

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07D251/48

C07D251/42 C07C279/26

A01N 43/68



[12] 发明专利说明书

[21] ZL 专利号 98813503.5

[45] 授权公告日 2004 年 8 月 4 日

[11] 授权公告号 CN 1160341C

[22] 申请日 1998.11.28 [21] 申请号 98813503.5

[30] 优先权

[32] 1997.12.11 [33] DE [31] 19755016.9

[86] 国际申请 PCT/EP1998/007691 1998.11.28

[87] 国际公布 WO1999/029677 德 1999.6.17

[85] 进入国家阶段日期 2000.8.4

[71] 专利权人 拜尔公司

地址 德国莱沃库森

共同专利权人 日本拜耳农药株式会社

[72] 发明人 K·福格特 H·-J·里贝尔

S·莱尔 A·伦德 R·基尔斯滕

M·多林格 M·-W·德鲁斯

I·维特乔洛夫斯基 渡边幸喜

五岛敏男 R·A·迈尔斯

审查员 吴顺华

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

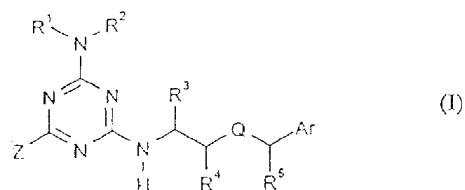
代理人 周慧敏

权利要求书 6 页 说明书 95 页

[54] 发明名称 取代的 2,4-二氨基-1,3,5-三嗪类

[57] 摘要

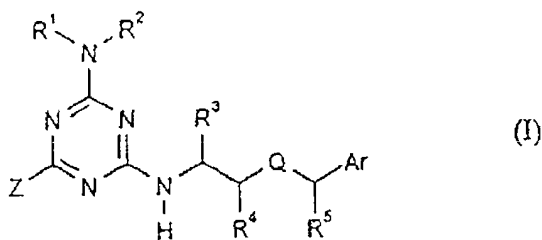
本发明涉及新的通式(I)的取代的 2,4-二氨基-1,3,5-三嗪,其中 Q 表示 O(氧)、S(硫)、SO、SO₂、NH 或 N(烷基),R¹表示氢或任选取代的烷基,R²表示氢、甲酰基或各个任选取代的烷基、烷基羰基、烷氧基羰基或烷基氨基羰基,R³表示各个任选取代的烷基或环烷基,R⁴表示氢或烷基,R⁵表示氢或烷基,Ar 表示任选取代的芳基或杂芳基,及 Z 表示氢、氰基、卤素或各个取代的烷基、烷氧基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、链烯基、链炔基或环烷基。本发明还涉及它们的制备方法和新的中间产物、它们的生产以及涉及它们作为除草剂的用途。



(I)

1. 通式(I)的取代的 2,4-二氨基-1,3,5-三嗪类

5



10

其中

Q 表示 O、S 或 SO₂,R¹ 表示氢,R² 表示氢、甲酰基或表示在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基羰基,R³ 表示具有 1-6 个碳原子的烷基或表示具有 3-6 个碳原子的环烷基,

15

R⁴ 表示氢,R⁵ 表示氢,

Ar 表示在每种情况下任选取代的苯基、四氢萘基或杂芳基,

其中可能的杂芳基选自下列基团:

噻吩基、噻唑基、异噻唑基,

20

且其中在每种情况下可能的取代基选自下列基团:

氰基、卤素, 在每种情况下任选卤素-取代的、在每种情况下具有 1-6 个碳原子的烷基或烷氧基, 或者苯基或苯氧基, 以及在每种情况下任选卤素-取代的亚甲基二氧基或亚乙基二氧基, 及

25

Z 表示在每种情况下任选羟基-或卤素取代的、在其烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基, 或表示任选卤素-取代的具有 3-6 个碳原子的环烷基。

2. 权利要求 1 的式(I)化合物, 其特征在于, 其中,

Q 表示 O 或 S,

R¹ 表示氢,

R^2 表示氢、甲酰基或表示乙酰基、丙酰基、正-或异-丁酰基,

R^3 表示乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔丁基或表示环丙基、环丁基、环戊基或环己基,

R^4 表示氢,

5 R^5 表示氢,

Ar表示在每种情况下任选取代的苯基、四氢萘基或杂芳基,

其中可能的杂芳基选自下列基团:

噻吩基、噻唑基、异噻唑基,

且其中在每种情况下可能的取代基选自下列基团:

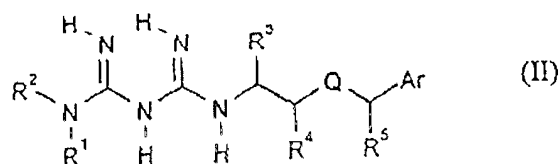
10 氰基、氟、氯、溴,在每种情况下任选氟-或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基,甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、正-、异-、仲-或叔-丁氧基,或者苯基或苯氧基,及在每种情况下任选氟-或氯-取代的亚甲基二氧基或亚乙基二氧基,

和

15 Z表示在每种情况下任选羟基-、氟-或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基,或表示任选氟-或氯-取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

3. 制备权利要求1的式(I)的取代的2,4-二氨基三嗹的方法,其特征在于

20 (a) 如果合适的话,在反应助剂存在下和如果合适的话,在稀释剂存在下,使通式(II)的双胍和/或通式(II)的化合物的酸加合物



30 其中

Q、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和 Ar 如权利要求 1 所定义，与通式(III)的烷
氧基羰基化合物反应



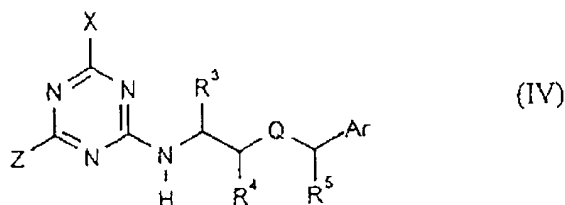
5 其中

Z 如权利要求 1 所定义和

R'表示烷基，

或其特征在于

10 (b) 如果合适的话，在反应助剂存在下和如果合适的话，在稀释剂存
在下，使通式(IV)的取代的卤代三嗪



15

其中

Q、R³、R⁴、R⁵、Ar 和 Z 如上所定义和

X 表示卤素，与通式(V)的氮化合物反应

20



25

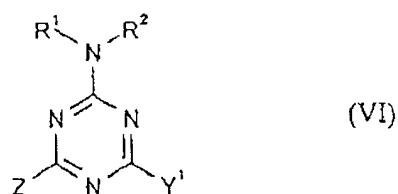
其中

R¹和 R²如上所定义，

或其特征在于

30 (c) 如果合适的话，在反应助剂存在下和如果合适的话，在稀释剂存
在下，使通式(VI)的取代的氨基三嗪

5

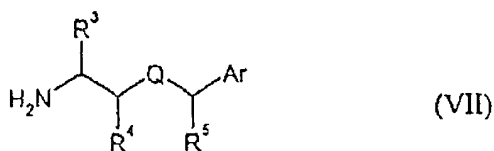


其中

R¹、R²和Z如上所定义和

Y¹表示卤素或烷氧基，与通式(VII)的取代的烷基胺反应

10



15

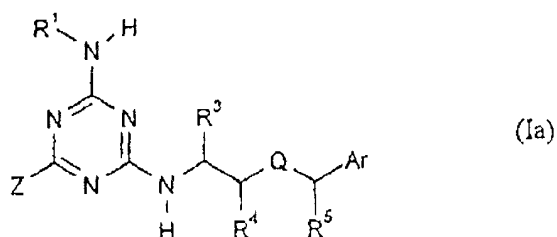
其中

Q、Ar、R³、R⁴和R⁵如上所定义，

或其特征在于

(d) 如果合适的话，在反应助剂存在下和如果合适的话，在稀释剂存在下，使通式(Ia)的取代的2,4-二氨基-1,3,5-三嗪

25



其中

Q、R¹、R³、R⁴、R⁵、Ar和Z如上所定义，与通式(VIII)的烷基化剂或酰化剂反应

30



其中

R^2 如上所定义,除了不表示氢外,和

5 Y^2 表示卤素、 $-O-R^2$ 或 $-O-CO-R^2$,

及用常规方法对在(a)、(b)、(c)或(d)中所述方法获得的通式(I)的化合物进行在上述定义的取代基范围内的其它转化。

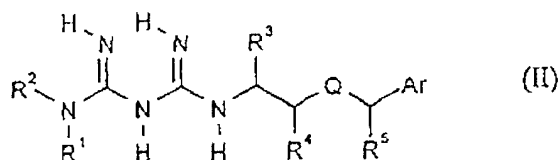
4. 除草剂组合物,其特征在于它们包括至少一种根据权利要求1的式(I)化合物。

10 5. 根据权利要求1的式(I)化合物用于控制不需要的植被的用途。

6. 除草的方法,其特征在于,让根据权利要求1的式(I)化合物作用于杂草或其生境(habitat)。

7. 制备除草剂组合物的方法,其特征在于,将根据权利要求1的式(I)化合物与补充剂和/或表面活性剂混合。

15 8. 通式(II)的双胍



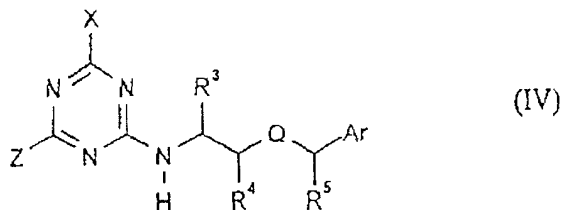
20

其中

Q 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 Ar 如权利要求1所定义,和通式(II)的化合物的酸加合物。

9. 通式(IV)的取代的卤代三嗪

25



30

其中

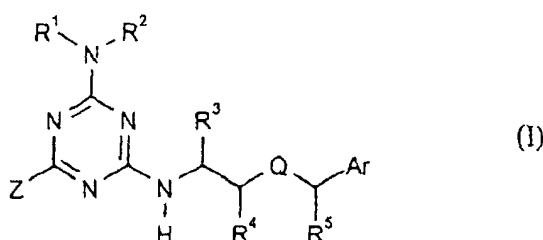
Q、R³、R⁴、R⁵、Ar 和 Z 如权利要求 1 中所定义和
X 表示卤素。

取代的 2,4-二氨基-1,3,5-三嗪类

- 5 本发明涉及新的取代的 2,4-二氨基-1,3,5-三嗪类, 涉及它们的制备方法和新的中间体以及涉及它们作为除草剂的用途。

从(专利)文献(参考 EP-273328, EP-411153/WO 90/09378)已经得知许多取代的芳氧基烷基氨基三嗪类。然而, 迄今为止, 这些化合物尚没有任何特殊的重要意义。

- 10 本发明现提供通式(I)的新的取代的 2,4-二氨基-1,3,5-三嗪类

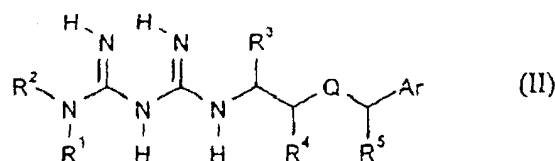


其中

- Q 表示 O(氧)、S(硫)、SO、SO₂、NH 或 N(烷基),
 R¹ 表示氢或任选取代的烷基,
 R² 表示氢、甲酰基或表示在每种情况下任选取代的烷基、烷基羰基、
 15 烷氧基羰基或烷基氨基羰基,
 R³ 表示在每种情况下任选取代的烷基或环烷基,
 R⁴ 表示氢或烷基,
 R⁵ 表示氢或烷基,
 Ar 表示在每种情况下任选取代的芳基或杂芳基, 及
 20 Z 表示氢、氟基、卤素或表示在每种情况下任选取代的烷基、烷氧基、
 烷基羰基、烷氧基羰基、烷基硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、链烯基、
 链炔基或环烷基。

在下列反应中可获得新的通式(I)的取代的 2,4-二氨基三嗪类化合物,

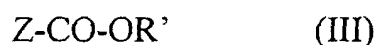
(a) 如果合适的话, 在反应助剂存在下和如果合适的话, 在稀释剂存在下, 使通式(II)的双胍和/或通式(II)的化合物的酸加合物



其中

Q、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和Ar如上所定义, 与通式(III)的烷氧基羰基

5 化合物反应



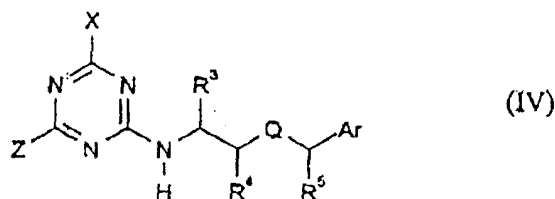
其中

Z如上所定义和

R'表示烷基,

10 或当

(b) 如果合适的话, 在反应助剂存在下和如果合适的话, 在稀释剂存在下, 使通式(IV)的取代的卤代三嗪



其中

Q、R³、R⁴、R⁵、Ar和Z如上所定义和

15 X表示卤素, 与通式(V)的氮化合物反应



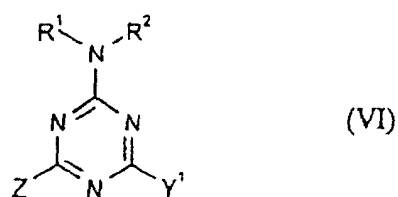
其中

R¹和R²如上所定义,

或当

(c) 如果合适的话, 在反应助剂存在下和如果合适的话, 在稀释剂存在

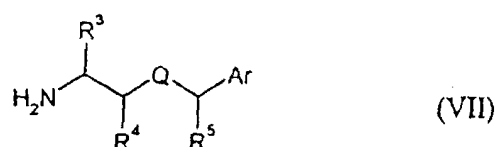
20 下, 使通式(VI)的取代的氨基三嗪



其中

R^1 、 R^2 和 Z 如上所定义和

Y^1 表示卤素或烷氧基, 与通式(VII)的取代的烷基胺反应

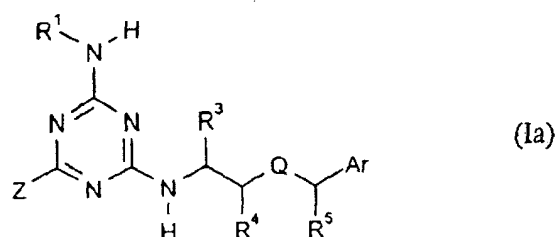


其中

5 Q 、 Ar 、 R^3 、 R^4 和 R^5 如上所定义,

或当

(d) 如果合适的话, 在反应助剂存在下和如果合适的话, 在稀释剂存在下, 使通式(Ia)的取代的2,4-二氨基-1,3,5-三嗪



其中

10 Q 、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Ar 和 Z 如上所定义, 与通式(VIII)的烷基化剂或酰化剂反应



其中

R^2 如上所定义, 除了不表示氢外, 和

15 Y^2 表示卤素、 $-O-R^2$ 或 $-O-CO-R^2$,

及对用在(a)、(b)、(c)或(d)中所述方法获得的通式(I)的化合物, 通过常规方法进行在上述定义的取代基范围内的其它转化。

新的通式(I)的取代的2,4-二氨基-1,3,5-三嗪类化合物具有强烈的

和选择性的除草剂活性。

根据本发明的通式(I)的化合物至少含有一个不对称取代的碳原子, 因而可以以不同的对映体形式(R-和 S-构型)和/或非对映体形式存在。本发明涉及通式(I)化合物的各种可能的单独对映体形式或立体异构体形式和涉及这些异构体化合物的混合物。

在这些定义中, 所述烃链, 如烷基-包括与杂原子结合的, 如烷氧基或烷硫基-在每种情况下可为直链或支链。卤素一般表示氟、氯、溴或碘, 优选氟、氯或溴, 尤其是氟或氯。

本发明优选提供式(I)的化合物, 其中

- 10 Q 表示 O(氧)、S(硫)、SO、SO₂、NH 或 N(C₁-C₄-烷基),
R¹ 表示氢或表示任选羟基-、氟基-、卤素-或具有 1-6 个碳原子的 C₁-C₄-烷氧基-取代的烷基,
R² 表示氢、甲酰基或表示在每种情况下任选氟基-、卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的在每种情况下在烷基部分具有 1-6 个碳原子的烷基、烷基羰基、烷氧基羰基或烷基氨基羰基,
15 R³ 表示任选羟基-、氟基-、卤素-或具有 1-6 个碳原子的 C₁-C₄-烷氧基-取代的烷基或表示任选氟基-、卤素-或具有 3-6 个碳原子的 C₁-C₄-烷基-取代的环烷基,
R⁴ 表示氢或具有 1-4 个碳原子的烷基,
20 R⁵ 表示氢或具有 1-4 个碳原子的烷基,
Ar 表示在每种情况下任选取代的苯基、萘基、四氢萘基或杂芳基, 其中可能的杂芳基选自下列基团:
呋喃基、苯并呋喃基、噻吩基、苯并噻吩基、噻唑基、苯并噻唑基、咪唑基、苯并咪唑基、异噻唑基、噻二唑基、咪二唑基、吡唑基、咪唑基、吡咯基、吡啶基、嘧啶基,
25 且其中在每种情况下可能的取代基选自下列基团:
羟基、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、硝基、卤素, 在每种情况下任选羟基-、氟基-或卤素-取代的烷基或烷氧基(在每种情况下具有

- 1-6 个碳原子), 在每种情况下任选卤素-取代的烷基羰基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、二烷基氨基、烷基羰基氨基、烷基磺酰基氨基、双-烷基羰基-氨基、双-烷基磺酰基-氨基、N-烷基-N-烷基羰基-氨基或 N-烷基-N-烷基磺酰基-氨基(在每种情况下在其烷基部分具有 1-6 个碳原子), 在每种情况下任选羟基-、氟基-、硝基-、卤素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-卤代烷基-、C₁-C₄-烷氧基-或 C₁-C₄-卤代烷氧基-取代的苯基或苯氧基, 以及在每种情况下任选卤素-取代的亚甲基二氧基或亚乙基二氧基, 及
- 5 Z 表示氢、氟基、卤素, 表示在每种情况下任选羟基-、氟基-、卤素-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-烷基-羰基-、C₁-C₄-烷氧基-羰基-、C₁-C₄-烷硫基-、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-或 C₁-C₄-烷基磺酰基-取代的烷基、烷氧基、烷基羰基、烷氧基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基(在每种情况下在其烷基部分具有 1-6 个碳原子), 表示在每种情况下任选氟基-、卤素-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的链烯基或链炔基(在每种情况下在其链烯基或链炔基中具有 2-4 个碳原子), 或表示任选氟基-、卤素-或 C₁-C₄-烷基-取代的具有 3-6 个碳原子的环烷基。
- 10 15

从优选的以上定义的通式(I)的化合物中, 特别强调下列基团:

- (A) 其中 Q、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 和 Z 如上所定义且 Ar 表示在每种情况下任选取代的苯基或萘基的式(I)化合物, 其中可能的取代基如上所
- 20 定义;
- (B) 其中 Q、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 和 Z 如上所定义且 Ar 表示任选取代的杂环基的式(I)化合物, 其中可能的杂环基和可能的取代基如上所定义。

本发明具体涉及式(I)的化合物, 其中

- 25 Q 表示 O(氧)、S(硫)或 NH,
- R¹ 表示氢或表示在每种情况下任选羟基-、氟基-、氟-、氯-、甲氧基-或乙氧基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基,
- R² 表示氢、甲酰基或表示在每种情况下任选氟基-、氟-、氯-、溴-、甲

- 氧基-或乙氧基-取代的甲基、乙基、乙酰基、丙酰基、正-或异-丁酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基、甲基氨基羰基、乙基氨基羰基、正-或异-丙基氨基羰基，
- R^3 表示在每种情况下任选羟基-、氟基-、氟-、氯-、甲氧基-或乙氧基-取代的乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基或表示在每种情况下任选氟基-、氟-、氯-、甲基-或乙基-取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基，
- R^4 表示氢或甲基，
- R^5 表示氢或甲基，
- 10 Ar表示在每种情况下任选取代的苯基、萘基、四氢萘基或杂芳基，其中可能的杂芳基选自下列基团：
- 呋喃基、苯并呋喃基、噻吩基、苯并噻吩基、噻唑基、苯并噻唑基、噁唑基、苯并噁唑基、异噁唑基、噻二唑基、噁二唑基、吡唑基、咪唑基、吡咯基、吡啶基、嘧啶基，
- 15 且其中在每种情况下可能的取代基最好选自下列基团：
- 羟基、氟基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、硝基、氟、氯、溴，在每种情况下任选羟基-、氟基-、氟-或氯-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基，甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、正-、异-、仲-或叔-丁氧基，在每种情况下任选氟-或氯-取代的乙酰基、丙酰基、正-或异-丁酰基，甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基、甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异-丙基亚磺酰基，甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异-丙基磺酰基，二甲基氨基、二乙基氨基、乙酰基氨基、丙酰基氨基、甲基磺酰基氨基、乙基磺酰基氨基、双-乙酰基-氨基、双-甲基磺酰基-氨基、N-甲基-N-乙酰基-氨基或N-甲基-N-甲基磺酰基氨基，在每种情
- 25 况下任选羟基-、氟基-、硝基-、氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正-或异-丙基-、正-、异-、仲-或叔-丁基-、三氟代甲基-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、正-、异-、仲-或叔-丁氧基-、二氟甲氧基-或三氟甲

氧基-取代的苯基或苯氧基, 及在每种情况下任选氟-或氯-取代的亚甲基二氧基或亚乙基二氧基,

和

- 5 Z表示氟、氯、溴, 表示在每种情况下任选羟基-、氟基-、硝基-、氟-、氯-、甲氧基-、乙氧基-、正-或异-丙氧基-、正-、异-、仲-或叔-丁氧基-、甲硫基-、乙硫基-、正-或异-丙硫基-、甲基亚磺酰基-、乙基亚磺酰基-、正-或异-丙基亚磺酰基-、甲基磺酰基-、乙基磺酰基-、正-或异-丙基磺酰基-取代的甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、甲氧基、乙氧基、正-或异-丙氧基、正-、异-、仲-或叔-丁氧基、
- 10 甲硫基、乙硫基、正-或异-丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正-或异-丙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正-或异-丙基磺酰基, 表示在每种情况下任选氟基-、氟-、氯-、溴-、甲氧基-或乙氧基-取代的乙烯基、丙烯基、丁烯基、乙炔基、丙炔基或丁炔基, 或表示在每种情况下任选氟基-、氟-、氯-、甲基-或乙基-取代的环丙基、环丁基、环戊基或环己基。
- 15

从特别优选的以上定义的式(I)的化合物中, 特别强调下列基团:

- (A') 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 Z 如上所定义, Q 表示 O(氧)和 Ar 表示在每种情况下任选取代的苯基或萘基的式(I)化合物, 其中可能的取代基如上所定义, 条件是 R^3 连接的碳原子上的取代基以 R 构型排列;
- 20

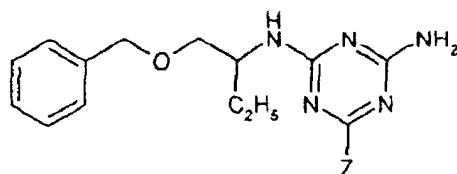
(B') 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 Z 如上所定义, Q 表示 O(氧)和 Ar 表示在每种情况下任选取代的苯基或萘基的式(I)化合物, 其中可能的取代基如上所定义, 条件是 R^3 连接的碳原子上的取代基以 S 构型排列。

- 25 上述一般的或优选的基团定义应用于式(I)的终产物且在每种制备情况下相应地应用于所需的原料或中间体。这些基团定义可以按照愿望相互结合, 即包括在给定的优选范围内的结合。

根据本发明的式(I)化合物的实例列于下面各组中。在此, 所述通

式表示在每种情况下 R 对映体, S 对映体和外消旋体。

组 1



在此, Z 具有例如在下表给定的意义:

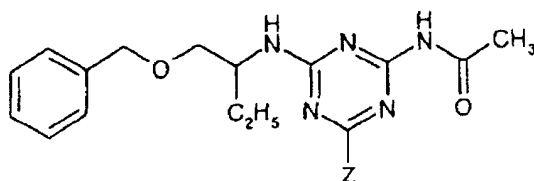
- 甲基、乙基、正-或异-丙基、正-、异-、仲-或叔-丁基、氟代甲基、二
 5 氟代甲基、三氟代甲基、氯代甲基、二氯代甲基、氯代氟代甲基、氯
 代溴代甲基、氯代二氟代甲基、氟代二氯代甲基、溴代二氟代甲基、
 三氯代甲基、1-氟代乙基、2-氟代乙基、1-氯代乙基、2-氯代乙基、1-
 溴代乙基、1-氯代-1-氟代-乙基、1-氟代-丙基、2-氟代-丙基、3-氟代-
 丙基、1-氯代-丙基、2-氯代-丙基、3-氯代-丙基、1-溴代-丙基、1-氟代
 10 -1-甲基-乙基、2-氟代-1-甲基-乙基、1-氯代-1-甲基-乙基、1-氟代-1-甲
 基-丙基、1-氯代-1-乙基-丙基、1-氟代-1-乙基-丙基、1-氟代-2-甲基-丙
 基、1-氯代-2-甲基-丙基、2-氯代-1-甲基-乙基、1,1-二氟代-乙基、1,2-
 二氟代-乙基、1,1-二氯代-乙基、2,2,2-三氟代-乙基、1,2,2,2-四氟代-
 乙基、全氟代乙基、1,1-二氟代-丙基、1,1-二氯代-丙基、全氟代丙基、
 15 1-氟代-丁基、1-氯代-丁基、全氟代丁基、全氟代戊基、全氟代己基、
 1-羟基-乙基、1-羟基-1-甲基-乙基、1-羟基-丙基、甲氧基甲基、乙氧基
 甲基、二甲氧基-甲基、1-甲氧基乙基、2-甲氧基-乙基、1,1-二甲氧基-
 乙基、1-乙氧基-乙基、2-乙氧基-乙基、2,2-二甲氧基-乙基、2,2-二乙
 氧基-乙基、2-甲氧基-1-甲基-乙基、2-甲氧基-1-乙基-乙基、2-乙氧基-
 20 1-甲基-乙基、2-乙氧基-1-乙基-乙基、2,2-双-甲氧基-甲基、甲硫基甲
 基、乙硫基甲基、1-甲硫基-乙基、2-甲硫基乙基、1-乙硫基-乙基、2-
 乙硫基乙基、甲基亚磺酰基甲基、乙基亚磺酰基甲基、甲磺酰基甲基、
 乙磺酰基甲基、乙烯基、1-氯代-乙烯基、2-氯代-乙烯基、1-氟代-乙烯
 基、2-氟代-乙烯基、1-溴代-乙烯基、2-溴代-乙烯基、1,2-二氯代-乙烯
 25 基、1,2-二溴代-乙烯基、1,2-二氟代-乙烯基、2,2-二氯代-乙烯基、2,2-

- 二氟代-乙烯基、2,2-二溴代-乙烯基、1-氟代-2-氟代-乙烯基、1-氟代-2-氯代-乙烯基、2-溴代-1-氟代-乙烯基、2-溴代-2-氟代-乙烯基、1-溴代-2-氟代-乙烯基、1-氟代-2-溴代-乙烯基、1-溴代-2-氯代-乙烯基、三氟代-乙烯基、三氟代-乙烯基、三溴代-乙烯基、1-氟代-2,2-二氯代-乙烯基、
- 5 1-溴代-2,2-二氯代-乙烯基、1-氟代-2,2-二溴代-乙烯基、1-氟代-2,2-二氯代-乙烯基、1-氟代-2,2-二溴代-乙烯基、1-溴代-2,2-二氯代-乙烯基、2-氯代-1,2-二氯代-乙烯基、2-氯代-1,2-二氟代-乙烯基、2-溴代-1,2-二氯代-乙烯基、2-溴代-1,2-二氟代-乙烯基、2-氯代-1,2-二溴代-乙烯基、2-氟代-1,2-二溴代-乙烯基、2-溴代-1-氟代-2-氟代-乙烯基、2-甲氧基-
- 10 乙烯基、2-乙氧基-乙烯基、烯丙基、2-氯代-烯丙基、3-氯代-烯丙基、3,3-二氯代-烯丙基、丙烯-1-基、丙烯-2-基、1-氟代-丙烯-1-基、1-溴代-丙烯-1-基、1-氟代-丙烯-2-基、1-氯代-丙烯-2-基、1-溴代-丙烯-2-基、2-甲氧基-丙烯-1-基、2-乙氧基-丙烯-1-基、3,3,3-三氟代-丙烯-1-基、3,3,3-三氟代-丙烯-2-基、1-氯代-丙烯-2-基、1-氟代-丙烯-2-基、1-溴代-
- 15 -丙烯-2-基、1,2-二氯代-丙烯-1-基、1,2-二溴代-丙烯-1-基、1,2-二氯代-丙烯-1-基、1,1-二氯代-丙烯-2-基、1,1-二溴代-丙烯-2-基、1,1-二氯代-丙烯-2-基、1-氯代-2-氟代-丙烯-1-基、1-氯代-2-溴代-丙烯-1-基、1-溴代-2-氯代-丙烯-1-基、1-溴代-2-氟代-丙烯-1-基、1-氯代-3,3,3-三氟代-丙烯-2-基、1-溴代-3,3,3-三氟代-丙烯-2-基、1-氟代-3,3,3-三氟代-丙烯-
- 20 -1-基、1,3,3,3-四氟代-丙烯-1-基、1,3,3,3-四氟代-丙烯-2-基、1-溴代-2-氯代-3,3,3-三氟代-丙烯-1-基、1,1,3,3,3-五氟代-丙烯-2-基、1,2,3,3,3-五氟代-丙烯-1-基、1,1-二氯代-3,3,3-三氟代-丙烯-2-基、1,2-二氯代-3,3,3-三氟代-丙烯-2-基、1,1-二溴代-3,3,3-三氟代-丙烯-2-基、1,2-二溴代-3,3,3-三氟代-丙烯-2-基、1-氯代-2,3,3,3-四氟代-1-丙烯-1-基、2-甲基-
- 25 -丙烯-1-基、1-氯代-2-甲基-丙烯-1-基、1-溴代-2-甲基-丙烯-1-基、1-氟代-2-甲基-丙烯-1-基、1-溴代-2-甲基-3,3,3-三氟代-丙烯-1-基、1-氯代-3,3,3-三氟代-2-三氟代-甲基-丙烯-1-基、1-溴代-3,3,3-三氟代-2-三氟代-甲基-丙烯-1-基、1-氯代-3,3,3-三氟代-丙烯-1-基、1-溴代-3,3,3-三氟代-丙

- 烯-1-基、1-氯代-2,3,3,3-四氟代-丙烯-1-基、1-氯代-2-溴代-3,3,3-三氟代-丙烯-1-基、1-氯代-2-甲基-3,3,3-三氟代-丙烯-1-基、1-溴代-2-氟代-丙烯-1-基、1-丁烯-1-基、1-丁烯-2-基、2-丁烯-1-基、2-丁烯-2-基、1-氯代-1-丁烯-1-基、1-溴代-1-丁烯-1-基、1-氯代-1-丁烯-1-基、1-氯代-1-丁烯-2-基、1-氟代-1-丁烯-2-基、1-溴代-1-丁烯-2-基、1,2-二氟代-1-丁烯-1-基、1,2-二氯代-1-丁烯-1-基、1,2-二溴代-1-丁烯-1-基、1-溴代-2-氟代-1-丁烯-1-基、3-甲基-2-丁烯-2-基、1-氯代-2-氟代-1-丁烯-1-基、1-溴代-2-氯代-1-丁烯-1-基、1,1,1-三氟代-2-甲基-2-丁烯-2-基、4,4,4-三氟代-2-甲基-丁烯-2-基、4,4,4-三氟代-3-三氟代甲基-2-丁烯-2-基、1-氯代-2-甲基-3,3,3-三氟代-1-丙烯-1-基、3-氯代-2-丁烯-2-基、3-溴代-2-丁烯-2-基、3-氟代-2-丁烯-2-基、1-氯代-2-甲基-1-丁烯-1-基、1-溴代-2-甲基-1-丁烯-1-基、1-氟代-2-甲基-1-丁烯-1-基、1-氯代-3-甲基-1-丁烯-1-基、1-氯代-3-甲基-1-丁烯-1-基、2-甲氧基-1-丁烯-1-基、2-乙氧基-1-丁烯-1-基、1,1-二氯代-1-丁烯-2-基、1,1-二溴代-1-丁烯-2-基、1,1-二氟代-1-丁烯-2-基、1-氯代-2-氟代-1-丁烯-1-基、1-氯代-2-溴代-1-丁烯-1-基、1-氯代-2-三氟代甲基-1-丁烯-1-基、1,1,1-三氟代-2-丁烯-2-基、4,4,4-三氟代-2-丁烯-2-基、4,4,4-三氟代-3-甲基-2-丁烯-2-基、1,1,1-三氟代-3-甲基-2-戊烯-2-基、1,1,1-三氟代-3-乙基-2-戊烯-2-基、1,1,1,4,4,4-六氟代-2-丁烯-2-基、1-氯代-2-乙基-1-丁烯-1-基、1-溴代-2-乙基-1-丁烯-1-基、1-氟代-2-乙基-1-丁烯-1-基、2-戊烯-2-基、2-戊烯-3-基、2-氯代-2-戊烯-3-基、2-溴代-2-戊烯-3-基、2-氟代-2-戊烯-3-基、3-氯代-2-戊烯-2-基、3-溴代-2-戊烯-2-基、3-氟代-2-戊烯-2-基、3-三氟代甲基-2-戊烯-2-基、1,1,1-三氟代-2-戊烯-3-基、1,1,1-三氟代-2-戊烯-2-基、1,1,1-三氟代-3-甲基-2-戊烯-2-基、2-甲基-2-戊烯-3-基、3-甲基-2-戊烯-2-基、1,1,1-三氟代-2-三氟代甲基-2-戊烯-3-基、4-甲基-3-己烯-3-基、4-氟代-3-己烯-3-基、4-氯代-3-己烯-3-基、4-溴代-3-己烯-3-基、1,1,1-三氟代-2-甲基-2-己烯-3-基、4-乙基-3-己烯-3-基、乙炔基、2-氯代-乙炔基、2-溴代-乙炔基、丙炔-1-基、丙炔-3-基、3,3,3-三氟代-丙炔-1-基、1-丁炔-1-基、

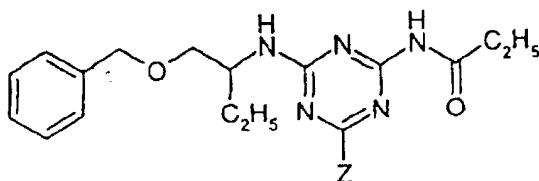
- 1-丁炔-3-基、3-甲基-1-丁炔-1-基、1-戊炔-1-基、环丙基、1-氟基-环丙基、1-氟代-环丙基、1-氯代-环丙基、2-氟基-环丙基、2-氟代环丙基、2-氯代-环丙基、2,2-二氟代-环丙基、2,2-二氯代-环丙基、环丁基、2,2-二氟代-环丁基、2,2,3-三氟代-环丁基、2,2-二氟代-3-氯代-环丁基、环戊基、环己基。

组 2



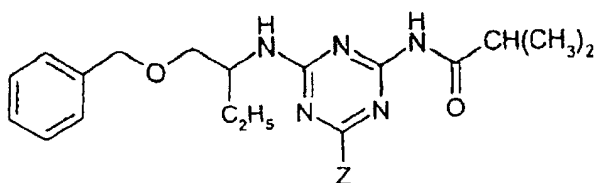
在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 3



在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

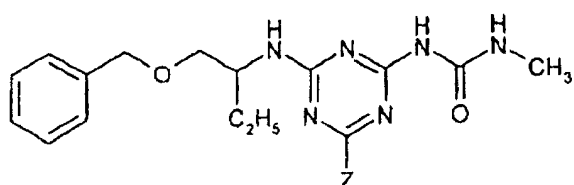
组 4



在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

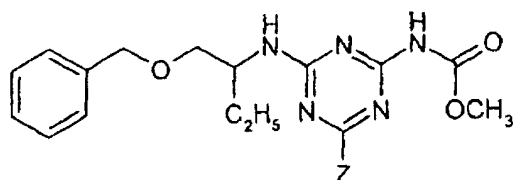
15

组 5



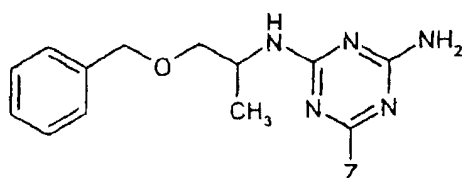
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 6



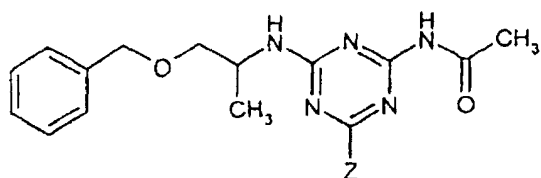
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

5 组 7



在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

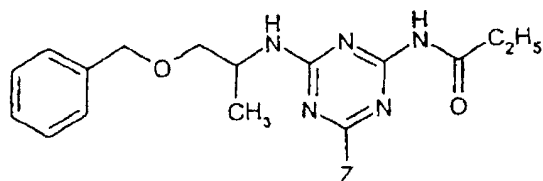
组 8



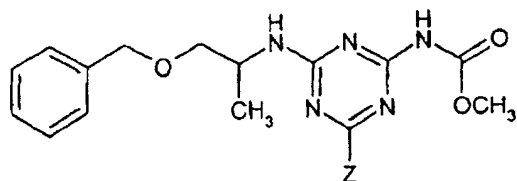
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10

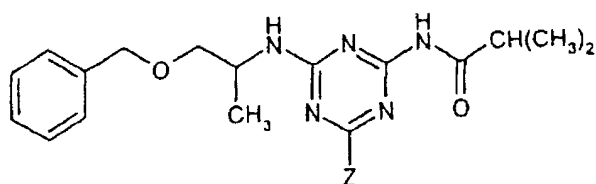
组 9



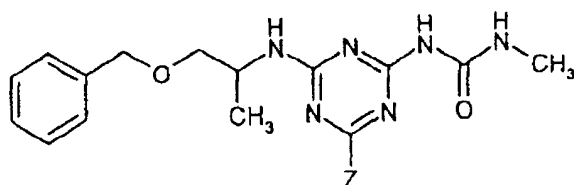
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 10

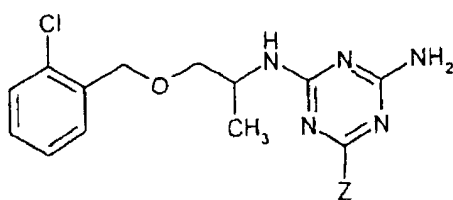
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 11

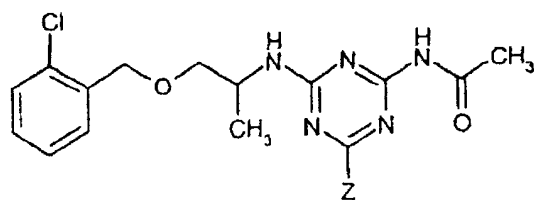
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 12

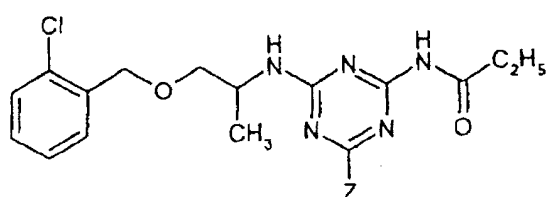
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 13

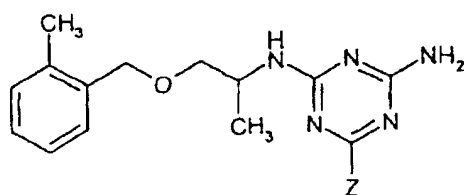
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 14

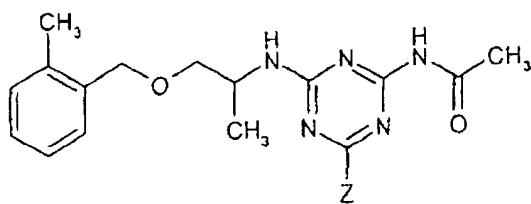
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 15

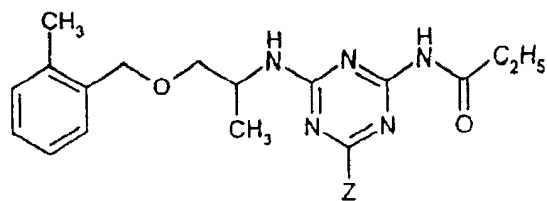
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 16

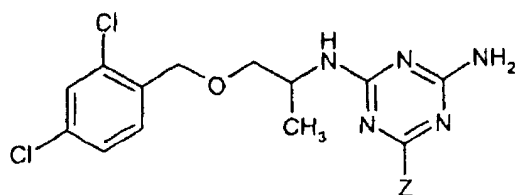
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 17

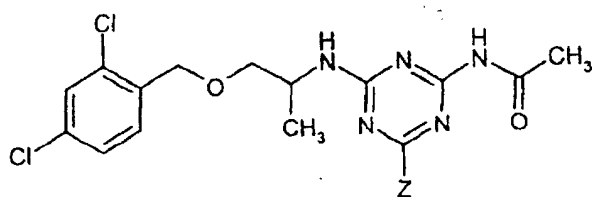
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 18

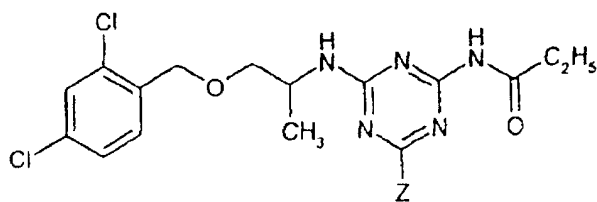
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 19

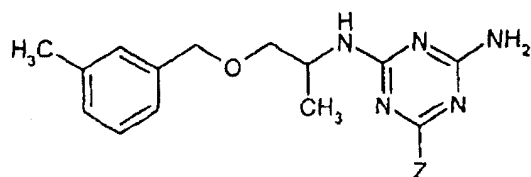
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 20

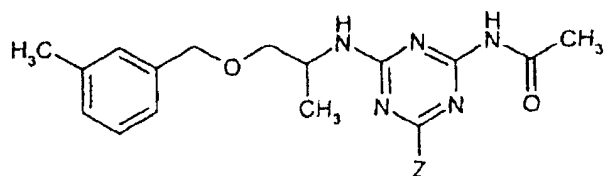
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 21

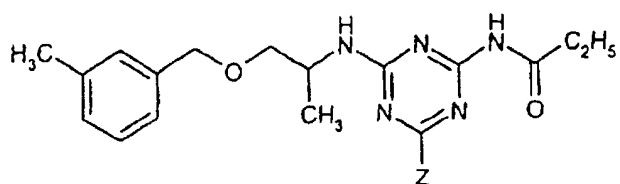
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 22

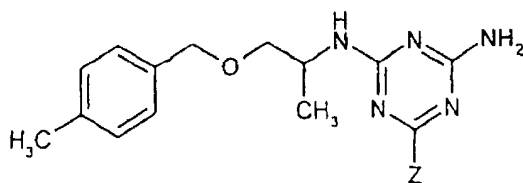
在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 23

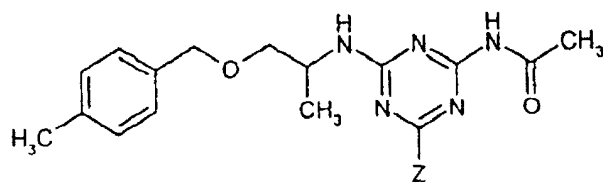
5 在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 24

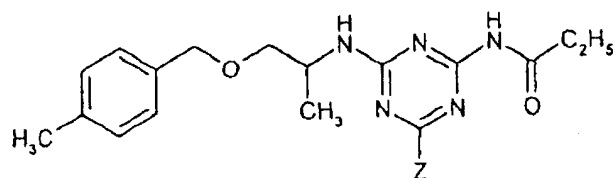
在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 25

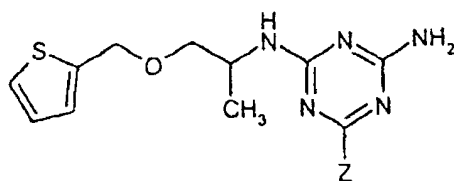
在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 26

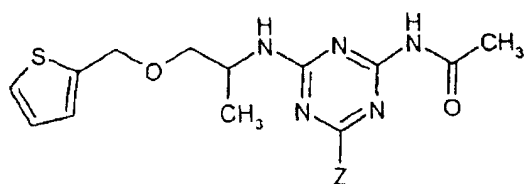
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 27

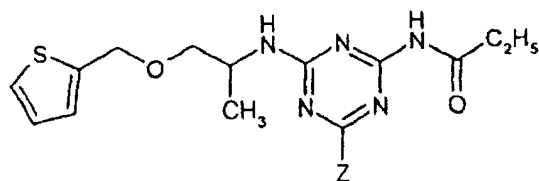
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 28

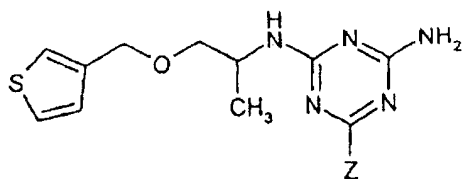
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 29

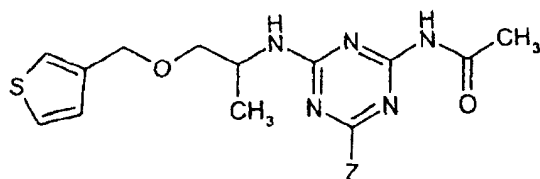
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 30

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

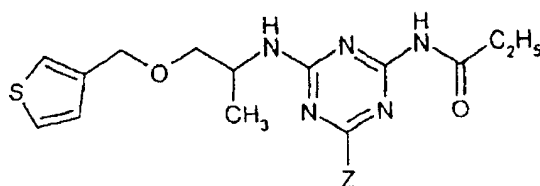
组 31

5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

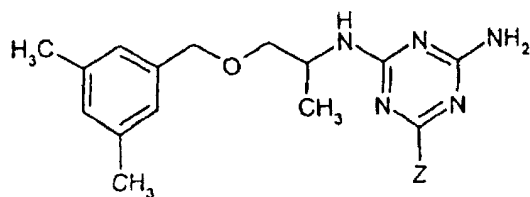
组 32

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

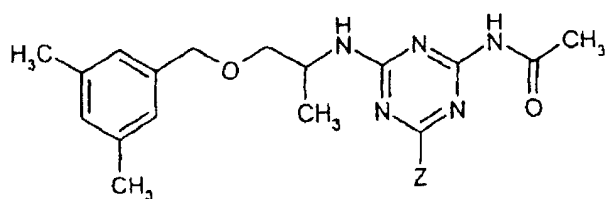
10 组 33



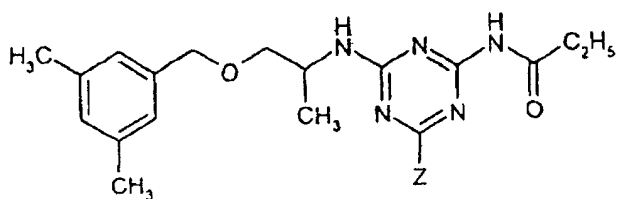
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 34

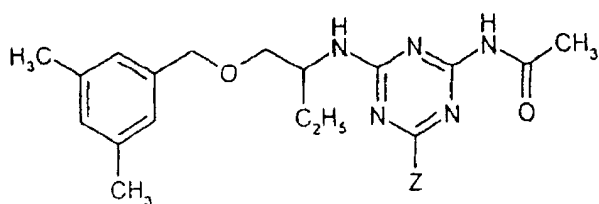
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 35

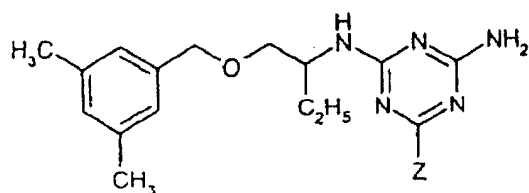
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 36

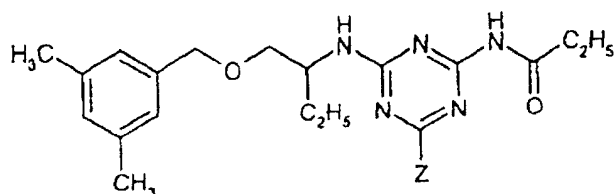
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 37

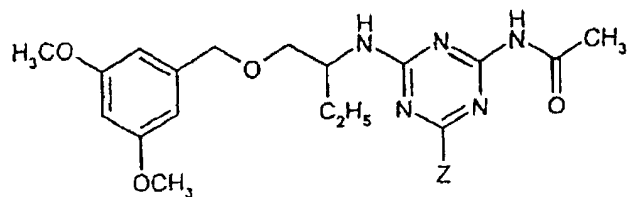
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 38

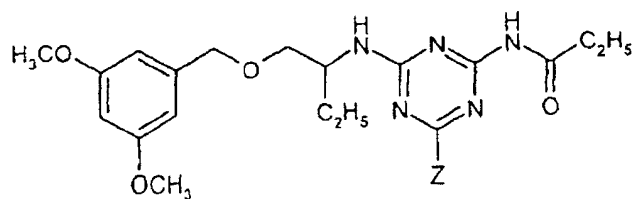
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 39

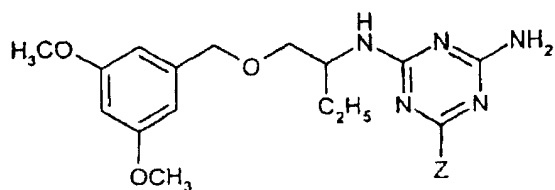
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 40

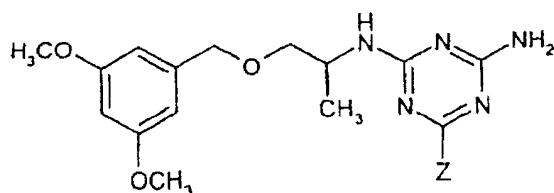
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 41

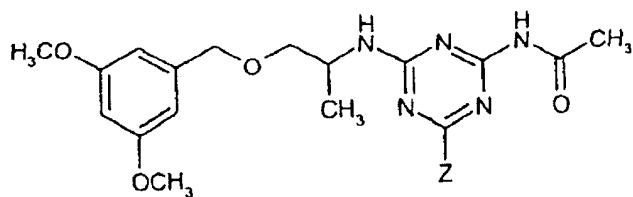
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 42

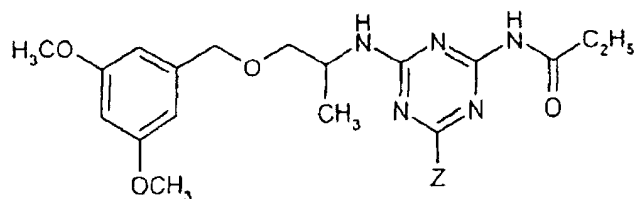
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 43

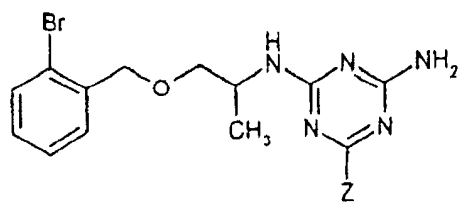
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 44

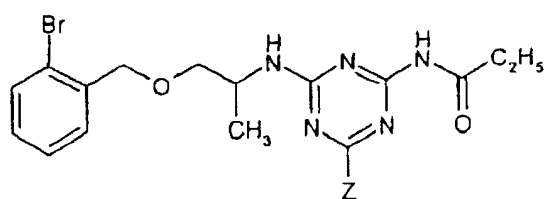
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 45

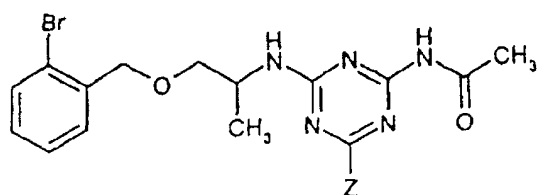
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 46

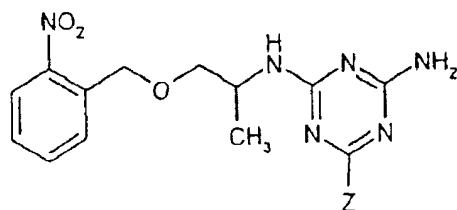
在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 47

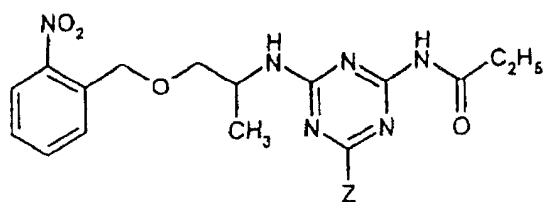
5 在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 48

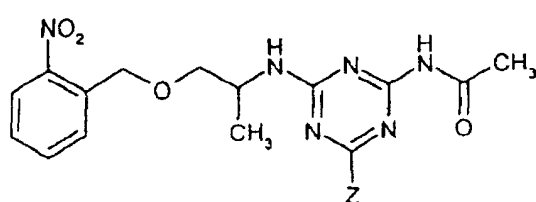
在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 49

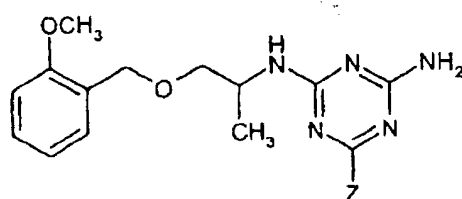
在此，Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 50

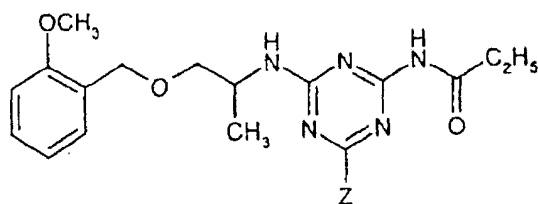
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 51

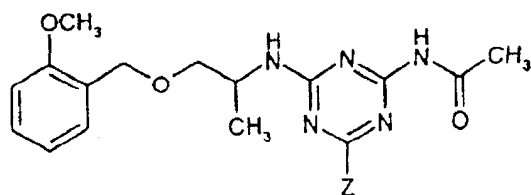
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 52

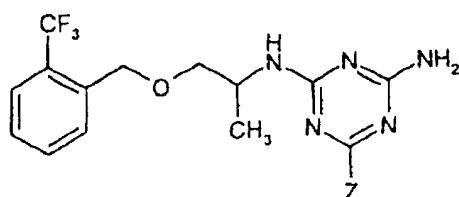
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 53

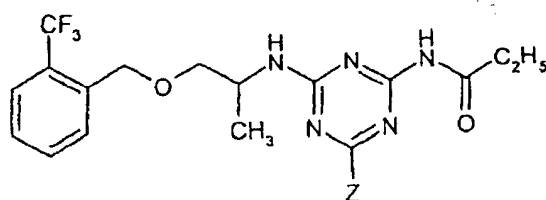
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 54

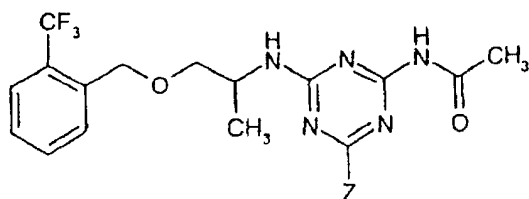
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 55

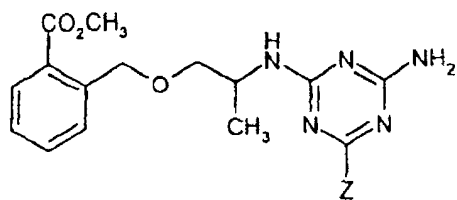
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 56

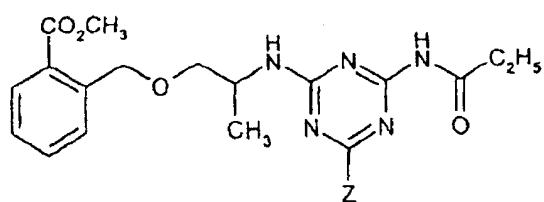
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 57

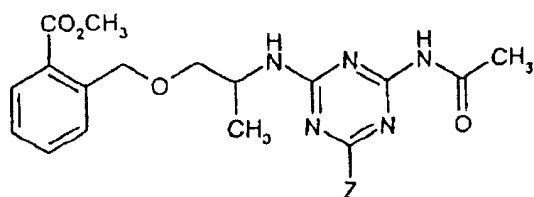
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 58

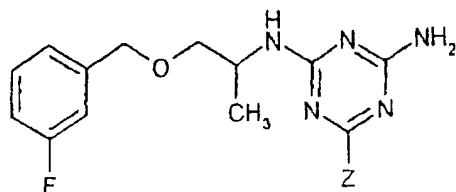
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 59

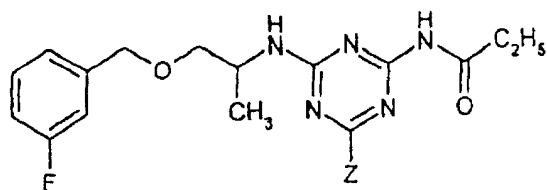
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 60

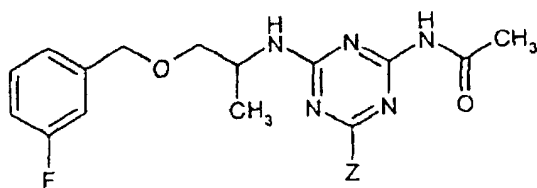
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 61

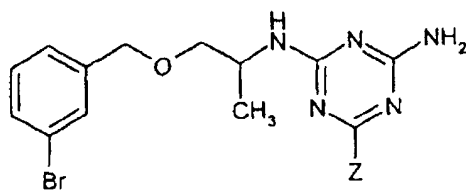
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 62

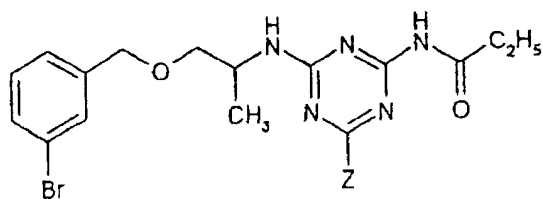
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 63

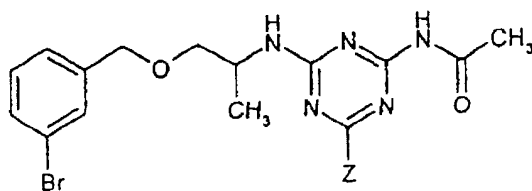
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 64

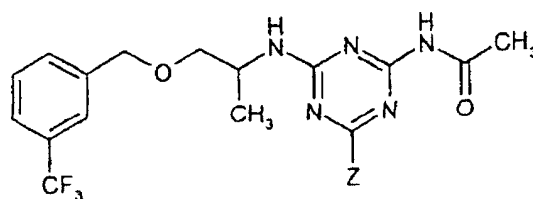
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 65

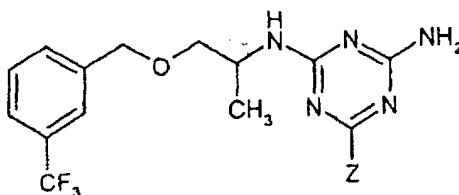
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 66

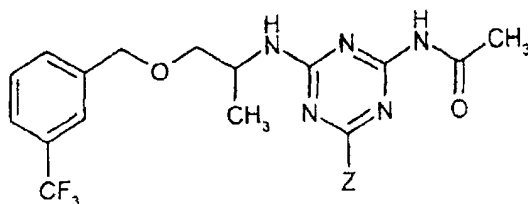
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 67

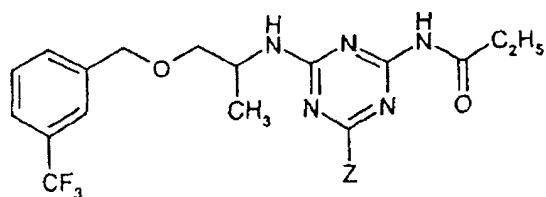
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 68

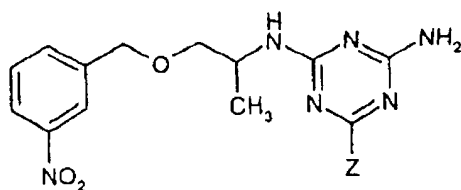
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 69

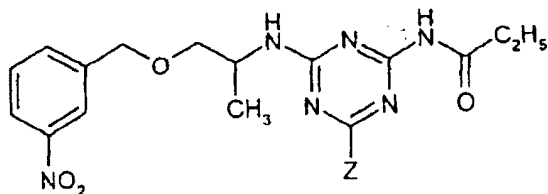
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 70

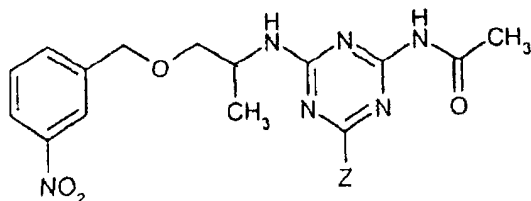
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 71

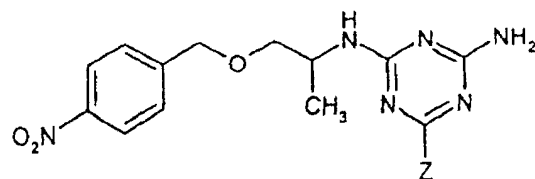
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 72

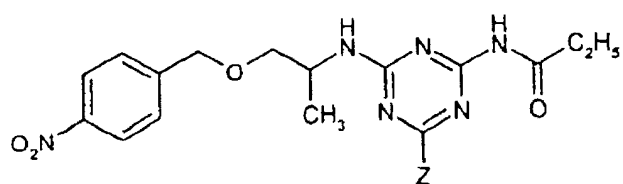
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 73

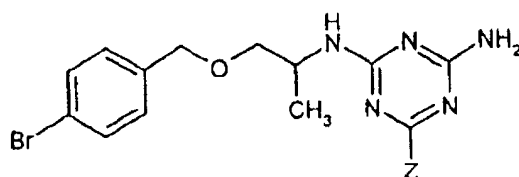
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 74

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

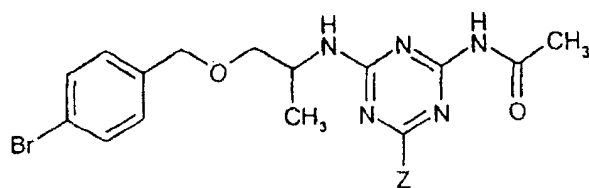
组 75

5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

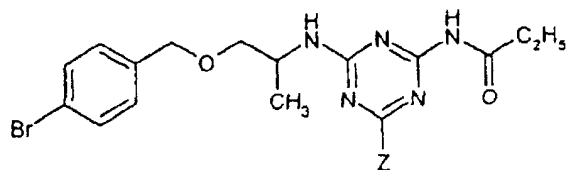
组 76

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

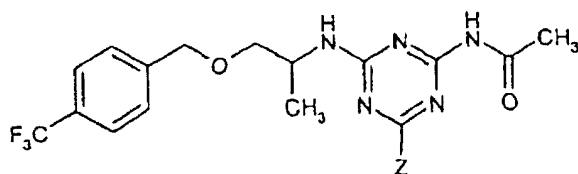
10 组 77



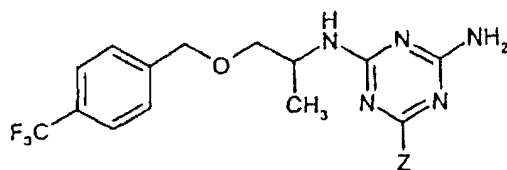
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 78

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

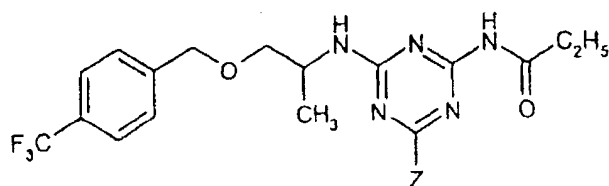
组 79

5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

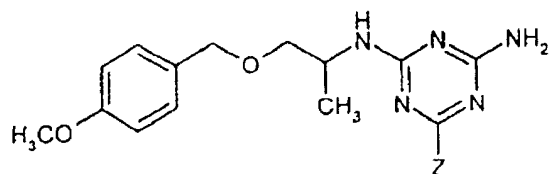
组 80

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

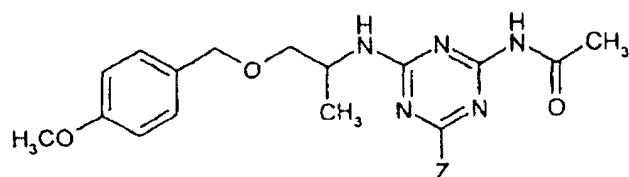
10 组 81



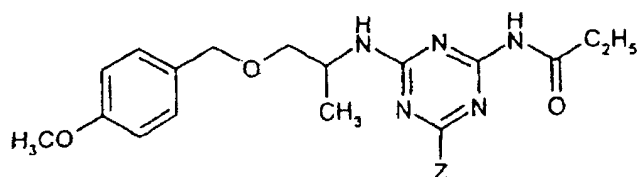
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 82

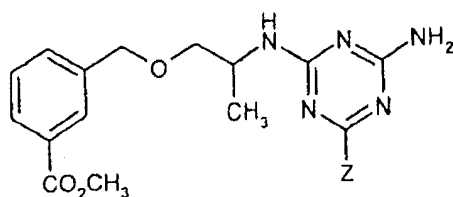
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 83

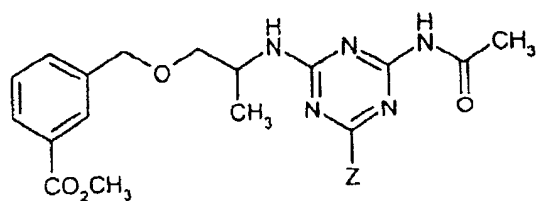
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 84

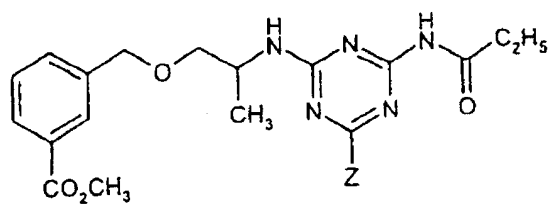
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 85

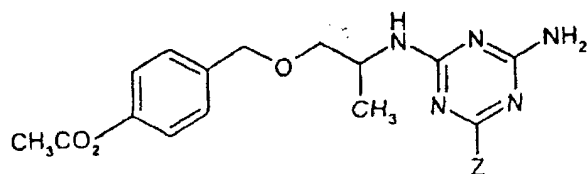
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 86

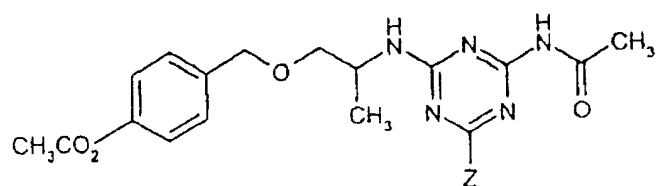
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 87

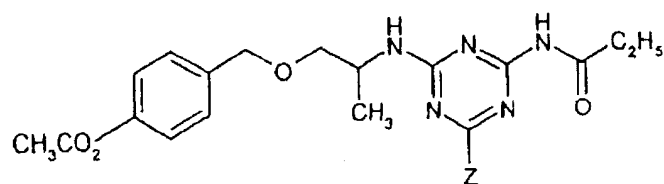
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 88

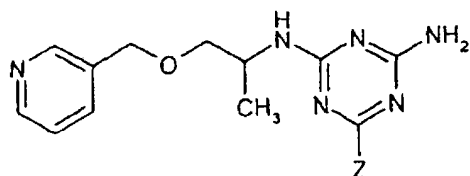
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 89

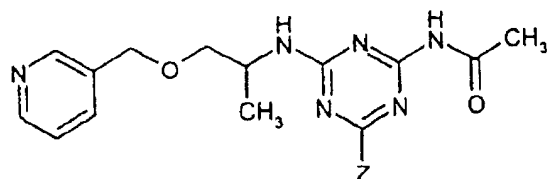
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 90

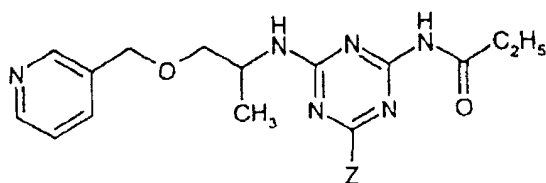
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 91

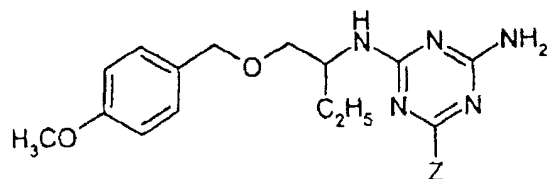
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 92

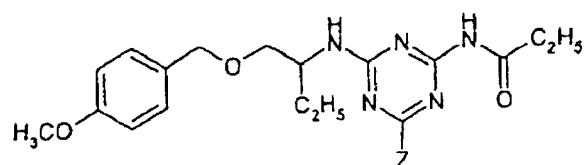
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 93

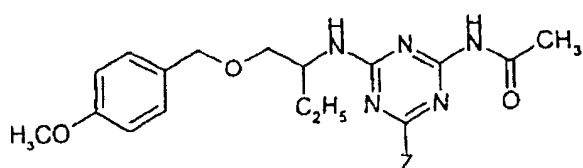
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 94

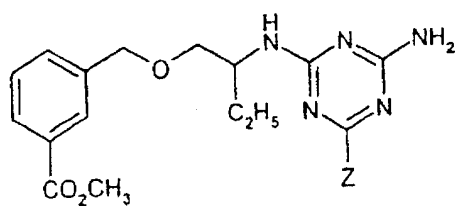
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 95

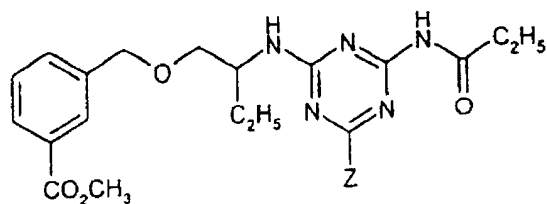
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 96

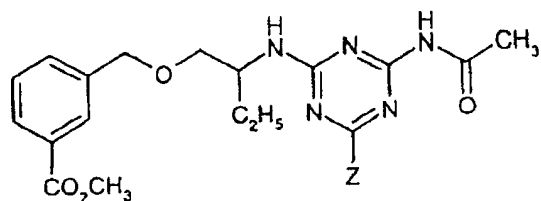
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 97

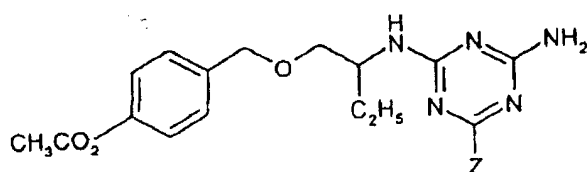
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 98

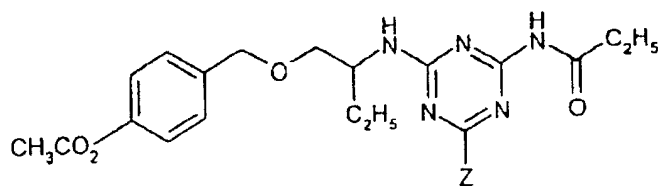
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 99

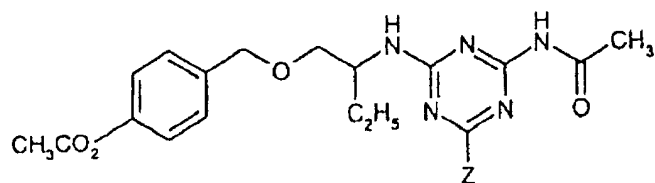
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 100

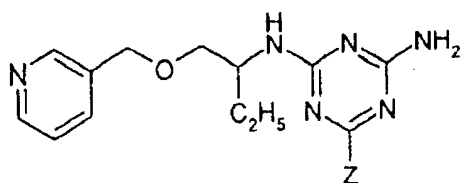
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 101

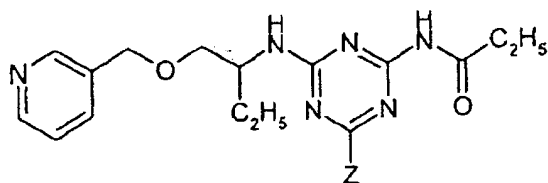
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 102

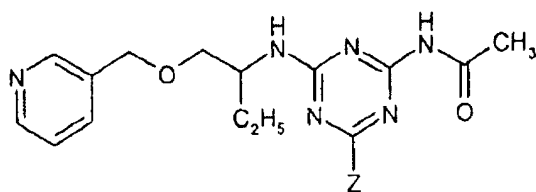
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 103

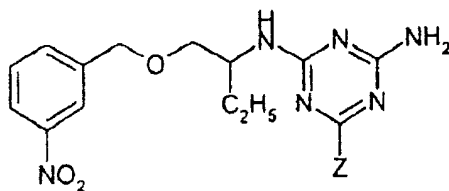
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 104

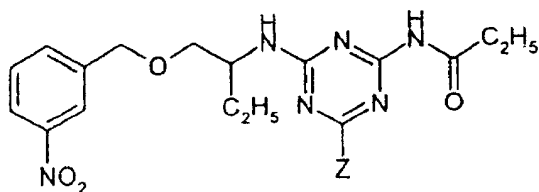
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 105

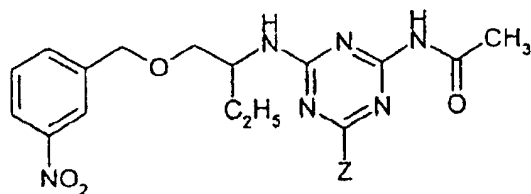
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 106

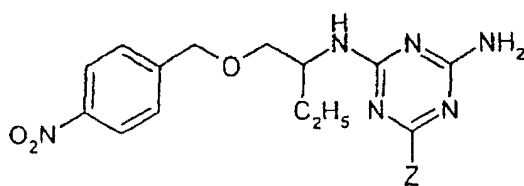
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 107

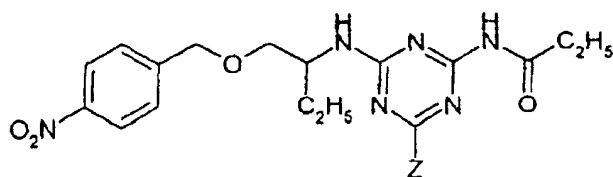
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 108

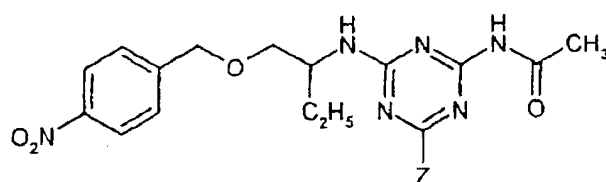
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 109

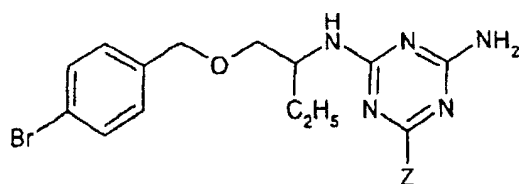
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 110

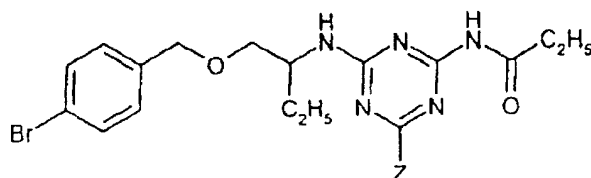
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 111

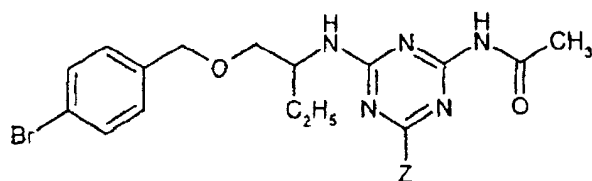
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 112

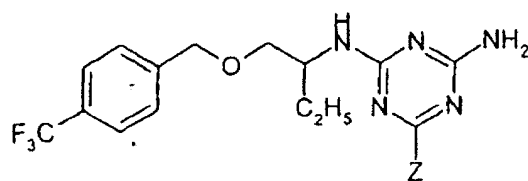
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 113

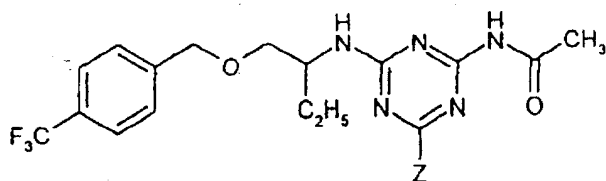
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 114

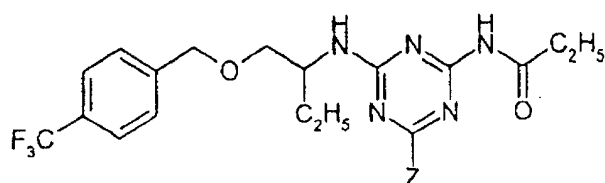
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 115

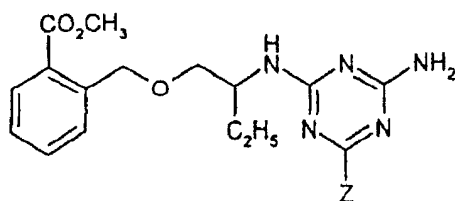
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 116

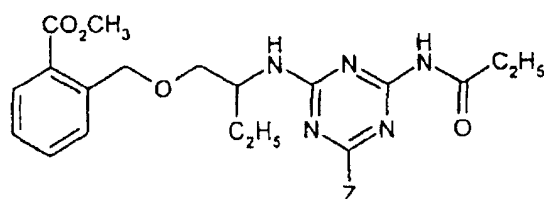
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 117

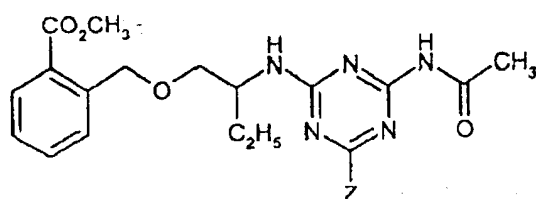
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 118

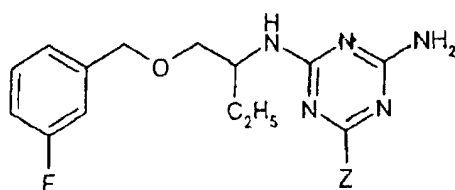
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 119

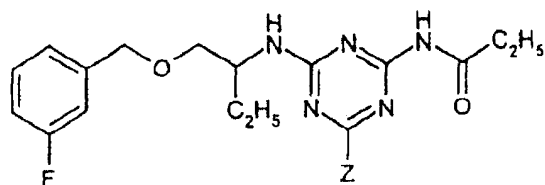
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 120

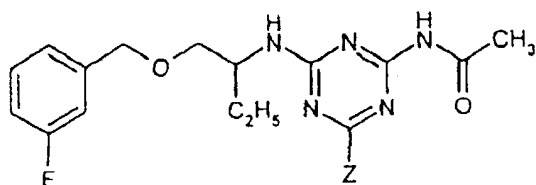
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 121

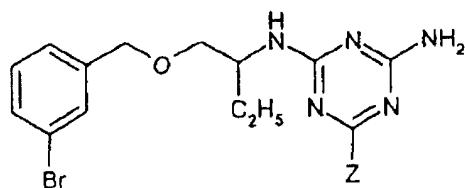
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 122

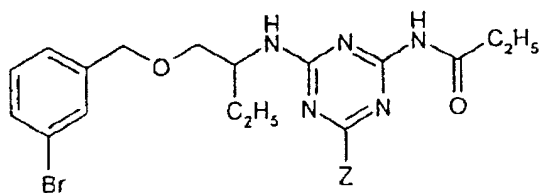
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 123

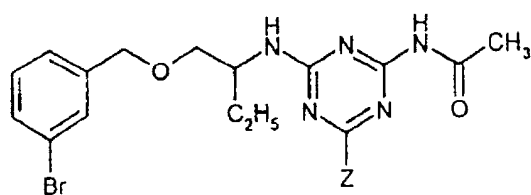
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 124

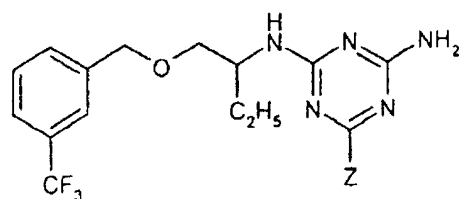
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 125

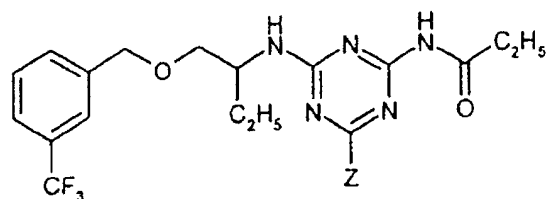
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 126

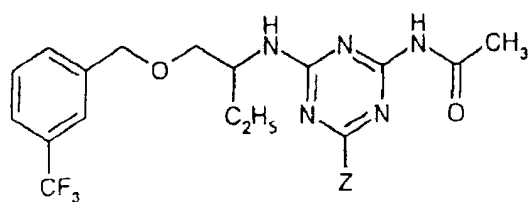
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 127

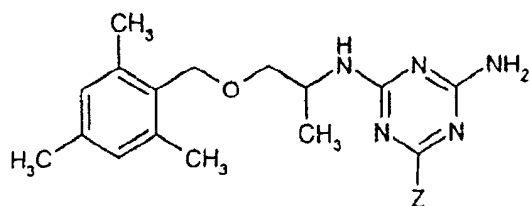
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 128

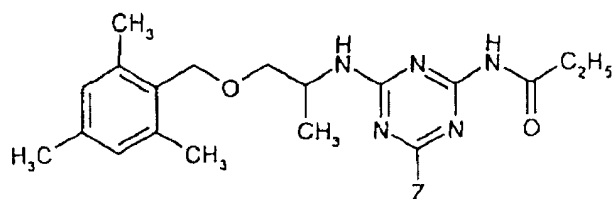
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 129

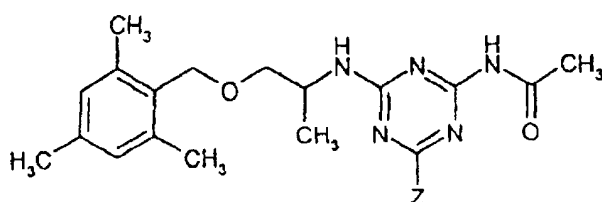
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 130

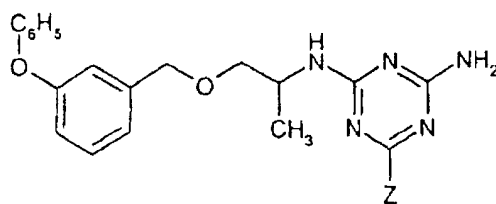
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 131

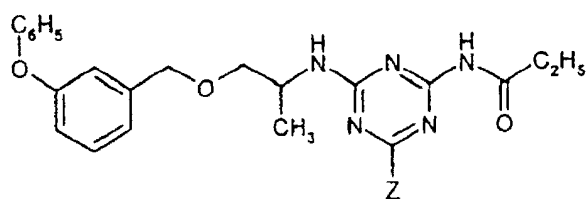
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 132

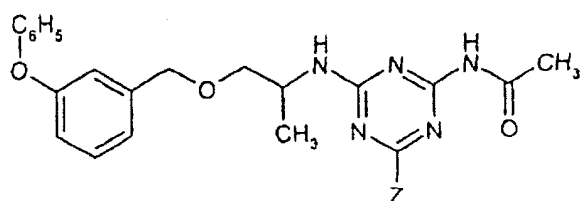
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 133

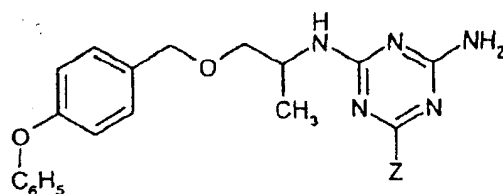
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 134

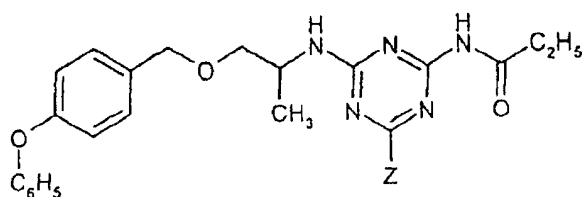
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 135

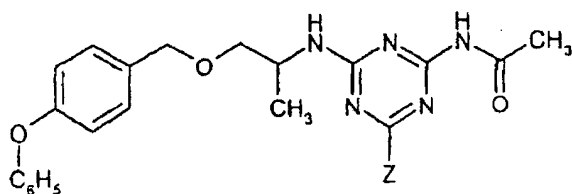
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 136

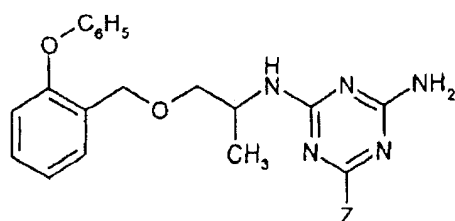
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 137

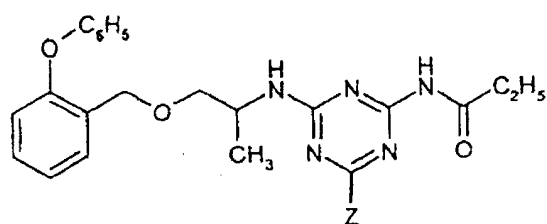
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 138

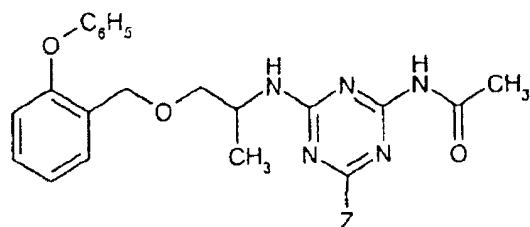
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 139

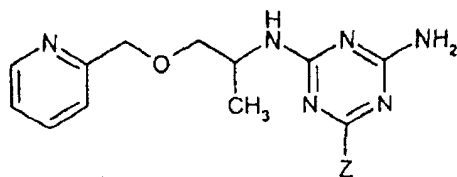
5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 140

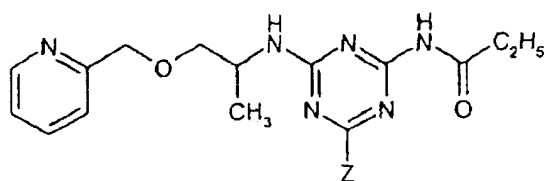
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 141

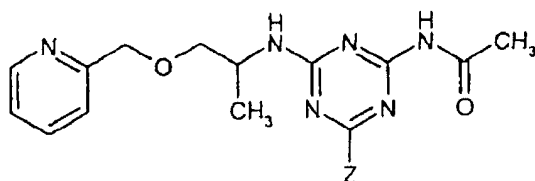
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 142

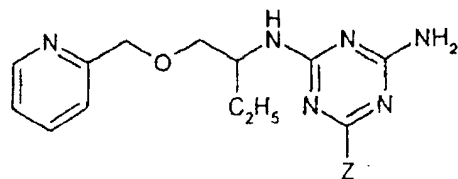
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 143

5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

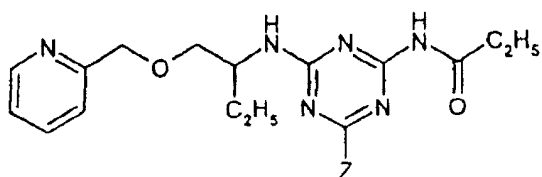
组 144

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

10 组 145

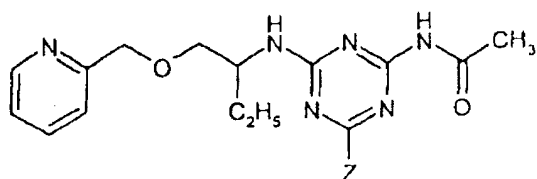
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 146



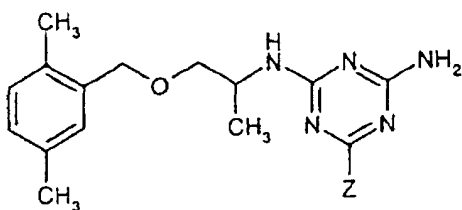
在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

组 147

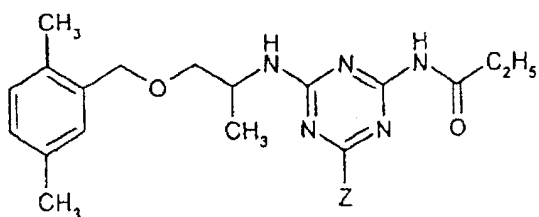


5 在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

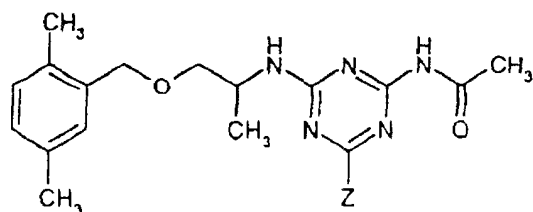
组 148



在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

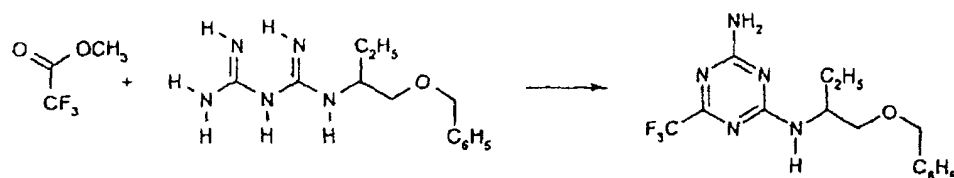
10 组 149

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

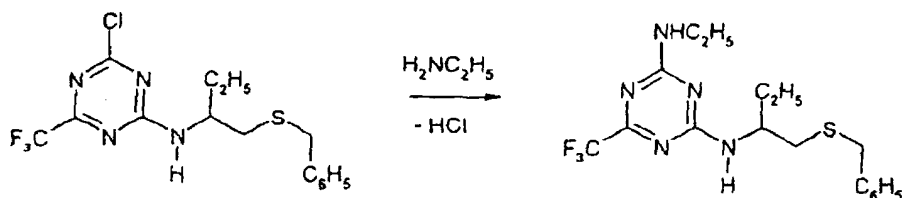
组 150

在此, Z 具有例如上面组 1 中给定的意义。

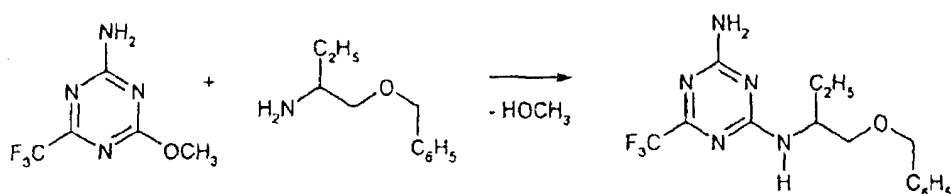
使用, 例如, 1-(1-苄氧基甲基-丙基)-双胍和三氟代乙酸甲酯作为原料, 通过下式的流程可以阐明根据本发明方法(a)中的反应过程:



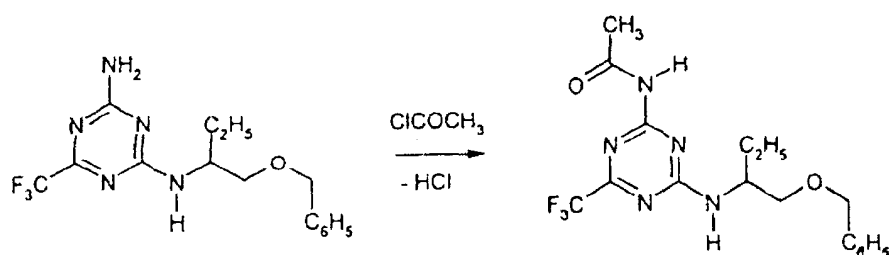
使用, 例如, 2-氯代-4-(1-苄硫基甲基-丙氨基)-6-三氟代甲基-1,3,5-三嗪和乙胺作为原料, 通过下式的流程可以阐明根据本发明方法(b)中的反应过程:



使用, 例如, 2-氨基-4-甲氧基-6-三氟代甲基-1,3,5-三嗪和 1-苄氧基甲基-丙胺作为原料, 通过下式的流程可以阐明根据本发明方法(c)中的反应过程:



使用, 例如, 2-氨基-4-(1-苄氧基甲基-丙氨基)-6-三氟代甲基-1,3,5-三嗪和乙酰氯作为原料, 通过下式的流程可以阐明根据本发明方法(d)中的反应过程:

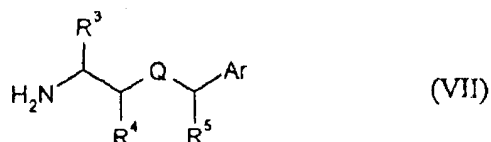


在用于制备式(I)化合物的根据本发明的方法(a)中, 式(II)提供待用作原料的双胍的一般定义。在式(II)中, Q、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和Ar优选或特别具有上面在根据本发明的式(I)化合物叙述中, 已叙述的对于Q、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和Ar优选的或特别优选的意义。

- 5 式(II)化合物的合适的酸加合物为它们与质子酸的加合物, 例如与氯化氢、溴化氢、硫酸、甲磺酸、苯磺酸和对-甲苯磺酸的加合物。

迄今为止, 通式(II)的原料尚未在文献中公开; 作为新物质, 它们也形成本申请主题的部分。

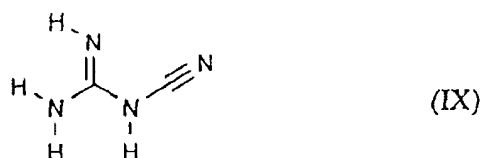
- 10 如果合适的话, 在反应助剂如氯化氢存在下和如果合适的话, 在稀释剂如正癸烷或1,2-二氯代-苯存在下, 于100℃至200℃之间的温度下, 使通式(VII)的取代的烷基胺和/或通式(VII)化合物的酸加合物如盐氧化物



其中

Q、R³、R⁴、R⁵和Ar如上所定义, 与式(IX)的氰基胍(“双氰胺”)反

- 15 应



获得新的通式(II)的双胍(参见 EP-492615, 制备实施例)。

用于该目的需要作为前体的通式(VII)的取代的烷基胺是已知的和/或可通过已知的方法制备(参见: 有机化学杂志(J. Org. Chem.), 34

(1969), 466-468; J. Heterocycl. Chem. 11 (1974), 985-989; Liebigs Ann. Chem. 1980, 786-790; Can. J. Chem. 60 (1982), 1836-1841; 四面体 (Tetrahedron) 40 (1984), 1255-1268; 美国化学会杂志(J. Am. Chem. Soc.), 109 (1987), 236-239 和 1798-1805; loc. cit. 110 1988), 3862-3869;
5 四面体通讯, 30 (1989), 731-734; 四面体: asymmetry 3 (1992), 587-590; loc. cit. 7 (1996), 3397-3406; 四面体通讯, 34 (1993), 2957-2960; 四面体, 51 (1995), 1709-1720; 有机化学杂志, 61 (1996), 7285-7290; 四面体 52 (1996), 4199-4214; EP-192060; EP-199845; WO 9213823; 制备实施例).

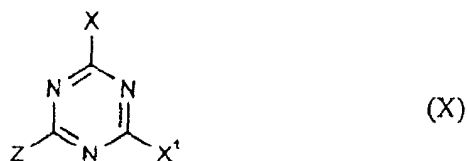
10 在用于制备式(I)化合物的根据本发明的方法(a)中, 式(III)提供进一步被用作原料的烷氧基羰基化合物的一般定义。在式(III)中, Z 优选或特别具有上面在根据本发明的式(I)化合物的叙述中, 已叙述的对于 Z 的优选的或特别优选的意义; R' 优选表示具有 1-4 个碳原子的烷基, 特别是甲基或乙基。

15 已知式(III)的原料为用于合成的化学物质。

在用于制备式(I)化合物的根据本发明的方法(b)中, 式(IV)提供待用作原料的取代的卤代三嗪的一般定义。在式(IV)中, Q、R³、R⁴、R⁵、Ar 和 Z 优选或特别具有在根据本发明的式(I)化合物的叙述中, 上面已叙述的对于 Q、R³、R⁴、R⁵、Ar 和 Z 的优选的或特别优选的意义; X
20 优选表示氟或氯, 特别是氯。

迄今为止, 通式(IV)的原料尚未在文献中公开; 作为新物质, 它们也形成本申请主题的部分。

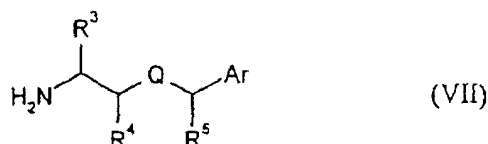
如果合适的话, 在酸性接受体如乙基二异丙基胺存在下和如果合适的话, 在稀释剂如四氢呋喃或二噁烷存在下, 于-50℃至+50℃之间的温度下, 使通式(X)的相应的二卤代三嗪
25



其中

X 和 Z 如上所定义和

X¹ 表示卤素, 与通式(VII)的取代的烷基胺反应



其中

- 5 Q、R³、R⁴、R⁵ 和 Ar 如上所定义, 获得通式(IV)的新的取代的卤代三嗪(参考制备实施例)。

在用于制备式(I)化合物的根据本发明的方法(b)中, 式(V)提供进一步被用作原料的氮化合物的一般定义。在式(V)中, R¹ 和 R² 优选或特别具有在根据本发明的式(I)化合物的叙述中, 上面已叙述的对于 R¹ 和 R² 优选的或特别优选的意义。

已知通式(V)的原料为用于合成的化学物质。

在用于制备式(I)化合物的根据本发明的方法(c)中, 式(VI)提供待用作原料的取代的氨基三嗪的一般定义。在式(VI)中, R¹、R² 和 Z 优选或特别具有在根据本发明的式(I)化合物的叙述中, 上面已叙述的对于 R¹、R² 和 Z 的优选的或特别优选的意义; Y¹ 优选表示氟、氯、甲氧基或乙氧基, 特别是氯或甲氧基。

通式(VI)的原料是已知的和/或可通过已知的方法制备(参见 WO 95/11237)。

在根据本发明的方法(c)中, 式(VII)提供进一步被用作原料的取代的烷基胺的一般定义。在式(VII)中, Q、R³、R⁴、R⁵ 和 Ar 优选或特别具有在根据本发明的式(I)化合物的叙述中, 上面已叙述的对于 Q、R³、R⁴、R⁵ 和 Ar 的优选的或特别优选的意义。

通式(VII)的原料是已知的和/或可通过已知的方法制备(参见: 有

机化学杂志, 34 (1969), 466-468; J. Heterocycl. Chem. 11 (1974), 985-989; Liebigs Ann. Chem. 1980, 786-790; Can. J. Chem. 60 (1982), 1836-1841; 四面体 40 (1984), 1255-1268; 美国化学会杂志, 109 (1987), 236-239; loc. cit. 110 (1988), 3862-3869; 四面体通讯, 30 (1989), 731-734; 四面体: Asymmetry 3 (1992), 587-590; 四面体通讯 34 (1993), 2957-2960; EP-192060; EP-199845; WO 9213823; 制备实施例)。

在用于制备式(I)化合物的根据本发明的方法(d)中, 式(Ia)提供待用作原料的取代的 2,4-二氨基-1,3,5-三嗪的一般定义。在式(Ia)中, Q、R¹、R³、R⁴、R⁵、Ar 和 Z 优选或特别具有在根据本发明的式(I)化合物的叙述中, 上面已经叙述的对于 Q、R¹、R³、R⁴、R⁵、Ar 和 Z 的优选的或特别优选的意义。

作为新的物质, 通式(Ia)的原料也形成本申请主题的部分; 它们可通过根据本发明的方法(a)、(b)和(c)制备(参见制备实施例)。

在根据本发明的方法(d)中, 式(VIII)提供进一步被用作原料的烷基化剂或酰化剂的一般定义。在式(VIII)中, R² 除了不表示氢外, 优选或特别具有在根据本发明的式(I)化合物的叙述中, 上面已叙述的对于 R² 的优选的或特别优选的意义; Y² 优选表示氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基、乙酰氧基或丙酰氧基, 特别是氯、甲氧基或乙酰氧基。

已知通式(VIII)的原料为用于合成的化学物质。

如果合适的话, 使用反应助剂进行用于制备式(I)化合物的本发明的方法。一般来说, 用于方法(a)、(b)、(c)和(d)的合适的反应助剂为常规无机或有机碱或酸受体。这些碱或酸受体优选包括碱金属或碱土金属的乙酸盐、酰胺、碳酸盐、碳酸氢盐、氢化物、氢氧化物或醇盐, 例如, 乙酸钠、乙酸钾或乙酸钙, 氨基化锂、氨基化钠、氨基化钾或氨基化钙, 碳酸钠、碳酸钾或碳酸钙, 碳酸氢钠、碳酸氢钾或碳酸氢钙, 氢化锂、氢化钠、氢化钾或氢化钙, 氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾或氢氧化钙, 甲醇钠、乙醇钠、正-或异-丙醇钠、正-、异-、仲-或叔-丁醇钠, 或甲醇钾、乙醇钾、正-或异-丙醇钾、正-、异-、仲-或叔-丁醇钾。

叔-丁醇钾;而且还包括碱性有机氮化合物,例如三甲胺、三乙胺、三丙胺、三丁胺、乙基-二异丙胺、N,N-二甲基-环己胺、二环己胺、乙基-二环己胺、N,N-二甲基-苯胺、N,N-二甲基-苄胺、吡啶、2-甲基-、3-甲基-、4-甲基-、2,4-二甲基-、2,6-二甲基-、3,4-二甲基-和3,5-二甲基-吡啶、5-乙基-2-甲基吡啶、4-二甲基氨基-吡啶、N-甲基-哌啶、1,4-二氮杂二环[2,2,2]-辛烷(DABCD)、1,5-二氮杂二环[4,3,0]-壬-5-烯(DBN)或1,8-二氮杂二环[5,4,0]-十一-7-烯(DBU)。

如果合适的话,分子筛也适合用作反应助剂。

用于进行根据本发明的方法(a)、(b)、(c)或(d)的合适的稀释剂,除了水外,尤其是惰性有机溶剂。这些包括特别是任选的脂族、脂环族或芳香族的卤代烃,例如,汽油、苯、甲苯、二甲苯、氯代苯、二氯代苯、石油醚、己烷、环己烷、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳;醚如乙醚、二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃或乙二醇二甲醚或乙二醇二乙醚;酮如甲基异丙基酮或甲基异丁基酮;腈如乙腈、丙腈或丁腈;酰胺如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-N-甲酰苯胺、N-甲基-吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺;酯如乙酸甲酯或乙酸乙酯;亚砷如二甲亚砷;醇如甲醇、乙醇、正-或异-丙醇、乙二醇一甲醚、乙二醇一乙醚、二乙二醇一甲醚、二乙二醇一乙醚,其与水或纯水的混合物。

当进行根据本发明的方法(a)、(b)、(c)和(d)时,反应温度可在比较宽的范围内变化。一般来说,该方法在-20℃至+300℃之间的温度、优选在-10℃至+250℃之间实施。

根据本发明的方法(a)、(b)、(c)和(d)一般在常压下实施。然而,也有可能在升高或降低的压力、一般在0.1巴至10巴之间实施根据本发明的方法。

为实施根据本发明的方法,通常以约等摩尔的量使用原料。然而,也可能在每种情况下以较大的过量使用一种成分。一般在反应助剂存在下,在合适的稀释剂中进行该反应,该反应混合物一般在所需

的温度下搅拌数小时。经常规方法进行后处理(参见制备实施例)。

根据本发明的活性化合物可以用作脱叶剂、干燥剂、茎秆杀灭剂(haulm killer)及尤其是用作除草剂。杂草从广义上来说,应理解为生长在不需要它们的地方的所有植物。根据本发明的物质是否作为全部的
5 或选择性的除草剂起作用主要取决于所用的量。

例如,在涉及下列植物时,可以使用根据本发明的活性化合物:

下列属的双子叶杂草: 白芥属、独行菜属、猪殃殃属、繁缕属、母菊属、春黄菊属、牛膝菊属、藜属、苘麻属、千里光属、苋属、马齿苋属、苍耳属、旋花属、番薯属、蓼属、田菁属、豕草属、薊属、
10 飞廉属、苦苣菜属、茄属、蔊菜属、节节属、母草属、野芝麻属、婆婆纳属(Veronica)、苘麻属、刺酸模属、曼陀罗属、堇菜属、鼬瓣花属、罂粟属、矢车菊属、车轴草属、毛茛属、蒲公英属。

下列属的双子叶作物: 棉属、大豆属、甜菜属、胡萝卜属、菜豆属、豌豆属、茄属、亚麻属、番薯属、野豌豆属、烟草属、番茄属、
15 花生属、芥属、莴苣属、香瓜属、南瓜属。

下列属的单子叶杂草: 稗属、狗尾草属、黍属、马唐属、梯牧草属、早熟禾属、羊茅属、稈属、臂形草属、毒麦属、雀麦属、燕麦属、莎草属、高粱属、冰草属、狗牙根属、雨久花属、飘拂草属、慈姑属、荸荠属、莞草属、雀稗属、鸭嘴草属、尖瓣花属、龙爪茅属、翦股颖
20 属、看麦娘属、阿披拉草属(Apera)。

下列属的单子叶作物: 稻属、玉蜀黍属、小麦属、大麦属、燕麦属、黑麦属、高粱属、黍属、甘蔗属、凤梨属、天门冬属、葱属。

然而,根据本发明的活性化合物的用途决不限制于这些属,而且还以同样的方式扩展到其它植物。

25 根据其浓度,该化合物适合用于例如,工业区、铁路、道路和有或无树木生长的地方的所有杂草的控制。同样地,该化合物也可用于在多年生农作物例如森林、观赏树种植园、果园、葡萄园、柑橘林(citrus groves)、坚果园、香蕉种植园、咖啡种植园、茶叶种植园、橡胶种植

园、油棕种植园、可可种植园、浆果种植园和蛇麻种植地、草地和草皮及牧场中所有杂草的防除，以及用于在一年生作物中选择性地除草。

5 根据本发明的式(I)化合物特别适合于通过出苗前和出苗后法，在单子叶农作物中选择性去除单子叶和双子叶杂草。

可将所述活性化合物转化为常规制剂，例如溶液、乳液、可湿性粉剂、悬浮液、散剂、粉剂、膏剂、可溶性粉剂、颗粒剂、乳悬液(suspo-emulsion)浓缩物、用活性化合物浸渍的天然或合成物质及微型包囊在聚合物中。

10 这些制剂可用已知的方法，例如，通过将活性化合物与增量剂(即说液体溶剂和/或固体载体)混合、任选使用表面活性剂(即说乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂)来制备。

如果使用的增量剂是水，也有可能使用例如有机溶剂作为辅助溶剂。合适的液体溶剂主要有：芳族溶剂如二甲苯、甲苯或烷基苯；氯代芳族和氯代脂族烃溶剂如氯代苯、氯乙烯或二氯甲烷；脂族烃溶剂如环己烷或石蜡，例如石油馏分、矿物油和植物油；醇类溶剂如丁醇或乙二醇，以及它们的醚和酯；酮如丙酮、丁酮、甲基异丁酮或环己酮；强极性溶剂如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷，以及水。

20 合适的固体载体有：例如铵盐和磨碎的天然矿物，例如高岭土、陶土、滑石粉、白垩、石英、硅镁土(attapulgite)、蒙脱土、硅藻土及磨碎的合成矿物，例如细分散的硅石、氧化铝和硅酸盐；用于制粒的合适的固体载体有：例如，碾碎的和分级的天然岩石，如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石以及无机和有机粗粉的合成颗粒，有机物质如锯末、椰子壳、玉米芯和烟草梗的有机材料的颗粒；合适的乳化剂25 剂和/或发泡剂有：例如，非离子和阴离子乳化剂如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，如烷基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐和蛋白水解产物；合适的分散剂有：例如，木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

在该制剂中也可使用粘合剂，如羧甲基纤维素，粉末、颗粒或胶乳形式的天然和合成聚合物，例如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，还可使用天然磷脂如脑磷脂和卵磷脂，以及合成磷脂。其它合适的添加剂有矿物油和植物油。

- 5 可以使用染料如无机色素，例如氧化铁、氧化钛、普鲁士蓝及有机染料如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料，及微量营养素如铁、镁、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

该制剂一般含有0.1-95% (重量)，优选0.5-90% (重量)之间的活性化合物。

- 10 为了进行除草，还可将根据本发明的活性化合物(其本身或以其制剂的形式)作为与已知的除草剂的混合物、可能的最终制剂或桶混制剂来使用。

- 对于该混合物的可能组分已知有，例如，乙草胺、三氟羧草醚、苯草醚、甲草胺、禾草灭、莠灭净、amidochlor、酰嘧磺隆、莎稗磷、
15 磺草灵、莠去津、azafenidin、四唑嘧磺隆、草除灵、呋草黄、苄嘧磺隆、灭草松、吡草酮、新燕灵、双丙胺膦、甲羧除草醚、双草醚、溴
酰草胺、溴酚脞、溴苯腈、丁苯胺、butoxydim、丁草敌、苯酮唑、
caloxydim、双酚草胺、carfentrazone (-乙基)、甲氧除草醚、草灭畏、
氯草敏、氯嘧磺隆、草枯醚、氯磺隆、氯麦隆、环庚草醚、醚磺隆、
20 烯草酮、炔草酸、异恶草松、氯甲酰草胺、二氯吡啶酸、clopyrasulfuron
(-甲基)、cloransulam (-甲基)、cumyluron、氯乙酰肼、草灭特、环丙嘧
磺隆、噻草酮、氟氟草酯、2,4-滴、2,4-滴丁酸、2,4-DP、甜草胺、燕
麦敌、麦草畏、禾草灵、diclosulam、乙酰甲草胺、野草枯、吡氟酰草
胺、diflufenzopyr、恶唑隆、啶草丹、二甲草胺、异戊乙净、二甲酚草
25 胺、dimexyflam、敌乐氯、双苯酰草胺、敌草快、氯硫草定、敌草隆、
杀草隆、epoprodan、茵草敌、戊草丹、乙丁烯氟灵、胺苯磺隆(-甲基)、
乙氧呋草黄、ethoxyfen、乙氧嘧磺隆、etobenzanid、精恶唑禾草灵、
麦草氟异丙酯、麦草氟异丙酯-L、麦草氟甲酯、啶嘧磺隆、精吡氟禾

- 草灵、唑啉磺草胺、氟烯草酸、丙炔氟草胺、flumipropyn、唑啉磺草胺、氟草隆、氟咯草酮、乙羧氟草醚、氟胺唑草、flupropacil、flurpysulfuron (-甲基, -钠)、芬丁酯(-丁基)、氟啶草酮、氟氟吡氧乙酸(-甲基)、唑啉醇、唑草酮、fluthiacet (-甲基)、fluthiamide、氟磺胺草醚、
- 5 草铵膦(-铵)、草甘膦(-异丙基铵)、halosafen、氟吡禾灵(-乙氧基乙基)、氟吡甲禾灵(haloxypop (-p-methyl))、环嗪酮、咪草酸、imazamethapyr、imazamox、咪唑烟酸、咪唑喹啉酸、咪唑乙烟酸、唑啉磺隆、碘苯腈、异丙乐灵、isoproturon、异恶隆、异恶酰草胺、isoxaflutole、异噁草醚、乳氟禾草灵、环草啶、利谷隆、2 甲 4 氯、MCPP、苯噻酰草胺、
- 10 苯噻草酮、吡唑草胺、甲基苯噻隆、吡喃隆、溴谷隆、(α -)异丙甲草胺、磺草唑胺、甲氧隆、噻草酮、甲磺隆、禾草敌、绿谷隆、萘丙胺、敌草胺、草不隆、烟嘧磺隆、氟草敏、坪草丹、氧磺乐灵、oxadiagyl、噁草酮、oxasulfuron、oxaziclomefone、乙氧氟草醚、百草枯、pelargonic 酸、二甲戊灵、pentoxazone、甜菜宁、啶草磷、丙草胺、氟啉磺隆、
- 15 扑草净、毒草胺、敌稗、恶草酸、异丙草胺、炔苯酰草胺、苄草丹、氟磺隆、pyraflufen (-乙基)、吡唑特、吡啉磺隆、苄草唑、pyribenzoxim、稗草丹、啶草特、pyriminobac (-甲基)、啉草硫醚、二氯喹啉酸、氯甲喹啉酸、灭藻醌、精喹禾灵、喹禾糖酯、砒啉磺隆、稀禾定、西玛津、西草净、磺草酮、甲磺草胺、甲啉磺隆、草硫膦、sulfosulfuron、牧草
- 20 胺、丁噻隆、特丁津、特丁净、噻吩草胺、thiafluamide、噻唑烟酸、thidiazimin、噻吩磺隆、禾草丹、仲草丹、三甲苯草酮、野麦畏、醚苯磺隆、苯磺隆、三氯吡氧乙酸、灭草环、氟乐灵和氟胺磺隆。

与其它已知的活性化合物，例如杀真菌剂、杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、驱鸟剂(bird repellents)、植物营养素和改善土壤结构的物质的

25 混合物也是可能的。

可以使用该活性化合物本身、以其制剂的形式或以通过将其进一步稀释而由此制备的使用形式，例如待用(ready-to-use)的溶液、悬浮液、乳液、散剂、膏剂和颗粒剂。它们可以以常规方法，例如浇水、

喷洒、喷雾、撒布来使用。

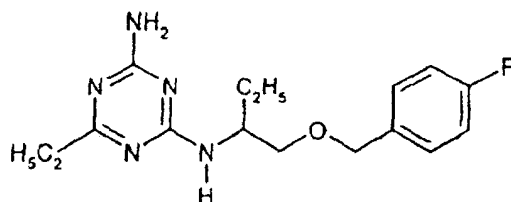
根据本发明的活性化合物可以在植物出苗前和出苗后均可以施用。它们也可在播种前掺入到土壤中。

所用活性化合物的量可在相当宽的范围内变化。这主要取决于所需作用的性质。一般来说，所用的量在每公顷土表 1g-10kg 活性化合物之间，优选在每公顷 5g-5kg 之间。

根据本发明的活性化合物的制备和用途可从以下实施例中看出。

10 制备实施例:

实施例 1

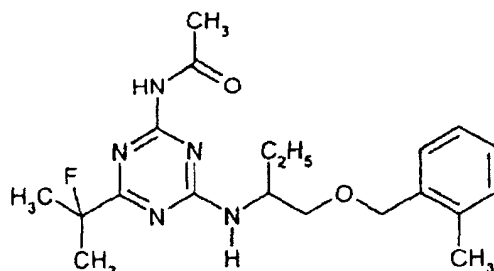


(方法(a))

于-10℃，将 1.08g (20mmol) 甲醇钠在 5ml 甲醇中的溶液搅拌下滴加到 3.18g (10mmol) 的 1-[1-(4-氟代苄氧基甲基)-丙基]-双胍盐酸盐(外消旋的)和 2.8g 粉末状分子筛(4Å)在 10ml 甲醇中的混合物中。然后滴加 1.14ml (10mmol) 丙酸乙酯。将该反应混合物温热至室温(约 20℃)并再搅拌 15 小时。然后从沉淀的混合物中，用抽吸滤除固体和分子筛，浓缩滤液，将残留物溶解于乙酸乙酯中。用水洗涤后，经硫酸钠干燥并用水泵真空浓缩，残留物经柱层析(硅胶，乙酸乙酯/石油醚)处理。

如此得到熔点为 96℃ 的 1.4g (44%理论值) 2-氨基-4-乙基-6-[1-(4-氟代苄氧基甲基)-丙基氨基]-1,3,5-三嗪(外消旋体)。

实施例 2



(方法(d))

- 于 100℃, 将 2-氨基-4-(1-氟代-1-甲基-乙基)-6-[1-(2-甲基-苄氧基甲基-1-丙基氨基]-1,3,5-三嗪(外消旋体, 260mg, 0.75mmol)在乙酸酐 (5ml)中加热 1 小时。冷却至室温后, 将该混合物与水(10ml)混合, 搅拌 1 小时, 通过抽滤分离沉淀的产物。

如此得到熔点为 108℃的 140mg (50%理论值) 2-乙酰氨基-4-(1-氟代-1-甲基-乙基)-6-[1-(2-甲基-苄氧基甲基)-丙基氨基]-1,3,5-三嗪(外消旋体)。

- 10 类似于实施例 1 和 2, 并根据本发明对制备方法的一般描述, 也有可能制备例如列于下表 1 中的式(I)化合物。

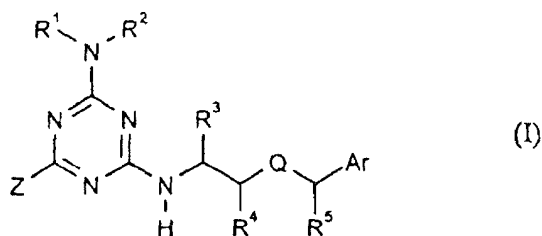


表 1：式(I)化合物的实施例

实施例 编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说 明
3	H	H	CH ₃	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 104°C (外消旋体)
4	H	H	CH ₃	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 105°C (外消旋体)
5	H	H	CH ₃	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 114°C (外消旋体)
6	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 95°C (外消旋体)
7	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 98 °C (外消旋体)
8	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 114°C (外消旋体)
9	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 118°C (外消旋体)
10	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 126°C (外消旋体)
11	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 115°C (外消旋体)
12	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 89°C (外消旋体)
13	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 104°C (外消旋体)
14	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 104°C (外消旋体)
15	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 105°C (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

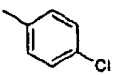
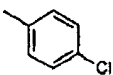
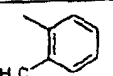
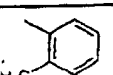
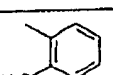
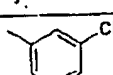
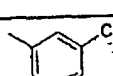
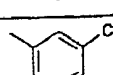
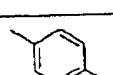
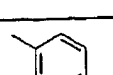
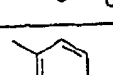
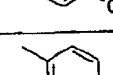
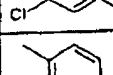
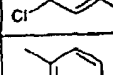
实施例 编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说明
16	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 100°C (外消旋体)
17	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 102°C (外消旋体)
18	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 102°C (外消旋体)
19	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 104°C (外消旋体)
20	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 106°C (外消旋体)
21	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 99°C (外消旋体)
22	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 102 °C (外消旋体)
23	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 107°C (外消旋体)
24	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 94°C (外消旋体)
25	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 96°C (外消旋体)
26	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 116°C (外消旋体)
27	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 113°C (外消旋体)
28	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 103°C (外消旋体)
29	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 112°C (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

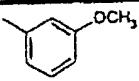
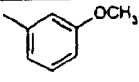
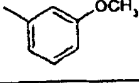
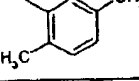
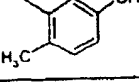
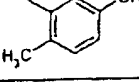
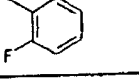
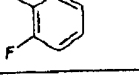
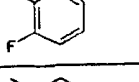
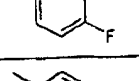
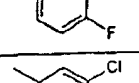
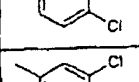
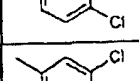
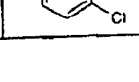
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
30	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 92°C (外消旋体)
31	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 95°C (外消旋体)
32	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 98° (外消旋体)
33	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 129°C (外消旋体)
34	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 134°C (外消旋体)
35	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 143°C (外消旋体)
36	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 92°C (外消旋体)
37	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 104°C (外消旋体)
38	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 113°C (外消旋体)
39	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 98°C (外消旋体)
40	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 99°C (外消旋体)
41	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 86°C (外消旋体)
42	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 85°C (外消旋体)
43	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 97°C (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

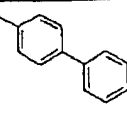
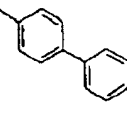
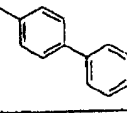
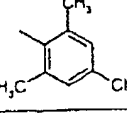
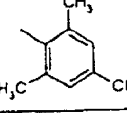
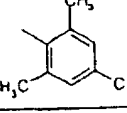
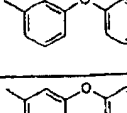
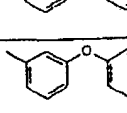
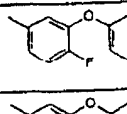
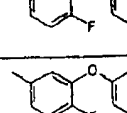
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
44	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 84°C (外消旋体)
45	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 101°C (外消旋体)
46	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 89°C (外消旋体)
47	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
48	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 60°C (外消旋体)
49	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 63°C (外消旋体)
50	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
51	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 86°C (外消旋体)
52	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 91°C (外消旋体)
53	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
54	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 85°C (外消旋体)
55	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 116°C (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

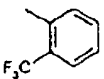
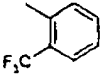
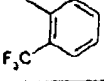
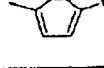
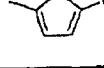
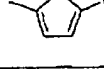
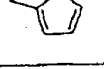
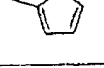
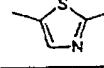
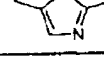
实施 例编 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说 明
56	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 83°C (外消旋体)
57	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 117°C (外消旋体)
58	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 131°C (外消旋体)
59	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 78°C (外消旋体)
60	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 105°C (外消旋体)
61	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 94°C (外消旋体)
62	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
63	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
64	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)
65	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 83°C (外消旋体)
66	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 86°C (外消旋体)
67	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 94°C (外消旋体)
68	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
69	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

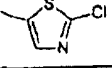
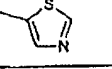
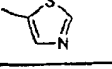
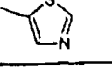
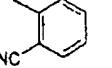
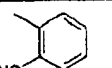
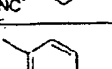
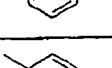
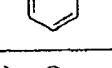
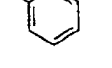
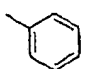
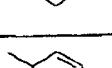
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
70	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
71	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
72	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
73	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
74	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p.: 96 °C (外消旋体)
75	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 106 °C (外消旋体)
76	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 119 °C (外消旋体)
77	H	COCH ₃	CH ₃	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
78	H	COCH ₃	CH ₃	H	H		O	CHFCH ₃	
79	H	COCH ₃	CH ₃	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)
80	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
81	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
82	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
83	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

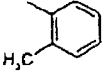
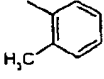
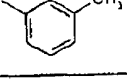
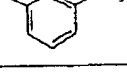
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
84	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
85	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p. 102°C (外消旋体)
86	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
87	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
88	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)
89	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
90	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p. 104°C (外消旋体)
91	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
92	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
93	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
94	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
95	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

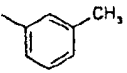
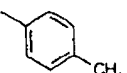
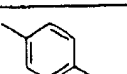
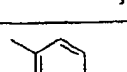
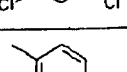
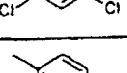
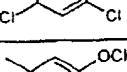
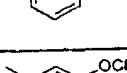
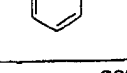
实施 例编 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说 明
96	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
97	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p. 85°C (外消旋体)
98	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
99	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
100	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
101	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p. 128°C (外消旋体)
102	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
103	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
104	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
105	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)
106	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

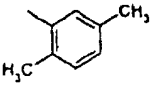
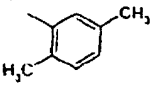
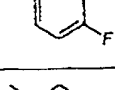
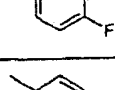
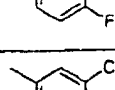
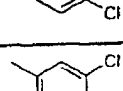
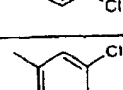
实施例 编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说明
107	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
108	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
109	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
110	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
111	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)
112	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
113	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
114	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)
115	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p. 84°C (外消旋体)
116	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
117	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

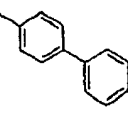
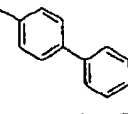
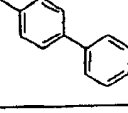
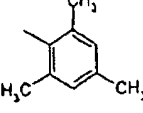
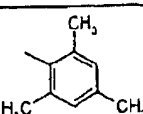
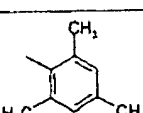
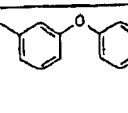
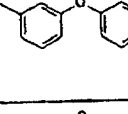
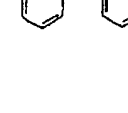
实施 例编 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说 明
118	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	m.p. 123°C (外消旋体)
119	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
120	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)
121	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
122	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
123	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
124	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
125	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
126	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

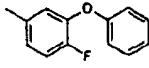
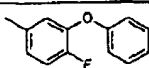
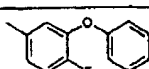
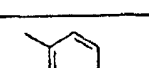
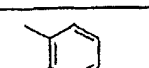
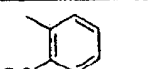
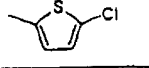
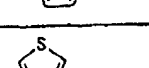
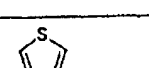
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
127	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
128	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
129	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
130	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
131	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
132	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
133	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
134	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p. 83°C (外消旋体)
135	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
136	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
137	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
138	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	(无定形的) (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

实施 例编 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说 明
139	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
140	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
141	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
142	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
143	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
144	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
145	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
146	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
147	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
148	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
149	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
150	H	COCH ₃	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p. 131°C (外消旋体)
151	H	COC ₂ H ₅	CH ₃	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
152	H	COC ₂ H ₅	CH ₃	H	H		O	CHFCH ₃	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
153	H	COC ₂ H ₅	CH ₃	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	m.p. 126°C (外消旋体)
154	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
155	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
156	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
157	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
158	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
159	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
160	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
161	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
162	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
163	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
164	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

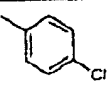
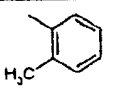
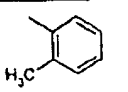
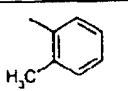
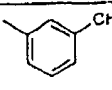
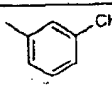
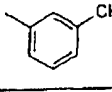
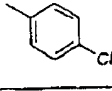
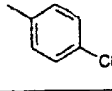
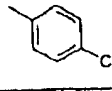
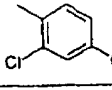
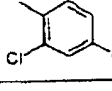
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
165	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
166	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
167	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
168	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
169	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
170	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
171	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
172	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
173	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
174	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
175	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
176	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

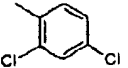
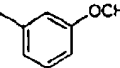
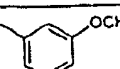
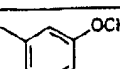
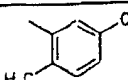
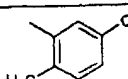
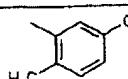
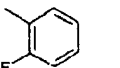
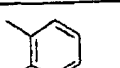
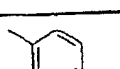
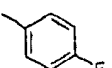
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
177	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
178	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)
179	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
180	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
181	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
182	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
183	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
184	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
185	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
186	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
187	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

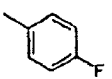
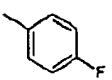
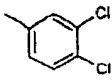
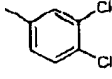
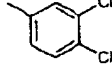
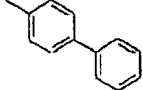
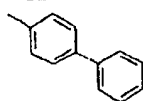
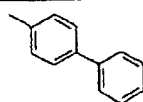
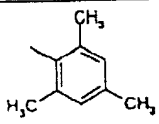
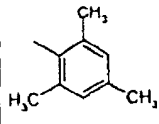
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
188	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
189	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
190	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
191	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
192	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
193	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
194	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
195	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
196	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
197	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

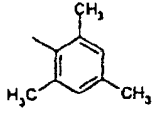
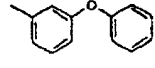
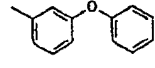
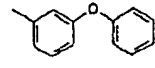
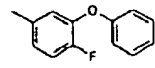
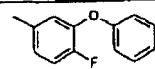
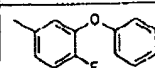
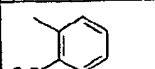
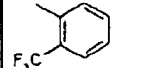
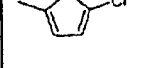
实施例 编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说 明
198	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
199	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
200	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
201	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
202	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
203	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
204	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
205	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
206	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
207	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
208	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	(无定形的) (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

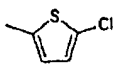
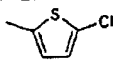
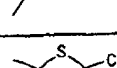
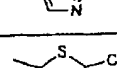
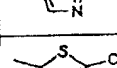
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
209	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
210	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
211	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
212	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
213	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
214	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
215	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
216	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
217	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
218	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
219	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
220	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
221	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
222	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

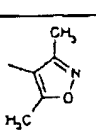
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
223	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CH ₂ CH ₃	
224	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	
225	H	COC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H		O	C(CH ₃) ₂ F	
226	H	H	CH ₃	H	H		O	CF ₃	
227	H	H	CH ₃	H	H		S	C(CH ₃) ₂ F	n _D ²⁰ : 1.5635 (外消旋体)
228	H	H	CH ₃	H	H		S O ₂	C(CH ₃) ₂ F	m.p.: 67°C (外消旋体)
229	H	H	C ₂ H ₅	H	H		S	C(CH ₃) ₂ F	

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

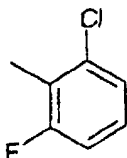
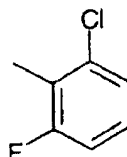
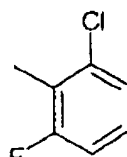
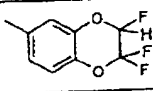
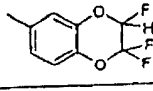
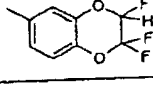
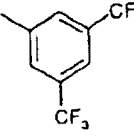
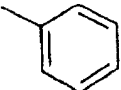
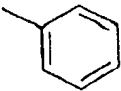
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
230	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C ₂ H ₅	m.p.: 69°C (外消旋体)
231	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
232	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	(无定形的) (外消旋体)
233	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C ₂ H ₅	m.p.: 84°C (外消旋体)
234	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	(无定形的) (外消旋体)
235	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 99°C (外消旋体)
236	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 61°C (外消旋体)
237	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C ₂ H ₅	m.p.: 87°C (S 对映体)
238	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 98°C (S 对映体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

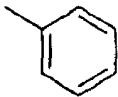
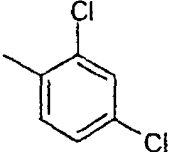
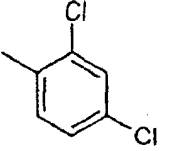
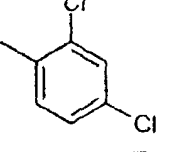
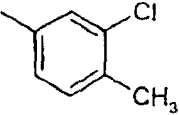
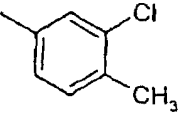
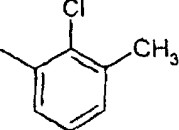
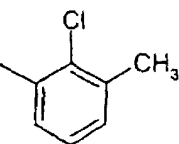
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
239	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 89°C (S 对映体)
240	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C ₂ H ₅	m.p.: 111°C (R 对映体)
241	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 99°C (R 对映体)
242	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 117°C (R 对映体)
243	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 80°C (外消旋体)
244	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C ₂ H ₅	m.p.: 64°C (外消旋体)
245	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 85°C (外消旋体)
246	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 112°C (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

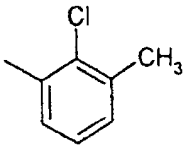
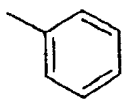
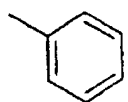
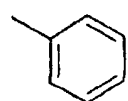
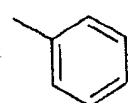
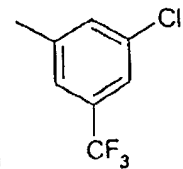
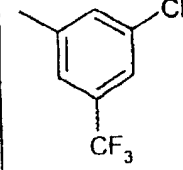
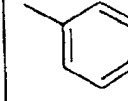
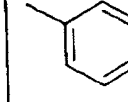
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
247	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	C ₂ H ₅	m.p.: 118°C (外消旋体)
248	H	H	CH ₃	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 84°C (S 对映体)
249	H	H	CH ₃	H	H		O	C ₂ H ₅	m.p.: 61°C (S 对映体)
250	H	H	CH ₃	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 82°C (R 对映体)
251	H	H	CH ₃	H	H		O	C ₂ H ₅	m.p.: 73°C (R 对映体)
252	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 96°C (外消旋体)
253	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 96°C (外消旋体)
254	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	(无定形的) (S 对映体)
255	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 97°C (S 对映体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

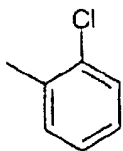
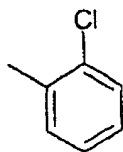
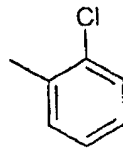
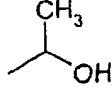
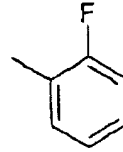
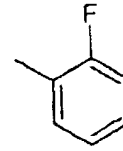
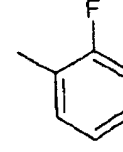
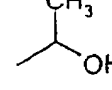
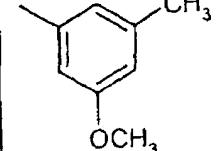
实施例编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和立体化学说明
256	H	H	CH ₃	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 95°C (外消旋体)
257	H	H	CH ₃	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 92°C (外消旋体)
258	H	H	CH ₃	H	H		O		(无定形的) (外消旋体)
259	H	H	CH ₃	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 93°C (外消旋体)
260	H	H	CH ₃	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 113°C (外消旋体)
261	H	H	CH ₃	H	H		O		(无定形的) (外消旋体)
262	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 98°C (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

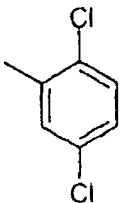
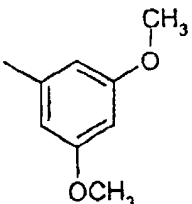
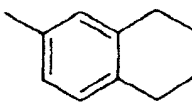
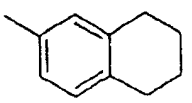
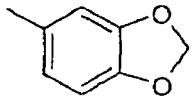
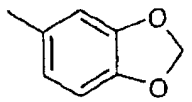
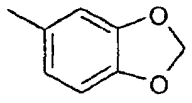
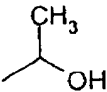
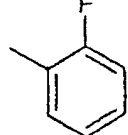
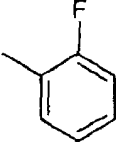
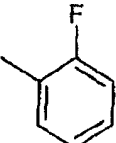
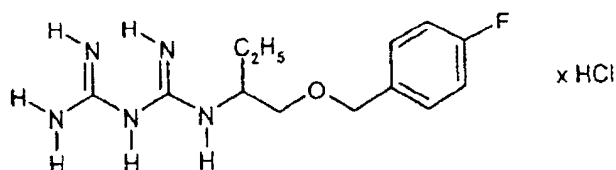
实施例 编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说明
263	H	H	CH ₃	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 107°C (外消旋体)
264	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 100°C (外消旋体)
265	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 117°C (外消旋体)
266	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 103°C (外消旋体)
267	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF(CH ₃) ₂	m.p.: 128°C (外消旋体)
268	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCH ₃	m.p.: 97°C (外消旋体)
269	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O		m.p.: 106°C (外消旋体)
270	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CF ₂ Cl	m.p.: 100°C (外消旋体)

表 1 (续): 式(I)化合物的实施例

实施例 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	Z	物理数据和 立体化学说明
271	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHFCl ₃	m.p.: 117°C (外消旋体)
272	H	H	C ₂ H ₅	H	H		O	CHCl ₂	m.p.: 87°C (外消旋体)

式(II)的原料:实施例(II-1)

将 2.52g (30mmol) 氰基胍和 7.01g (30mmol) 的 2-氨基-1-(4-氟代苄氧基)-丁烷盐酸盐(外消旋的)在研钵中均匀混合, 然后于 160℃ 融化在一起 30 分钟。在冷却期间, 将该混合物与 30ml 甲醇混合。生成的 1-[1-(4-氟代-苄氧基甲基)-丙基]-双胍盐酸盐根据实施例 1 进行反应。

与实施例(II-1)类似, 也有可能制备例如下式(II)的化合物。

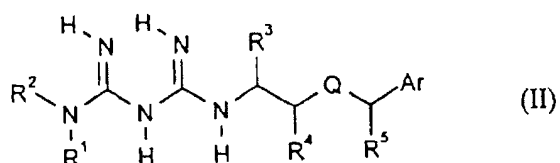


表 2：式(II)化合物的实施例

-在每种情况下 R^1 和 R^2 表示 H(氢)

-所有的化合物为盐酸盐

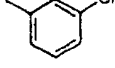
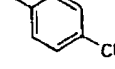
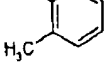
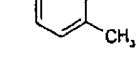
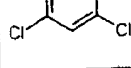
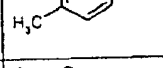
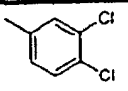
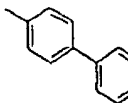
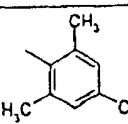
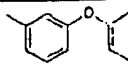
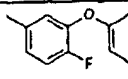
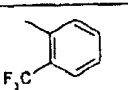
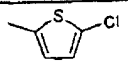
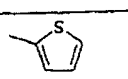
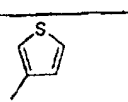
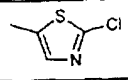
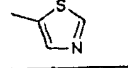
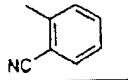
实施例编号	R^3	R^4	R^5	Ar	Q	物理数据和立体化学说明
II-2	CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-3	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-4	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-5	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-6	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-7	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-8	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-9	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-10	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-11	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-12	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-13	CH ₂ CH ₃	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)

表 2 (续): 式(II)化合物的实施例

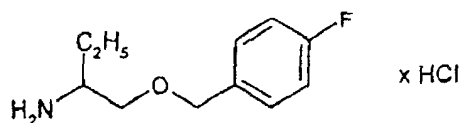
-在每种情况下 R^1 和 R^2 表示 H(氢)

-所有的化合物为盐酸盐

实施例编号	R^3	R^4	R^5	Ar	Q	物理数据和立体化学说明
II-14	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-15	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-16	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-17	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-18	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-19	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-20	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-21	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-22	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)
II-23	CH_2CH_3	H	H		O	
II-24	CH_2CH_3	H	H		O	
II-25	CH_2CH_3	H	H		O	(无定形的) (外消旋体)

式(VII)的原料:

实施例(VII-1)



步骤 1

于室温(约 20℃)下,使 7.5ml (80mmol) 2-氨基-1-丁醇在 90ml 四氢
 5 呋喃中的溶液与 2.4g (80mmol) 氯化钠(80%强度)一次一小部分地混
 合,然后于回流下加热 30 分钟。冷却后,加入 10.3g (71mmol) 4-氟代
 -苄基氯,然后在回流下加热该混合物 2 小时。再次冷却后,加入水直
 至沉淀的盐溶解,经水泵真空从该混合物中蒸馏掉溶剂。将残留物倾
 10 入 1N 盐酸中并用二氯甲烷提取二次。用水再提取二氯甲烷相。然后
 用浓氢氧化钠水溶液将该含水相调至 pH 10,并用二氯甲烷提取 3 次。
 经硫酸钠干燥有机提取溶液并过滤。在水泵真空下从滤液中小心蒸馏
 掉溶剂。

这样得到 13.4g (96%理论值) 2-氨基-1-(4-氟代-苄氧基)-丁烷,为
 油性残留物。

15

步骤 2

将 13.4g (68mmol) 2-氨基-1-(4-氟代苄氧基)-丁烷溶于 40ml 甲醇中
 并与 7.7g (68mmol) 浓盐酸混合。在水泵真空下除去溶剂,使残留物与
 20ml 甲苯混合并再一次在水泵真空下浓缩。

20 这样得到 14.9g (94%理论值) 为白色固体的 2-氨基-1-(4-氟代-苄氧
 基)-丁烷盐酸盐。

类似于实施例(VII-1),也有可能制备,例如列于下表 3 中的式(VII)
 化合物。

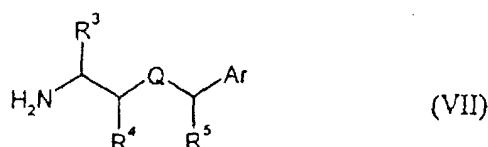


表 3 : 式(VII)化合物的实施例

-在每种情况下所述化合物为盐酸盐

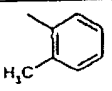
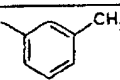
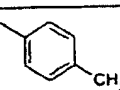
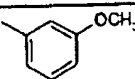
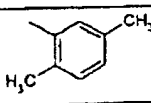
实施例 编号	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	物理数据和立体 化学说明
VII-2	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 141°C (外消旋体)
VII-3	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 97°C (外消旋体)
VII-4	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 112°C (外消旋体)
VII-5	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 101°C (外消旋体)
VII-6	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 115°C (外消旋体)
VII-7	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 103°C (外消旋体)
VII-8	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 113°C (外消旋体)
VII-9	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 129°C (外消旋体)

表 3 (续): 式(VII)化合物的实施例

-在每种情况下所述化合物为盐酸盐

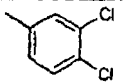
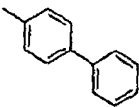
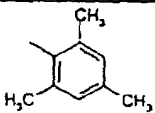
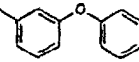
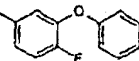
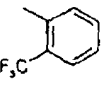
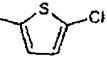
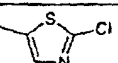
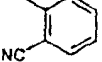
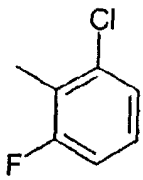
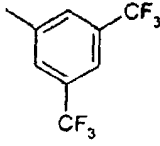
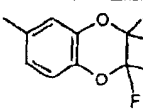
实施例 编号	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	物理数据和立体 化学说明
VII-10	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 145°C (外消旋体)
VII-11	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 150°C (外消旋体)
VII-12	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 78°C (外消旋体)
VII-13	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 66°C (外消旋体)
VII-14	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 125°C (外消旋体)
VII-15	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 84°C (外消旋体)
VII-16	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 63°C (外消旋体)
VII-17	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 58°C (外消旋体)
VII-18	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 72°C (外消旋体)
VII-19	CH ₂ CH ₃	H	H		O	
VII-20	CH ₂ CH ₃	H	H		O	
VII-21	CH ₂ CH ₃	H	H		O	m.p.: 93°C (外消旋体)

表 3 (续): 式(VII)化合物的实施例

-在每种情况下所述化合物为盐酸盐

实施例 编号	R ³	R ⁴	R ⁵	Ar	Q	物理数据和立体 化学说明
VII-22	CH ₂ CH ₃	H	H		O	
VII-23	CH ₂ CH ₃	H	H		O	
VII-24	CH ₂ CH ₃	H	H		O	

用途实施例:实施例 A

萌芽前实验

溶剂: 5 份(重量)丙酮

5 乳化剂: 1 份(重量)烷基聚乙二醇醚

为生产活性化合物的适合的制剂, 将 1 份(重量)活性化合物与所述量的溶剂混合, 加入所述量的乳化剂并用水将该浓缩物稀释至所需浓度。

10 将实验植物的种子播种在普通泥土中。约 24 小时后, 向泥土喷洒活性化合物的制剂, 以使每单位面积施用所需的特定量的活性化合物。选择喷洒液的浓度, 以使所需的特定量的活性化合物以 1000L 水/公顷施用。

3 周后, 与未处理的对照植物的发育比较, 以%受损率评价植物的受损程度。

15

数字表示:

0% = 无作用(类似未处理对照植物)

100% = 完全破坏

20 在该实验中, 例如, 制备实施例 8 和 14 的化合物表现出极强的抑制杂草的作用(参见表 A; “ai.” = 活性成分), 它们中的一些可为作物, 例如玉米很好地耐受。

表 A :

萌芽前实验(温室)

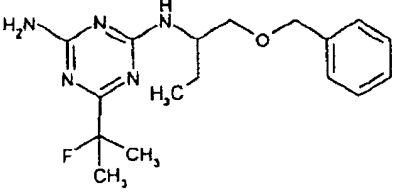
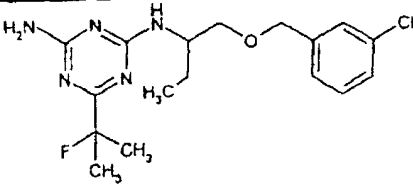
制备实施例的活性化合物	使用率 (活性 成分 g/ 公顷)	看麦 娘属	狗尾 草属	苘麻 属	苋属	猪殃 殃属	白芥属
 (8)	1000	100	100	100	100	100	100

表 A (续):

制备实施例的活性化合物	使用率 (活性 成分 g/ 公顷)	玉蜀 黍属	看麦 娘属	苘麻 属	苋属	白芥属
 (14)	1000	10	95	95	100	90

实施例 B

萌芽后实验

溶剂: 5 份(重量)丙酮

乳化剂: 1 份(重量)烷基聚乙二醇醚

5

为生产活性化合物的适合的制剂, 将 1 份(重量)活性化合物与所述量的溶剂混合, 加入所述量的乳化剂并用水将该浓缩物稀释至所需浓度。

10 将活性化合物的制剂喷洒到高度为 5-15cm 的实验植物上, 以使每单位面积施用所需的特定量的活性化合物。选择喷洒液的浓度, 以使所需的特定量的活性化合物以 1000L 水/公顷施用。

3 周后, 与未处理的对照植物的生长比较, 以%受损率评价植物的受损程度。

数字表示:

15 0% = 无作用(类似未处理对照植物)

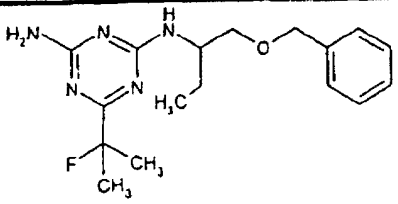
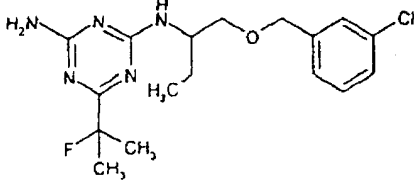
100% = 完全破坏

在该实验中, 例如, 制备实施例 8 和 14 的化合物表现出极强的抑制杂草的作用(参见表 B)。

20

表 B :

萌芽后实验/温室

制备实施例的活性成分	使用率 (活性成分 g/ 公顷)	看麦 娘属	苘麻 属	苋属	猪殃 殃属	白芥属
 (8)	1000	95	100	100	90	100
 (14)	1000	100	100	100	95	100