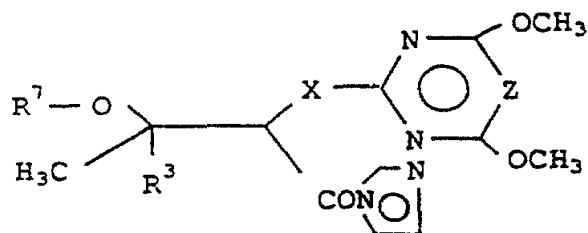
表 1



10

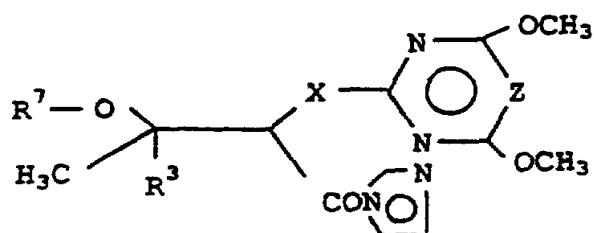
化合物号	R ⁷	R ³	X	Z	物理性质
1	CH ₃	H	O	CH	
2	"	"	"	N	
3	"	"	S	CH	
4	"	"	"	N	
5	"	CH ₃	O	CH	m.p. 129 - 131°C
6	"	"	"	N	m.p. 93 - 95°C
7	"	"	S	CH	m.p. 114 - 118°C
8	"	"	"	N	m.p. 74 - 76°C
9	C ₂ H ₅	H	O	CH	
10	"	"	S	"	n _D ^{24.0} 1.5298
11	"	"	"	N	m.p. 113 - 116°C
12	"	CH ₃	O	CH	m.p. 84 - 88°C
13	"	"	"	N	
14	"	"	S	CH	n _D ^{19.2} 1.5411

表 1 (续)



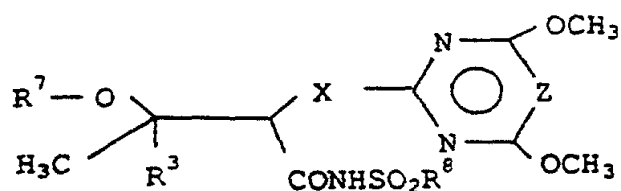
化合物号	R ⁷	R ³	X	Z	物理性质
15	C ₂ H ₅	CH ₃	S	N	m.p. 87 ~ 89°C
16	n-C ₃ H ₇	"	O	CH	m.p. 98 ~ 99°C
17	"	"	S	"	
18	"	"	"	N	
19	CH ₂ =CH-CH ₂ -	H	O	CH	m.p. 112 ~ 113°C
20	"	"	S	"	
21	"	"	"	N	
22	"	CH ₃	O	CH	m.p. 102 ~ 103°C
23	"	"	S	"	m.p. 99 ~ 100°C
24	"	"	"	N	m.p. 97 ~ 98°C
25	HC≡C-CH ₂ -	H	O	CH	m.p. 98 ~ 100°C
26	"	"	S	"	n _D ^{25.6} 1.5194
27	"	"	"	N	
28	"	CH ₃	O	CH	m.p. 90 ~ 92°C
29	"	"	S	"	m.p. 69 ~ 70°C
30	"	"	"	N	m.p. 83 ~ 85°C
31	C/CH ₂ CH ₂ -	"	O	CH	m.p. 96 ~ 97°C

表 1 (续)



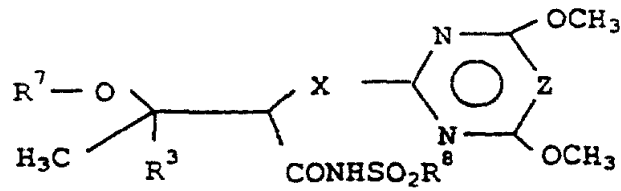
化合物号	R ⁷	R ³	X	Z	物理性质
32	C/CH ₂ CH ₂ -	CH ₃	O	N	m.p. 103 ~ 105°C
33	"	"	S	CH	m.p. 83 ~ 84°C
34	"	"	"	N	
35	CNCH ₂ CH ₂ -	"	O	CH	
36	"	"	"	N	
37	"	"	S	CH	
38	"	"	"	N	

表 1 (续)



化合物号	R ⁷	R ³	R ⁸	X	Z	物理性质
39	CH ₃	H	CH ₃	O	CH	
40	"	"	"	"	N	
41	"	"	"	S	CH	m.p. 123 ~ 126°C
42	"	"	"	"	N	
43	"	"	C ₂ H ₅	O	CH	
44	"	"	"	S	"	

表 1 (续)




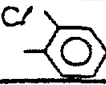

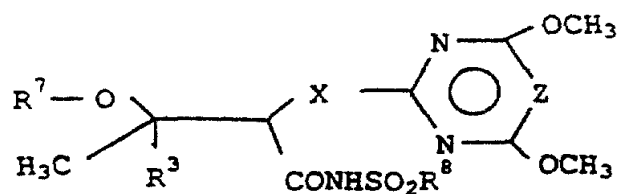
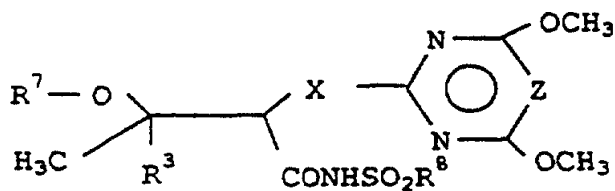
化合物号	R ⁷	R ³	R ⁸	X	Z	物理性质
45	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	CH	m.p. 126 ~ 127°C
46	"	"	"	"	N	n _D ^{23.8} 1.4933
47	"	"	"	S	CH	m.p. 97 ~ 98°C
48	"	"	"	"	N	m.p. 98 ~ 101°C
49	"	"	C ₂ H ₅	O	CH	m.p. 103 ~ 105°C
50	"	"	"	S	"	m.p. 73 ~ 75°C
51	"	"	"	"	N	油状产物
52	"	"	n-C ₃ H ₇	O	CH	
53	"	"	"	S	"	n _D ^{24.9} 1.5334
54	"	"	i-C ₃ H ₇	O	"	
55	"	"	"	S	"	n _D ^{23.7} 1.3310
56	"	"	n-C ₄ H ₉	O	"	
57	"	"	"	S	"	n _D ^{25.8} 1.5243
58	"	"		O	"	
59	"	"		"	"	
60	"	"		"	"	
61	C ₂ H ₅	H	CH ₃	"	"	m.p. 112 ~ 116°C
62	"	"	"	S	"	n _D ^{23.2} 1.5324

表 1 (续)



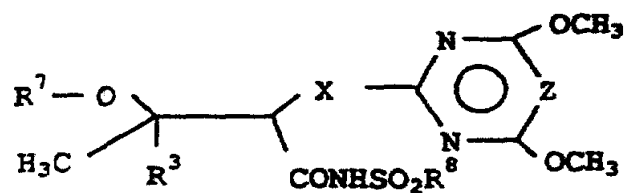
化合物号	R ⁷	R ³	R ⁸	X	Z	物理性质
63	C ₂ H ₅	H	CH ₃	S	N	n _D ^{23.7} 1.5056
64	"	"	C ₂ H ₅	O	CH	n _D ^{23.4} 1.5028
65	"	"	"	S	"	n _D ^{26.0} 1.5266
66	"	"	"	"	N	
67	"	CH ₃	CH ₃	O	CH	m.p. 58 ~ 60°C
68	"	"	"	S	"	n _D ^{21.8} 1.5253
69	"	"	"	"	N	油状产物
70	"	"	C ₂ H ₅	O	CH	m.p. 59 ~ 62°C
71	"	"	n-C ₃ H ₇	"	"	m.p. 79 ~ 81°C
72	"	"	i-C ₃ H ₇	"	"	m.p. 117 ~ 118°C
73	"	"	n-C ₄ H ₉	"	"	m.p. 72 ~ 74°C
74	"	"		"	"	m.p. 120 ~ 121°C
75	"	"		"	"	油状产物
76	n-C ₃ H ₇	"	CH ₃	"	"	m.p. 58 ~ 59°C
77	"	"	"	S	"	m.p. 104 ~ 106°C
78	"	"	"	"	N	m.p. 110 ~ 112°C

表 1 (续)



化合物号	R^7	R^3	R^8	X	Z	物理性质
79	$i-C_3H_7$	H	CH_3	O	CH	
80	$CH_2=CHCH_2-$	"	"	"	"	m.p. 122 ~ 125°C
81	"	"	"	S	"	m.p. 98 ~ 101°C
82	"	"	"	"	N	
83	"	CH_3	"	O	CH	m.p. 60 ~ 61°C
84	"	"	"	S	"	$n_D^{24.0}$ 1.5342
85	"	"	"	"	N	$n_D^{22.6}$ 1.5332
86	$HC\equiv CCH_2-$	H	"	O	CH	m.p. 128 ~ 131°C
87	"	"	"	S	"	
88	"	"	"	"	N	
89	"	CH_3	"	O	CH	m.p. 62 ~ 65°C
90	"	"	"	S	"	m.p. 131 ~ 134°C
91	"	"	"	"	N	
92	C/CH_2CH_2-	"	"	O	CH	m.p. 93 ~ 94°C
93	"	"	"	S	"	$n_D^{22.6}$ 1.5451
94	"	"	"	O	N	$n_D^{21.6}$ 1.4916
95	"	"	"	S	"	油状产物
96	$CNCH_2CH_2-$	"	"	O	CH	m.p. 155 ~ 158°C

表 1 (续)




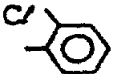
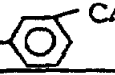
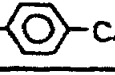
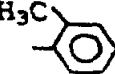

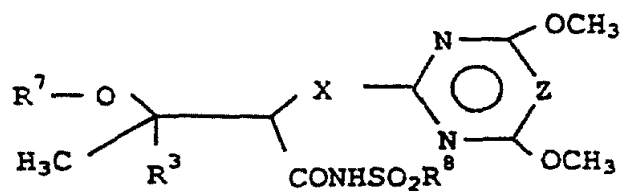
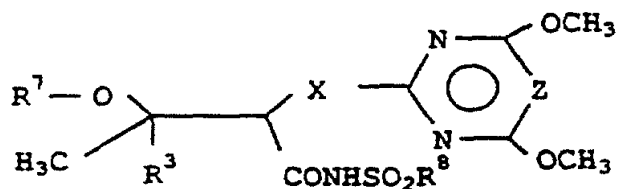
化合物号	R ⁷	R ³	R ⁸	X	Z	物理性质
97	CNCH ₂ CH ₂ -	CH ₃	CH ₃	S	CH	
98	"	"	"	"	N	
99	CH ₃	"	n-C ₃ H ₇	"	"	n _D ^{24.9} 1.5178
100	"	"	i-C ₃ H ₇	"	"	n _D ^{24.5} 1.5190
101	"	"	n-C ₄ H ₉	"	"	n _D ^{24.6} 1.5140
102	"	"		"	CH	n _D ^{25.5} 1.5470
103	"	"	"	"	N	m.p. 47 ~ 50°C
104	"	"		"	CH	m.p. 131 ~ 135°C
105	"	"	"	"	N	油状产物
106	"	"		"	CH	m.p. 49 ~ 52°C
107	"	"	"	"	N	m.p. 51 ~ 54°C
108	"	"		"	CH	m.p. 89 ~ 93°C
109	"	"	"	"	N	m.p. 68 ~ 72°C
110	"	"		"	CH	m.p. 44 ~ 49°C
111	"	"	"	"	N	m.p. 38 ~ 41°C
112	"	"		"	CH	m.p. 42 ~ 46°C
113	"	"	"	"	N	n _D ^{24.6} 1.5450

表 1 (续)



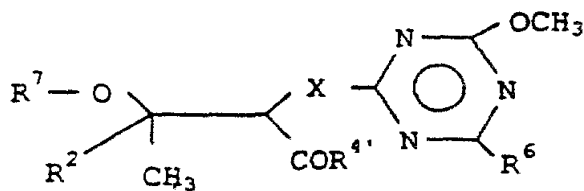
化合物号	R ⁷	R ³	R ⁸	X	Z	物理性质
114	CH ₃	CH ₃		S	CH	m.p. 53 ~ 57°C
115	"	"	"	"	N	m.p. 46 ~ 52°C
116	C ₂ H ₅	"	C ₂ H ₅	"	"	n _D ^{24.0} 1.5244
117	"	"	n-C ₃ H ₇	"	"	n _D ^{24.3} 1.5210
118	"	"	i-C ₃ H ₇	"	CH	m.p. 87 ~ 90°C
119	"	"	"	"	N	n _D ^{23.5} 1.5220
120	"	"	n-C ₄ H ₉	"	"	n _D ^{23.6} 1.5190
121	"	"		"	CH	n _D ^{19.8} 1.5438
122	"	"	"	"	N	m.p. 46 ~ 49°C
123	n-C ₃ H ₇	"	C ₂ H ₅	"	CH	m.p. 88 ~ 90°C
124	"	"	"	"	N	n _D ^{18.5} 1.5112
125	"	"	i-C ₃ H ₇	"	CH	油状产物
126	"	"	"	"	N	油状产物
127	i-C ₃ H ₇	"	CH ₃	O	CH	m.p. 104 ~ 105°C
128	"	"	"	S	"	m.p. 112 ~ 115°C
129	HC≡CCH ₂ -	"	C ₂ H ₅	O	"	m.p. 111 ~ 112°C
130	"	"	"	S	"	m.p. 126 ~ 128°C

表 1 (续)



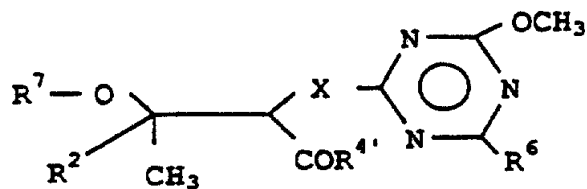
化合物号	R ⁷	R ³	R ⁸	X	Z	物理性质
131	HC≡CCH ₂ -	CH ₃	C ₂ H ₅	S	N	油状产物
132	"	"	n-C ₃ H ₇	O	CH	m.p. 111 ~ 113°C
133	"	"	"	S	N	油状产物
134	FCH ₂ CH ₂ -	"	CH ₃	O	CH	m.p. 112 ~ 114°C
135	"	"	"	S	"	油状产物
136	F ₂ CHCH ₂ -	"	"	O	"	"
137	"	"	C ₂ H ₅	"	"	"
138	C/CH ₂ CH ₂ -	"	"	"	"	m.p. 92 ~ 93°C
139	CNCH ₂ CH ₂ -	"	"	"	"	20.6 n _D 1.5054
140	"	"	n-C ₃ H ₇	"	"	油状产物

表 1 (续)



化合物号	R ⁷	R ²	R ^{4'}	R ⁶	X	物理性质
141	CH ₃	H	OC ₂ H ₅	OCH ₃	O	
142	"	"	-OCH ₂ -	"	"	
143	"	"	OH	"	"	

表 1 (续)







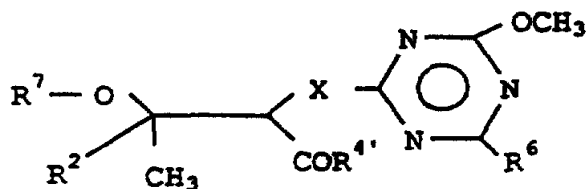
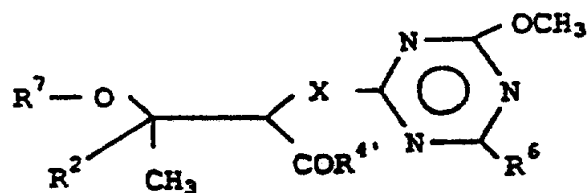
化合物号	R ⁷	R ²	R ^{4'}	R ⁶	X	物理性质
144	CH ₃	H	OH	OCH ₃	S	m.p. 111 ~ 115°C
145	"	CH ₃	OC ₂ H ₅	"	O	
146	"	"	-OCH ₂ - 	"	"	
147	"	"	OH	"	"	m.p. 94 ~ 96°C
148	"	"	"	"	S	m.p. 117 ~ 118°C
149	"	"	"	CH ₃	"	m.p. 121 to 124°C
150	C ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	OCH ₃	O	油状产物
151	"	"	-OCH ₂ - 	"	"	m.p. 60 ~ 65°C
152	"	"	OH	"	"	^{22.8} _D n _D 1.4790
153	"	"	"	"	S	^{19.6} _D n _D 1.5186
154	"	CH ₃	OC ₂ H ₅	"	O	^{22.4} _D n _D 1.4757
155	"	"	-OCH ₂ - 	"	"	m.p. 83 ~ 85°C
156	"	"	OH	"	"	^{22.4} _D n _D 1.4784
157	C ₂ H ₅	"	"	OCH ₃	S	^{25.6} _D n _D 1.5118
158	"	"	"	CH ₃	"	
159	n-C ₃ H ₇	"	OC ₂ H ₅	OCH ₃	O	油状产物
160	"	"	-OCH ₂ - 	"	"	^{20.8} _D n _D 1.5152

表 1 (续)



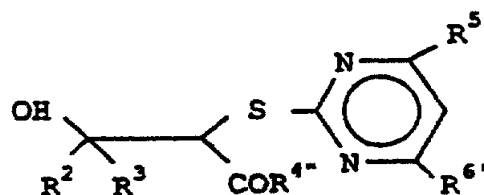
化合物号	R^7	R^2	$R^{4'}$	R^6	X	物理性质
161	$n-C_3H_7$	CH_3	OH	OCH_3	O	$n_D^{25.0}$ 1.4873
162	"	"	"	"	S	$n_D^{23.1}$ 1.5044
163	$i-C_3H_7$	H	OC_2H_5	"	O	
164	$CH_2=CH-CH_2-$	"	OH	"	S	
165	"	CH_3	OC_2H_5	"	O	$n_D^{22.3}$ 1.4840
166	"	"	$-OCH_2-$ 	"	"	
167	"	"	OH	"	S	$n_D^{21.8}$ 1.5354
168	$HC\equiv C-CH_2-$	H	"	"	"	
169	"	CH_3	OC_2H_5	"	O	$n_D^{23.0}$ 1.4851
170	"	"	$-OCH_2-$ 	"	"	$n_D^{22.8}$ 1.5316
171	"	"	OH	"	S	油状产物
172	C/CH_2CH_2-	"	OC_2H_5	"	O	m.p. 81 ~ 83°C
173	"	"	$-OCH_2-$ 	"	"	油状产物
174	"	"	OH	"	"	m.p. 87 ~ 88°C
175	"	"	"	"	S	m.p. 95 ~ 96°C
176	$BrCH_2CH_2-$	"	OC_2H_5	"	O	油状产物
177	"	"	$-OCH_2-$ 	"	"	m.p. 73 ~ 76°C

表 1 (续)



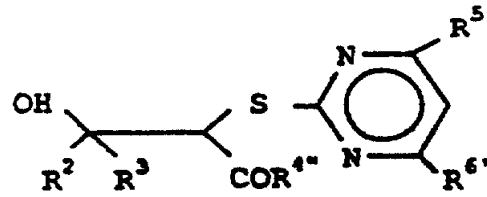
化合物号	R ⁷	R ²	R ^{4'}	R ⁶	X	物理性质
178	BrCH ₂ CH ₂ -	CH ₃	OH	OCH ₃	O	
179	"	"	"	"	S	
180	CNCH ₂ CH ₂ -	"	"	"	"	m.p. 98 - 101°C

表 1 (续)



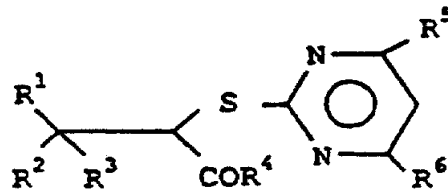
化合物号	R ²	R ³	R ⁵	R ^{6'}	R ^{4''}	物理性质
181	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅	n _D ^{20.0} 1.5230
182	"	C ₂ H ₅	"	"	"	n _D ^{20.0} 1.4931
183	"	CH ₃	"	"	NHSO ₂ CH ₃	m.p. 113 - 114°C
184	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₂ H ₅	
185	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₃ H _{7-n}	m.p. 117 - 118°C
186	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₃ H _{7-i}	
187	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₄ H _{9-n}	m.p. 102 - 104°C
188	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₄ H _{9-sec}	
189	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₄ H _{9-i}	
190	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₅ H _{11-n}	m.p. 81 - 83°C

表 1 (续)



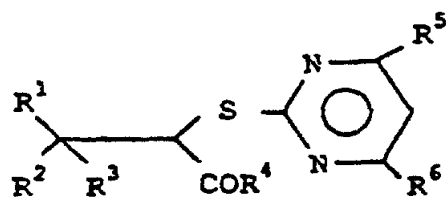
化合物号	R ²	R ³	R ⁵	R ^{6'}	R ^{4''}	物理性质
191	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	NHSO ₂ C ₆ H _{13-n}	m.p. 74 ~ 75°C
192	"	"	"	"	NHSO ₂ CH ₂ -	
193	"	"	"	"	NHSO ₂ (CH ₂) ₃ -	
194	"	"	"	"	NHSO ₂ -	
195	"	"	"	"	NHSO ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅	

表 1 (续)



化合物号	R ²	R ³	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁴	物理性质
196	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅	n _D ^{20.0} 1.5092
197	"	"	"	"	"	OH	m.p. 109 ~ 110°C
198	"	"	"	"	"	OCH ₂ -	n _D ^{20.0} 1.5326
199	"	"	"	"	"	NHSO ₂ CH ₃	m.p. 147°C
200	"	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₂ H ₅	m.p. 129 ~ 130°C
201	"	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₃ H _{7-n}	m.p. 103°C
202	"	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₃ H _{7-i}	m.p. 118°C

表 1 (续)




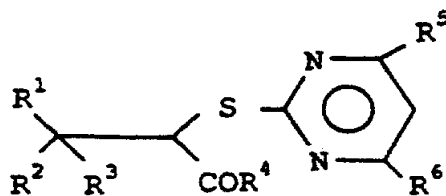
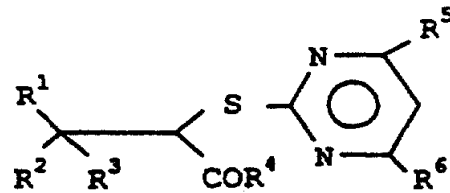
化合物号	R ²	R ³	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁴	物理性质
203	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	NHSO ₂ C ₄ H ₉ -n	m.p. 98°C
204	"	"	"	"	"	NHSO ₂ - 	^{20.0} n _D 1.5602
205	CF ₃	"	"	"	"	OC ₂ H ₅	^{20.0} n _D 1.4956
206		H	"	"	"	"	^{20.0} n _D 1.5735
207		"	"	"	"	"	^{20.0} n _D 1.4925
208	CH ₃	CH ₃	"	"	"	NHSO ₂ C ₅ H ₁₁ -n	m.p. 105 - 106°C
209	"	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₆ H ₁₃ -n	m.p. 78 - 79°C
210	"	"	"	"	"	NHSO ₂ (CH ₂) ₃ - 	m.p. 131 - 134°C
211	"	"	"	"	"	NHSO ₂ CH ₂ - 	m.p. 105 - 106°C
212	"	"	"	"	"	 NHSO ₂ CHC ₂ H ₅	m.p. 101 - 103°C
213	"	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₄ H ₉ -i	m.p. 88 - 90°C
214	"	"	"	"	"	 NHSO ₂ CHC ₃ H ₇	m.p. 102 - 104°C
215	"	"	Cl	"	"	OC ₂ H ₅	m.p. 47 - 48°C
216	"	"	"	"	"	OCH ₂ - 	^{20.0} n _D 1.5570
217	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₄ Si(CH ₃) ₃	^{20.0} n _D 1.5131
218	C ₂ H ₅	"	"	"	"	OC ₂ H ₅	^{20.0} n _D 1.4984

表 1 (续)



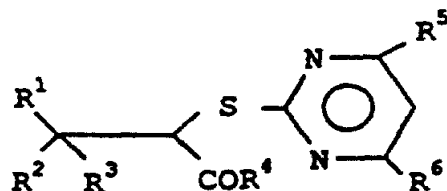
化合物号	R ²	R ³	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁴	物理性质
219	CH ₃	CH ₃	CN	OCH ₃	OCH ₃	OH	m.p. 104 ~ 106°C
220	"	"	"	"	"	OCH ₃	m.p. 100 ~ 101°C
221	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₅	m.p. 65 ~ 66°C
222	"	"	"	"	"	OC ₃ H _{7-n}	m.p. 63 ~ 64°C
223	"	"	"	"	"	OC ₃ H _{7-i}	m.p. 67 ~ 68°C
224	"	"	"	"	"	OCH ₂ CH=CH ₂	^{20.0} _D n _D 1.5268
225	"	"	"	"	"	OCH ₂ C≡CH	^{20.0} _D n _D 1.5243
226	"	"	"	"	"	OC ₄ H _{9-n}	^{20.0} _D n _D 1.5164

表 1 (续)



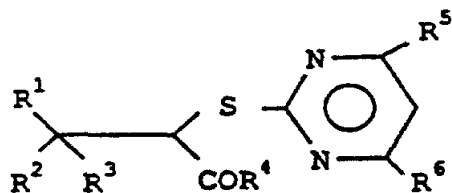
化合物号	R ²	R ³	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁴	物理性质
227	CH ₃	CH ₃	CN	OCH ₃	OCH ₃	OC ₄ H ₉ -i	
228	"	"	"	"	"	OC ₄ H ₉ -s	
229	"	"	"	"	"	OC ₄ H ₉ -t	m.p. 89 ~ 90°C
230	"	"	"	"	"	OC ₅ H ₉ -cyclo	n _D ^{20.0} 1.5206
231	"	"	"	"	"	OC ₆ H ₁₁ - cyclo	
232	"	"	"	"	"	O(2-C)- C ₆ H ₁₀ -cyclo	n _D ^{20.0} 1.5178
233	"	"	"	"	"	O-	n _D ^{20.0} 1.5457
234	"	"	"	"	"	OCH ₂ -	n _D ^{20.0} 1.5367
235	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₄ - Si(CH ₃) ₃	m.p. 88 ~ 89°C
236	"	"	"	"	"	SCH ₃	
237	"	"	"	"	"	SC ₂ H ₅	m.p. 81 ~ 83°C
238	"	"	"	"	"	SC ₃ H ₇ -n	
239	"	"	"	"	"	S-	m.p. 133 ~ 135°C
240	"	"	"	"	"	-	m.p. 122 ~ 124°C
241	"	"	"	"	"	NHSO ₂ CH ₃	m.p. 162 ~ 163°C
242	"	"	"	"	"	NHSO ₂ C ₂ H ₅	m.p. 153 ~ 154°C
243	"	"	"	"	"	NHSO ₂ -	m.p. 151 ~ 153°C
244	"	"	"	"	"	OCH ₂ OCH ₃	n _D ^{20.0} 1.5204

表 1 (续)



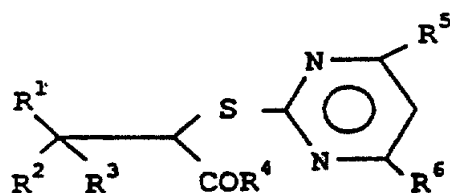
化合物号	R ²	R ³	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁴	物理性质
245	CH ₃	CH ₃	CN	OCH ₃	OCH ₃	OK	m.p. 88 ~ 90°C
246	"	"	"	"	"	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₃	n _D ^{20.0} 1.5049
247	"	"	"	"	"	OCH ₂ CF ₃	n _D ^{20.0} 1.5001
248	"	"	"	"	"	OCH ₂ C ₃ H ₅ -cyclo	m.p. 54 ~ 55°C
249	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₄ OCH ₃	n _D ^{20.0} 1.5133
250	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	n _D ^{20.0} 1.5100
251	"	"	"	"	"	OCH ₂ CH ₂ C'	n _D ^{20.0} 1.5266
252	C ₂ H ₅	"	"	"	"	OH	n _D ^{20.0} 1.5407
253	"	"	"	"	"	OCH ₃	m.p. 98 ~ 99°C
254	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₅	n _D ^{20.0} 1.5094
255	"	"	"	"	"	NHSO ₂ CH ₃	
256	"	"	"	"	"	SC ₂ H ₅	
257	"	"	"	"	"	OCH ₂ C≡CH	n _D ^{20.0} 1.5270
258	"	"	"	"	"	OCH ₂ CH=CH ₂	n _D ^{20.0} 1.5218
259	"	"	"	"	"	OCH ₂ OOC(CH ₃) ₃	
260	CH ₃	H		"	"	OH	
261	"	"	"	"	"	OCH ₃	
262	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₅	
263	"	"	"	"	"	SC ₂ H ₅	
264	"	"	"	"	"	NHSO ₂ CH ₃	

表 1 (续)



化合物号	R ²	R ³	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁴	物理性质
265	"	"	CN	"	"	OCH ₂ CF ₃	n _D ^{20.0} 1.4912
266	"	C ₂ H ₅	"	"	"	OC ₂ H ₅	m.p. 65 ~ 66°C
267	C ₃ H _{7-n}	CH ₃	"	"	"	"	n _D ^{20.0} 1.5084
268	C ₂ H ₅	"	"	"	"	OCH ₂ OCH ₃	n _D ^{20.0} 1.5171
269		"	"	"	"	OC ₂ H ₅	n _D ^{20.0} 1.5531
270	H	H	"	"	"	"	n _D ^{20.0} 1.5337
271	C ₃ H _{7-i}	CH ₃	"	"	"	"	n _D ^{20.0} 1.3476
272	CH ₃	"	"	"	"	OCH ₂ CF ₃	n _D ^{20.0} 1.5001
273	"	"	"	"	"	OCH ₂ 	m.p. 54 ~ 55°C
274	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	n _D ^{20.0} 1.5100
275	"	"	"	"	"	OC ₂ H ₄ OCH ₃	n _D ^{20.0} 1.5133
276	"	"	"	"	"	OCH ₂ CHF ₂	m.p. 99 ~ 100°C
277	"	"	"	"	"	OCH(CF ₃) ₂	m.p. 77 ~ 79°C

表 1 (续)






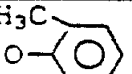
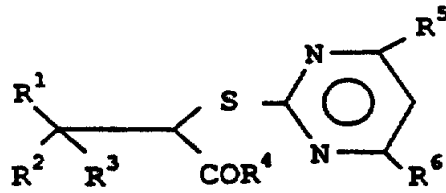
化合物号	R ²	R ³	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁴	物理性质
278	CH ₃	CH ₃	CN	OCH ₃	OCH ₃	OCH(CF ₃)C ₂ F ₅	n _D ^{20.0} 1.4700
279	"	"	"	"	"	OCH ₂ CH ₂ F	m.p. 75 ~ 76°C
280	"	"	"	"	"	OCH(CH ₂ F) ₂	m.p. 77 ~ 78°C
281	"	"	"	"	"	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	n _D ^{20.0} 1.4742
282	"	"	"	"	"	OCH ₂ OC ₂ H ₄ OCH ₃	n _D ^{20.0} 1.5172
283	"	"	"	"	"	OCH ₂ SCH ₃	n _D ^{20.0} 1.5242
284	"	"	"	"	"	OCH ₂ CN	n _D ^{20.0} 1.5253
285	"	"	"	"	"	OCH ₂ S- 	n _D ^{20.0} 1.5340
286	"	"	"	"	"	ON=C(CH ₃) ₂	n _D ^{20.0} 1.5282
287	"	"	"	"	"	OCH ₂ OC ₂ H ₅	n _D ^{20.0} 1.5076
288	"	"	"	"	"	OCH ₂ - 	n _D ^{20.0} 1.5466
289	"	"	"	"	"	OCH ₂ - 	n _D ^{20.0} 1.5446
290	"	"	"	"	"	OCH(CH ₃)CH=CH ₂	n _D ^{20.0} 1.5176
291	"	"	"	"	"	OCH ₂ C≡CCH ₃	n _D ^{20.0} 1.5320
292	"	"	"	"	"	OCH ₂ CH ₂ C≡CH	n _D ^{20.0} 1.5264
293	"	"	"	"	"	OCH(CH ₃)C≡CH	n _D ^{20.0} 1.5247
294	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.5502

表 1 (續)



化合物号	R ²	R ³	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁴	物理性質
295	CH ₃	CH ₃	CN	OCH ₃	OCH ₃		n _D ^{20.0} 1.5488
296	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.5492
297	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.4008
298	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.3994
299	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.5524
300	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.5149
301	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.5569
302	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.5382
303	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.4770
304	"	"	"	"	"		n _D ^{20.0} 1.5720
305	"	"	"	"	"	OCH(COOC ₂ H ₅) ₂	n _D ^{20.0} 1.3534
306	CF ₃	"	"	"	"	OC ₂ H ₅	m.p. 82 ~ 84°C

实例 2

(1) 制备颗粒剂

使 8 份重量的化合物 5 与 3 0 份重量的膨润土、5 9 份重量的滑石、1 份重量的Neopelex粉（商品名，由Kao K.K.生产）和 2 份重量的木素磺酸钠一起均匀地混合，然后将混合物与加入的少量水一起混合成团，接着制粒和干燥，得到颗粒剂。

(2) 制备可湿性粉剂

使 5 0 份重量化合物 7 与 4 6 份重量高岭土、2 份重量Neopelex粉（商品名，Kao K.K.生产）和 2 份重量Demol N（商品名，由Kao K.K.生产）均匀地混合，然后使混合物粉碎成粉末，得到可湿性粉剂。

(3) 制备乳化剂

将 3 0 份重量化合物 1 2 加到 6 0 份重量二甲苯、5 份重量二甲基甲酰胺和 5 份重量Sorpul 3005X（商品名，由Toho Kagaku Kogyo生产）中，并均匀地混合使其溶解，得到乳化剂。

(4) 制备粉剂

将 5 份重量化合物 2 4 与 5 0 份重量滑石和 4 5 份重量粘土均匀地混合，得到粉剂。

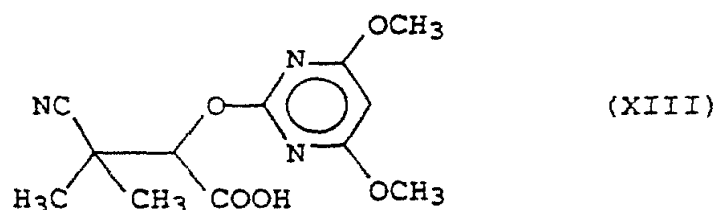
实例 3

(1) 稻田除草试验

用Ube土壤（冲积土）装填Wagner罐，每个罐的面积为 1 / 5000 公亩，并且播种杂草（稗、蔗草和沙草）种子或植入块茎。然后使罐子充有水，其深度为 3 厘米。

将按照实例 2 制得的表 1 中各所需化合物（I）的可湿性粉剂用水稀释，用吸管逐滴施药，在稗的一叶阶段施用的各个除草剂中化合物

(I) 的有效浓度为 2 0 克 / 公亩。将上述植物置于平均温度为 2 5 ℃ 的温室中 3 周, 然后考察其除草效果。用日本临时专利公开说明书 No. 8 5 2 6 2 / 1 9 9 0 中公开的化合物 No. 1 5 5 (下式 XIII) 作为对比化合物, 其配制方法同以上所述,



按照 6 个等级评价除草效果, 结果与未经处理的区域相比较, 0 : 无效 (正常生长), 1 : 很少杀伤, 2 : 稍有杀伤, 3 : 中等杀伤, 4 : 严重杀伤, 5 : 全部杀死。

结果见表 2 。

表 2

化合物	杂草种类			化合物	杂草种类		
	稗	蔗草	沙草		稗	蔗草	沙草
5	5	5	4	76	4	5	
7	5	5	5	77	5	5	5
12	5	5	5	81	5	5	5
14	5	5	5	83	5	5	3
15	5	5	3	84	5	5	5
16	5	5	3	89	5	5	2
22	5	5	4	90	5	5	5
23	5	5	5	92	5	5	5
28	5	5	3	93	5	5	2
29	5	5	5	94		3	
41	5	5	5	95	4	4	
45	5	5	4	96	2	4	
46	4	3		99	5	5	3
47	5	5	5	100	5	5	4
48	5	4		101		5	3
49	3	5	4	104	2	5	4
50	5	5	5	108	2	4	3
51	3	2	2	110	4	5	3
53	5	5	4	112	4	5	3
55	5	5	4	114	2	5	2
57	5	5	4	116	5	5	3
63		5		117	3	5	2
65	5	5	3	118	5	5	5
67	5	4		119	4	5	2
68	5	5	5	123	5	5	5
69	5	5	4	125	5	5	3
70	4	5		128	4	5	3
72	5	5	2	130	5	5	5
73	5	5	2	131	4	5	3

表2 (续)

化合物	杂草种类			化合物	杂草种类		
	稗	蔗草	沙草		稗	蔗草	沙草
134	5	5	3	275	5	5	3
135	5	5	3	276	5	5	4
136	4	5	3	277	5	5	4
138	4	5	3	278	5	5	4
144	3	3	3	279	5	5	4
147	4	5	0	280	5	5	5
148	5	5	4	281	5	5	4
156	5	5	4	282	5	5	5
157	5	5	3	283	5	5	2
219	5	5	4	284	2	5	
220	5	5	3	285	2	5	
221	5	5	5	286	5	5	3
229	5	5		287	5	5	5
240	5	5	5	288	5	5	4
241	5	5	5	289	5	5	
242	5	5	3	290	5	4	
243		5		291	4	4	2
244	5	5	5	292	4	3	
253	5	5	5	293	5	5	4
265	5	5	4	294	5	5	4
266	5	5		295	4	5	3
267	5	5		296	5	5	3
268	5	5	3	297	5	5	5
269				298	4	5	2
270		5		299	5	5	4
271	5	4	2	300	5	5	3
272	5	5	5	301	4	5	2
273	5	5	3	302	5	5	4
274	5	5	2	303	2	5	

表2 (续)

化合物	杂草种类			化合物	杂草种类		
	稗	蔗草	沙草		稗	蔗草	沙草
304	5	5	3	199		5	5
305	5	5	4	204			
306	5	5	5	205	2	5	
196	5	5	4	206	3	5	2
197	5	5	5	207		5	
198	4	3		(XIII)	3	2	1

(2) 旱田的土壤处理试验

用Ube土壤（冲积土）装填Wagner罐，每个罐的面积为1 / 5000公亩，然后播种棉花、大豆、蟋蟀草、稗绒毛草、藜、苋、圆叶牵牛、苍耳和狗尾草的种子，并用土壤复盖。

将按照实例2制得的表1中各所需化合物（I）的可湿性粉剂用水稀释并均匀地喷洒在各罐土壤表面，使各除草剂中化合物（I）的有效浓度为20克 / 公亩。将上述植物置于平均温度为25℃的温室中3周，然后考察其除草效果。

按照稻田除草试验(1)所述评价方法评价除草效果，本试验结果和(1)中应用的对比药物的结果列于表3。

表 3

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
7	1		4	4	5	5	5	4	
8	0		4	5	5	5	4	3	
12	0		5	4	5	5	4	4	
14	0		5	5	5	5	5	4	
22	1		5	5	4	5	5	4	
23	0		5	4	4	5	5	3	
29	0		4	5	3	5	5	4	
41	0		5	5	5	5	5	4	3
45	0		5	5	3	2		3	4
47	0		5	4	5	5		4	2
48	2		5	5	5	4	2	4	5
49	0		4	4	5	5	3	4	5
50			5	5	5	5	4	5	4
51			5	5	5	5	4	5	4
53	0		5	5		4	4	4	
55			4	4		4	4	5	
57	0		5	5	5	4	4	4	2
65			5	5	5	5	3	5	3

表 3(续)

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
67	2		5	4	2	3	3	4	3
68			5	5	5	5	5	4	4
69	0		5	5	5	5	3	4	3
70			5	5	5	4	4	5	5
71			4	3	5	5	3	5	5
72	0		3	3	5	4	3	5	4
76			5	5	3	5	5	3	3
81	0		5	5	5	5	5	3	3
82	0	2	5	5	5	4	4	4	2
83	0	0	5	4	3	3	4	4	3
84	1	1	5	5	4	4	5	4	3
89	0		4	4	4	4	2	4	5
90	0		4	5	4	3	4		
92			5	5	3	5	5		4
93	0	0	5	5	5	4	4	5	4
95	2		5	5	5	4	3	3	4
96	0		4		2	3	2	5	
99			5	5		4		5	3

表 3(续)

化合物	作物		杂草种类							
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳	
	100	2		5	5	5	5	5	4	
101			5		2	4	5	4	5	
102	0	0				2		2	5	
103	2	2						4	3	
116	2		4	4	5	4	4	4		
117			3		4	4	4	4	5	
118	0	0	4	5	3	4	4	5		
129	1		5	3	3	4	2	4	5	
130	2		5	4	5	5	5	4	3	
131	0	1	4	5	4			4	5	
132	1		4	5	4	5	5	5	5	
134	0		5	5	5	5	5	5		
136			5	5	4	5	5	4	5	
138	0		5	5	4	3	2	4	3	

表 3(续)

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	狗尾草	绒毛草	苋	圆叶牵牛	苍耳
144				4	5	5	5		
147				5	5	5	5		
148				5	5	5	5		
156				5	5	4	5		
157				5	5	5	5		

表 3(续)

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
219				5	5	5	5		
220				4	5	5	5		
221				5	5	5	5		
225				5	5	5	5		
229	0	0							
234				5	5	5	5		
240				4	4	4	4		
241				4	3	4	4		
242	1		4	4	5	4	2	5	4

表 3(续)

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
243	0	0							
244	2		5	5	4	5	4	5	4
245				4	4	5	5		
246				3	3	4	4		
253	1	2	5	5	4	4	4	4	5
265	1	1	2		2	4	4	2	
266	0	0	2		2			3	2
267	2		4	5	4	5	3	4	5
268	1	0	2	3	2		2		3
269	0	0		2					2
270	0	0							
271	0	0							
272	1		5	5	4	3	5	5	4
273	0	1	5	4	4	2		2	
274	2		5	4	4	2	2	3	2
275	0		5	5	3		2	3	3
276	0				3	2		2	
277	0	0	5	5	5	4	5	4	4
278	0	0							

表 3(续)

化合物	作物		杂草种类							
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	铁毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳	
279	0	2	5	5	5	4	4	3	4	
280	0	0	3	4	3	2		3	2	
281	0	0	4	3	2				2	
282	0	0	3		2	3	2	2	3	
283	0	0	2				2	2	3	
284	0	0					2	3	2	
285										
286	0	2	3		2	4	4	4	3	
287	1		2	4	3	4	3	3	2	
288	0	0	2	2			2	3	2	
289	0			2		2				
290	0	0								
291	0		2	4	2	2	4	3	3	
292	0		2	2	3	3	4	3	2	
293	2		4	4	3	5	4	3	2	
294	1		5	5	4	4	5	5		
295	0	2	3	5	4	4	4	5	3	
296	0	0	4	5	5	5	4	3	3	
297	0	2	5	4	4	4	2	2	3	

表 3(续)

化合物	作物		杂草种类							
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	荩毛草	藜	莠	圆叶牵牛	苍耳	
298	2		5	5	5	4	4	5	3	
299	1	0	2		3	3	3	3	2	
300	0	0	2		4	4	4	4		
301	0	0			2			2		
302	0	2	4	4	4	3	4	2	2	
303	1	0			2				3	
304	0	0					2			
305	0	1					2			
306	0	2	2	4	4	5	5	4		
196	0	1		2		2	2	2	2	
197			5	5	5	5	5	2		
198	0	0		2		2	2			
199										
204										
205										
206										
207										
(XIII)				3	2	3	3	3		

(3) 旱田叶子的喷雾试验

用火山灰土装填 Wanger 罐，每个罐的面积为 1 / 5 0 0 0 公亩，然后播种蟋蟀草、稗、绒毛草、藜、苋、圆叶牵牛、苍耳、狗尾草、棉花和大豆的种子，并用土壤复盖，让其生长二周。

将按照实例 2 制得的表 1 中各所需化合物 (I) 的可湿性粉剂用水稀释到浓度为 2 0 0 0 ppm，并且其中含有 5 0 0 ppm 展着剂 Neoesterin (商品名，由 Kumiai Kagaku 公司生产)，然后均匀地喷雾到上述各植物上。将上述植物置于平均温度为 2 5 ℃ 的温室中 3 周后，评价其除草效果。

按照稻田除草试验 (I) 所述评价方法评价其除草效果，本试验结果和 (I) 中应用的对比药物的结果列于表 4。

表 4

化合物	杂草种类						
	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
5	5	5	5	5	5	3	
6	5	5	5	5	5	3	
7	5	5	5	5	5	4	
12	5	5	5	5	5	5	
14	4	5	5	5	5	4	
15	5	5	5	5	5	3	
16	5	4	5	5	5	5	
22	4	5	4	5	5	4	

表 4(续)

化合物	杂草种类						
	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
23	4	5	5	5	5	3	
28	5	5	5	5	5	5	
29	4	5	5	5	5	3	
31	5	5	5	5	5	5	
41	5	5	5	5	5	5	5
45	5	5	5	5	5	4	5
46	4	4	3	4	4	4	5
47	5	5	5	5	5	5	5
48	5	5	5	5	5	5	5
49	4	5	5	5	5	5	5
50	4	5	5	5	5	5	5
51	5	5	5	4	3	5	5
53	4	5				5	5
55	3	5		4	4	5	5
57	5	5	5	5	5	5	5
65	3	4	5	2		5	5
67	5	5	5	5	5	5	5
68	5	5	5	5	5	5	5
69	5	5	5	5	5	4	5
70	5	4	5	5	5	5	5
71	3	3	4	5	5	5	5
72	4	4	4	5	5	5	5
73	4	5	5	5	5	5	5
74			3	4	4	5	5
75			5	3	4	3	5
76	5	5	5	5	5	5	5
77	2	2	5	2	2	5	5
78	2	3	4	4	4	5	5
81	5	4	5	5	5	5	5

表 4(续)

化合物	杂草种类						
	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
82	5	4	5	5	5	4	5
83	4	4	5	5	5	4	5
84	4	4	5	5	5	5	5
89	5	5	5	5	5	5	5
90	5	5	5	5	5	5	5
92	5	5	5	5	5	5	5
93	5	5	5	5	5	5	5
94	3	4	5	4	4	4	5
95	5	5	4	5	5	5	5
96	3		4	3	3	5	5
99	3	3	5	3	3	5	5
100	5	3		3	3	5	5
101						5	5
102			5		5	5	5
103						5	5
104			5			5	5
106						5	5
108			4			4	5
110			4			5	5
111			4			5	5
112						5	5
113						4	5
116						5	5
117	2	3				5	5
118		3				5	5
119	4	4	4			5	5
120		2		5		5	3
121						5	5
122			3			5	5

表 4(续)

化合物	杂草种类						
	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	阔叶牵牛	苍耳
123			5			5	5
125			4			5	5
128			3			5	3
129	4	5	5	2	3	5	5
130		4				5	5
131	5	5			3	5	5
132			5		3	5	5
133		2	3	3		5	5
134	5	4	5	3	4	5	5
135	3	5	5			5	5
136	3	3	4	3		5	5
138	3	4	5	5	5	4	5
139	3	2	5			5	5
140			5			5	5

表 4(续)

化合物	杂草种类				
	稗	狗尾草	绒毛草	藜	苋
144	5	5	5	5	5
147	5	5	4	5	5
148	5	5	5	5	5
156	5	5	5	5	5
157	5	5	5	5	5
160	3	3	5	4	4

表 4(续)

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
219				5	5	5	5		5
220				5	5	5	5		5
221				5	5	5	5		5
224				5	5	5	5		4
226				5	5	5	5		5
229	2	1		2		2	2	2	
230				4	5	5	5		5
233				4	5	5	5		4
234				4	5	5	5		5
239				4	5	5	5		5
240				5	5	5	5		4
241				4	5	5	5		4
242	1		2		5	2	3	5	5
243	0			2	3	2		4	5
244			4	5	5	5	5	5	5
245				5	5	5	5		5
246				5	5	5	5		5
252				3	5	5	5		4

表 4(续)

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
253			5	5	5	4	4	5	5
254				5	5	5	5		5
265			2		5	3	2	5	5
266	1	2		2	2		2		
267	0	2		2					
268			4	4	5	5	5	5	5
269	0	0			2				
270	0	0							
271	1	2				2		3	3
272			4	5	5	5	5	5	5
273	2		3	5	5	5	5	5	5
274			2	4	5	5	5	5	5
275	1		4	5	5	3	2	5	5
276	2		3	5	4	2		5	5
277	0				5			5	5
278	0		4	4	5	3	3	5	3
279			5	5	4	4	4	5	5
280	2		2	2	5	3	3	4	5

表 4(续)

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
281			3	4	5	3	2	5	5
282			3	5	5	5	5	5	5
283			3	4	5	2	3	4	3
284	2		3	2	4	2		5	5
285									
286	2		2	3	5	2	3	5	5
287			3	3	5	4	4	5	5
288	2		2	4	5	2		5	4
289	0		2	5	5	3	3	5	5
290	0	2	4	5	4	2	3	5	5
291	2		5	4	5	5	5	5	5
292	2		3	5	5	5	5	5	5
293			5	5	5	5	5	5	5
294	0		3	5	5	5	3	5	4
295	2		3	5	5	5	5	5	5
296	2		3	4	4	3	5	5	5
297	2		3	5	5	5	5	5	5
298	1		4	5	5	5	5	5	5

表 4(续)

化合物	作物		杂草种类						
	棉花	大豆	蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	圆叶牵牛	苍耳
299			5	5	5	5	5	5	5
300	2		2	4	4	4	4	5	5
301	2		2	5	5	5	5	5	5
302			2	3	5	5	5	5	5
303	2		2	3	4	2		4	4
304	0	2			2	3		4	3
305	0		2	4	4	2	3	5	4
306	0	2			2		3	5	3
196	0		2	5	4	2	4	3	3
197			4	5	5	5	5	5	5
198	1				3		2	4	4
199	1		5	5	5	4	4	5	5
200									
205									
206									
207									
(XIII)				3	2	3	3	3	2

(4) 在低浓度下对旱田叶的喷雾试验

用火山灰土壤装填Wanger罐，每个罐的面积为1 / 5 0 0 0 公亩，然后播种棉花、蟋蟀草、稗、绒毛草、藜、苋和阔叶牵牛的种子，并用土壤复盖，让其生长2周。

将按照实例2制得的表1中各所需化合物(I)的可湿性粉剂用水稀释到浓度为1 2 5 ppm，并且其中含有5 0 0 ppm展着剂Neosterin(商品名，由Kumiai Kagaku公司生产)，然后均匀地喷雾到上述各植物上。将上述植物置于平均温度为2 5 ℃的温室中3周后，评价其除草效果。

按照旱田除草试验(I)所述评价方法评价除草效果，结果列于表5。

表 5

化合物	棉花	杂草种类					
		蟋蟀草	稗	绒毛草	藜	苋	阔叶牵牛
41	0	4	5	4	5	5	2
45	1	5	4	4	5	5	2
47	1	4	5	5	5	5	5
57	0	4	4	5	4	4	4
89	1	4	4	5	5	5	4
90	0	4	3	5	5	5	4

本发明新的3-烷氧基链烷酸衍生物对于一年生和多年生杂草具有很好的选择性，并且还显示出良好的除草效果，对于一年生杂草和阔叶杂草尤其有效。