

[19]中华人民共和国国家知识产权局

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

C07D251/18

C07D407/12 C07D413/12

C07D417/12 C07D403/12

A01N 43/68 C07C279/26

# [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 99807435.7

[43]公开日 2002年10月23日

[11]公开号 CN 1376149A

[22]申请日 1999.6.2 [21]申请号 99807435.7

[30]优先权

[32]1998.6.16 [33]DE [31]19826670.7

[86]国际申请 PCT/EP99/03817 1999.6.2

[87]国际公布 WO99/65882 德 1999.12.23

[85]进入国家阶段日期 2000.12.15

[71]申请人 阿温提斯作物科学有限公司

地址 德国法兰克福

[72]发明人 W·金克 K·敏恩 L·威尔姆斯

T·奥勒 H·比林格

C·罗辛格

[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所

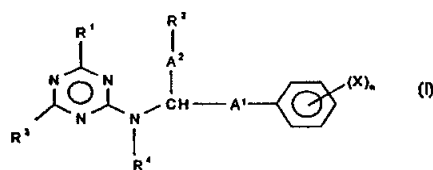
代理人 黄泽雄

权利要求书/4页 说明书73页 附图页数0页

[54]发明名称 2,4-二氨基-1,3,5-三嗪类,其制法及其作为除草剂及植物生长调节剂的用途

[57]摘要

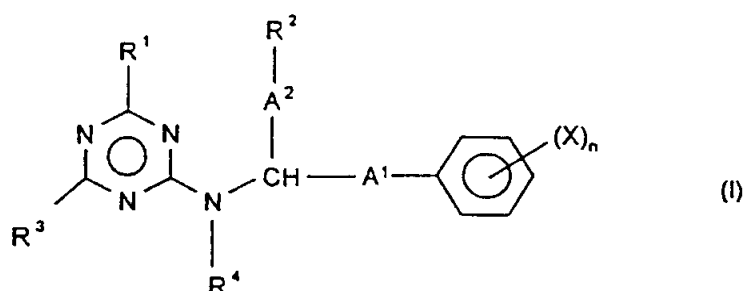
式(I)化合物及其盐类,其中R<sup>1</sup>,R<sup>2</sup>,R<sup>3</sup>,R<sup>4</sup>,A<sup>1</sup>,A<sup>2</sup>,X及n具有如权利要求1中给定的定义,其适合作为除草剂及植物生长调节剂。式(I)化合物可以如权利要求7所述的方法、经由一些新颖的中间体如式(III)及(V)制备。



ISSN 1008-4274

# 权 利 要 求 书

## 1. 式(I)化合物或其盐类



其中

$R^1$  为未取代或经取代的芳基、或未取代或经取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、或经取代或未取代的杂环基、或(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)烯基、或(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)炔基, 上述 3 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氰基、硝基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基亚磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基亚磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基、及未取代或经取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、未取代或经取代的苯基、未取代或经取代的杂环基、及式  $R'-C(=Z')-$ ,  $R'-C(=Z')-Z-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-$ ,  $R'R''N-C(=Z')-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-O-$ ,  $R'R''N-C(=Z')-Z-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-NR''-$  及  $R'R''N-C(=Z')-NR'''-$  基团, 其中  $R'$ ,  $R''$  及  $R'''$  分别独立为(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、芳基、芳基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基, 上述 5 个基团的每一基团未取代或经取代, 且其中  $Z$  及  $Z'$  分别独立为氧或硫原子,

$R^2$  为未取代或经取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、未取代或经取代的(C<sub>4</sub>-C<sub>9</sub>)环烯基、未取代或经取代的杂环基、或未取代或经取代的苯基,

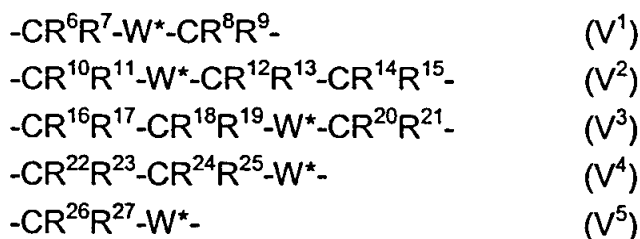
$R^3$  或为氢、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、芳基或(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基, 上述 3 个基团

的每一基团为未取代或经取代，或为式  $-N(B^1-D^1)(B^2-D^2)$  或  $-NR'-N(B^1-D^1)(B^2-D^2)$  基团，其中  $B^1$ ， $B^2$ ， $D^1$  及  $D^2$  分别如下面所定义，及  $R'$ =氢、 $(C_1-C_6)$ 烷基或  $[(C_1-C_4)$ 烷基] 羰基，

$R^4$  为式  $-B^3-D^3$  基团， $B^3$  及  $D^3$  如下定义，

$A^1$  为具有 1 至 5 个碳原子的直链烷撑基或直链的烯撑基或炔撑基，其每一基团有 2 至 5 个碳原子，上述 3 个两价基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、氰硫基及式  $-B^4-D^4$  基团， $B^4$  及  $D^4$  如下定义，

$A^2$  为一个直接的键或具有 1 至 4 个碳原子的直链烷撑基或直链的烯撑基或炔撑基，其每一基团有 2 至 5 个碳原子，上述 3 个两价基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、氰硫基及式  $-B^5-D^5$  基团，或式  $V^1$ ， $V^2$ ， $V^3$ ， $V^4$  或  $V^5$  之两价基团，



， $R^6$  至  $R^{27}$  的每一基团分别独立为氢、卤素、硝基、氰基、氰硫基或式  $-B^6-D^6$ ，

$W^*$  为氧原子、硫原子或式  $N(B^7-D^7)$  及

$B^5$ ， $B^6$ ， $B^7$ ， $D^5$ ， $D^6$  及  $D^7$  为如下定义，

$B^1$ ， $B^2$ ， $B^3$  及  $B^7$  在每一案例中分别独立为一个直接的键或式  $-C(=Z^*)-$ ， $-C(=Z^*)-Z^{**}-$ ， $-C(=Z^*)-NH-$  或  $-C(=Z^*)-NR^*-$  之两价基团， $Z^*$  为一个氧或硫原子， $Z^{**}$  为一个氧或硫原子， $R^*$  为  $(C_1-C_6)$ 烷基、芳基、芳基- $(C_1-C_6)$ 烷基、 $(C_3-C_9)$ 环烷基或  $(C_3-C_9)$ 环烷

基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经取代,

B<sup>4</sup>, B<sup>5</sup> 及 B<sup>6</sup> 分别独立为一个直接的键或式 -O-, -S(O)<sub>p</sub>-, -S(O)<sub>p</sub>-O-, -O-S(O)<sub>p</sub>-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -S-CO-, -CO-S-, -S-CS-, -CS-S-, -O-CO-O-, -NR<sup>0</sup>-, -O-NR<sup>0</sup>-, -NR<sup>0</sup>-O-, -NR<sup>0</sup>-CO-, -CO-NR<sup>0</sup>-, -O-CO-NR<sup>0</sup>- 或 -NR<sup>0</sup>-CO-O- 之两价基团, p 为整数 0、1 或 2, 及 R<sup>0</sup> 为氢、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、芳基、芳基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经取代,

D<sup>1</sup>, D<sup>2</sup>, D<sup>3</sup>, D<sup>4</sup>, D<sup>5</sup> 及 D<sup>6</sup> 分别独立为氢、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、芳基、芳基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经取代,

或两个 D<sup>5</sup> 基团被键结至一个碳原子上的两个 -B<sup>5</sup>-D<sup>5</sup> 基团相互连结且形成具有 2 至 4 个碳原子的烷撑基, 此烷撑基为未取代或经一个或多个选自(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基的取代基所取代,

(X)<sub>n</sub> 为 n 个取代基 X, 其中 X 分别独立为卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、氨基羰基或(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)炔基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷氧基]羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷酰基氨基或 N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷酰基-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基,

上述 13 个基团的每一基团为未取代或经取代, 较佳地未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基氨基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基]羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环

基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基，

上述 8 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、甲酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基，

或为(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷氧基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基氨基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基，

上述 11 个基团的每一基团为未取代或经取代，

或两个相邻 X 基团一起为一稠合环，其具有 4 至 6 个环原子，及为碳环或包含选自 O、S 及 N 的杂环原子，及其为未取代或经一个或多个选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及氧代基的取代基所取代，

n 为 0、1、3、4 或 5，及

在上述基团中的杂环基分别独立为具有 3 至 7 个环原子及 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的杂原子的杂环，其中

(a)在 A<sup>1</sup> 及 A<sup>2</sup>-R<sup>2</sup> 中的总碳数至少为 6 个碳原子或

(b)在 A<sup>1</sup> 及 A<sup>2</sup>-R<sup>2</sup> 中的总碳数为 5 个碳原子及 A<sup>1</sup> 为式 -CH<sub>2</sub>- 或 -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- 及 R<sup>1</sup> 为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)卤代烯基或(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基，其为未取代或经取代。

2. 如权利要求 1 的式(I)化合物或其盐类，其中

R<sup>1</sup> 为未取代或经一个或多个取代基所取代的苯基，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基]羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，

或

为未取代或经一个或多个取代基所取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基及二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基,

或

为未取代或经一个或多个取代基所取代的杂环基, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基, 或

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)烯基, 或(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)炔基, 上述 3 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氰基、硝基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基亚磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基亚磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基及未取代或经一个或多个取代基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基及二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基, 及苯基及杂环基, 上述 2 个基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基-羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基, 式  $R'-C(=Z')$ 、 $R'-C(=Z'-Z-$ 、 $R'-Z-$

$C(=Z')-$ ,  $R'R''N-C(=Z')-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-O-$ ,  $R'R''N-C(=Z')-Z-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-NR''-$  及  $R'R''N-C(=Z')-NR'''-$  基团, 其中  $R'$ ,  $R''$  及  $R'''$  分别独立为  $(C_1-C_4)$  烷基、苯基、苯基- $(C_1-C_4)$  烷基、 $(C_3-C_6)$  环烷基或  $(C_3-C_6)$  环烷基- $(C_1-C_4)$  烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$  烷氧基、 $(C_1-C_4)$  烷硫基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷硫基、单  $(C_1-C_4)$  烷基氨基、二  $(C_1-C_4)$  烷基氨基、 $(C_2-C_4)$  烯基、 $(C_2-C_4)$  炔基、 $(C_3-C_6)$  环烷基及在环状基团的情况下亦为  $(C_1-C_4)$  烷基及  $(C_1-C_4)$  卤代烷基, 其中  $Z$  及  $Z'$  分别独立为氧或硫原子。

3. 如权利要求 1 或 2 的式(I)化合物或其盐类,

其中

$R^2$  为未取代或经一个或多个取代基取代的  $(C_3-C_9)$  环烷基, 该取代基选自 A), B), C) 及 D) 组,

其中

A 组) 为卤素、羟基、氨基、甲酰基、羧基、氨基羧基、磺基、氰基、氰硫基及氧代基,

B 组) 为  $(C_1-C_6)$  烷基、 $(C_1-C_6)$  烷氧基、 $(C_1-C_6)$  烷硫基、单  $(C_1-C_6)$  烷基氨基、二  $(C_1-C_4)$  烷基氨基、 $(C_2-C_6)$  烯基、 $(C_2-C_6)$  炔基、 $(C_3-C_9)$  环烷基、 $(C_4-C_9)$  环烯基、 $(C_1-C_6)$  烷叉基、 $(C_4-C_9)$  环烷叉基、 $R'-C(=Z')-$ ,  $R'-C(=Z')-Z-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-$ ,  $R'R''N-C(=Z')-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-O-$ ,  $R'R''N-C(=Z')-Z-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-NR''-$  及  $R'R''N-C(=Z')-NR'''-$  基团, 其中  $R'$ ,  $R''$  及  $R'''$  分别独立为  $(C_1-C_6)$  烷基、苯基、苯基- $(C_1-C_6)$  烷基、 $(C_3-C_9)$  环烷基或  $(C_3-C_9)$  环烷基- $(C_1-C_6)$  烷基,  $Z$  及  $Z'$  分别独立为氧或硫原子,

C 组) 为如 B 组) 所示基团, 但每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$  烷氧基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷氧基、 $(C_1-$

C<sub>4</sub>)烷基硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、(C<sub>4</sub>-C<sub>9</sub>)环烷撑基、(C<sub>4</sub>-C<sub>9</sub>)环烷叉基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基，上述 21 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、甲酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基，及在环状基团中亦为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷叉基，

在环状基团中，亦为(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)卤代烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷叉基，及

D 组)为有 1 至 6 个碳原子、较佳为 1 至 4 个碳原子的两价或三价脂肪族桥，

在两价桥的情况下，其连结环架上两个碳原子，在三价桥的情况下，其连结环架上三个碳原子，因此 R<sup>2</sup> 基团代表双环或三环基团，每一个桥为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、甲酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基及氧代基，或

为未取代或经一个或多个取代基取代的(C<sub>4</sub>-C<sub>9</sub>)环烯基，该取代基选自 A)，B)，C)及 D)组，其定义如 R<sup>2</sup>=(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基时所定义，

或

为未取代或经一个或多个取代基取代的杂环基，该取代基选自 A)，B)，C)及 D)组，其定义如 R<sup>2</sup>=(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基时所定义，

或

为未取代或经一个或多个取代基取代的苯基，该取代基选自 A)，B)及 C)组，其定义如 R<sup>2</sup>=(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基时所定义。

4. 如权利要求 1-3 之一的式(I)化合物或其盐类，



其中

$R^3$  为氢、未取代或经一个或多个取代基取代的 $(C_1-C_4)$ 烷基, 取代基选自卤素、羟基、氨基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷硫基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基及二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基, 或苯基或 $(C_3-C_6)$ 环烷基, 上述 2 个基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$ 烷基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷硫基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、 $(C_3-C_9)$ 环烷基、 $[(C_1-C_4)$ 烷基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰基、氨基羰基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基-羰基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基、 $(C_1-C_4)$ 烷基磺酰基、及 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基磺酰基, 或式  $N(B^1-D^1)(B^2-D^2)$  基团,

$R^4$  为式  $-B^3-D^3$  基团,

$A^1$  为含 1 至 5 个碳原子的直链烷撑基或含 2 至 5 个碳原子的烯撑基或炔撑基, 上述 3 个两价基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、硝基、氰基、氰硫基及式  $-B^4-D^4$  基团,

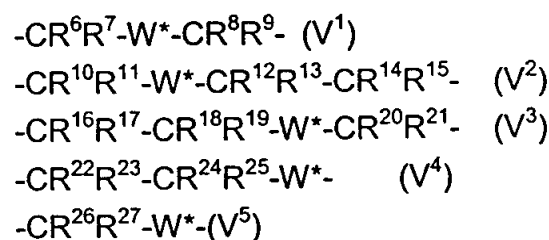
$B^4$  为一个直接的键或为式  $-O-$ ,  $-SO_2-$ ,  $-CO-$ ,  $-O-CO-$ ,  $-NR^0-$ ,  $-NR^0-CO-$ ,  $-CO-NR^0-$ ,  $-CO-NR^0-$  或  $-NR^0-CO-O-$  所示的两价基团,

其中

$R^0$  及  $D^4$  分别独立为氢、 $(C_1-C_4)$ 烷基、苯基、苯基- $(C_1-C_4)$ 烷基、 $(C_3-C_6)$ 环烷基或 $(C_3-C_6)$ 环烷基- $(C_1-C_4)$ 烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷硫基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、 $(C_3-C_9)$ 环烷基、 $[(C_1-C_4)$ 烷基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰基、氨基羰基、单 $(C_1-C_4)$ 烷

基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，及在环状基团的情况下亦为(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基所取代，

A<sup>2</sup> 为一个直接的键或为式 —CH<sub>2</sub>—，—CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>—，—CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>—或—CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>—，上述 4 个两价基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、氰硫基及式—B<sup>5</sup>—D<sup>5</sup>—基团，或式 V<sup>1</sup>，V<sup>2</sup>，V<sup>3</sup>，V<sup>4</sup> 或 V<sup>5</sup> 之两价基团



其中 R<sup>6</sup> 至 R<sup>27</sup> 的每一基团分别独立为氢、卤素、硝基、氰基、氰硫基或式—B<sup>6</sup>—D<sup>6</sup>基团，

W<sup>\*</sup>为氧原子、硫原子或式 N(B<sup>7</sup>—D<sup>7</sup>)，

B<sup>1</sup>，B<sup>2</sup>，B<sup>3</sup> 及 B<sup>7</sup> 分别独立为一个直接的键或为式—C(=Z<sup>\*</sup>)—，—C(=Z<sup>\*</sup>)—Z<sup>\*\*</sup>—，—C(=Z<sup>\*</sup>)—NH—或—C(=Z<sup>\*</sup>)—NR<sup>\*</sup>—之两价基团，Z<sup>\*</sup>=O 或 S，Z<sup>\*\*</sup>=O 或 S 及 R<sup>\*</sup>=(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基、苯基、苯基—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基，上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，在环状基团的情况下亦为(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)

卤代烷基取代;

$B^4, B^5$  及  $B^6$  分别独立地为一个直接的键或式  $-O-$ ,  $-S(O)_p-$ ,  $-S(O)_p-O-$ ,  $-O-S(O)_p-$ ,  $-CO-$ ,  $-O-CO-$ ,  $-CO-O-$ ,  $-S-CO-$ ,  $-CO-S-$ ,  $-S-CS-$ ,  $-CS-S-$ ,  $-O-CO-O-$ ,  $-NR^0-$ ,  $-O-NR^0-$ ,  $-NR^0-O-$ ,  $-NR^0-CO-$ ,  $-CO-NR^0-$ ,  $-O-CO-NR^0-$  或  $-NR^0-CO-O-$  之两价基团,  $p$  为整数 0、1 或 2, 及  $R^0$ =氢、 $(C_1-C_4)$ 烷基、苯基、苯基- $(C_1-C_4)$ 烷基、 $(C_3-C_6)$ 环烷基或 $(C_3-C_6)$ 环烷基- $(C_1-C_6)$ 烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷硫基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、 $(C_3-C_9)$ 环烷基、〔 $(C_1-C_4)$ 烷基〕羰基、〔 $(C_1-C_4)$ 烷氧基〕羰基、氨基羰基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基、 $(C_1-C_4)$ 烷基磺酰基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基磺酰基, 及在环状基团的情况下亦为 $(C_1-C_4)$ 烷基及 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基取代,

$D^1, D^2, D^3, D^4, D^5$  及  $D^6$  分别独立为氢、 $(C_1-C_6)$ 烷基、苯基、苯基- $(C_1-C_4)$ 烷基、 $(C_3-C_6)$ 环烷基或 $(C_3-C_6)$ 环烷基- $(C_1-C_6)$ 烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷硫基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、 $(C_3-C_9)$ 环烷基、〔 $(C_1-C_4)$ 烷基〕羰基、〔 $(C_1-C_4)$ 烷氧基〕羰基、氨基羰基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基、 $(C_1-C_4)$ 烷基磺酰基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基磺酰基, 及在环状基团的情况下亦为 $(C_1-C_4)$ 烷基及 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基取代;

$(X)_n$  为  $n$  个取代基  $X$ , 其中  $X$  分别独立地为卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、氨基羰基或 $(C_1-C_4)$ 烷基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基

基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)炔基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷酰基氨基或 N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷酰基-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基，

上述 13 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基氨基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基，

上述 8 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、甲酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基，

或为(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基，

上述 9 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基，

或两个相邻 X 基团一起为一稠合环，其具有 4 至 6 个环原子，为碳环或包含选自 O、S 及 N 的杂环原子，其为未取代或经一个或多个选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及氧代之取代基所取代，

n 为 0、1、2 或 3。

5. 如权利要求 1-4 中任一项的式(I)化合物或其盐类,

其中

$R^2$  为未取代或经一个或多个取代基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基, 该取代基选自卤素、羟基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷叉基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基及二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基,

或

杂环基或苯基, 上述 2 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基、具有 3 至 6 个环原子的杂环基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基]羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基。

6. 如权利要求 1-5 中任一项的式(I)化合物或其盐类,

其中

$A^1$  为式  $-CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ , 或  $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2-$  基团, 及

$A^2$  为一个直接的键或式  $-CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2-O-CH_2-$ ,  $-CH_2-O-CH_2-CH_2-$ ,  $-CH_2-CH_2-O-CH_2-$ ,  $-CH_2-S-CH_2-$ ,  $-CH_2-S-CH_2-CH_2-$ ,  $-CH_2-CH_2-S-CH_2-$ ,  $-CH_2-NH-CH_2-$ ,  $-CH_2-NH-CH_2-CH_2-$ ,  $-CH_2-CH_2-NH-CH_2-$ ,  $-CH_2-N(CH_3)-CH_2-$ ,  $-CH_2-N(CH_3)-CH_2-CH_2-$  或  $-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-$ , 及

$A^1$  及  $A^2-R^2$  两基团的总碳数为

a) 6 至 20 个碳原子或

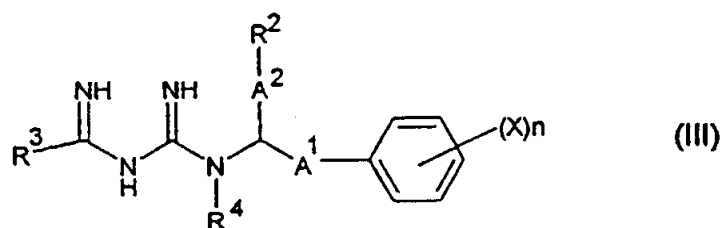
b) 5 个碳原子, 此时  $A^1 = -CH_2-$  或  $-CH_2CH_2-$  及  $R^1 = (C_1-C_4)$  烷基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷基或  $(C_3-C_6)$  环烷基。

7. 一种制备如权利要求 1-6 中任一项的式(I)化合物或其盐类的方法, 其包括

a) 反应式(II)化合物

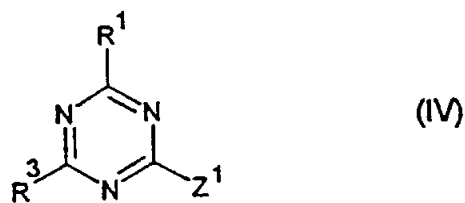


其中 Fu 为选自羧酸酯、羧酸原酯、羧酰氯、羧酰氨、羧酸酐的一个官能团及三氯甲基, 与式(III)双胍或其酸加成盐反应

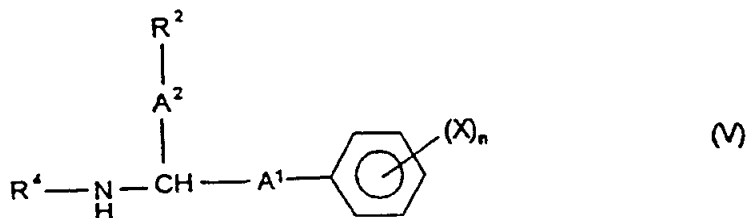


或

b) 使式(IV)化合物



其中  $Z^1$  为可交换的基团或离去基, 与适合的式(V)胺或其酸加成盐反应



其中，在式(II)，(III)，(IV)及(V)中， $R^1$ ， $R^2$ ， $R^3$ ， $R^4$ ， $A^1$ ， $A^2$ 及X及n如式(I)中定义。

8. 一种除草剂或植物生长调节剂，其包括一种或多种如权利要求1—6中之一的式(I)化合物或其盐类，以及通常用于作物保护的辅剂。

9. 一种控制有害植物或调节植物生长的方法，其中有效量的一种或多种如权利要求1—6中之一的式(I)化合物或其盐类被施用于植物上、植物的种子上或耕作面积上。

10. 如权利要求1—6中之一的式(I)化合物或其盐类作为除草剂或植物调节剂的用途。

11. 如权利要求10的用途，其中式(I)化合物或其盐类被用于控制有害植物或调节作物或观赏植物的生长。

12. 如权利要求11的用途，其中作物为转基因的作物。

13. 一种如权利要求7定义的式(III)或式(V)化合物。

# 说 明 书

## 2, 4-二氨基-1, 3, 5-三嗪类, 其制法及其作为除草剂及 植物生长调节剂的用途

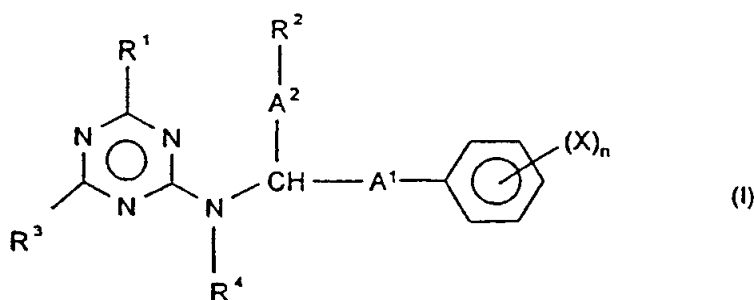
本发明涉及作物保护剂如除草剂或植物调节剂的技术领域, 特别涉及除草剂以选择控制在有用作物中的有害植物。

已知在 6-位被取代及其可能进一步被取代的 2-氨基-4-(N-苯基烷基氨基)-1, 3, 5-三嗪类具有除草及调节植物生长的性质; 参考 WO97/08156 及在该文中被引用的文献, 及 WO98/15537 及在该文中被引用的文献; 亦参考 WO97/00254 的观点及在该文中被引用的文献。

当已知的活性成分被使用时, 其中一些具有不利作用, 其不具有充分的除草作用以抵抗有害植物, 可被活性物质控制的有害植物种类亦太窄, 或对有用的作物的选择性太小。其它活性物质不可能在工业上有经济效益地的生产, 因为其前体及反应试剂不易取得, 或其化学稳定性不充足。

本发明的目的在于提供 2, 4-二氨基-1, 3, 5-三嗪类的活性成分, 其可被有利地用作为除草剂或植物生长调节剂。

本发明涉及式(I)化合物及其盐类





其中

$R^1$  为未取代或经取代的芳基，其包括取代基在内较佳地具有 6 至 30 个碳原子；或为未取代或经取代的 $(C_3-C_9)$ 环烷基，其包括取代基在内较佳地具有 3 至 30 个碳原子；或为经取代或未取代的杂环基，其包括取代基在内较佳地具有 2 至 30 个碳原子；

或 $(C_1-C_6)$ 烷基、 $(C_2-C_6)$ 烯基、或 $(C_2-C_6)$ 炔基，上述 3 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氰基、硝基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基、 $(C_2-C_4)$ 烯氧基、 $(C_2-C_4)$ 卤代烯氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、 $(C_1-C_4)$ 烷基亚磺酰基、 $(C_1-C_4)$ 烷基磺酰基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基亚磺酰基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基磺酰基；及

未取代或经取代的 $(C_3-C_9)$ 环烷基、未取代或经取代的苯基、未取代或经取代的杂环基、式  $R'-C(=Z')-$ ， $R'-C(=Z')-Z-$ ， $R'-Z-C(=Z')-$ ， $R'R''N-C(=Z')-$ ， $R'-Z-C(=Z')-O-$ ， $R, R''N-C(=Z')-Z-$ ， $R'-Z-C(=Z')-NR''-$  及  $R'R''N-C(=Z')-NR'''-$  基团，其中  $R'$ ， $R''$  及  $R'''$  分别独立为 $(C_1-C_6)$ 烷基、芳基、芳基- $(C_1-C_6)$ 烷基、 $(C_3-C_9)$ 环烷基或 $(C_3-C_9)$ 环烷基- $(C_1-C_6)$ 烷基，上述 5 个基团的每一基团未取代或经取代，且其中  $Z$  及  $Z'$  分别独立为氧或硫原子，

其包括取代基在内较佳地具有 1 至 30 个碳原子，

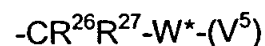
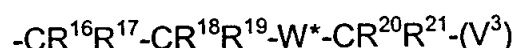
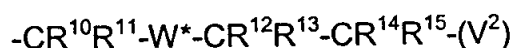
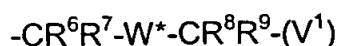
$R^2$  为未取代或经取代的 $(C_3-C_9)$ 环烷基、未取代或经取代的 $(C_4-C_9)$ 环烯基、未取代或经取代的杂环基、或未取代或经取代的苯基，其中  $R^2$  包括取代基在内较佳地具有至多 30 个碳原子，或

$R^3$  为氢、 $(C_1-C_6)$ 烷基、芳基或 $(C_3-C_9)$ 环烷基，上述 3 个基团的每一基团为未取代或经取代，或为式  $N(B^1-D^1)(B^2-D^2)$  或  $-NR'-N(B^1-D^1)(B^2-D^2)-$  基团，其中  $B^1$ ， $B^2$ ， $D^1$  及  $D^2$  在分别如下面所定义，及  $R'$ =氢、 $(C_1-C_6)$ 烷基或〔 $(C_1-C_4)$ 烷基〕羰基， $R^3$  包括取代基在内较佳地具有至多 20 个碳原子，

$R^4$  为式  $-B^3-D^3$  基团， $B^3$  及  $D^3$  如下定义，及  $R^4$  包括取代基在内较佳地具有至多 20 个碳原子，

$A^1$  为具有 1 至 5 个碳原子的直链烷撑基或直链的烯撑基或炔撑基，其每一基团有 2 至 5 个碳原子，上述 3 个两价基团的每一基团为未取代或经一或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、氰硫基及式  $-B^4-D^4$  基团， $B^4$  及  $D^4$  如下定义，

$A^2$  为一个直接的键或具有 1 至 4 个碳原子的直链烷撑基或直链的烯撑基或炔撑基，其每一基团有 2 至 5 个碳原子，上述 3 个两价基团的每一基团为未取代或经一或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、氰硫基及式  $-B^5-D^5$  基团，或式  $V^1, V^2, V^3, V^4$  或  $V^5$  之两价基团，



$R^6$  至  $R^{27}$  的每一基团分别独立为氢、卤素、硝基、氰基、氰硫基或式  $-B^6-D^6$ ，

$W^*$  为氧原子、硫原子或式  $N(B^7-D^7)$  及

$B^5, B^6, B^7, D^5, D^6$  及  $D^7$  为如下定义，

$B^1, B^2, B^3$  及  $B^7$  分别独立为一个直接的键或式  $-C(=Z^*)-$ ， $-C(=Z^*)-Z^{**}-$ ， $-C(=Z^*)-NH$  或  $-C(=Z^*)-NR^*$  之两价基团， $Z^*$  为一个氧或硫原子， $Z^{**}$  为一个氧或硫原子， $R^*$  为  $(C_1-C_6)$  烷基、芳基、芳基- $(C_1-C_6)$  烷基、 $(C_3-C_9)$  环烷基或  $(C_3-C_9)$  环烷基- $(C_1-C_6)$  烷基，上述 5 个基团的每一基团为未取代或经取代，及其包括取代基在内较佳地具有至多 20 个碳原子，

$B^4, B^5$  及  $B^6$  分别独立为一个直接的键或式  $-O-$ ， $-S(O)_p-$ ， $-S(O)_p-O-$ ， $-O-S(O)_p-$ ， $-CO-$ ， $-O-CO-$ ， $-CO-O-$ ， $-$

S—CO—, —CO—S, —S—CS—, —CS—S—, —O—CO—O—, —NR<sup>0</sup>—, —O—NR<sup>0</sup>—, NR<sup>0</sup>—O—, —NR<sup>0</sup>—CO—, —CO—NR<sup>0</sup>—, —O—CO—NR<sup>0</sup>—或—NR<sup>0</sup>—CO—O—之两价基团, p 为整数 0、1 或 2, 及 R<sup>0</sup> 为氢、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、芳基、芳基—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经取代, 其包括取代基在内较佳地具有至多 20 个碳原子,

D<sup>1</sup>, D<sup>2</sup>, D<sup>3</sup>, D<sup>4</sup>, D<sup>5</sup> 及 D<sup>6</sup> 分别独立为氢、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、芳基、芳基—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基, 上述 5 个基团的每一基团为未取代或经取代, 其包括取代基在内较佳地具有至多 20 个碳原子,

或两个 D<sup>5</sup> 基团被键结至一个碳原子上的两个—B<sup>5</sup>—D<sup>5</sup> 基团相互连结且形成具有 2 至 4 个碳原子的烷撑基, 此烷撑基为未取代或经一或多个选自(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基的取代基所取代,

(X)<sub>n</sub> 为 n 个取代基 X, 其中 X 分别独立为卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、氨基羰基或(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷硫基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)烯基、(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)炔基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷氧基〕羰基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、N—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷酰基氨基或 N—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷酰基—N—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基,

上述 13 个基团的每一基团为未取代或经取代, 较佳地未取代或经一或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基、(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基氨基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基,

上述 8 个基团的每一基团为未取代或经一或多个取代基所取代,

该取代基选自卤素、硝基、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、甲酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基，

或为(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷氧基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基氨基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基，

上述 11 个基团的每一基团为未取代或经取代，较佳地为未取代或经一或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氨基、硝基、甲酰基、羰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基氨基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基及二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基，

或两个相邻 X 基团一起为一稠合环，其具有 4 至 6 个环原子，及为碳环或包含选自 O、S 及 N 的杂环原子，及其为未取代或经一个或多个选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及氧代基的取代基所取代，

n 为 0、1、3、4 或 5，较佳为 0、1、2、3 或 4，特别为 1 或 2，及

在上述基团中的杂环基分别独立为具有 3 至 7 个环原子及 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的杂原子的杂环，其中

(a)在 A<sup>1</sup> 及 A<sup>2</sup>-R<sup>2</sup> 中的总碳数至少为 6 个碳原子或

(b)在 A<sup>1</sup> 及 A<sup>2</sup>-R<sup>2</sup> 中的总碳数为 5 个碳原子及 A<sup>1</sup> 为式 -CH<sub>2</sub>- 或 -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- 及 R<sup>1</sup> 为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)卤代烯基或(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基，其为未取代或经取代。

除非详细具体指明，两价基团如 B<sup>1</sup>=-C(=Z<sup>\*</sup>)-Z<sup>\*\*</sup>- 这样定义，在一组合基团例如 -B<sup>1</sup>-D<sup>1</sup> 中，两价基团的一个键被连结至 D<sup>1</sup> 基团，D<sup>1</sup> 对两价基团而言显示在式的右边，即 -B<sup>1</sup>-D<sup>1</sup> 为式 -C(=Z<sup>\*</sup>)-Z<sup>\*\*</sup>-D<sup>1</sup>；类似定义也适用于类似的两价基团。

式(I)化合物可形成盐类，当式(I)化合物中含有碱基例如氨基或烷

基氨基时，它经历一酸加成反应，适合的酸为无机或有机酸，如 HCl、HBr、 $H_2SO_4$  或  $HNO_3$ ，但亦可为草酸或磺酸。其以去质子形式存在的适合取代基，如磺酸或羧酸可用那些可质子化的基团，如氨基形成内盐。同样地，盐可如下形成，在适合取代基如磺酸或羧酸中，使氢用农业上适合的阳离子替代。此盐的例子为金属盐，特别为碱金属盐或碱土金属盐，特别为钠盐及钾盐，或其他铵盐，盐用有机胺或季式铵盐。

在式(I)及所有后续式子中，烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、烷基氨基及烷硫基及相应不饱和及/或经取代的基团，在每一情况下其碳骨架为直链或支链的。除非另有说明，否则低碳骨架较佳地具有例如 1 至 6 个碳原子，或在饱和族中具有 2 至 6 个碳原子。同样地，烷基在组合定义如烷氧基、卤代烷基等中，为例如甲基、乙基、正一或异丙基、正一、异一、叔一或 2-丁基、戊基、己基如正己基、异己基及 1, 3-二甲基丁基、庚基如正庚基、1-甲基己基及 1, 4-二甲基戊基；烯基及炔基具有可能相应于烷基的不饱和基团的意义，例如烯基为烯丙基、1-甲基丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、1-甲基丁-3-烯-1-基及 1-甲基丁-2-烯-1-基；炔基为，例如，炔丙基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、1-甲基丁-3-炔-1-基。

环烷基为一饱和碳环系统，较佳为具有 3-8 个碳原子，例如，环丙基、环丁基、环戊基或环己基。经取代的环烷基包含有取代基的环系统，取代基经由双键如烷撑基例如甲撑基键结至环烷基上。对取代的环烷基而言，也可包含多核脂族环系，例如，双环[1.1.0]丁烷-1-基、双环[1.1.0]丁烷-2-基、双环[2.1.0]戊烷-1-基、双环[2.1.0]戊烷-2-基、双环[2.1.0]戊烷-5-基、金刚烷-1-基及金刚烷-2-基。

环烯基为一非芳香族的部分未饱和的碳环系统，较佳为具有 4-8 个碳原子，例如，1-环丁烯基、2-环丁烯基、1-环戊烯基、2-环戊烯基、3-环戊烯基、或 1-环己烯基、2-环己烯基、3-环己烯基、

1, 3-环己二烯基或 1, 4-环己二烯基。对经取代的环烷基的说明类似地应用于经取代的环烯基。

卤素为例如氟、氯、溴或碘。卤代烷基、卤代烯基及卤代炔基为烷基、烯基或炔基被卤素部分或完全取代的那些，较佳被氟、氯及/或溴取代，特别被氟或氯取代，例如单卤代烷基、全卤代烷基、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CHF}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{FCHCl}$ 、 $\text{CCl}_3$ 、 $\text{CHCl}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；卤代烷氧基为例如  $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OCHF}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  和  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；这类似地适用于卤代烯基及其他经卤素取代的基团。

芳基为单一、双-或多环芳香族系统，例如，苯基、萘基、四氢萘基、茚基、2, 3-二氢化茚基、并环茂二烯基、茛基及类似物，较佳为苯基。

杂环基团或环(杂环基)可被是饱和的、未饱和的或杂芳族的；其较佳包括一或多个、特别为 1、2 或 3 个杂原子于杂环上，较佳选自氮、氧及硫；其较佳为具有 3 至 7 个环原子的脂肪族杂环基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳族基团。杂环基可为例如杂芳族基团或环(杂芳基)如，单一、双-或多环芳香族系统，其中至少一个环包括一或多个杂原子，例如，吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、噁吩基、噁唑基、噁二唑基、噁唑基、异噁唑基、咪唑基、吡咯基、吡唑基、咪唑基及三唑基，或其为部分或完全氢化的基团如环氧乙基、氧杂环丁烷基、四氢咪唑基、环氧乙烷基、吡咯烷基、哌啶基、哌嗪基、二氧戊环基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑烷基及吗啉基。对经取代的杂环基团而言，适合的取代基为那些下面进一步提到的，及另外还包括氧代基。此氧代基团亦可能存在于那些在不同的氧化步骤中可能存在的杂环原子上，例如在氮及硫上。

经取代的基团如一经取代的烷基、烯基、炔基、芳基、苯基、苄基、杂环基及杂芳基团为例如一个经取代的基团，其衍生自未经取代的骨架，取代基包括例如一或多个、较佳为 1、2 或 3 个基团，该基团选自卤素、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基、叠氨基、烷氧基羰基、烷基羰基、甲酰基、氨基甲酰基、单一

及双烷基氨基羰基，经取代的氨基和酰基氨基，单一及双烷基氨基、及烷基亚磺酰基、卤代烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基及在环状基团的案例中，同样也为烷基及卤代烷基；“经取代的基团”一词如经取代的烷基及等等包括，除了上述饱和的含烃基团外，相应的未饱和脂肪族及芳香族基团作为取代基，如任选取代的烯基、炔基、烯氧基、炔氧基、苯基、苯氧基及等等。在环上具有脂肪族部分的取代的环状基团中，该定义亦包括那些具有取代基的环系统，取代基被双键例如经由烷撑基如甲撑基或乙撑基键结至环。

具有碳原子的基团中，具有1—4个碳原子、特别为1或2个碳原子的为佳。较佳的取代基一般为那些选自卤素例如氟及氯、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基，较佳为甲基或乙基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基，较佳为三氟甲基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基，较佳为甲氧基或乙氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、硝基及氰基。

特别好的取代基为甲基、甲氧基及氟。

单一或双取代的氨基为一化学上稳定的基团，选自经取代的氨基，例如，被一或二个相同或不同的下列基团取代，所说基团选自烷基、烷氧基、酰基及芳基；较佳为单烷基氨基、二烷基氨基、酰基氨基、芳基氨基、N—烷基—N—芳基氨基及N—杂环基；具有1至4个碳原子的烷基基团为较佳；芳基较佳为苯基或经取代的苯基；酰基适用下面进一步给出的定义，较佳为(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷酰基。这也类似地适用于经取代的羟基氨基或胍基。

任选经取代的苯基较佳为未取代或单一或多取代的，较佳被相同或不同基团至多为三取代的，取代基选自卤素、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷氧基及硝基，例如邻—、间—及对—甲苯基、二甲基苯基、2—、3—及4—氯苯基、2—、3—及4—三氟—及三氯苯基、2，4—、3，5—、2，5—及2，3—二氯苯基、邻—、间—及对—甲氧基苯基。

酰基为有机酸的基团，例如羧酸的基团及衍生自羧酸的酸基团如硫代羧酸、任选N—取代的亚氨基羧酸或碳酸单酯基团、任选N—取

代的氨基甲酸、磺酸、亚磺酸、膦酸、次膦酸。酰基为，例如，甲酰基、烷基羰基如〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、苯基羰基、烷氧基羰基、苯氧基羰基、苄氧基羰基、烷基磺酰基、烷基亚磺酰基、N-烷基-1-亚氨基烷基及其他有机基团。基团可能进一步被取代在烷基或苯基部分，例如在烷基部分被一个或多个选自卤素、烷氧基、苯基及苯氧基取代基所取代；在苯基部分的取代基的例子为那些已在上述提到的经取代的苯基的取代基。

再者，本发明也涉及所有被式(I)包含的立体异构物及其混合物。此式(I)化合物包含一个或多个不对称碳原子或双键，其未在式(I)中未被特定地指出。式(I)包含所有可能的由其特定的空间形式定义的人，例如对映异构物、非对映异构物、Z-及E-异构物，它们可能从立体异构物混合物中通过已知方法而被得到，或藉由立体选择性反应、结合使用立体化学纯的起始物质而被制备。

依据本发明的上述式(I)化合物及其盐类具有特别的意义，主要是因为其具有更有效的除草作用、改进的选择性及/或因为其易于被制备，其中各个基团具有一种已经提到的或下面所说的较佳的意义，或特别是那些，其中一个或多个较佳意义已在上述被提到或在下文中被提到，或为其组合。

R<sup>1</sup> 较佳为未取代或经一个或多个取代基所取代的苯基，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，且它们包括取代基在内共具有6至30个碳原子，较佳为6至20个碳原子，特别为6至15个碳原子。

R<sup>1</sup> 较佳为未取代或经一个或多个取代基所取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基，该取代基选自卤素、羟基、氨基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、



(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基及二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基，且它们包括取代基在内共具有3至30个碳原子，较佳为3至20个碳原子，特别为3至15个碳原子。

R<sup>1</sup>较佳还为未取代或经一个或多个取代基所取代的杂环基，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，且它们包括取代基在内共具有2至30个碳原子，较佳为2至20个碳原子，特别为2至15个碳原子。

在此及其他基团中，杂环基较佳为具有3至7个、特别是3至6个环原子的杂环基，且一个杂原子选自N、O及S，例如吡啶基、噻吩基、咪唑基、吡咯基、环氧乙基、氧杂环丁烷基、四氢咪唑基、环氧乙烷基、吡咯烷基、哌啶基，或为具有2或3个杂原子的杂环基，选自嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、噻吩基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、三唑基、哌嗪基、二氧戊环基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑烷基、吗啉基。

R<sup>1</sup>较佳为(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)烯基、或(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)炔基，上述3个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氰基、硝基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基亚磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基亚磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，及

未取代或经一个或多个取代基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基，该取代基选自卤素、羟基、氨基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)

卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基及二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基，及苯基及杂环基，上述 2 个基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基-羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，式 R'-C(=Z')-，R'-C(=Z')-Z-，R'-Z-C(=Z')-，R'R''N-C(=Z')-，R'-Z-C(=Z')-O-，R'R''N-C(=Z')-Z-，R'-Z-C(=Z')-NR''-及 R'R''N-C(=Z')-NR'''-基团，其中 R'，R''及 R'''分别独立为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、苯基、苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基，上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基，及在环状基团情况下亦为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基，其中 Z 及 Z'分别独立为氧或硫原子，

且它包括取代基在内较佳地具有 1 至 20 个碳原子，特别为 1 至 15 个碳原子。

R<sup>1</sup> 较佳为未取代或经一个或多个取代基取代的(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基，该取代基选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、未取代或经取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、及未取代或经一个或多个取代基取代的苯基，该取代基选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、氨基、单-及双-〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕氨基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷酰基氨基、苯甲酰基氨基、硝基、氰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、甲酰基、氨基甲酰基、单-及双-〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕氨基羰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基，及具有 3 至 6 个环原子及 1 至 3 个选自氮、氧及硫的杂原子的杂环基，环为未取

代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及氧代基，或未取代或经一个或多个取代基取代的苯基，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基-羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，且它们包括取代基在内共具有 2 至 30 个碳原子、较佳为 1 至 20 个碳原子、特别为 2 至 15 个碳原子。

R<sup>1</sup> 较佳为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、苄基或〔(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基〕-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)烷基、特别为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基或〔(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基〕甲基、较佳为-CH<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>F，-CHF<sub>2</sub>，-CF<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>Cl，-CHCl<sub>2</sub>，-CCl<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>Br，-CHBr<sub>2</sub>，-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F，-CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，-CF(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>，-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F，-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl 或环丙基甲基。

下面 R<sup>2</sup> 的意义特别感兴趣，它独立于 R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup> 及(X)<sub>n</sub> 且较佳地与一个或多个这些基团的较佳意义相组合：

R<sup>2</sup> 较佳为未取代或经一个或多个下述取代基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基，所说取代基选自 A)，B)，C) 及 D) 组，

其中

A 组) 为卤素、羟基、氨基、甲酰基、羧基、氨基羰基、磺基、氰基、氰硫基及氧代基，

B 组) 为(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、(C<sub>4</sub>-C<sub>9</sub>)环烯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷叉基、(C<sub>4</sub>-C<sub>9</sub>)环烷叉基、式 R'-C(=Z')-，R'-C(=Z')-Z-，R'-Z-C(=Z')-，R'R''N-C(=Z')-，R'-Z-C(=Z')-O-，R'R''N-C(=Z')-Z-，R'-Z-C(=Z')-NR''-

及  $R'R''N-C(=Z')-NR'''$  基团，其中  $R'$ ,  $R''$  及  $R'''$  分别独立为  $(C_1-C_6)$  烷基、苯基、苯基- $(C_1-C_6)$  烷基、 $(C_3-C_9)$  环烷基或  $(C_3-C_9)$  环烷基- $(C_1-C_6)$  烷基，其中  $Z$  及  $Z'$  分别独立为氧或硫原子，

C 组)为如 B 组)所示基团，但每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$  烷氧基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷氧基、 $(C_1-C_4)$  烷硫基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷硫基、单  $(C_1-C_4)$  烷基氨基、二  $(C_1-C_4)$  烷基氨基、 $(C_3-C_9)$  环烷基、 $(C_4-C_9)$  环烷撑基、 $(C_4-C_9)$  环烷叉基、 $[(C_1-C_4)$  烷基] 羰基、 $[(C_1-C_4)$  烷氧基] 羰基、氨基羰基、单  $(C_1-C_4)$  烷基氨基羰基、二  $(C_1-C_4)$  烷基氨基羰基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基，上述 21 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、 $(C_1-C_4)$  烷氧基、 $(C_1-C_4)$  烷硫基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷氧基、甲酰基、 $(C_1-C_4)$  烷基羰基、 $(C_1-C_4)$  烷氧基羰基，及在环状基团中亦为  $(C_1-C_4)$  烷基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷基及  $(C_1-C_6)$  烷叉基，

在环状基团中，亦为  $(C_1-C_6)$  烷基、 $(C_1-C_6)$  卤代烷基及  $(C_1-C_6)$  烷叉基，及

D 组)为有 1 至 6 个碳原子、较佳为 1 至 4 个碳原子的两价或三价脂肪族桥，

在两价桥的情况下，其连结环架上两个碳原子，在三价桥的情况下，其连结环架上三个碳原子，因此  $R^2$  基团代表双环或三环基团，每一个桥为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、 $(C_1-C_4)$  烷基、 $(C_1-C_4)$  烷氧基、 $(C_1-C_4)$  烷硫基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷氧基、甲酰基、 $(C_1-C_4)$  烷基羰基、 $(C_1-C_4)$  烷氧基羰基及氧代基，

$R^2$ ，包括取代基在内，较佳具有 3 至 20 个碳原子，特别为 3 至 15 个碳原子。较佳的  $(C_3-C_9)$  环烷基为环丙基、环丁基、环戊基或环己基，特别为环丙基、环丁基或环戊基。

$R^2$  较佳还为未取代或经一个或多个取代基取代的  $(C_4-C_9)$  环烯

基, 该取代基选自 A 组), B 组), C 组)及 D 组), 其定义如  $R^2=(C_3-C_9)$ 环烷基时所定义, 且, 包括其取代基在内, 较佳具有 4 至 20 个碳原子, 特别为 4 至 15 个碳原子。

较佳的( $C_4-C_9$ )环烯基为 1-环丁烯基、2-环丁烯基、1-环戊烯基、2-环戊烯基及 3-环戊烯基。

$R^2$ 较佳为未取代或经一个或多个取代基取代的杂环基, 该取代基选自 A 组), B 组), C 组)及 D 组), 其定义如  $R^2=(C_3-C_9)$ 环烷基时所定义。

杂环基较佳为一个具有 3 至 6 环元的杂环基, 选自吡啶基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、环氧乙基、2-氧杂环丁烷基、3-氧杂环丁烷基、四氢呋喃基、吡咯烷基、哌啶基, 特别为环氧乙基、2-氧杂环丁烷基、3-氧杂环丁烷基或 oxolanyl, 或为一个具有 2 或 3 个杂原子的杂环基, 例如嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、噻吩基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、三唑基、哌嗪基、二氧戊环基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑烷基、吗啉基。

$R^2$ 较佳为未取代或经一个或多个取代基取代的苯基, 该取代基选自 A 组), B 组)及 C 组), 其定义如  $R^2=(C_3-C_9)$ 环烷基时所定义。

$R^2$ , 包括其取代基在内, 较佳有至多 20 个碳原子, 特别有至多 15 个碳原子, 非常特别有至多 10 个碳原子。

$R^2$ 较佳为未取代或经一个或多个取代基取代的苯基, 该取代基选自 A 组), B 组), C 组)及 D 组), 其中

A 组)为卤素、羟基、硝基、甲酰基、氨基羰基、氰基及氰硫基,

B 组)为( $C_1-C_4$ )烷基、( $C_1-C_4$ )烷氧基、( $C_1-C_4$ )烷硫基、单( $C_1-C_4$ )烷基氨基、二( $C_1-C_4$ )烷基氨基、( $C_2-C_4$ )烯基、( $C_2-C_4$ )炔基、( $C_3-C_6$ )环烷基、( $C_4-C_6$ )环烯基、( $C_1-C_4$ )烷撑基、( $C_4-C_6$ )环烷撑基、式  $R'-C(=Z')-$ ,  $R'-C(=Z')-Z-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-$ ,  $R'R''N-C(=Z')-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-O-$ ,  $R'R''N-C(=Z')-Z-$ ,  $R'-Z-C(=Z')-NR''-$  及  $R'R''N-C(=Z')-NR'''-$  基团, 其中  $R'$ 、 $R''$ 及  $R'''$ 分别为( $C_1-C_4$ )烷基、苯基、苯基-( $C_1-C_4$ )烷基、( $C_3-C_6$ )环烷基或( $C_3-C_6$ )环烷基-

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基, 及 Z 及 Z' 分别为氧或硫原子,

C 组)为如 B 组)所示的基团, 但每一基团被一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基,

上述 8 个基团的每一基团为未取代或有一个或多个取代基, 该取代基选自卤素、硝基、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基, 及

D 组)为连结环状骨架上两个碳原子的二价脂肪族桥所组成的, 因此 R<sup>2</sup> 基团表示双环, 例如双环〔1.1.0〕丁烷-1-基、双环〔1.1.0〕丁烷-2-基、双环〔2.1.0〕戊烷-1-基、双环〔2.1.0〕戊烷-2-基或双环〔2.1.0〕戊烷-5-基, 每一个桥为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基-羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基及氧代基。

R<sup>2</sup> 特别佳地为未取代或经一个或多个取代基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基, 取代基选自卤素、羟基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷叉基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基及二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基,

或为

杂环基或苯基, 上述 2 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫

基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基、具有3至6个环原子的杂环基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基]羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基。

对下面 R<sup>3</sup> 的意义特别感兴趣，它独立于 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup> 及 (X)<sub>n</sub> 且较佳地与其一个或多个这些基团的较佳意义相组合：

R<sup>3</sup> 为氢、未取代或经一个或多个取代基取代的(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基，取代基选自卤素、羟基、氨基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基及二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基，或苯基或(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基，上述2个基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基]羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基-羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，或式 N(B<sup>1</sup>-D<sup>1</sup>)(B<sup>2</sup>-D<sup>2</sup>)基团，B<sup>1</sup>、D<sup>1</sup>、B<sup>2</sup> 及 D<sup>2</sup> 如上所定义，或较佳为如下进一步的定义，特别为氨基。

对下面 R<sup>4</sup> 的意义特别感兴趣，它独立于 R<sup>1</sup> 至 R<sup>3</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup> 及 (X)<sub>n</sub> 且较佳地与一个或多个这些基团的较佳意义相组合：

R<sup>4</sup> 为式 -B<sup>3</sup>-D<sup>3</sup> 基团，B<sup>3</sup> 及 D<sup>3</sup> 较佳为如下进一步的定义。

R<sup>4</sup> 较佳为氢、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、苯基或(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基，上述3个基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，及在环状基团的情况下同样被(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基取代，或

甲酰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基或二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基；特别为氢、甲基、乙基、正丙基或异丙基；特别佳为氢。

对下面 A<sup>1</sup> 的意义特别感兴趣，它独立于 R<sup>1</sup> 至 R<sup>4</sup>、A<sup>2</sup> 及 (X)<sub>n</sub> 且较佳地与一个或多个这些基团的较佳意义相组合：

A<sup>1</sup> 为含 1 至 5 个碳原子的直链烷撑基或含 2 至 5 个碳原子的烯撑基或炔撑基，上述 3 个两价基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、氰硫基及式 —B<sup>4</sup>—D<sup>4</sup> 基团，

B<sup>4</sup> 为一个直接的键或为式 —O—，—SO<sub>2</sub>—，—CO—，—O—CO—，—NR<sup>0</sup>—，—NR<sup>0</sup>—CO—，—CO—NR<sup>0</sup>—，—O—CO—NR<sup>0</sup>— 或 —NR<sup>0</sup>—CO—O— 所示的两价基团，

其中

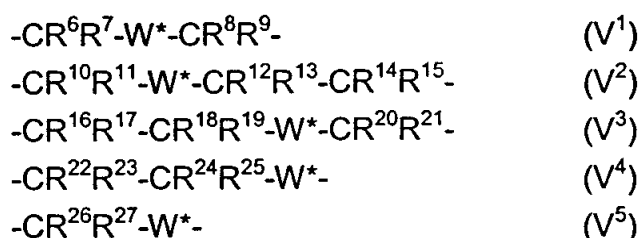
R<sup>0</sup> 及 D<sup>4</sup> 分别独立为氢、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基、苯基、苯基—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基，上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，及在环状基团的情况下亦为(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基所取代。

A<sup>1</sup> 较佳为式 —CH<sub>2</sub>—，—CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>—，—CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>—，—CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>— 或 —CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>— 基团，其为未取代的。同样地，较佳的是上述基团中的一个，其为经一个或多个上述 —B<sup>4</sup>—D<sup>4</sup> 基团的取代基所取代。A<sup>1</sup> 特别佳为式 —CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>— 或 —CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>—，其为未取代或经一个或两个羟基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基或(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基所取代。



对下面  $A^2$  的意义特别感兴趣，它独立于  $R^1$  至  $R^4$ 、 $A^1$  及  $(X)_n$  且较佳地与一个或多个这些基团的较佳意义相组合：

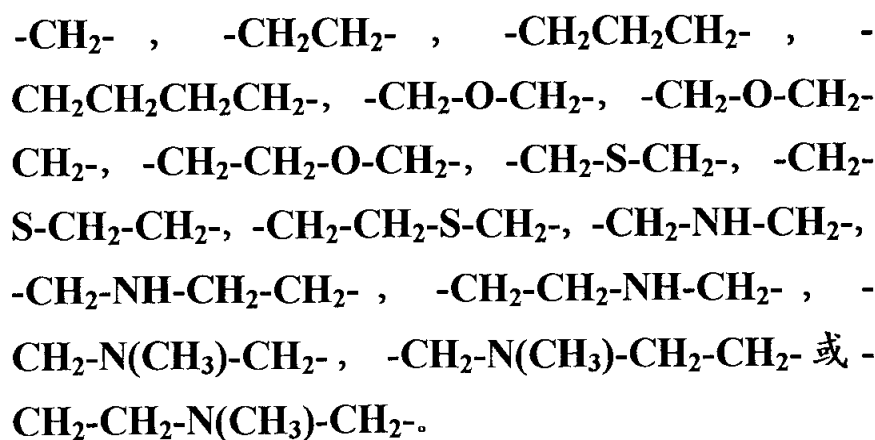
$A^2$  较佳为一个直接的键或式  $-\text{CH}_2-$ ， $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ， $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$  或  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，上述 4 个两价基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、氰硫基及式  $-\text{B}^5-\text{D}^5-$  基团，或式  $V^1$ ， $V^2$ ， $V^3$ ， $V^4$  或  $V^5$  之两价基团



其中  $R^6$  至  $R^{27}$  的每一基团分别独立为氢、卤素、硝基、氰基、氰硫基或式  $-\text{B}^6-\text{D}^6$  基团，

$\text{W}^*$  为氧原子、硫原子或式  $\text{N}(\text{B}^7-\text{D}^7)$ ，及  $\text{B}^5$ 、 $\text{B}^6$ 、 $\text{B}^7$ 、 $\text{D}^5$ 、 $\text{D}^6$  及  $\text{D}^7$  为如下定义，

$A^2$  较佳为一个直接的键或一个下式基团



$\text{B}^1$ ， $\text{B}^2$ ， $\text{B}^3$  及  $\text{B}^7$  较佳是分别独立为一个直接的键或式  $-\text{C}(=\text{Z}^*)-$ ， $-\text{C}(=\text{Z}^*)-\text{Z}^{**}-$ ， $-\text{C}(=\text{Z}^*)-\text{NH}-$  或  $-\text{C}(=\text{Z}^*)-\text{NR}^*-$  之两价基团， $\text{Z}^*=\text{O}$  或  $\text{S}$ ， $\text{Z}^{**}=\text{O}$  或  $\text{S}$  及  $\text{R}^*=(\text{C}_1-\text{C}_4)$  烷基、苯基、苯基  $-(\text{C}_1-$

$C_4$ 烷基、 $(C_3-C_6)$ 环烷基或 $(C_3-C_6)$ 环烷基- $(C_1-C_4)$ 烷基，上述 5 个基团的每一基团为未取代或经取代的，较佳为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷硫基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、 $(C_3-C_9)$ 环烷基、〔 $(C_1-C_4)$ 烷基〕羰基、〔 $(C_1-C_4)$ 烷氧基〕羰基、氨基羰基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基、 $(C_1-C_4)$ 烷基磺酰基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基磺酰基，在环状基团的情况下亦为 $(C_1-C_4)$ 烷基及 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基取代；

$B^1$ ， $B^2$ ， $B^3$  及  $B^7$  更佳地分别独立地为一个直接的键或式  $-C(=Z^*)-$ ， $-C(=Z^*)-Z^{**}-$ ， $-C(=Z^*)-NH-$  或  $-C(=Z^*)-NR^*-$  之两价基团， $Z^*=O$  或  $S$ ， $Z^{**}=O$  或  $S$  及  $R^*=(C_1-C_4)$ 烷基、苯基、苯基- $(C_1-C_4)$ 烷基、 $(C_3-C_6)$ 环烷基或 $(C_3-C_6)$ 环烷基- $(C_1-C_4)$ 烷基，上述 5 个基团中每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、甲酰基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基、 $(C_1-C_4)$ 烷硫基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基、 $(C_3-C_9)$ 环烷基、〔 $(C_1-C_4)$ 烷基〕羰基、〔 $(C_1-C_4)$ 烷氧基〕羰基、氨基羰基、单 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基、二 $(C_1-C_4)$ 烷基氨基羰基，及在环状基团中亦为 $(C_1-C_4)$ 烷基及 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基取代，特别地  $R^*=(C_1-C_4)$ 烷基或 $(C_3-C_6)$ 环烷基或特别地  $R^*=\text{苯基}$ 或苯基- $(C_1-C_4)$ 烷基，上述两个基团中每一基团在苯环部分为未经取代的或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、 $(C_1-C_4)$ 烷基、 $(C_1-C_4)$ 卤代烷基、 $(C_1-C_4)$ 烷氧基或 $(C_1-C_4)$ 卤代烷氧基。

$B^4$ ， $B^5$  及  $B^6$  较佳是分别独立地为一个直接的键或式  $-O-$ ， $-S(O)_p-$ ， $-S(O)_p-O-$ ， $-O-S(O)_p-$ ， $-CO-$ ， $-O-CO-$ ， $-CO-O-$ ， $-S-CO-$ ， $-CO-S-$ ， $-S-CS-$ ， $-CS-S-$ ， $-O-CO-O-$ ， $-NR^0-$ ， $-O-NR^0-$ ， $-NR^0-O-$ ， $-NR^0-CO-$ ， $-CO-NR^0-$ ， $-O-CO-NR^0-$  或  $-NR^0-CO-O-$  之两价基团， $p$  为整数 0、1 或 2，及  $R^0=\text{氢}$ 、 $(C_1-C_4)$ 烷基、苯基、苯基- $(C_1-C_4)$

烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基，上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，及在环状基团的情况下亦为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基取代，及特别地 R<sup>0</sup>=氢、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基或(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基，或特别地 R<sup>0</sup>=苯基或苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基，上述 2 个基团的每一基团在苯基部分为未经取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基。

更佳地 B<sup>4</sup>，B<sup>5</sup> 及 B<sup>6</sup> 分别独立地为一个直接的键或式 -O-，-S(O)<sub>p</sub> -，-CO-，-O-CO-，-CO-O，-S-CO-，-CO-S-，-NR<sup>0</sup>-，-NR<sup>0</sup>-CO-，-CO-NR<sup>0</sup>-，-O-CO-NR<sup>0</sup>- 或 -NR<sup>0</sup>-CO-O- 之两价基团，p 为整数 0、1 或 2，及具有上述意义的 R<sup>0</sup> 特别为 H 或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基。

D<sup>1</sup>，D<sup>2</sup>，D<sup>3</sup>，D<sup>4</sup>，D<sup>5</sup> 及 D<sup>6</sup> 分别独立为氢、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、苯基、苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基，上述 5 个基团的每一基团为未取代或经取代的，较佳为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基磺酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基磺酰基，及在环状基团的情况下亦为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基取代；

更佳地，D<sup>1</sup>，D<sup>2</sup>，D<sup>3</sup>，D<sup>4</sup>，D<sup>5</sup> 及 D<sup>6</sup> 分别独立为(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、苯

基、苯基—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基或(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基，上述 5 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、甲酰基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷硫基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>—C<sub>9</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基，及在环状基团的情况下亦为(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基及(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基取代，及特别地

为(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基或(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基或苯基或苯基—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基，上述两个基团每一基团在苯环部分为未经取代的或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基或(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷氧基。

对下面(X)<sub>n</sub>的意义特别感兴趣，它独立于R<sup>1</sup>至R<sup>4</sup>、A<sup>1</sup>及A<sup>2</sup>且较佳地与一个或多个这些基团的较佳意义相组合：

(X)<sub>n</sub>为 n 个取代基 X，其中 X 分别独立为卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、氨基羰基或(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷硫基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)烯基、(C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)炔基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、N—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷酰基氨基或 N—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷酰基—N—(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基，

上述 13 个基团的每一基团为未取代或经取代的，较佳为未取代或经一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、羟基、氨基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷硫基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基、(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)环烷基氨基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、二(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基，

上述 8 个基团的每一基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、硝基、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、甲酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基,

或为(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、苯基、苯氧基、苯硫基、苯基羰基、杂环基、杂环基氧基、杂环基硫基及杂环基氨基,

上述 9 个基团的每一基团为未取代或经取代的, 较佳为未取代或经一个或多个取代基所取代, 该取代基选自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷硫基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕羰基、〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基〕羰基、氨基羰基、单(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基,

或两个相邻 X 基团一起为一稠合环, 其具有 4 至 6 个环原子, 为碳环或包含选自 O、S 及 N 的杂环原子, 其为未取代或经一个或多个选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及氧代之取代基所取代,

n 为 0、1、2 或 3, 特别为 1 或 2。

(X)<sub>n</sub> 更佳为 n 个取代基 X, 其中 X 分别独立为卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、氰基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基、卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、羟基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、卤代-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)烯基、卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)炔基、卤代-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、二-〔(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基〕-氨基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)环烷基氨基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)环烷基、杂环基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基, 其具有 3 至 9 个环成员, 上述 3 个环基团为未取代或经一个或多个取代基所取代, 较佳是至多 3 个取代基, 该取代基选自(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、卤素及氰基, 或苯基、苯氧基、苯基羰基、苯基羰基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基-(C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基、氨基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基氨基羰基、苯氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基杂环基、杂环基氨基、杂环基氧基、杂环基硫基，或上述 16 个基团之一其在非环状部分为经取代的，或较佳在环状部分被一个或多个取代基所取代，该取代基选自卤素、硝基、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)卤代烷氧基、甲酰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基、杂环基，其在每一情况下包含 3 至 9 个环原子及 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的杂原子，或两个相邻 X 基团一起为一稠合环，其具有 4 至 6 个环原子及为碳环，或其包含选自 O、S 及 N 的杂环原子及为未取代或经一个或多个选自卤素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基及氧代基之取代基所取代。

(X)<sub>n</sub> 特别佳为 n 个取代基 X，其中 X 分别独立为卤素、OH、NO<sub>2</sub>、CN、SCN、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基羰基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基羰基、上述 4 个基团为未取代或经卤素或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基取代，及特别佳地为 n 个取代基 X，其中 X 分别独立为卤素、羟基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基。

在上面或下面提到的杂环基分别独立地较佳为具有 3 至 7 个环原子及 1 至 3 个选自 N、O 及 S 之杂原子，较佳的杂芳基选自吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、噻吩基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、异噁唑基、呋喃基、吡咯基、吡唑基、咪唑基及三唑基或下述部分或完全氢化的杂环基：选自环氧乙基、氧杂环丁烷基、四氢呋喃基、环氧乙烷基、吡咯烷基、哌啶基、哌嗪基、二氧戊环基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑烷基及吗啉基。

特别优选的杂环基为具有 3 至 6 个环原子及 1 个选自 N、O 及 S 之杂原子，特别为具有 5 或 6 个环原子的杂芳基，或为一个具有 3 至 6 个环原子之饱和或部分未饱和之杂环基(非杂芳基)。

再者，杂环基为一较佳具有 5 或 6 个环原子及 2 或 3 个选自 N、O 及 S 之杂原子的杂环基，特别为嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、

噻唑基、噻二唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、咪唑基、三唑基或  
 哌嗪基、二氧戊环基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁  
 唑烷基或吗啉基。

较佳地， $A^1$  及  $A^2-R^2$  两个基团的总碳数为

a) 至少 6 个碳原子，特别为 6 至 20 个碳原子，非常特别为 6 至  
 12 个碳原子，或

b) 5 个碳原子，则  $A^1=$  式  $-CH_2-$  或  $-CH_2CH_2-$  及  $R^1=(C_1-C_4)$   
 烷基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷基、 $(C_2-C_6)$  卤代烯基或未经取代或经取代的  
 $(C_3-C_9)$  环烷基，较佳地， $R^1=(C_1-C_4)$  烷基、 $(C_1-C_4)$  卤代烷基或未经  
 取代或经一个或多个选自  $(C_1-C_4)$  烷基及  $(C_1-C_4)$  烷基取代基所取代  
 的  $(C_3-C_6)$  环烷基。

特别地， $A^1$  及  $A^2-R^2$  一起的总碳数为上述 a) 项所说。

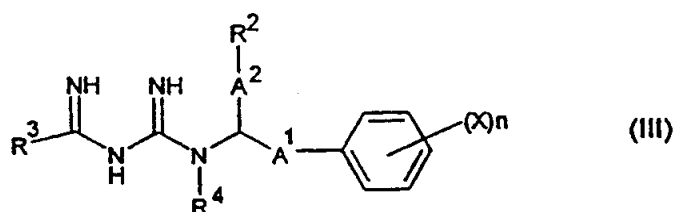
组合的  $-A^2-R^2$  基团较佳为环丙基(下文亦为“c-Pr”)、 $CH_2-c-$   
 Pr、 $-(CH_2)_2-c-Pr$ 、环丁基(下文亦为“c-Bu”)、 $CH_2-c-Bu$ 、  
 $(CH_2)_2-c-Bu$ 、环氧乙基、环氧乙基甲基或 2-(环氧乙基)-乙-1-  
 基。

本发明亦涉及式(I)化合物或其盐的制备方法，其包括

a) 使反应式(II)化合物

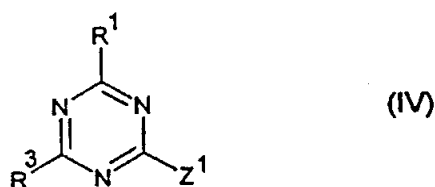


其中 Fu 为选自羧酸酯、羧酸原酯、羧酰氯、羧酰胺、羧酸酐的一个官  
 能团及三氯甲基，与式(III)双胍或其酸加成盐反应

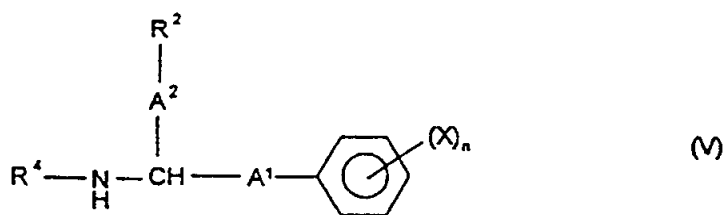


或

b) 使式(IV)化合物



其中  $Z^1$  为可交换的基团或离去基, 例如氯、三氯甲基、 $(C_1-C_4)$ 烷基磺酰基及未取代或经取代的苯基— $(C_1-C_4)$ 烷基磺酰基或 $(C_1-C_4)$ 烷基苯基磺酰基, 与适合的式(V)胺或其酸加成盐反应



其中, 在式(II), (III), (IV)及(V)中,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $A^1$ ,  $A^2$  及  $X$  及  $n$  如式(I)中定义。

式(II)及(III)化合物较佳地用碱催化反应, 且是在惰性有机溶剂如四氢呋喃(THF)、二噁烷、乙腈、二甲基甲酰胺(DMF)、甲醇及乙醇中、及温度为介于 $-10^{\circ}\text{C}$ 及溶剂沸点间, 较佳是在 $20^{\circ}\text{C}$ 至 $60^{\circ}\text{C}$ 下进行; 若式(III)的酸加成盐被使用, 其通常在原位用碱使之释放。适合的碱或碱性催化剂为碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷氧化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙基胺或1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一-7-烯(DBU)。碱的用量例如为, 以式(III)化合物为基准计, 0.1至3摩尔当量。式(II)化合物的用量例如为, 相对于式(III)化合物为准计, 等摩尔当量或过量至多2摩尔当量。制备方法原则上参照已知文献(综合杂环化学, A. R. Katritzky, C. W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, 卷



3; 部分 2B; ISBN 0-08-030703-5, p. 290).

式(IV)及(V)化合物较佳地用碱催化反应且是在惰性有机溶剂如 THF、二噁烷、乙腈、DMF、甲醇及乙醇中、及温度为介于 $-10^{\circ}\text{C}$ 及溶剂或溶剂混合物的沸点间, 较佳是在  $20^{\circ}\text{C}$  至  $60^{\circ}\text{C}$ ; 若式(V)以酸加成盐被使用, 若适合, 则在原位用碱使之释放。适合的碱或碱性催化剂为碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷氧化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙基胺或 1, 8-二氮杂双环[5.4.0]十一-7-烯(DBU)。碱的用量通常为, 以式(IV)化合物为基准计, 1 至 3 摩尔当量。式(IV)化合物的用量例如为, 相对于式(V)化合物的量计, 等摩尔当量或过量至多 2 摩尔当量。制备方法参照已知文献(参见综合杂环化学, A. R. Katritzky, C. W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, 卷 3; 部分 2B; ISBN 0-08-030703-5, p. 482)。

式(II)、(III)、(IV)及(V)之起始物质为市售的或可按文献中已知的类似方法制备。一些式(III)及(V)化合物为新颖的, 它们亦为本发明的主题。同样地, 化合物可例如通过下述制备方法之一制备。

式(IV)化合物或其前体可例如如下制备:

1. 使式(II)化合物与式(VI)脘硫脲衍生物反应



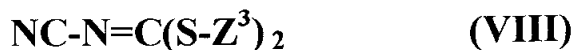
其中  $\text{Z}^2$  为  $(\text{C}_1\text{---}\text{C}_4)$  烷基或苯基— $(\text{C}_1\text{---}\text{C}_4)$  烷基,  $\text{R}^3$  如在式(I)中之定义, 得到式(IV)化合物, 其中  $\text{Z}^1 = \text{---}\text{SZ}^2$ 。

2. 式(VII)脘或其酸加成盐



其中  $\text{R}^1$  如在式(I)中之定义

与式(VIII)N-氨基二硫亚胺基碳酸酯反应



其中  $Z^3$  为  $(C_1-C_4)$  烷基或苯基- $(C_1-C_4)$  烷基, 得到式(IV)化合物, 其中  $Z^1 = -S-Z^3$ 。

3. 碱金属二氰胺与上述式(II)羧酸衍生物反应, 得到式(IV)化合物, 其中  $Z^1 = \text{NH}_2$ 。

4. 三氯乙腈与式(IX)腈反应



其中  $R^1$  如在式(I)中之定义, 起初得到式(X)化合物



其中  $Z^1$  及  $Z^4$  分别为  $\text{CCl}_3$ , 随后用式  $\text{H-R}^3$  ( $R^3$  如在式(I)中定义) 化合物反应, 生成式(IV)化合物, 其中  $Z^1 = \text{CCl}_3$ 。

式(II)羧酸衍生物与式(VI)脒硫脒衍生物反应是在有机溶剂如丙酮、THF、二噁烷、DMF、甲醇、乙醇中, 在温度介于  $-10^\circ\text{C}$  至溶剂沸点之间、较佳是在  $0^\circ\text{C}$  至  $20^\circ\text{C}$  下进行, 较佳用碱催化。然而, 反应亦可能在水或上述有机溶剂之一或多种含水溶剂混合物中实施。若(VI)以酸加成盐方式被使用, 其可能在原位使用碱而释放适合的碱或碱性催化剂为碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷氧化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙基胺或 1, 8-二氮杂双环 [5.4.0] 十一-7-烯(DBU)。碱的用量通常为 1 至 3 摩尔当量, 以式(VI)化合物为基准计。式(II)及(VI)

化合物的用量例如为，式(II)化合物的用量范围为等摩尔当量或过量至多 2 摩尔当量。原则上制备方法是文献已知的(参见 H. Eilingsfeld, H. Scheuermann, 化学通讯; 1967, 100, 1874), 相应的式(IV)中间体为新颖的化合物。

式(VII)脒与式(VIII)N-氟基二硫亚氨基碳酸酯反应是在惰性有机溶剂如乙腈、DMF、二甲基乙酰氨(DMA)、N-甲基吡咯烷酮(NMP)、甲醇及乙醇中, 在温度介于 $-10^{\circ}\text{C}$ 至溶剂沸点之间, 较佳是在 $20^{\circ}\text{C}$ 至 $80^{\circ}\text{C}$ 下进行的, 较佳用碱催化。若(VII)以酸加成盐方式被使用, 其可能在原位使用碱而释放。适合的碱或碱性催化剂为碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷氧化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙基胺或 1, 8-二氮杂双环[5.4.0]十一-7-烯(DBU)。碱的用量例如为 1 至 3 摩尔当量, 以式(VIII)化合物为基准计。式(VII)及(VIII)化合物可以这样的量被使用, 通常使式(VII)化合物的量为等摩尔当量或过量至多 2 摩尔当量。原则上制备方法由文献已知(参见 T. A. Riley, W. J. Henney, H. K. Dalley, B. E. Wilson, R. K. Robins; 杂环化学杂志; 1986, 23(6), 1706-1714), 相应的式(IV)中间体为新颖的化合物。

其中  $Z^1$ =氯的式(X)中间体, 可这样制备, 通过碱金属二氟胺与式(II)羧酸衍生物反应, 其中 Fu 较佳为羧酰氯或羧酰胺的官能基。反应物之间的反应用例如酸催化, 在惰性有机溶剂如甲苯、氯苯、氯化烃中, 在温度介于 $-10^{\circ}\text{C}$ 至溶剂沸点之间, 较佳是在 $20^{\circ}\text{C}$ 至 $80^{\circ}\text{C}$ 下进行, 其中出现的中间体可在原位使用一合适的氯化剂如磷酰氯使之氯化。适合的酸为, 例如, 氢卤酸如 HCl, 或路易斯酸如  $\text{AlCl}_3$  或  $\text{BF}_3$ (参考 US-A-5095113, 杜邦)。

其中  $Z^1$ 、 $Z^4$ =三卤甲基的式(X)中间体可如下制备, 通过用式(IX)脒与相应的三卤乙腈反应。反应物之间的反应用例如酸催化, 在惰性有机溶剂如甲苯、氯苯、氯化烃中、在温度介于 $-40^{\circ}\text{C}$ 至溶剂沸点之间, 较佳是在 $-10^{\circ}\text{C}$ 至 $30^{\circ}\text{C}$ 下进行。适合的酸为例如氢卤酸如 HCl, 或路易斯酸如  $\text{AlCl}_3$  或  $\text{BF}_3$ (参考 EP-A-130939, Ciba Geigy)。

其中  $Z^1=(C_1-C_4)$ 烷基巯基或未取代的苯基— $(C_1-C_4)$ 烷基巯基的式(IV)中间体可与一适合的氯化剂如元素氯或磷酰氯反应转化，它在惰性有机溶剂如甲苯、氯苯、氯化的烃或其他溶剂中、在温度介于—40℃至溶剂沸点之间，较佳是在 20℃至 80℃下进行，得到更具反应性的式(IV)氯三嗪，其中  $Z^1=Cl$ (参见 J. K. Chakrabarti, D. E. Tupper; 四面体 1975, 31(16), 1879-1882)。

其中  $Z^1=(C_1-C_4)$ 烷基巯基或未取代或经取代的苯基— $(C_1-C_4)$ 烷基巯基或 $(C_1-C_4)$ 烷基苯基巯基的式(IV)中间体可与一适合的氧化剂如间—氯过苯甲酸、过氧化氢、过氧单硫酸钾盐氧化，它在一适合的溶剂如氯化的烃、乙酸、水、醇、丙酮或其混合物中，在温度介于 0℃至溶剂沸点之间，较佳是在 20℃至 80℃下进行(参见 T. A. Riley, W. J. Henney, N. K. Dalley, B. E. Wilson, R. K. Robins; 杂环化学杂志; 1986, 23(6), 1706-1714)。

适于制备式(I)化合物的酸加成盐的酸为如下：氢卤酸如氢氯酸或氢溴酸，磷酸、硝酸、硫酸、单一或双官能羧酸及羟基羧酸，例如乙酸、马来酸、琥珀酸、富马酸、酒石酸、柠檬酸、水杨酸、山梨酸或乳酸，及磺酸，例如对—甲苯磺酸或 1, 5—萘二磺酸。式(I)的酸加成盐可以简单方式得到，它通过常用的形成盐的方法，例如将式(I)化合物溶解于适合的有机溶剂如甲醇、丙酮、二氯甲烷或苯中，在温度从 0 至 100℃下加入酸，且以已知方式分离，例如通过过滤，及，若适合，通过用惰性有机溶剂洗涤而纯化。

式(I)化合物的碱性加成盐较佳是在惰性极性溶剂如水、甲醇或丙酮中，在温度从 0 至 100℃时制备。依据本发明，适合制备盐的碱为碱金属碳酸盐如碳酸钾，碱金属氢氧化物及碱土金属氢氧化物如 NaOH 或 KOH，碱金属氢化物及碱土金属氢化物如 NaH，碱金属烷氧化物及碱土金属烷氧化物如甲醇钠、叔丁醇钾，或氨或乙醇氨。季铵可通过例如复分解作用或缩合作用而制备，其中用式  $[NRR'R''R''']^+X^-$  的季铵盐，其中 R, R', R''及 R'''分别相互独立地为 $(C_1-C_4)$ 烷基、苯基或苄基，X<sup>-</sup>为阴离子，例如 Cl<sup>-</sup>或 OH<sup>-</sup>。

在上述方法中称为“惰性溶剂”的溶剂应被理解为这些，它们在本发明的反应条件下是为惰性，但不需在任何反应条件下均为惰性。

依据本发明的式(I)化合物及其盐类，在下文中均称为式(I)化合物(依据本发明)，具有良好的除草活性以抵抗广谱的经济性重要的单子叶及双子叶有害植物。活性物质亦对由地下茎、根茎或其他多年生器官生长出嫩芽且是难以控制的多年生宽叶杂草是有效的，在此所指的是，不论此物质是在播种前、萌发前或萌发后施用。

以下将详细地提及一些可为本发明化合物所控制的单子叶和双子叶杂草植物相的代表例，但不限于这些特定物种。

活性成分可有效去除的单子叶杂草的例子例如有燕麦属、毒麦属、看麦娘属、草芦属、稗属、马唐属、粟属，以及一年生的莎草属，和多年生杂草例如鹅观草属、狗牙根属、白茅属和高粱属，以及多年生莎草属。

对双子叶杂草而言，包括一年生杂草例如猪殃殃属、堇菜属、草本威灵仙属、野芝麻属、繁缕属、苋属、白芥属、牵牛属、母草属、苘麻属、柝花属，及多年生杂草例如三色旋花属、蓟属、酸模属和蒿属。

本发明活性物质亦对在水稻生长的特殊条件下出现的杂草例如慈姑属、泽泻属、荸荠属、荆三菱属和莎草属有优异的控制功效。

如本发明的化合物适于苗前施用于土壤表面，则杂草幼苗的萌发可被完全预防，或者杂草生长直到子叶期但是接着其生长停止，最后杂草将在3—4周后完全死亡。

活性物质是在萌发后施用至植物的绿色部位，在处理后极短的时间内生长缓慢且彻底地停止，杂草植物会停留在施用时的生长阶段，或者在一段时间后完全死亡，由此对农作植物有害的杂草的竞争将在早期被消除，且此一情形将持续维持。

虽然本发明化合物对单子叶和双子叶杂草具有优异的除草功效，经济上重要的耕作植物例如小麦、大麦、裸麦、稻米、玉米、甜菜、棉花和大豆却不会受到伤害，或仅只有可忽略的程度。为此，本发明

化合物高度地适合于在农业耕作区域内选择性地防止不需要的杂草生长。

此外，本发明化合物对耕作植物具有优异的生长调节功能，其以调节的方式参与植物新陈代谢，如此而可以用于植物成分的有目的的预防而有利于收割，例如经由引起干燥及发育不全。此外，它适用于一般防止和抑制不需要的植物生长而不会破坏植物，植物生长的抑制对许多单子叶和双子叶作物是非常地重要，因为其可减少或完全预防倒伏。

由于其除草及植物生长调节性质，活性物质亦可被用于控制在已知改良的农作物中的或尚在开发的基因工程改良的作物中的有害植物。通常，转基因植物以特别优异的性质具备特色，例如抵抗某种农药，主要为某种除草剂，抵抗植物疾病或植物疾病的病原体，如某种昆虫或微生物如真菌、细菌或病毒。其他特别的性质涉及例如收割物质的量、性质、储存性质、组成及特定成分含量。因此，转基因植物已知具有较高的淀粉成分含量或改进了的淀粉质量或收割物质具有不同的脂肪酸组成。

依据本发明式(I)化合物或其盐类较佳被用于经济上重要的有用植物的转基因作物或观赏植物，例如谷类植物如小麦、大麦、裸麦、燕麦、高粱及小米、稻米、树薯及玉蜀黍，或其他如甜菜、棉花、大豆、油菜籽、马铃薯、蕃茄、豌豆等作物及其他蔬菜。

式(I)化合物较佳可被用作有用作物的除草剂，有用作物是对除草剂的植物毒性效应耐受的或经由基因工程变得耐受的。

培植新颖植物—其与已有植物相比较具有改良的特征—的传统途径在于，例如，传统育种方法及产生突变体。然而，也可能用基因工程方法以产生具有改变了特性的新颖植物(参考，例如 EP-A-0221044, EP-A-0131624)。例如许多案例中已描述了，

—具有以改良植物中合成的淀粉为目标的作物基因工程改良法(例如 WO92/11376, WO92/14827, WO91/19806)，

—耐受草铵膦型(参考，例如 EP-A-0242236, EP-A-242246)或草甘

麟型(WO92/00377)或磺酰基脲型(EP-A-0257993, US-A-5013659)除草剂的转基因作物,

—转基因作物例如棉花, 其具有产生使植物抵抗特定害虫的芽孢杆菌 *thuringensis* 毒素(B<sub>t</sub>-毒素)的能力(EP-A-0142924, EP-A-0193259),

—转基因作物, 它的脂肪酸组成被改良(WO91/13972)。

大量分子生物工程方法是原则上已知的, 通过它们可制得具有改变了的性的新型转基因植物, 见例如 Sambrook 等, 1989, 分子无性化, 实验室年报, 第二版, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; 或 Winnacker “基因和无性系”, VCH Weinheim, 第 2 版 1996, 或 Christou, “植物科学中的趋势” 1(1996)423-431。

为了实施此基因工程的操作, 核酸分子可能被引至质体, 其允许经由 DNA 序列重组而突变或序列改变。可能用上述标准方法实施碱交换、移除部分序列或加入天然-或合成序列。为了相互邻接 DNA 片段, 转接体或连接体可能被连接至片段上。

例如, 具有一还原活性基因产物的植物细胞可产生通过传递至少一种相应的抗感觉的(antisense)RNA、一种感觉的 RNA, 以得到一种共抑制效应或通过表达至少一种相应构造的核糖酶, 其特定地切断上述基因产物的转录本。

为此目的, 可能一方面利用一种 DNA 分子—其包含基因产物(包括任何可能存在的侧序列)的整个编码序列, 另一方面也可利用这样的 DNA 分子—其仅包含部分的编码序列, 但这些部分必须够长, 以便在细胞中产生抗感觉效果。也可以使用这些 DNA 序列, 其显示对基因产物的编码序列具有一高度的同质性, 但其不完全相同。

当在植物核酸分子中表达时, 已合成的蛋白质可能被定域在植物细胞中任何想要的隔室中。然而, 为了在至特定的隔室中定域, 编码区域例如可能与 DNA 序列连接, 这保证在特定的隔室中定域。这类序列是本领域专业人员所熟知的(见, 例如, Braun 等人, EMBO J. 11 (1992),3219-3227; Wolter 等人, 美国国家科学院论文集 85(1988),

846-850; Sonnewald 等人, 植物杂志 1(1991), 95-106)。

转基因植物细胞可能按已知技术再生为完整的植物。原则上, 转基因植物可指任何植物种类, 也即包括单子叶及双子叶植物。

因此可得到这样的转基因植物, 它具有已改变的特性, 这是经由同质(=天然)基因或基因序列经由过度表达、压抑或抑制作用, 或异质性(=外来)基因或基因序列的表达而达到的。

依据本发明的式(I)化合物较佳可用于转基因作物, 其耐受选自磺酰基脲、草铵膦—铵或草甘膦—异丙基铵类除草剂及类似的活性物质。

当依据本发明的活性物质被用于转基因作物时, 除了要观察针对有害植物的除草效果外, 时常还观察到在施用至各转基因作物上的特异作用, 例如一种已改变的或特别拓宽的杂草谱可得到控制, 改变了的施用速量, 较佳的组合与转基因作物具有耐受性的除草剂的良好可组合性及对转基因作物的生长及产量的影响。

因此本发明还涉及本发明式(I)化合物作为除草剂的应用, 以控制在转基因作物中的有害植物。

依据本发明控制有害植物或调节植物的生长的用途亦包括这些情况, 直至施用至植物上后, 式(I)活性物质或其盐才在植物中或在土壤中由一前体(前药)生成。

本发明化合物可制成常用制剂, 以可湿性粉剂、乳油、喷洒液、粉剂或粒剂的形式施用。因此本发明亦涉及含式(I)化合物的除草一和植物生长调节组合物。

式(I)化合物可配制成多种形式, 具体取决于生物—及/或化学物理参数。下列是可能适合的调配物形式: 可湿性粉末(WP)、水溶性粉末(SP)、水溶性浓缩液、乳油(EC)、乳剂(EW)例如水包油和油包水乳剂、喷洒液、悬浮液(SC)、油—或水性分散液、与油互溶的溶液、胶囊悬浮液(CS)、粉剂(DP)、种子包衣产物、供播种和土壤施用的粒剂、微粒形式的粒剂(GR)、包衣粒剂及吸收粒剂、水分散性粒剂(WG)、水溶性粒剂(SG)、ULV 制剂、微胶囊和蜡剂。



这些各种配方型式原则上为已知且揭示在例如 Winnacker-Küchler, “化学工艺学, 卷 7, C. Hauser Verlag, Munich, 第 4 版 1986; Wade van Valkenburg, “杀虫剂制剂”, Marcel Dekker, N. Y., 1973; K. Martens, “喷雾干燥手册”, 第 3 版 1979, G. Goodwin Ltd. London.

必要的配方助剂如惰性物质、界面活性剂、溶剂及其他添加剂亦已知且揭示在例如 Watkins, “杀虫粉剂稀释物及载体手册”, 第 2 版, Darland Books, Caldwell N. J.; H. v. Olphen, “粘土胶体化学导论”, 第 2 版, J. Wiley & Sons, N. Y.; C. Marsden, “溶剂导论”, 第 2 版, Interscience, N. Y. 1963; McCutchenon's “清洁剂和乳化剂手册”, MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, “表面活性剂大全”, Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964; Schönfeldt, “表面活性的乙氧化物加合物”, Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, “化学工艺学”, 卷 7, C. Hauser Verlag, Munich, 第 4 版 1986.

基于这些配方, 可能与其他农药活性物质例如杀虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂、及与安全剂、肥料及/或生长调节剂相组合, 制成例如预配制物或桶混物。

可均匀分散在水中的喷粉剂, 除了活性物质外, 亦包括离子一及/或非离子界面活性剂(润湿剂、分散剂), 例如, 聚氧乙基化的烷基酚、聚氧乙基化的脂肪醇、聚氧乙基化的脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷磺酸盐、烷基苯磺酸盐、木素磺酸钠、2, 2-二萘基甲烷-6, 6 二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰甲基牛磺酸钠, 除了稀释剂或惰性物质外。为了制备喷粉剂, 除草活性物质例如用已知装置如锤磨机、鼓风磨机及空气喷射磨机细微地磨碎, 并与配方辅剂同时或之后混合。

乳油例如通过溶解活性物质于有机溶剂中而制备, 溶剂例如为丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或其他高沸点的芳香族或烃或其混合物, 并添加一种或多种离子一及/或非离子界面活性剂(乳化剂)。可被使用的乳化剂为例如烷基芳基磺酸钙盐如十二烷基苯磺酰钙盐,

或非离子型乳化剂，如脂肪酸聚乙二醇酯、烷基芳基聚乙二醇酯、脂肪醇聚乙二醇酯、丙烯氧化物/乙烯氧化物缩合物、烷基聚醚、山梨糖醇酐酯，如山梨糖醇酐脂肪酸酯，或聚氧乙烯山梨糖醇酐酯，如聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯。

通过用细分散的固体物质与活性物质研磨得到粉末，固体物质例如为滑石或天然黏土，如高岭土、皂土或青磐岩，或硅藻土。

浓悬液可能以水—或油—为基础。其可例如通过市售珠磨机湿式研磨而制备，若适合，添加界面活性剂，如同上述例如在其他配制形式中所述的那些。

乳液例如水包油型乳液(EW)可例如经由搅拌器、胶体研磨机及/或使用水溶性有机溶剂的静态混合机而制备，若适合，添加界面活性剂，如同上述例如在其他配制形式中所述的那些。

通过将活性物质喷射至吸附颗粒的惰性或物质或是通过施用活性物质浓缩液至载体的表面上而制备颗粒剂，载体如沙、高岭土或颗粒化的惰性物质，经由粘结剂，例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠盐或矿物油。适合的活性物质亦可以已知的肥料颗粒制造方式如与肥料混合方式而造粒。

水—分散颗粒通常通过已知方法制备，如喷射—干燥法、流化床造粒法、圆盘造粒法，以高速混合机混合及不含固体惰性物质的挤压成型法。为了制备圆盘—、流化床—、挤压—及喷射颗粒，方法参考“喷雾干燥化手册”第3版 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “附聚”，化学和工程 1967, 147页往后; “Perry's 化学工程手册”，第5版, McGraw-Hill, New York 1973, 8-57页。

关于作物保护剂配制的详细资料，请参考 G. C. Kingman, “作为一门科学的杂草控制”，John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 81-96页和 J. D. Freyer, S. A. Evans, “杂草控制手册”，第5版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 101-103页。

通常，农药制剂包括 0.1 至 99 重量%、特别是 0.1 至 95 重量%的式(I)活性物质。

活性物质在喷粉剂中的浓度为例如约 10 至 90 重量%，其余添加至 100 重量%的是已知制剂成分。对乳油而言，活性物质的浓度可能为约 1 至 90 重量%，较佳为 5 至 80 重量%。粉状制剂通常包括 1 至 30 重量%的活性物质，在大部分情况下较佳为 5 至 20 重量%的活性物质。对可喷洒的溶液而言，含 0.05 至 80、优选 2 至 50 重量%活性物质。对水可分散颗粒剂而言，活性物质的含量部分地取决于活性化合物为液体或固体形式及使用的颗粒化辅剂、填充物及等等。对于水可分散颗粒剂，包括例如 1 至 95 重量%的活性物质，较佳为 10 至 80 重量%。

此外，提到的活性物质制剂包括，若适合，粘着剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、抗冷冻剂、溶剂、填充物、载体、调色剂、抗泡沫剂、蒸发抑制剂、pH 调节剂及粘度调节剂，它们皆为已知。

其可能被作为混合制剂或桶混物中的配对组成的已知活性物质，活性物质与本发明的活性物质一起使用，它们例如描述在杂草研究 26, 441-445 (1986)，或“除虫剂手册”第 10 版，英国作物保护协会和皇家化学会，1994 及文中引用的文献。为已知及可能与式 (I) 化合物相组合的除草剂，例如下面活性物质（注意：这些化合物可按标准化的国际组织 (ISO) 的“俗名”或化学名字标示，若适合，与惯用的号码一起使用）：乙草胺；三氟羧草醚；苯草醚；AKH7088，即[[[1-[5-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]2-硝基苯基]-2-甲氧基乙叉基]胺基]氧基]乙酸及其甲基酯；甲草胺；杀草灭；莠灭净；酰嘧磺隆；杀草强；氨基磺酸铵，即硫酸铵盐；莎稗磷；磺草灵；莠去津；四唑嘧磺隆 (DPX-A8947)；叠氮净；燕麦灵；BAS 516H，即 5-氟-2-苯基 4H-3, 1-苯并噁嗪-4-酮；草除灵；乙丁氟灵；吡草黄；苄嘧磺隆；地散磷；灭草松；吡草酮；benzofluor；新燕灵；苯噻隆；双丙氨酰磷；甲羧除草醚；除草定；溴丁酰草胺；溴酚脞；溴苯脞；bromuron；丁环草磷；羟草酮；丁草胺；抑草磷；丁烯草胺；buthidazole；双丁乐灵；丁草特；cafenstrole (CH-900)；苄草胺；磺草酮 (ICI-A0051)；CDAA，即 2-

氯-N, N-二-2-丙烯基乙酰胺; CDEC, 即 2-氯烯丙基二乙基二硫氨基甲酸酯; 甲氧除草醚; 灭草平; chlorazifop-butyl, chlormesulon(ICI-A0051) 绿秀隆; 稗蓼灵; 伐草克; 正形素; 杀草敏; 氯嘧黄隆; 草枯醚; 绿麦隆; 枯草隆; 氯苯胺灵; 绿黄隆; 氯酞酸; 草克乐; 环庚草醚; 醚黄隆; 烯草酮; clodinafop and its ester derivatives(例如 clodinafop-propargyl); 异噁草酮; 稗草胺; cloproxydim; 二氯吡啶酸; cumyluron(JC 940); 氟草津; 灭草特; cyclosulfamuron (AC 104) 噻草酮; 环莠隆; cyhalofop 及其酯衍生物 (for example butyl ester, DEH-112); 牧草快; 环丙津; 三环赛草胺; 杀草隆; 2, 4-滴丁酸; dalapon; 甜菜安; 敌草净; 燕麦敌; 麦草畏; 敌草腈; 2, 4-滴丙酸; 禾草灵和它的酯例如 diclofop-methyl; 乙酰甲草胺; 枯莠隆; 双苯唑快; 吡氟草胺; 丁噁隆; 二甲草胺; 二甲丙乙净; dimethenamid(SAN-582H); 异噁草酮; 异噁草松; 噻节因; dimetrasulfuron, 氨基乙氟灵; 地乐酚; 特乐酚; 双苯酰草胺; 异丙净; 敌草快; 氟硫草定; 敌草隆; 二硝酚; 甘草津; EL77, 即 5-氟基-1-(1, 1-二甲基乙基)-N-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺; 茵多杀; 茵达灭; 禾草畏; 乙丁烯氟灵; ethametsulfuronmethyl; 赛黄隆; 乙嗪草酮; 乙唑草黄; F5231, 即 N-[2—4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4, 5-二氢-5-氧代-1H-四唑-1-基]-苯基]乙磺酰胺; ethoxyfen 及其酯 (for example ethyl ester, HN-252); etobenzanid(HW 52); 2, 4, 5-涕丙酸; fenoxan, 噁唑禾草灵和高噁唑禾草灵及其酯, 例如高噁唑禾草灵乙酯和噁唑禾草灵乙酯; fenoxymidon; 非草隆; 麦草伏甲酯; 啶嘧黄隆; fluazifop 和吡氟禾草灵及其酯, 例如 fluazifop-butyl 和 吡氟禾草灵丁酯; 氟乙氟灵; flumetsulam; 伏草隆; flumiclorac 及其酯 (例如戊酯, S-23031); flumioxazin(S-482); flumipropyn; 胺草唑 (KNW-739); 三氟硝草醚; 乙羧氟草醚酯; flupropacil(UBIC-4243); 氟定酮; 氟咯草酮; 氟草烟; 唑草酮; 氟黄胺草醚; 蔓草磷; 氟唑草醚; 草铵磷; 草甘磷; halosafen; halosulfuron 及其酯 (例如甲酯, NC-319); 吡氟氟禾灵及其酯; haloxyfop-P(=R-haloxyfop)及其酯; 环嗪酮; 咪草酯; 灭草烟; 灭草啞

及盐如铵盐; imazethamethapyr; 咪草烟; imazosulfuron; 碘苯腈; 丁腈胺; 异丙乐灵; 异丙隆; 异噁隆; 异噁草胺; 噁草醚; 隆草特; 乳氟禾草灵; 环草定; 利谷隆; 2甲4氯; 2甲4氯丁酸; 2甲4氯丙酸; 苯噻草胺; 伏草胺; 苯嗪草酮; 吡草胺; 甲基苯噻隆; 威百亩; 灭杀唑; 甲氧苯酮; 甲基杀草隆; metabenzuron; 甲基苯噻隆; 秀谷隆; 异丙甲草胺; metosulam(XRD 511); 甲氧隆; 嗪草酮; 甲黄隆; 抑芽丹; 草达灭; 庚草利; monocarbamide dihydrogensulfate; 绿谷隆; 灭草隆; MT 128 即 6-氯-N-(3-氯-2-丙烯基)-5-甲基-N-苯基-3-吡嗪胺; MT 5950, 即, N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺; 萘丙胺; 萘氧丙草胺; 萘草胺; NC 310, 即 4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄氧基吡唑; 草不隆; 烟嘧黄隆; 吡氯草胺; 磺乐灵; 除草醚; nitrofluorfen; 吡草伏; 坪草丹; 安磺灵; oxadiargyl(rp-020630); 噁草酮; 乙氧氟草醚; 百草枯; 克草猛; 二甲戊乐灵; 黄草伏; 棉胺宁; 甜菜宁; 毒莠定; 啶草磷; piributicarb; pirifenop-butyl; 丙草胺; 氟嘧黄隆(酯); 环丙青津; 氨基丙氟灵; 环丙氟灵; 甘扑津; 扑灭通; 扑草净; 毒草胺; 敌稗; 啶草酯及其酯; 扑灭津; 苯胺灵; propisochlor; 戊炔草胺; prosulfalin; 苄草丹; prosulfuron(CGA-152005); 丙炔草胺; 吡唑特; 杀草敏; 吡嘧黄隆; 苄草唑; 吡草特; pyriithiobac(KIH-2031); pyroxofop 及其酯(例如 propargyl 酯; 二氯喹啉酸; 喹草酸; quinofp 及其酯衍生物, quizalofop 和喹禾灵及其酯衍生物, 例如 quizalofop-ethyl; quizalofop-P-tefuryl and -ethyl; renriduron; rimsulfuron 9DPX-E9636); S275, 即, 2-[4-(2-氯-5-(2-丙炔基氧基)苯基)-4,5,6,7-四氢-2H-吡唑]; 仲丁通; 稀禾定; 环草隆; 西玛津; 西草净; SN 106279, 即 2-[[7-(2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基)-2-萘基]氧基]丙酸及其甲基酯; sulfentrazone(FMC-97285, F-6285); sulfazuron; 嘧黄隆; 草甘膦(ICI-A0224); 三氯醋酸; 牧草胺(GCP-5544); 特丁噻草隆; 特草定; 特草克; 特丁草胺; 特丁通; 特丁津; 特丁净; TFH 450, 即, N,N-二乙基-3-[(2-乙基-6-甲基苯基)磺酰基]-1H-1,2,4-三唑-1-甲酰胺; thenylchlor(NSK-850); 噻氟隆; thizopyr(Mon-13200); thidiazimin

(SN-24085); 噻黄隆; 杀草丹; 仲草丹; 脞草酮; 野燕畏 (阿畏达); 醚苯黄隆; trazofenamide; 苯黄隆; 绿草定; 灭草环; 草达津; 氟乐灵; triflusulfuron 和其酯(例如甲酯, DPX-66037); 三甲异脲; tsitodef; 灭草猛; WL 110547, 即 5-苯氧基-1-[3-(三氟甲基)苯基]-1H-四唑; UBH-509; D-489; Ls 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 和 KIH-2023.

为了使用, 可以市售方式存在得到的制剂, 若适合, 可以已知方式被稀释, 例如对喷粉剂、乳油、分散液及水可分散的颗粒剂而言。以粉状制剂、土壤用或撒施粒剂及可喷洒溶液在使用前一般不再以其它惰性物质稀释。

式(I)化合物的施用量随外在条件如尤其为温度、湿度及使用除草剂的本性而不同。它可能在一宽限内波动, 例如用 0.001 及 10.0kg/公顷或更多活性物质, 但其较佳为 0.005 及 5kg/公顷之间。

下面实施例的含量数据(百分比)以重量为基准计, 除非另有说明。

## A. 化学实施例

### 实施例 A1

2-氨基-4-(1-氟-1-甲基乙基)-6-(3-苯基-1-环丁基-1-丙基氨基)-1, 3, 5-三嗪(见表 4, 实施例 4-2)

0.32 克(0.014 摩尔)钠及 10 毫升甲醇制得的溶液被加至 1.90 克(0.00613 摩尔)3-苯基-1-环丁基-1-(二胍基)丙烷盐酸盐于 30 毫升甲醇及 2 克 3Å(埃)分子筛中。然后, 1.10 克(0.0092 摩尔)1-氟-1-甲基丙酸甲酯被逐滴加入, 且混合物在 25℃ 搅拌 2 小时, 然后在 65℃ 搅拌 4 小时。反应混合物过滤, 滤液被浓缩, 及残留物溶于乙酸乙酯。混合物用水洗及用硫酸钠干燥。干燥剂用吸滤器过滤掉, 溶剂在真空下蒸发掉。通过柱色谱层析法纯化, 得到 1.66 克(理论值的 79%)2-氨基-4-(1-氟-1-甲基乙基)-6-(3-苯基-1-环丁

基-1-丙基氨基)-1, 3, 5-三嗪。

#### 实施例 A2

2-氨基-4-(1-氟-1-甲基乙基)-6-(1-苯基-4-环丙基-4-丁基氨基)-1, 3, 5-三嗪(见实施例 22-12, 表 22)

1.52 克(0.008 摩尔)2-氨基-4-氟-6-(1-氟-1-甲基乙基)-1, 3, 5-三嗪及 1.64 克(0.012 摩尔)的碳酸钾被导入 30 毫升乙腈中。1.50 克(0.008 摩尔)4-苯基-1-环丙基-1-丁基胺于 10 毫升乙腈中的溶液逐滴加至此溶液中。混合物被回流 3 小时。然后, 固体成分用吸滤器过滤掉, 滤液用旋转蒸发器蒸发。残留物用柱色谱层析法(洗提液: 乙酸甲酯)纯化。得到 2.36 克(理论值的 86%)2-氨基-4-(1-氟-1-甲基乙基)-6-(1-苯基-4-环丙基-4-丁基氨基)-1, 3, 5-三嗪。

#### 实施例 A3

2-氨基-4-(1-氟-1-甲基乙基)-6-[3-(3, 5-二甲基苯基)-1-环丙基-1-丙基氨基]-1, 3, 5-三嗪(见表 9, 实施例 9-17)

1.2 克(0.05 摩尔)钠及 100 毫升甲醇制得的甲醇钠溶液被加至 8.1 克(0.025 摩尔)3-(3, 5-二甲基苯基)-1-环丙基-1-(1-二胍基)丙烷盐酸盐于 50 毫升甲醇中的溶液并加入 7 克磨碎的 3Å 分子筛。然后, 5.4 克(0.045 摩尔)1-氟-1-甲基丙酸甲酯被逐滴加入, 混合物在 25°C 搅拌 2 小时, 然后在 65°C 搅拌 4 小时。反应混合物过滤, 滤液浓缩及残留物溶于乙酸乙酯。混合物用水洗及用硫酸钠干燥。干燥剂用吸滤器过滤掉, 溶剂在真空下蒸发掉。通过柱色谱层析法(洗提液: 乙酸乙酯)纯化, 得到 7.4 克(理论值的 83%)的 2-氨基-4-(1-氟-1-甲基乙基)-6-[3-(3, 5-二甲基)-1-环丙基-1-丙基氨基]-1, 3, 5-三嗪。

#### 实施例 A4

2-氨基-6-甲基-4-[3-(3-甲基苯基)-1-环丁基-1-丙基氨基]-1, 3, 5-三嗪(见表 4, 实施例 4-29)

2.2 克(0.015 摩尔)的 2-氨基-4-氯-6-甲基-1, 3, 5-三嗪及 4.1 克(0.03 摩尔)的  $K_2CO_3$  被导入 50 毫升乙腈中。2.5 克(0.015 摩尔)3-(3-甲基苯基)-1-环丁基-1-丙基胺于 20 毫升乙腈中的溶液逐滴加至此溶液中。混合物回流 3 小时。然后, 固体成分用吸滤器过滤掉, 滤液用旋转蒸发器蒸发。残留物用柱色谱层析法(洗提液: 乙酸乙酯)纯化。得到 4.3 克(理论值 92%)2-氨基-6-甲基-4-[3-(3-甲基苯基)-1-环丁基-1-丙基氨基]-1, 3, 5-三嗪。

#### 实施例 A5

2-氨基-4-(1-氟-1-甲基乙基)-6-[4-(3, 5-二甲基苯基)-1-环丙基-1-丁基氨基]-1, 3, 5-三嗪(见表 22, 实施例 22-28)

1.2 克(0.05 摩尔)钠及 100 毫升甲醇制得的甲醇钠溶液被加至 8.4 克(0.025 摩尔)4-(3, 5-二甲基苯基)-1-环丙基-1-(1-二胍基)丁烷盐酸盐于 50 毫升甲醇溶液中且加入 7 克磨碎的  $3\text{\AA}$  分子筛。然后, 5.4 克(0.045 摩尔)1-氟-1-甲基丙酸甲酯被逐滴加入, 且混合物在  $25^\circ\text{C}$  搅拌 2 小时, 然后在  $65^\circ\text{C}$  搅拌 4 小时。反应混合物过滤, 滤液浓缩, 及残留物溶于乙酸乙酯。混合物用水洗及用硫酸钠干燥。干燥剂用吸滤器过滤掉, 及溶剂在真空下蒸发掉。通过柱色谱层析法(洗提液: 乙酸乙酯)纯化, 得到 7.7 克(理论值的 83%)2-氨基-4-(1-氟-1-甲基乙基)-6-[3-(3, 5-二甲基)-1-环丙基-1-丁基氨基]-1, 3, 5-三嗪。

下面表 1 至 44 中的化合物通过或类似于上述实施例 A1 至 A5 的方法、或通过其它或通用方法制得。表中的缩写意义为:

Me=甲基

Et=乙基

Pr=丙基



i-Pr=异丙基

c-Pr=环丙基

c-Bu=环丁基

t-Bu=叔丁基

c-Hexyl=环己基

A1=(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>=-CH<sub>2</sub>-

A2=(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>=-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-

A3=(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>=-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-

A4=(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>=-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-

Ac=COCH<sub>3</sub>=乙酰基

Ox=  =环氧乙基

Ph=苯基

(X)<sub>n</sub>= “-” 相应于 n=0

下面表 1 至 41 涉及式 (1)

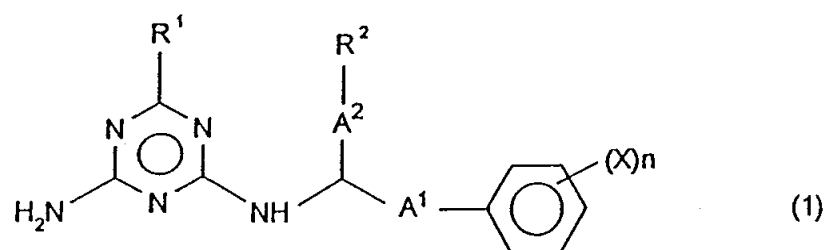


表 1

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
1-1	CH <sub>2</sub> -i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Pr	A1	-	油状
1-2	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	A1	-	油状
1-3	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Pr	A1	-	油状
1-4	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Bu	A1	-	
1-5	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Bu	A1	-	
1-6	Me	CH <sub>2</sub> -c-Bu	A1	-	
1-7	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Bu	A1	3-Me	
1-8	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -c-Pr	A1	-	
1-9	i-Pr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -c-Pr	A1		
1-10	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -c-Bu	A1		
1-11	i-Pr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -c-Bu	A1		

表 2

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
2-1	c-Pr	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-Pr	A2	3-Cl, 5-F	
2-2	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Me	
2-3	CClMe <sub>2</sub>	"	"	3-Me	
2-4	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Cl	
2-5	i-Pr	"	"	3-Cl	
2-6	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-F	
2-7	CHF <sub>2</sub>	"	"	3-F	
2-8	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-OMe	
2-9	CClMe <sub>2</sub>	"	"	3-OMe	
2-10	CFMe <sub>2</sub>	"	CH <sub>2</sub> CHMe	-	
2-11	CClMe <sub>2</sub>	"	CH <sub>2</sub> CHMe	-	

表 3

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
3-1	CFMe <sub>2</sub>	2-OMe-c-Pr	A2	-	
3-2	CFMe <sub>2</sub>	2-OEt-c-Pr	A2	-	
3-3	CF <sub>3</sub>	2,2-(OMe) <sub>2</sub> -c-Pr	A2	-	
3-4	CH <sub>2</sub> F	2,2-(OEt) <sub>2</sub> -c-Pr	A2	-	

表 4

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
4-1	i-Pr	c-Bu	A2	-	油状
4-2	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	A2	-	油状
4-3	Me	c-Bu	A2	-	油状
4-4	Et	c-Bu	A2	-	
4-5	Pr	c-Bu	A2	-	
4-6	Bu	c-Bu	A2	-	

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
4-7	Ph	c-Bu	A2	-	
4-8	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	c-Bu	A2	-	
4-9	c-Pr	c-Bu	A2	-	
4-10	i-Pr	c-Bu	A2	3-Cl	油状
4-11	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	A2	3-Cl	油状
4-12	CF <sub>3</sub>	c-Bu	A2	3-Cl	
4-13	CF <sub>3</sub>	c-Bu	A2	-	
4-14	i-Pr	c-Bu	A2	3-Me	油状
4-15	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	A2	3-Me	油状
4-16	CF <sub>3</sub>	c-Bu	A2	3-Me	
4-17	CCl <sub>3</sub>	c-Bu	A2	3-Me	
4-18	Me	c-Bu	A2	2-Me	
4-19	Et	c-Bu	A2	2-Me	
4-20	CH <sub>2</sub> -i-Pr	c-Bu	A2	2-Me	
4-21	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	c-Bu	A2	2,4-Cl <sub>2</sub>	
4-22	CH <sub>2</sub> -Ph	c-Bu	A2	4-NO <sub>2</sub>	
4-23	i-Pr	c-Bu	A2	3-OMe	油状
4-24	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	A2	3-OMe	油状
4-25	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	A2	2-Me	油状
4-26	i-Pr	c-Bu	A2	2-Me	油状
4-27	i-Pr	c-Bu	A2	3-F	油状
4-28	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	A2	3-F	油状
4-29	Me	c-Bu	A2	3-Me	油状

表 5

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
5-1	CFMe <sub>2</sub>	2,2,3,3-F <sub>4</sub> -c-Bu	A2	-	
5-2	CHFMe	"	A2	-	
5-3	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"	A2	-	
5-4	CClMe <sub>2</sub>	"	A2	-	
5-5	i-Pr	"	A2	-	

表 6

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
6-1	CFMe <sub>2</sub>	3-OH-c-Bu	A2	-	
6-2	i-Pr	"	A2	-	
6-3	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-Me	
6-4	CF <sub>3</sub>	"	A2	3-Me	
6-5	Et	"	A2	3,5-Me <sub>2</sub>	
6-6	Et	"	A2	3,5-Me <sub>2</sub>	
6-7	CFMe <sub>2</sub>	3-Ac-c-Bu	A2	-	
6-8	CFMe <sub>2</sub>	3-OCH <sub>3</sub> - C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -c-Bu	A2	-	
6-9	Me	3,3-F <sub>2</sub> -c-Bu	A2	-	
6-10	Pr	"	A2	-	
6-11	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	-	
6-12	Et	"	A2	-	
6-13	CF <sub>3</sub>	"	A2	-	
6-14	CH <sub>2</sub> F	3-Me-c-Bu	A2	-	
6-15	CF <sub>3</sub>	3-Me-c-Bu	A2	-	

表 7

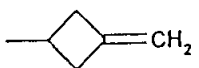
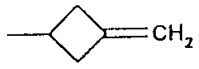
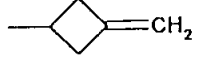
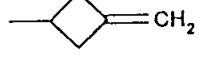

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
7-1	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
7-2	i-Pr		A2	-	
7-3	CF <sub>3</sub>		A2	-	
7-4	CH <sub>2</sub> F		A2	-	
7-5	CClMe <sub>2</sub>		A2	-	

表 8

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
8-1	i-Pr	c-Pentyl	A2	-	oil
8-2	CFMe <sub>2</sub>	c-Pentyl	A2	-	oil

表 9

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
9-1	CH <sub>2</sub> -i-Pr	c-Pr	A2	-	油状
9-2	Et	c-Pr	A2	-	油状
9-3	Me	c-Pr	A2	-	油状
9-4	CMe <sub>2</sub> C≡N	c-Pr	A2	-	油状
9-5	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	A2	3-F	油状
9-6	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	A2	3-CF <sub>3</sub>	油状
9-7	i-Pr	c-Pr	A2	3-Cl	油状
9-8	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	A2	3-Cl	油状
9-9	i-Pr	c-Pr	A2	-	油状

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
9-10	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	A2	-	油状
9-11	i-Pr	c-Pr	A2	3-CF <sub>3</sub>	"
9-12	i-Pr	c-Pr	A2	3-Me	"
9-13	i-Pr	c-Pr	A2	3-OMe	"
9-14	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	A2	3-OMe	"
9-15	CH <sub>2</sub> -i-Pr	c-Pr	A2	3-Me	"
9-16	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	A2	3-Me	"
9-17	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	A2	3,5-Me <sub>2</sub>	"
9-18	i-Pr	c-Pr	A2	3,5-Me <sub>2</sub>	"
9-19	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	c-Pr	A2	-	"
9-20	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CO-	-	"
9-21	i-Pr	c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CO-	-	"
9-22	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CO-	-	"

表 10

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
10-1	CFMe <sub>2</sub>	2,2-Me <sub>2</sub> -c-Pr	A2	-	油状
10-2	i-Pr	"	A2	-	
10-3	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-Cl	
10-4	C(F)(OMe)-CF <sub>3</sub>	"	A2	3-Cl	
10-5	CH <sub>3</sub>	"	A2	2,3-Cl <sub>2</sub>	
10-6	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3,5-F <sub>2</sub>	
10-7	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-F	
10-8	i-Pr	"	A2	3-F	
10-9	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-OMe	
10-10	CF <sub>3</sub>	"	A2	3-OMe	
10-11	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-Me	
10-12	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	"	A2	3-Me	

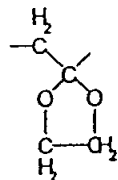
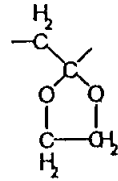
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
10-13	CFMe <sub>2</sub>	"		-	
10-14	CF <sub>3</sub>	"		-	
10-15	CHF <sub>2</sub>	"	CH <sub>2</sub> - CHMe-	-	
10-16	CClMe <sub>2</sub>	"	CH <sub>2</sub> - CHMe-	-	

表 11

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
11-1	CFMe <sub>2</sub>	2,2-F <sub>2</sub> -c-Pr	A2	-	
11-2	CH <sub>3</sub>	"	A2	-	
11-3	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-Cl	
11-4	i-Pr	"	A2	3-Cl	
11-5	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-F	
11-6	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"	A2	3-F	
11-7	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-OMe	
11-8	CH <sub>2</sub> -i-Pr	"	A2	3-OMe	
11-9	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-CF <sub>3</sub>	
11-10	CFMe <sub>2</sub>	"	A2	3-CCl <sub>3</sub>	
11-11	CFMe <sub>2</sub>	"	-CH <sub>2</sub> CHOH-	-	
11-12	C(OMe)Me <sub>2</sub>	"	-CH <sub>2</sub> CHOH-	-	
11-13	CClMe <sub>2</sub>	"	-CH <sub>2</sub> CHOAc-	-	
11-14	Me	"	-CH <sub>2</sub> CHOAc-	-	



表 12

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
12-1	CFMe <sub>2</sub>	2,2-Br <sub>2</sub> -c-Pr	A2	-	
12-2	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	2,2-Br <sub>2</sub> -c-Pr	A2	-	

表 13

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
13-1	Me	c-Hexyl	A2	-	
13-2	CH <sub>2</sub> F	"	A2	-	
13-3	CF <sub>3</sub>	"	A2	3-OH	
13-4	CCl <sub>3</sub>	"	A2	3-OEt	
13-5	CHFMe	"	A2	3-OPh	
13-6	c-Pr	"	A2	-	
13-7	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	"	A2	-	

表 14

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
14-1	Me	Ox	A2	-	
14-2	Et	Ox	A2	-	
14-3	Pr	Ox	A2	-	
14-4	i-Pr	Ox	A2	-	
14-5	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A2	-	
14-6	CF <sub>3</sub>	Ox	A2	3-Cl	
14-7	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A2	3-Cl	
14-8	i-Pr	Ox	A2	3-Cl	
14-9	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A2	3-OMe	
14-10	i-Pr	Ox	A2	3-OMe	
14-11	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A2	3-F	
14-12	i-Pr	Ox	A2	3-F	

表 15

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
15-1	CFMe	1-Me-Ox	A2	-	
15-2	i-Pr	1-Me-Ox	A2	-	
15-3	Me	1-Me-Ox	A2	-	
15-4	c-Pr	1-Me-Ox	A2	-	
15-5	Ox	1-Me-Ox	A2	2-NO <sub>2</sub>	

表 16

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
16-1	n-Pr	1,2-Me <sub>2</sub> -Ox	A2	3-OH	
16-2	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	1,2-Me <sub>2</sub> -Ox	A2	4-OH	
16-3	c-Pr	2-Me-Ox	A2	5-OEt	
16-4	CH <sub>2</sub> -4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-Ox	A2	5-SMe	

表 17

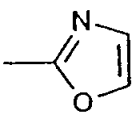
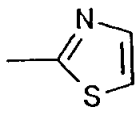
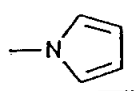
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
17-1	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
17-2	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>		A2	-	
17-3	CH <sub>2</sub> Ph		A2	-	

表 18

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
18-1	CFMe <sub>2</sub>	3-Furyl	A2	-	油状
18-2	i-Pr	3-Furyl	A2	-	油状
18-3	CFMe <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	A2	-	油状
18-4	i-Pr	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	A2	-	油状

表 19


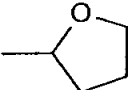
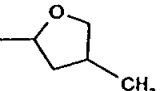

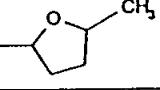
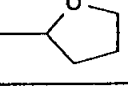
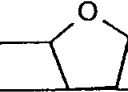
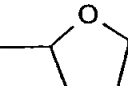
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
19-1	CH <sub>2</sub> - 		A2	2-OH	
19-2	CH <sub>2</sub> -c-Pr		"	-	
19-3	CH <sub>2</sub> - 		"	-	
19-4	C(H)(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		"	-	
19-5	CFMe <sub>2</sub>		"	-	油状
19-6	i-Pr		"	-	油状

表 20

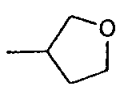
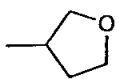
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
20-1	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	油状
20-2	i-Pr		A2	-	油状

表 21

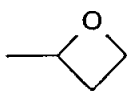
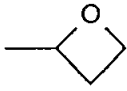
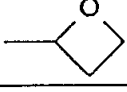
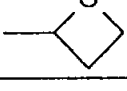
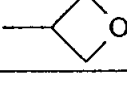
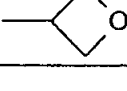
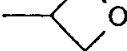
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
21-1	Me		A2	-	
21-2	CF <sub>3</sub>		A2	-	
21-3	CHFMe		A2	-	
21-4	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
21-5	CClMe <sub>2</sub>		A2	-	
21-6	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
21-7	CF <sub>2</sub> Cl <sub>3</sub>		A2	-	

表 22

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
22-1	CHClMe	c-Pr	A3	-	
22-2	CHClMe	c-Pr	"	-	
22-3	CHFMe	c-Pr	"	-	油状

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
22-4	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	c-Pr	"	-	
22-5	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	c-Pr	"	3-NO <sub>2</sub>	
22-6	CF <sub>3</sub>	c-Pr	"	2,4-Cl <sub>2</sub>	油状
22-7	CCl <sub>3</sub>	c-Pr	"	-	
22-8	Me	c-Pr	"	-	油状
22-9	Et	c-Pr	"	-	油状
22-10	Pr	c-Pr	"	-	
22-11	i-Pr	c-Pr	"	-	油状
22-12	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	-	油状
22-13	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	c-Pr	"	-	
22-14	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	2-Cl	
22-15	i-Pr	c-Pr	"	2-Cl	
22-16	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	2,4-Cl <sub>2</sub>	
22-17	i-Pr	c-Pr	"	2,4-Cl <sub>2</sub>	
22-18	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	3-Cl	油状
22-19	i-Pr	c-Pr	"	3-Cl	
22-20	i-Pr	c-Pr	"	3,5-Cl <sub>2</sub>	
22-21	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	3,5-Cl <sub>2</sub>	
22-23	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	2-F	
22-24	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	3-F	油状
22-25	i-Pr	c-Pr	"	3-F	油状
22-26	i-Pr	c-Pr	"	3-Me	油状
22-27	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	3-Me	油状
22-28	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	3,5-Me <sub>2</sub>	油状
22-29	i-Pr	c-Pr	"	3-OMe	油状
22-30	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	"	3-OMe	油状
22-31	CF <sub>3</sub>	c-Pr	"	-	油状

表 23

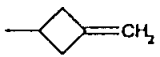
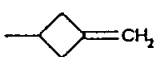
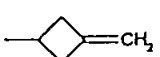
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
23-1	CFMe <sub>2</sub>		A3	-	
23-2	CClMe <sub>2</sub>		A3	-	
23-3	CHFMe		A3	-	

表 24

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
24-1	CFMe <sub>2</sub>	2,2-F <sub>2</sub> -c-Pr	A3	-	
24-2	i-Pr	"	"	-	
24-3	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Cl	
24-4	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3,5-Cl <sub>2</sub>	
24-5	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Me	
24-6	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Br	
24-7	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-F	
24-8	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3,5-F <sub>2</sub>	
24-9	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-OMe	
24-10	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-OH	

表 25

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
25-1	CFMe <sub>2</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-Pr	A3	-	
25-2	CFMe <sub>2</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-Pr	A3	3-Cl	

表 26

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
26-1	CFMe <sub>2</sub>	2,2-Me <sub>2</sub> -c-Pr	A3	-	
26-2	CHMe <sub>2</sub>	"	A3	-	
26-3	CFMe <sub>2</sub>	"	A3	3-F	
26-4	CFMe <sub>2</sub>	"	A3	3-Me	
26-5	CFMe <sub>2</sub>	"	A3	3-OMe	
26-6	CFMe <sub>2</sub>	"	A3	3-Cl	

表 27

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
27-1	Me	2,2,3,3-F <sub>4</sub> -c-Bu	A3	-	
27-2	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -CH <sub>3</sub>	"	A3	-	
27-3	CFMe <sub>2</sub>	"	A3	-	

表 28

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
28-1	Me	c-Bu	A3	-	
28-2	Et	c-Bu	"	-	
28-3	Pr	c-Bu	"	-	
28-4	i-Pr	c-Bu	"	-	油状
28-5	i-Bu	c-Bu	"	-	油状
28-6	CH <sub>2</sub> -i-Pr	c-Bu	"	-	
28-7	CF <sub>3</sub>	c-Bu	"	-	
28-8	CH <sub>2</sub> F	c-Bu	"	-	
28-9	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	c-Bu	"	-	
28-10	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	"	-	油状
28-11	i-Pr	c-Bu	"	4-NO <sub>2</sub>	
28-12	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	"	2-CF <sub>3</sub>	

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
28-13	i-Pr	c-Bu	"	3-Cl	油状
28-14	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	"	3-Cl	油状
28-15	i-Pr	c-Bu	"	3-CF <sub>3</sub>	
28-16	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	"	3-CF <sub>3</sub>	
28-17	i-Pr	c-Bu	"	3-Me	油状
28-18	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	"	3-Me	油状
28-18	i-Pr	c-Bu	"	3-F	
28-19	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	"	3-F	
28-20	i-Pr	c-Bu	"	3-OMe	油状
28-21	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	"	3-OMe	油状
28-22	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	-CH <sub>2</sub> CHNMe <sub>2</sub> -	-	
28-23	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	-CH <sub>2</sub> CHNMe <sub>2</sub> -	-	

表 29

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
29-1	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A3	-	
29-2	i-Pr	Ox	A3	-	
29-3	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A3	3-Cl	
29-4	c-Pr	Ox	A3	3-Cl	
29-5	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A3	3,5-Cl <sub>2</sub>	
29-6	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A3	3-F	
29-7	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A3	3-Me	
29-8	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A3	3-OMe	
29-9	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A3	3-F	
29-10	CFMe <sub>2</sub>	Ox	A3	3,5-F <sub>2</sub>	



表 30

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
30-1	i-Pr	c-Pr	A4	-	油状
30-2	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	A4	-	油状
30-3	CFMe <sub>2</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-Pr	A4	-	
30-4	CF <sub>3</sub>	2,2-F <sub>2</sub> -c-Pr	A4	-	

表 31

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
31-1	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	A4	-	油状
31-2	CF <sub>3</sub>	c-Bu	A4	-	
31-3	i-Pr	c-Bu	A4	-	油状

表 32

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
32-1	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Pr	A2	-	油状
32-2	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	-	油状
32-3	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-Br	
32-4	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-Br	
32-5	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-Cl	油状
32-6	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-Cl	油状
32-7	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-F	
32-8	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-F	
32-9	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-Me	油状
32-10	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-Me	油状
32-11	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-OMe	油状
32-12	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	"	3-OMe	油状
32-13	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CHOMe-	-	

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
32-14	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CHOEt-	-	
32-15	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>2</sub> -c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CHOAc-	-	
32-16	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CHOMe-	-	
32-17	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CH(OCOEt)-	-	
32-18	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CHSMe-	2-Cl	
32-19	CClMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	-CH <sub>2</sub> -CHSEt-	2,5-Cl <sub>2</sub>	

表 33

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
33-1	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -(2,2-F <sub>2</sub> -c-Pr)	A2	-	
33-2	CFMe <sub>2</sub>	"	"	-	油状
33-3	i-Pr	"	"	-	油状
33-4	Et	"	"	-	
33-5	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Cl	
33-6	i-Pr	"	"	3-Cl	
33-7	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-OMe	
33-8	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Me	
33-9	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-F	
33-10	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-I	
33-12	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Br	
33-13	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Cl, 5-F	

表 34

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
34-1	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -(2,2-Cl <sub>2</sub> -c-Pr)	A2		
34-2	i-Pr	"	"		
34-3	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-F	
34-4	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"	"	3-F	
34-5	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Cl	
34-6	CClMe <sub>2</sub>	"	"	3-Cl	
34-7	CFMe <sub>2</sub>	"	"	3-Me	
34-8	Me	"	"	3-Me	

表 35

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
35-1	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Bu	A2	-	
35-2	i-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Bu	"	-	
35-3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Bu	"	-	
35-4	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Bu	"	-	
35-5	CClMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Bu	"	-	
35-6	CHFMe	CH <sub>2</sub> -c-Bu	"	-	

表 36

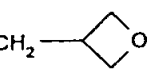
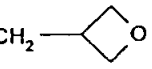
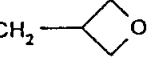
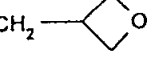
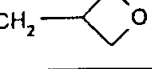
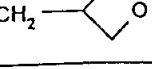
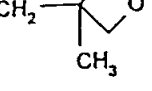
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
36-1	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CHOH-c-Pr	A2	-	
36-2	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CHOH-c-Pr	"	-	
36-3	CFCl <sub>2</sub>	-CHOH-c-Pr	"	-	
36-4	CFMe <sub>2</sub>	-CHOH-c-Pr	"	-	
36-5	CFMe <sub>2</sub>	-CHOH-c-Pr	"	3-Cl	

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
36-7	i-Pr	-CHOH-c-Bu	"	-	
36-8	CFMe <sub>2</sub>	-CHOH-c-Bu	"	-	
36-9	Me	-CHOMe-c-Pr	"	-	
36-10	CF <sub>3</sub>	-CHOMe-c-Bu	"	-	

表 37

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
37-1	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -Ox	A2	-	
37-2	CFMe <sub>2</sub>	"	"	-	
37-3	i-Pr	"	"	-	

表 38

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
38-1	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>2</sub> - 	A2	-	
38-2	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> - 	A2	-	
38-3	CClF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> - 	A2	-	
38-4	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> - 	A2	-	
38-5	i-Pr	CH <sub>2</sub> - 	A2	-	
38-6	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> - 	A2	-	
38-7	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> - 	A2	-	

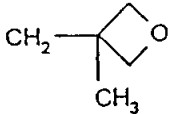
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
38-8	i-Pr		A2	-	

表 39

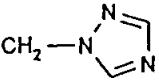
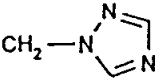
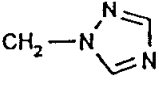
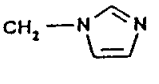
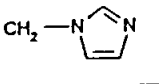

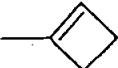
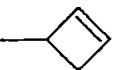
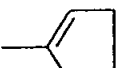
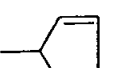
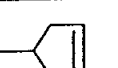



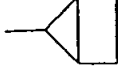
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
39-1	C(F)(OMe)-CF <sub>3</sub>		A2	4-CN	
39-2	CF(OEt)CF <sub>3</sub>		A2	3-OCH <sub>3</sub>	
39-3	CFMe <sub>2</sub>		A2	3-Cl	
39-4	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
39-5	Et		A2	-	

表 40

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
40-1	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -Ox	A3	3-Cl	
40-2	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -Ox	A3	3-Me	
40-3	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -Ox	A3	3-CF <sub>3</sub>	
40-4	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -Ox	A3	3-F	

表 41

化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
41-1	CHMeEt	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Ox	A2	3,5-F <sub>2</sub>	
41-2	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Ox	A2	-	
41-3	CFMe <sub>2</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -c-Pr	A2	-	
41-4	c-Pr	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -c-Pr	A2	2,4-Br <sub>2</sub>	
41-5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHOH-c-Bu	A2	-	
41-6	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>2</sub> CHOH-c-Bu	A2	-	
41-7	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>2</sub> CHOHCH <sub>2</sub> - 	A2	-	
41-8	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -c-Bu	A2	-	
41-9	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
41-10	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
41-11	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
41-12	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
41-13	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
41-14	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
41-15	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
41-16	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	
41-17	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	

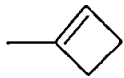
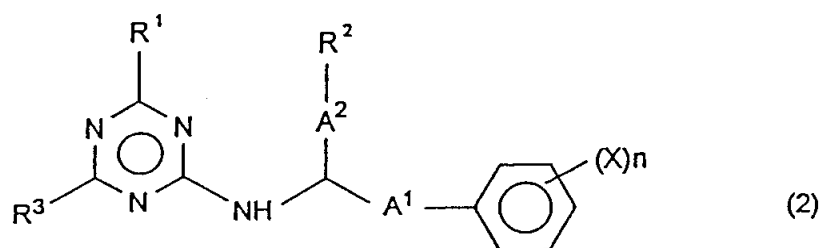
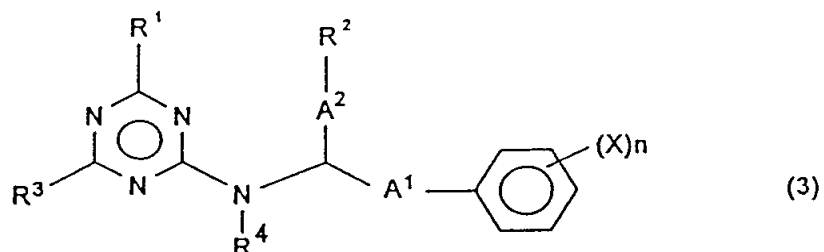
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
41-18	CFMe <sub>2</sub>		A2	-	

表 42: 式 (2) 化合物



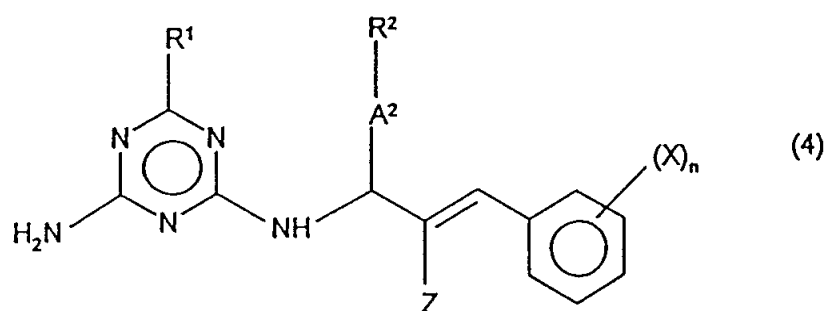
化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
42-1	Me	Ox	Me	A2	-	
42-2	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	Et	A2	2,4-Cl <sub>2</sub>	
42-3	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	i-Pr	A2	-	
42-4	i-Pr	c-Bu	NH-Me	A2	-	
42-5	i-Pr	c-Bu	NH-Et	A2	-	
42-6	Me	CH <sub>2</sub> -c-Bu	NMe <sub>2</sub>	A3	4-Cn	
42-7	Et	CH <sub>2</sub> -c-Bu	NEt <sub>2</sub>	A3	4-Et	
42-8	Me	c-Bu	H	A3	4-i-Pr	
42-9	Et	c-Bu	H	A3	4-c-Pr	
42-10	CFMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	NHAc	A2	-	
42-11	CClMe <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -c-Pr	NHCOEt	A2	-	
42-12	CH <sub>2</sub> -c-Pr	CH <sub>2</sub> -c-Bu	NHCOPh	A2	-	

表 43: 式 (3) 化合物



化合物号	R <sup>1</sup>	-A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	A <sup>1</sup>	(X) <sub>n</sub>	物理数据
43-1	CH(OMe)Me	c-Pentyl	NH <sub>2</sub>	NHAc	A2	-	
43-2	CH(OEt)Me	c-Pentyl	NH <sub>2</sub>	NHCHO	A2	-	
43-3	CMe <sub>2</sub> CN	c-Bu	NH <sub>2</sub>	NHCOEt	A2	-	
43-4	CMe <sub>2</sub> -SMe	c-Bu	NH <sub>2</sub>	Et	A2	-	
43-5	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	NH <sub>2</sub>	Me	A2	-	
43-6	CHFMe	c-Pr	NH <sub>2</sub>	n-Pr	A3	-	
43-7	CHClMe	c-Pr	NH <sub>2</sub>	n-Bu	A3	-	

表 44: 式 (4) 化合物



化合物号	R <sup>1</sup>	A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	X <sub>n</sub>	Z	物理数据
44-1	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	-	H	油状
44-2	i-Pr	c-Pr	-	H	油状
44-3	Me	c-Pr	-	H	
44-4	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	3-Cl	H	



化合物号	R <sup>1</sup>	A <sup>2</sup> -R <sup>2</sup>	X <sub>n</sub>	Z	物理数据
44-5	i-Pr	c-Pr	3-Cl	H	
44-6	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	3-CH <sub>3</sub>	H	
44-7	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	3-CH <sub>3</sub>	H	
44-8	CHFMe	c-Pr	-	Br	
44-9	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	-	Br	
44-10	i-Pr	c-Pr	-	Br	
44-11	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	-	Cl	
44-12	i-Pr	c-Pr	-	Cl	
44-13	CHFCH <sub>3</sub>	c-Pr	-	Cl	
44-14	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	-	H	
44-15	i-Pr	c-Bu	-	H	
44-16	CFMe <sub>2</sub>	i-Bu	-	Cl	
44-17	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	-	Br	
44-18	CHFCH <sub>3</sub>	t-Bu	-	Cl	
44-19	CHFCH <sub>3</sub>	t-Bu	-	Br	
44-20	CFMe <sub>2</sub>	c-Pr	-	Me	
44-21	CH <sub>3</sub>	c-Pr	-	Me	
44-22	CFMe <sub>2</sub>	c-Bu	-	Me	

个别实施例的 NMR 数据:

实施例 4—2:

$^1\text{H-NMR(DMSO-d}_6\text{)} : \delta =$   
1.5 (s,3H) ,1.6 (s,3H),  
1.5 – 2.0 (m), 2.4 – 2.6(m),  
4.0 (m,1H) , 7.2 (m, 5H)

实施例 4—28:

$^1\text{H-NMR(CDCl}_3\text{)} :$   
1.6 (s,3H) ,1.7 (s,3H),  
1.5 – 1.9 (m, ), 2.4(m,2H),  
2.6 – 2.7 (m,2H) , 4.1 (m, 1H),  
4.1 (m, 1H),6.8-7.0(m,3H),  
7.2(m,1H)

实施例 18—1:

$^1\text{H-NMR(DMSO-d}_6\text{)} : \delta =$   
1.5 (s,3H) ,1.6 (s,3H),  
1.7 – 2.1(m,2H),  
2.5 – 2.6 (m,2H) , 5.0 (m, 1H),  
7.2-7.7(m,8H)

实施例 20—1:

$^1\text{H-NMR(CDCl}_3\text{)} : \delta =$   
1.5 (s,3H) ,1.6 (s,3H),  
1.6 – 2.4(m,5H),  
2.5 – 2.8 (m,2H) ,  
3.6-3.9(m,4H),4.2m(1H),

7.2m(5H)

实施例 22—3:

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-d}_6)$  :  $\delta =$   
0.1 (m,1H) ,0.3 (m,2H),  
0.4 (m,1H), 0.9(m, 1H),  
1.5 (s,3H) ,1.6(s,3H),  
3.5m(1H), 7.1-7.3(m,5H)

实施例 22—25:

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$  :  $\delta =$   
0.2-0.6 (m,4H) ,0.8 (m,1H),  
1.2 (d,6H), 1.6-1.8(m, 4H),  
2.5-2.7 (m,2H) ,3.5m(1H),  
6.9(m,3H), 7.2m(1H)

实施例 28—10:

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO-d}_6)$  :  $\delta =$   
1.5 (s,3H) , 1.6 (s,3H),  
1.5-1.9 (m), 2.6(m),  
4.0 (m,1H) ,(m,1H),  
7.1-7.3(5H)

实施例 30—2:

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$  :  $\delta =$   
0.2-0.6 m(4H) ,  
0.8-1.0 (m,3H), 1.4m(2H),  
1.5 (s,3H) ,1.7(s,3H),  
2.6(t,2H), 3.5(m,1H),

7.1-7.3(m,5H)

实施例 32—12:

$^1\text{H-NMR(DMSO-d}_6\text{)} : \delta =$   
0.1 (m,2H), 0.4 (m,2H),  
0.7m(1H), 1.2(d,6H),  
1.4(m,3H), 1.8(m,2H),  
2.5-2.7m (2H), 3.7(m,3H),  
4.0 (m,1H), 6.7(m,3H),  
7.2(m,1H)

实施例 33—3:

$^1\text{H-NMR(DMSO-d}_6\text{)} : \delta =$   
1.1 (d,6H), 1.5-1.9 (m),  
2.5-2.7(m), 4.1(m,1H),  
7.1-7.3(m,5H)

实施例 44—1:

$^1\text{H-NMR(DMSO)} : \delta =$   
0.2-0.6(4H), 1.0(m, 1H),  
1.5 (m,3H), 1.6(m, 3H),  
4.1(m, 1H), 6.3(dd,1H),  
6.5(d,1H),7.2-7.4(m,5H)

## B. 制剂实施例

a) 一种粉末剂是通过混合 10 重份的式(I)化合物及 90 重份作为惰性物质的滑石、及在锤磨机中磨碎混合物而得到。

b) 一种在水中易于分散、润湿的粉剂是通过混合 25 重份的式(I)化合物, 64 重份作为惰性物质的含高领土的石英, 10 重份的木素磺酸

钾及 1 重份作为湿润剂及分散剂的油酰甲基牛磺酸钠盐、及在盘磨碎机中磨碎混合物而得到的。

c) 一种在水中易于分散的浓分散体是通过混合带有 6 重份烷基酚聚乙二醇醚<sup>®</sup> Triton X 207)的 20 重份式(I)化合物, 3 重份的异三十醇聚乙二醇醚(8EO)及 71 重份的石蜡矿物油(沸点范围例如为 255 至大于 277°C)、及在球磨碎机中磨碎混合物以得到小于 5 微米的粉末而得到的。

d) 一种乳油是从 15 重份式(I)化合物, 75 重份作为溶剂的环己酮及 10 重份作为乳化剂的乙氧化的壬基酚制得的。

e) 一种在水中可分散的颗粒剂是通过混合

75 重份式(I)化合物,

10 重份的木素磺酸钙,

5 重份的月桂基硫酸钠盐,

3 重份的聚乙烯醇及

7 重份的高岭土,

并在盘磨碎机中磨碎混合物并使粉末造粒, 它是在流化床中通过喷雾作为颗粒化液的水而造粒的。

f) 还可得到一种在水中可分散的颗粒剂, 通过在胶体研磨机中使下列物质均质化及预先研成粉,

25 重份式(I)化合物,

5 重份 2, 2'-二奈基甲烷-6, 6'-二磺酸钠,

2 重份油酰甲基牛磺酸钠盐,

1 重份聚乙烯醇,

17 重份碳酸钙,

50 重份水,

随后在珠磨机中研磨混合物, 通过单一物质喷嘴在喷雾塔中使得到的悬浮液粉化并干燥。

### C. 生物实施例

## 1. 苗前对野草的影响

单子叶及双子叶野草植物的种子或根茎部分被放置在塑胶盆中的沙质土壤中，用土壤覆盖。然后，配制成可润湿的粉剂或乳油的本发明化合物以水悬浮液或乳液方式被施用至覆盖土壤的表面，其施用量为 600 至 800 升水/公顷，浓度各不相同。

处理后，盆被放置在对杂草保持良好的生长条件的温室中。试验植物萌芽后，在 3 至 4 个星期试验期后，通过比较未处理的对照组，对植物的损害或对发芽的副作用作目测评分。如试验结果所示，依据本发明的化合物对广谱的野草及双子叶野草具有良好的除草性苗前作用。例如，实施例 4-1, 4-2, 4-3,

4-10, 4-11, 4-14, 4-15, 4-23, 4-24, 4-25, 4-26, 4-27,  
4-28, 4-29, 8-1, 8-2, 9-1, 9-2, 9-3, 9-4, 9-5, 9-6, 9-7, 9-8, 9-9, 9-10, 9-11,  
9-12, 9-13, 9-14, 9-15, 9-16, 9-17, 9-18, 9-19, 10-1, 18-1, 18-2, 18-3, 18-4,  
19-5, 19-6, 20-1, 20-2, 22-3, 22-6, 22-8, 22-9, 22-11, 22-12, 22-18, 22-24,  
22-25, 22-26, 22-27, 22-28, 22-29, 22-30, 33-31, 28-4, 28-5, 28-10, 28-13,  
28-14, 28-17, 28-18, 28-20, 28-21, 30-1, 30-2, 31-1, 31-2, 31-3, 32-1, 32-2,  
32-5, 32-6, 32-9, 32-10, 32-11, 32-12, 33-2, 33-4,

44-1 及 44-2 (见表 1 至 44) 在试验中显示具有良好的除草作用以抵抗有害植物如繁缕 (鹅肠草)、多花黑麦草、反枝苋 (西风谷)、白芥 (欧白芥)、燕麦及紫穗狗尾草，其施用量为每一公顷用 1 公斤或较少的活性物质作苗前施用。

## 2. 苗后对杂草的影响

单子叶及双子叶杂草植物的种子或根茎部分被放置在塑胶盆中的沙质土壤中，用土壤覆盖，在良好生长条件下于温室中生长。播种 3 星期后，试验植物在三叶阶段时被处理。以可喷洒粉剂或乳油形式配制的本发明化合物以不同剂量喷雾至植物的绿色部分，其施用量为 600 至 800 升水/公顷。试验植物维持在温室良好生长条件下约 3 至 4 星期，通过比较未处理的对照组，评估制剂的影响。依据本发明的试剂对广谱的经济上重要的杂草及双子叶杂草具有良好的除草性苗后作用。例如，实施例号 4-1, 4-2, 4-3, 4-10, 4-11, 4-14, 4-15, 4-23, 4-24, 4-25, 4-26, 4-27, 4-28, 4-29, 8-1, 8-2, 9-1, 9-2, 9-3, 9-4, 9-5, 9-6, 9-7, 9-8, 9-9, 9-10, 9-11, 9-12, 9-13, 9-14, 9-15, 9-16, 9-17, 9-18, 9-19, 10-1, 18-1, 18-2, 18-3, 18-4, 19-5, 19-6, 20-1, 20-2, 22-3, 22-6, 22-8, 22-9, 22-11, 22-12, 22-18, 22-24, 22-25, 22-26, 22-27, 22-28, 22-29, 22-30, 33-31, 28-4, 28-5, 28-10, 28-13, 28-14, 28-17, 28-18, 28-20, 28-21, 30-1, 30-2, 31-1, 31-2, 31-3, 32-1, 32-2, 32-5, 32-6, 32-9, 32-10, 32-11, 32-12, 33-2, 33-4, 44-1 及 44-2 (见表 1 至 43) 化合物在试验中显示良好的除草作用，以抵抗有害植物如白芥(欧白芥)、西来稗(锡兰稗)、多花黑麦草、繁缕(鹅肠草)、碎米莎草、反枝苋(西风谷)、紫穗狗尾草及燕麦，其施用率为每一公顷用 1 公斤或较少的活性物质施用至苗后。

## 3. 对水稻中有害植物的影响

移植的水稻及典型宽叶及单子叶水稻杂草在水稻生长条件(水深: 2—3 公分)下，在密封的塑胶盆中于温室中生长至 3 叶阶段(稗 1.5 叶)。然后，其用本发明化合物处理。为此目的，配制的活性物质被悬浮、溶解或乳化于水中及通过倒入灌溉水中以不同的剂量施用。处理后，试验植物放置于良好温室条件下及保持至整个试验时期。

约施用 3 星期后，通过与未处理的对照组比较，对植物的损害作外表上的评分而评估试验。依据本发明的试剂具有以抵抗有害植物的良好作用。例如，实施例化合物 4—1, 4—2, 4—14, 4—15, 4—23,

4—24, 9—4, 9—5, 9—9, 9—7 及 9—10(见表 1 至 44)在试验中显示良好的除草作用以抵抗对稻米耕种视为典型的有害植物, 如莎草、稗及矮慈姑。

#### 4. 农作物的耐受力

在另外的温室试验, 较大量的农作物及野草种子被放置于沙质土壤及用土壤覆盖。某些盆立刻如前面一段中所述处理, 剩余的盆被放置于温室中, 直到植物生长至 2 至 3 叶, 然后用不同剂量的本发明式(I)物质喷洒, 如第 2 段所述。施用后 4 至 5 星期作外表评估, 植物在温室中表明本发明化合物并未对双子叶作物如大豆、棉花、欧洲油菜、甜菜及马铃薯造成损害, 苗前及苗后使用时, 甚至当使用高剂量的活性物质时也如此。再者, 一些物质亦对禾本科作物如大麦、小麦、裸麦、蜀黍、玉蜀黍或水稻有好的作用。一些式(I)化合物具有高选择性且因此适宜于控制农作物的不希望的生长。