

(19)



SUOMI - FINLAND

(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI 800530 A7**

(12) **JULKISEKSI TULLUT PATENTTIHAKEMUS
PATENTANSÖKAN SOM BLIVIT OFFENTLIG
PATENT APPLICATION MADE AVAILABLE TO THE
PUBLIC**

(21) Patentihakemus - Patentansökan - Patent application 800530

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation -
International patent classification
C07D239/70
C07D491/044

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date 22.02.1980

(23) Saapumispäivä - Ankomstdag - Reception date 22.02.1980

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig - Available to the public 01.01.1981

(43) Julkaisupäivä - Publiceringsdag - Publication date 12.06.2019

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet - Priority

22.02.1979 US 014,201 28.08.1979 US 68,658

18.01.1980 US 109,262

(71) Hakija - Sökande - Applicant

1 •E.I. Du Pont de Nemours and Company, 1007 Market Street, Wilmington, DE 19898, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 •Levitt, George, USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Kolster Oy Ab, Salmisaarenaukio 1, 00180 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Herbisidiset sulfonamidit.

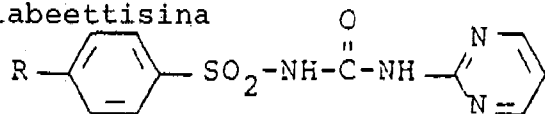
Herbicida sulfonamider.

E.I. du Pont de Nemours and Company, Wilmington, Delaware, Yhdysvallat

Herbisidiset suldonamidit - Herbicida sulfonamider

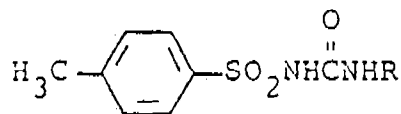
Tämä keksintö koskee N-(heterosyklisiä aminokarbonyyli)-aryyli ja pyridyylisulfonamidi-maanviljelyskemikaaleja.

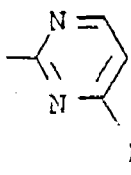
Ranskalaisessa patentissa no. 1 468 747 esitetään seuraavat para-substituoidut fenyyllisulfonamidit, jotka ovat käyttökelpoisia antidiabeettisina aineina:



jossa R=H, halogeeni, CF₃ tai alkyyli.

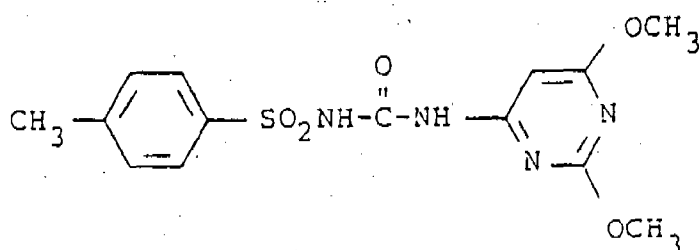
Logemann et al. Chem. Ab., 53, 18052 g (1959), esittävät lukuisia sulfonamideja, mukaanlukien urasiili-johdannaiset, sekä ne, joilla on kaava:



jossa R on butyyli, fenyyli tai  ja R₁ on

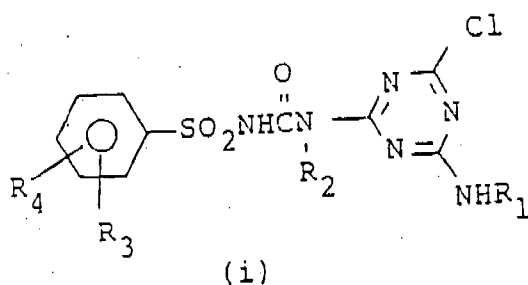
vety tai metyyli. Testattaessa hypoglyseemistä vaikutusta rotilla (suun kautta annettavat annokset 25 mg/100 g) olivat tehokkaimpia yhdisteet, joissa R on butyyli tai fenyyli. Muut olivat vähemmän tehokkaita tai tehottomia.

Wojciechowski, J. Acta. Polon. Pharm. 19, s. 121-5 (1962)
[Chem. Ab., 39 1633 e] esittää N-[(2,6-dimetoksi-pyrimidin-4-yyli)aminokarbonyyli]-4-metyylibentseenisulfonamidin synteesin:



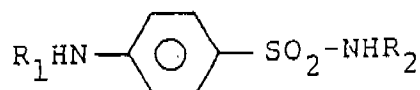
Perustuen samanlaisuuteen tunnetun yhdisteen kanssa, tekijä oletti edellä mainituille yhdisteille hypoglyseemisen aktiviteetin.

Alankomaalaisessa patentissa 121 788, julkaistu 15 syyskuuta, esitetään kaavan (i) mukaisten yhdisteiden valmistus ja niiden käyttö yleisinä tai selektiivisinä herbisideinä,



jossa R_1 ja R_2 voivat olla alkyyli, jolla on 1-4 hiiliatomia; tai R_3 ja R_4 voivat olla vety, kloori tai alkyyli, jolla on 1-4 hiiliatomia.

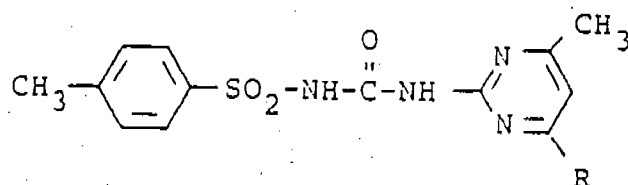
U.S. patentissa 3 637 366 esitetään yhdisteet, joilla on kaava:



jossa R_1 on vety tai alempi tyydytetty asyyli ja R_2 on vety, 2-pyrimidinyyli, pyridyyli, amidino, asetyyli tai karbamoyyli.

Esitettyjen yhdisteiden sanotaan aikaansaavan verihirssin, krassin, lehtisikurin, apilan ja Poa annua kontrollin.

Seuraavan kaavan mukaiset substituoidut pyrimidinyylisulfoniureat, jotka ovat myös para-substituoidut fenyyliarenkaan suhteen, on esitetty Farmco Ed. Sci:ssa, 12, 586 (1957) [Chem. Ab., 53, 18052 g (1959)]:

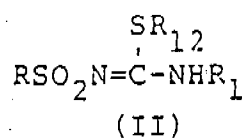
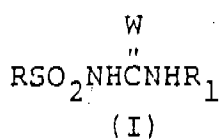


jossa $R = \text{H}$ tai CH_3 .

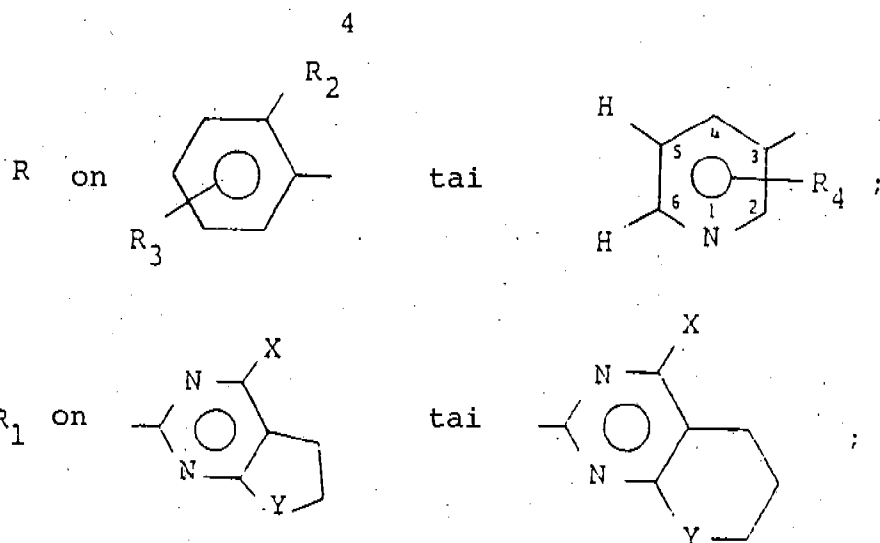
Ei-halutun kasvillisuuden läsnäolo aiheuttaa huomattavaa vahinkoa käyttökelpoiselle sadolle, erityisesti sellaisille maataloustuotteille, jotka tyydyttävät ihmisen ruoan ja kuitujen perustarpeet, kuten puuvillalle, riisille, maissille, vehnälle ja niiden kaltaisille. Nykyinen väestönräjähdyks ja siihen liittyvä maailman ruoan ja kuitujen puute vaativat parannuksia näiden satojen tuotantotehokkuuteen. Yksi tapa parantaa tätä tehokkuutta estettäessä tai minimoitaessa sellaisen arvokkaan sadon osan menetystä on ei-halutun kasvillisuuden tuhoaminen tai kasvunesto.

Saatavilla on laaja valikoima aineita, jotka ovat käyttökelpoisia ei-halutun kasvillisuuden tuhoamiseen tai kasvun estämiseen (säätelystä): tällaisiin aineisiin viitataan yleisesti herbisideinä. Jotkut rikkaruohot (kuten pähkinäsara) ovat hyvin vaikeasti hallittavissa; monet herbisideistä, joita käytetään pähkinäsaran säätelystä ovat niin valikoimattomia, että ne aiheuttavat vahinkoa viljelystuotteelle itselleen. Siten on tarvetta aktiiveista herbisideistä, jotka aiheuttavat minimaaliset vahingot viljelystuotteelle.

Tämän keksinnön mukaisesti aikaansaadaan kaavojen I ja II mukaiset yhdisteet ja niiden maanviljelyksellisesti sopivat suolat, niitä sisältävät sopivat maanviljelykselliset koostumukset ja menetelmät niiden käyttämiseksi sekä selektiivisinä, että yleisinä herbisideinä, joilla on sekä ennen kohoamista ja kohoamisen jälkeen vaikuttava aktiviteetti.



jossa



R_2 on H, CH_3 , OCH_3 , F, Cl, Br, NO_2 , CF_3 , COR_5 , $\text{S(O)}_m \text{R}_{10}$, $\text{SO}_2 \text{NR}_{10} \text{R}_{11}$, $\text{SO}_2 \text{OCH}_2 \text{CF}_3$, $\text{SO}_2 \text{OCH}_2 \text{CCl}_3$ tai $\text{SO}_2 \text{N}(\text{OCH}_3) \text{CH}_3$;

R_3 on H, F, Cl, Br, alkyylili $\text{C}_1\text{-C}_4$ tai CH_3O ;

R_4 on H, Cl, Br, F, alkyylili $\text{C}_1\text{-C}_4$, alkoksi $\text{C}_1\text{-C}_4$,

NO_2 , $\text{CO}_2 \text{R}_6$ tai $\text{R}_{13}\text{-S-}$,

edellyttäen, että R_4 on rajattu pyridiinirenkaan 2- tai 4- asemeen;

R_5 on alkoksi C_1-C_6 ; alkenyylioksi C_3-C_6 ; haloalkoksi C_2-C_6 , jossa 1-3 halogeenit kuuluvat ryhmään Cl, F ja Br; sykloalkoksi C_5-C_6 ; $O-(CH_2CH_2O)_nR_7$; $OCH_2CH_2CH_2OR_7$; NR_8R_9 ; $N(OCH_3)CH_3$ tai C_1-C_4 alkyylitio;
 R_6 on alkyyli C_1-C_6 ;
 R_7 on alkyyli C_1-C_2 ;
 R_8 ja R_9 ovat H tai alkyyli C_1-C_4 tai R_8 ja R_9 voivat olla yhdessä $(CH_2)_4$, $(CH_2)_5$ tai $O(CH_2CH_2-)_2$;
 R_{10} ja R_{11} ovat C_1-C_6 alkyyli tai C_3-C_4 alkenyyli tai R_{10} ja R_{11} voivat olla yhdessä $(CH_2)_4$, $(CH_2)_5$ tai $O(CH_2CH_2)_2$;
 R_{12} on C_1-C_{12} alkyyli; $CH_2CH_2OCH_3$; $CH_2CH_2OCH_2CH_3$; $CH_2CH_2CH_2OCH_3$; CH_2A tai $CH-A$;
 $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ | \\ \text{CH} \end{array}$

R_{13} on C_1-C_3 alkyyli;

X on H, CH_3 , CH_3O , Cl tai OCH_2CH_3 ;

Y on CH_2 tai O;

A on CO_2H , CO_2B , fenyyli, CN, C_2-C_4 alkenyyli,

C_2-C_4 alkyynyli, fenyyli, joka on substituoitu yhdellä tai kahdella metyyli-ryhmällä tai yhdellä tai kahdella kloorilla;

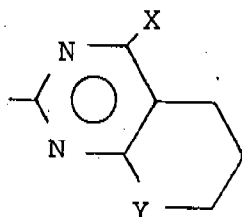
B on C_1-C_4 alkyyli;

m on 0, 1 tai 2;

n on 1 tai 2;

W on happi tai rikki; edellyttäen, että:

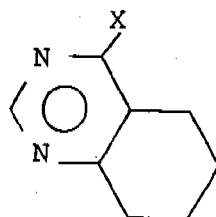
i) kun R_1 on



silloin

R_2 on COR_5 , $SO_2NR_{10}R_{11}$ tai $SO_2N(CH_3)(OCH_3)$; ja
 R_4 on muu kuin H; ja

ii) kun R_1 on

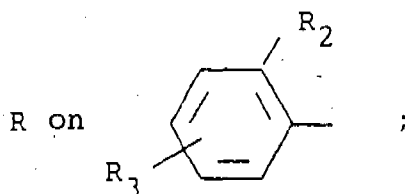


silloin

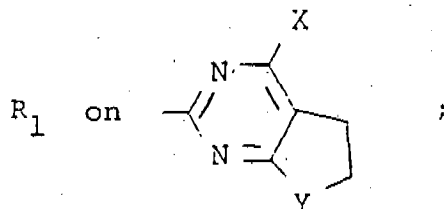
X = CH_3 on OCH_3 ; ja niiden maanviljelyksellisesti sopivat suolat.

Seuraavat yhdisteet ovat edullisia biologisen aktiviteetin tai synteessin helppouden tai kummankin vuoksi:

- (1) Kaavan I mukaiset yhdisteet, joissa W on happi,
- (2) Edulliset yhdisteet (1), joissa



- (3) Edulliset yhdisteet (2), joissa



- (4) Edulliset yhdisteet (3), joissa

X on H, CH₃ ja OCH₃;

- (5) Edulliset yhdisteet (4), joissa

R₂ on NO₂, COR₅, SO₂NR₁₀R₁₁, SO₂R₁₀ tai SO₂N(OCH₃)(CH₃);

R₃ on H; ja

- (7) Edulliset yhdisteet (6), joissa

R₂ on NO₂; COR₅, jossa R₅ on C₁-C₃ alkoksi tai allyylioksi; SO₂N(CH₃)₂; SO₂N(CH₂CH₃)₂ tai SO₂N(OCH₃)(CH₃).

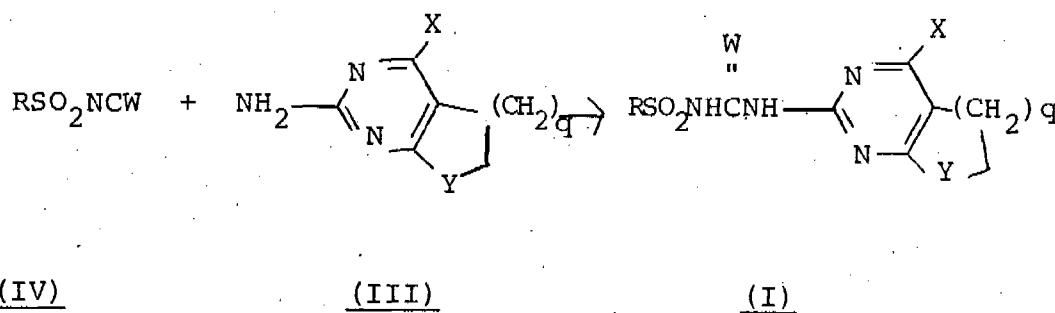
Erityisen edullisia merkittävän herbisidisen aktiviteetin tai hyvin suotuisien kustannuksien tai kummankin vuoksi ovat:
N-[/ (6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-amino-karbonyyli]-2-nitrobentseenisulfonamidi;
2-{[/ (6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-amino-karbonyyli]aminosulfonyyli}bentsoehappo, metyyliesteri;

N-[(6,7-dihydro-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-amino-
 karbonyyli]-2-nitrobentseenisulfonamidi;
 2-kloori-N-[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)
 aminokarbonyyli]/bentseenisulfonamidi;
 2-{[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli) amino-
 karbonyyli]/aminosulfonyyli} bentsoehappo, etyyli-esteri;
 2{[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)-aminokarbo-
 nyyli]/aminosulfonyyli} bentsoehappoetyyliesteri; ja
 2-{[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)-aminokarbo-
 nyyli]/aminosulfonyyli} bentsoehappo-sykloheksyyliesteri;
 N-[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)-aminokar-
 bonyyli]-2-nitrobentseenisulfonamidi;
 2-{[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)-amino-
 karbonyyli]/aminosulfonyyli} bentsoehappo-metyyliesteri; ja
 N'-[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)-amino-
 karbonyyli]-N,N-dimetyyli-1,2-bentseenidisulfonamidi.

Synteesi

Kuten yhtälössä 1 on esitetty kaavan I mukaiset yhdisteet
 voidaan valmistaa yhdistämällä sopiva 2-aminopyrimidiini, jolla
 on kaava III, kaavan IV mukaisen sopivasti substituoidun sulfo-
 nyyli-isosyanaatin tai isotiosyanaatin kanssa; R, X, Y ja W ovat
 samat kuin edellä ja q on 1 tai 2.

Yhtälö 1



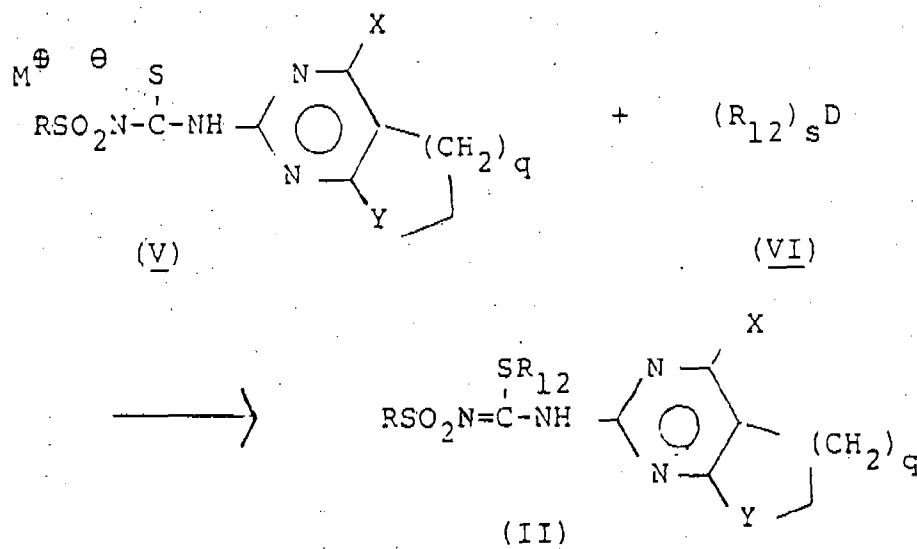
Reaktio suoritetaan edullisimmin inertissä sopivassa orgaa-
 nisessa liuottimessa, kuten metyleenikloridissa, tetrahydrofuraanis-
 sa tai asetonitriilissä, ympäröivässä lämpötilassa ja paineessa.

Lisäystapa ei ole kriittinen, kuitenkin on usein tarkoituksenmukaista lisätä sulfonyyli-isosyanaattia aminopyrimidiinin sekoitettuun suspensioon. Koska tällaiset isosyanaatit yleensä ovat nesteitä, voidaan niiden lisäystä helposti säädellä.

Reaktio on yleensä eksoterminen. Joissain tapauksissa haluttu tuote on liukenematon lämpimään reaktioväliaineeseen ja kiteytyy siitä puhtaassa muodossa. Reaktioväliaineeseen liukoiset tuotteet eristetään haihduttamalla liuotin, hieromalla kiinteä jäännös jauheeksi liuottimen, kuten 1-klooributaanin tai etyyylieetterin, kanssa ja suodattamalla.

Kuten yhtälössä 2 on esitetty, voidaan kaavan II mukaiset yhdisteet valmistaa antamalla sopivasti substituoidun karbamidotiolihapon suolan, jolla on kaava V, reagoida kaavan VI mukaisen alkylointiaineen kanssa:

Yhtälö 2



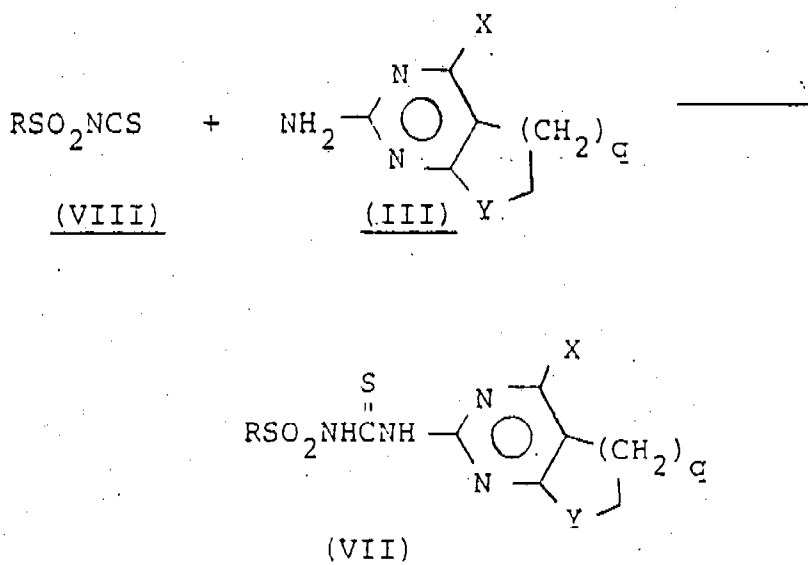
jossa R, R₁₂, X ja Y ovat samat kuin edellä; D on sulfaatti tai halogeeni; kuten Cl, Br tai I; M on alkali tai maa-alkalimetalli; q on 1 tai 2 ja s on muuttuja, joka vastaa D:n valenssia.

Reaktio suoritetaan edullisimmin inertissä sopivassa orgaanisessa liuottimessa, kuten tetrahydrofuraanissa tai dietyylieet-

terissä, lämpötilassa noin 25-100°C ja ympäröivässä paineessa. Lisäystapa ei ole kriittinen; kuitenkin usein on tarkoituksenmukaista lisätä alkylointiaine liuoksena mainitun suolan sekoitettuun suspensioon. Lopputuote eristetään haihduttamalla liuotin ja kiteyttämällä jäännös uudelleen liuottimesta, kuten asetonitriilistä tai etanolista.

Kaavan V mukaiset metallisuolat voidaan valmistaa käsittelemällä vastaavaa sulfonyylitioureaa (kaava VII, yhtälö 3) liuoksella, jossa on alkalimetalli- tai maa-alkalimetallisuola, jolla on riittävän emäksinen anioni erottamaan protonin (esim. hydroksidi, alkoksidi, karbonaatti tai hydridi). Kuten on esitetty yhtälössä 3, sulfonyylitiourea VII voidaan valmistaa yhdistämällä sopivasti substituoitu sulfonyyli-isotiosyanaatti, jolla on kaava VIII, sopivan kaavan III mukaisen 2-aminoheterorengaan kanssa; R, X, Y ja q ovat kuten edellä:

Yhtälö 3

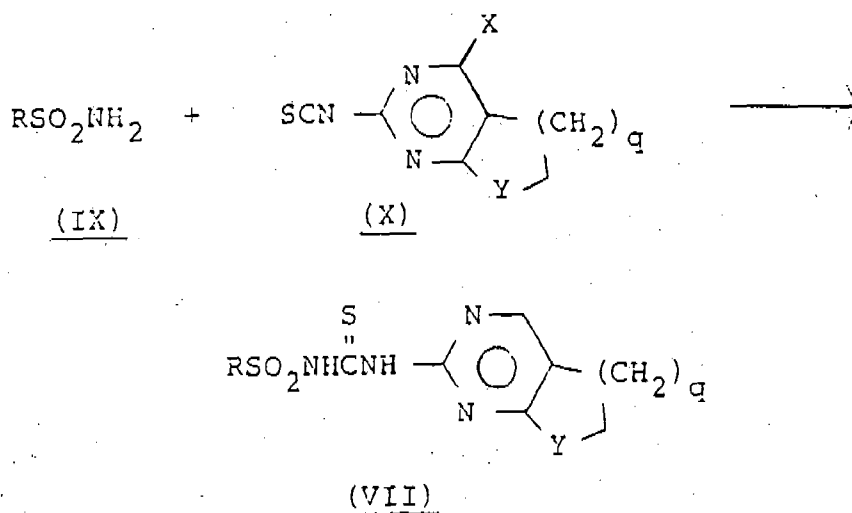


Reaktio suoritetaan edullisimmin inertissä sopivassa orgaanisessa liuottimessa, kuten metyleenikloridissa, tetrahydrofuraanissa tai asetonitriilissä, ympäröivässä paineessa ja lämpötilassa. Lisäystapa ei ole kriittinen; kuitenkin on usein tarkoituksenmukaista lisätä isotiosyanaatti sekoitettuun suspensioon, jossa on aminoheterorengas. Koska sellaiset isotiosyanaatit yleensä ovat nesteitä, niiden lisäystä on helpompi säädellä. Katalyyttejä, kuten

1,4-diatsabisyklo[2.2.2]oktaania tai dibutyylitindilauraattia, voidaan käyttää.

Jossain tapauksissa kaavan VII mukaiset sulfonyylitioureat valmistetaan edullisemmin kuten on esitetty yhtälössä 4, antamalla kaavan IX mukaisen sopivasti substituoidun sulfonamidin reagoida sopivan kaavan X mukaisen 2-isotiosyanatoheterorenkaan kanssa; R, X, Y ja q ovat samat kuin edellä:

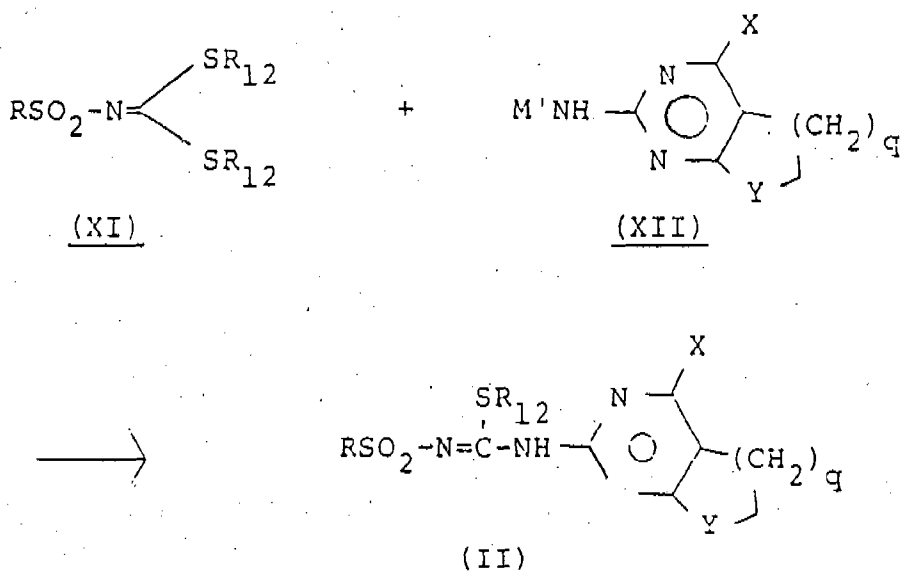
Yhtälö 4



Kaavan X mukaisten 2-isotiosyanatoheterorenkaiden valmistus on esitetty japanilaisessa patentissa Kokai 51-143686.

Kaavan VII mukaisten sulfonyylitioureoiden valmistus ja reagoivat aineet on esitetty mainituissa U.S. hakemuksissa S.N. 824 805 ja 840 389, joidenka sisältö siinä yhteydessä on sisällytetty tähän viittauksella.

Kaavan II mukaiset yhdisteet voidaan myös valmistaa kuten on esitetty yhtälössä 5.

Yhtälö 5

Kaavan XI mukaisen yhdisteen annetaan reagoida heterosykli-
sen aminin suolan kanssa lämpötilassa 0°C - 100°C sopivassa liuotti-
messä, esim. dimetyyliformamidissa, dimetyylisulfoksidissa tai
haihtuvassa liuottimessa, esim. tetrahydrofuraanissa; R, R_{12} , X,
Y ja q ovat samat kuin edellä. M' on alkalimetalli-kationi, esim.
natrium tai kalium.

Kaavan XI mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa kuten on
esitetty Chem. Ber:ssa 99, 2885 (1966).

a. Sulfonyyli-isosyanaatti- tai isotiosyanaatti-välituotteet

Kaavan IV (W=O) mukainen aryylisulfonyyli-isosyanaatti-
välituote voidaan valmistaa antamalla vastaavan aryylisulfonamidien
reagoida fosgeenin kanssa n-butyylimisosaanaatin läsnäollessa
paluujäähdyttämällä liuottimessa, kuten klooribentseenissä, menetelmän
mukaisesti, jonka ovat esittäneet H. Ulrich ja A. A. Y. Sayigh, Newer
Methods of Preparative Organic Chemistry, vol. VI, s. 223-241,
Academic Press, New York ja London, W. Foerst Ed. Kaavan IV (W=O)
mukainen pyridiylisulfonyyli-isosyanaatti-välituote voidaan valmis-
taa antamalla N-(alkyyliaminokarbonyyli)pyridiinisulfonamidin rea-
goida fosgeenin kanssa, kuten on kuvattu U.S. patenttihakemuksessa
966 258, jonka esitys on tässä sisällytetty viittauksin. N-(alkyyli-

aminokarbonyyli)pyridiinisulfonamidi voidaan valmistaa, kuten on kuvattu U.S. SN:ssa 966 258, pyridiinisulfonamidin, alkyylisisosyanaatin ja vedettömän emäksen reaktiolla vedettömässä liuottimessa.

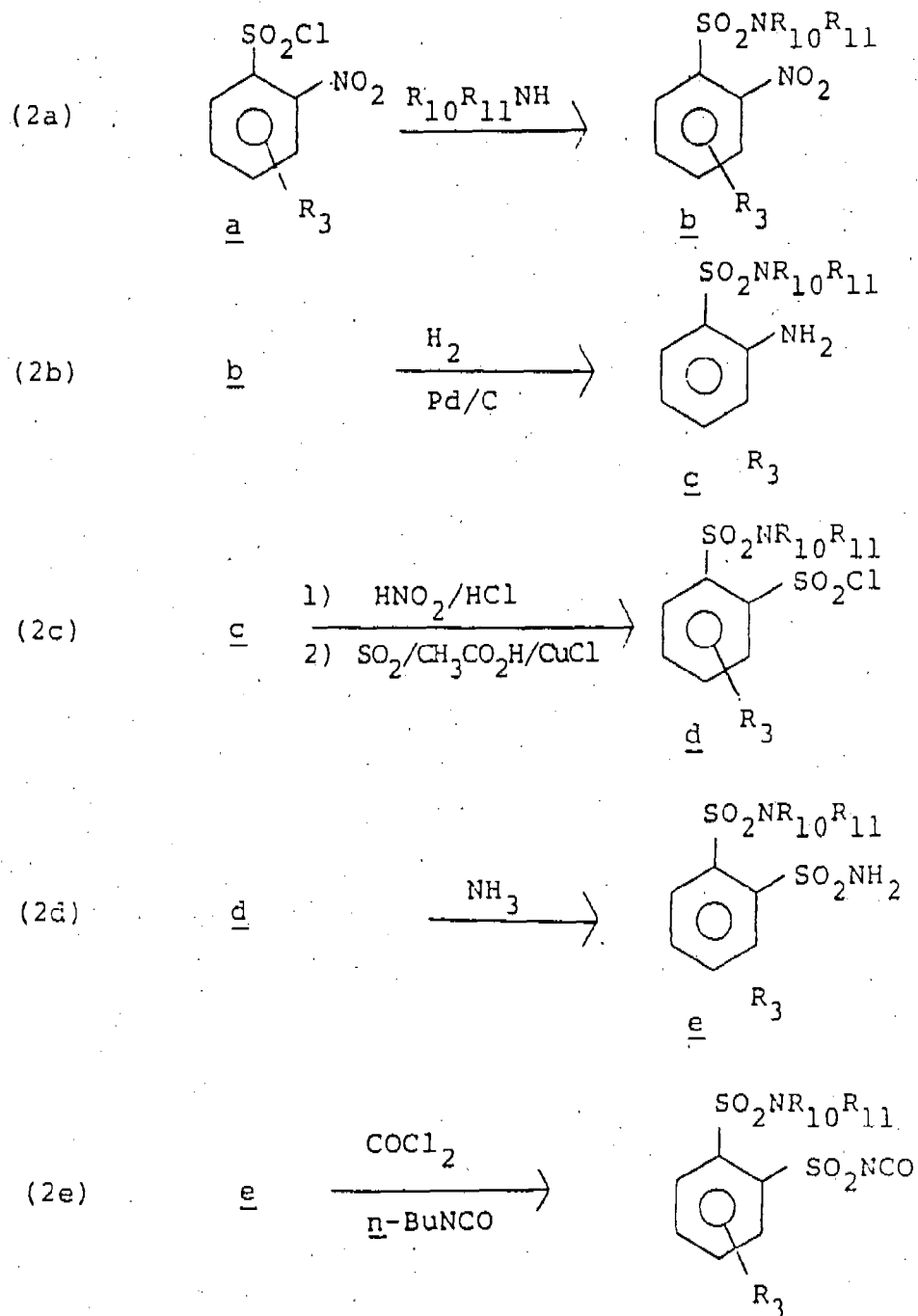
Sulfonamidien valmistusta ammoniumhydroksidista ja sulfonyyli-likloridista on laajalti käsitelty kirjallisuudessa, esim. Crossley et al., J. Am. Chem. Soc. 60, 2223 (1938). Pyridiinisulfonamidin valmistuksen ovat kuvanneet G. Machek, Monatsch 2, 84 (1939) ja L. Thunus ja C. L. Lapiere, Ann. Farn 33, 663 (1975).

Tietyt sulfonyyli-likloridit valmistetaan parhaiten kloorisulfonimalla substituoitu bentseeni hiilitetraklorisissa, niinkuin ovat esittäneet H. T. Clarke et al., Org. Synth. Coll. vol. 1, 2. painos, 1941, s. 85. Muut bentseenisulfonyyli-likloridit valmistetaan parhaiten diatsotoimalla sopiva aniliini natriumnitriitillä HCl:ssa, jonka jälkeen annetaan diatsonium-suolan reagoida rikkidioksidin ja kuparikloridin kanssa etikkahapossa, niinkuin ovat esittäneet H. L. Yale ja F. Sowinski, J. Org. Chem. 25, 1824 (1960). Pyridiinisulfonyyli-likloridien valmistus on esitetty Chem. Abs:ssa 88, 190603 m (1978).

Kaavan IV (W=S) mukaiset sulfonyyli-isotiosyanaatit voidaan valmistaa käsittelemällä sulfonamideja hiilidisulfidilla ja kaliumhydroksidilla, jota seuraa dikaliumsuolan reagoiminen fosgeenin kanssa, niinkuin on esittänyt K. Hartke, Arch. Pharm., 229 174 (1966).

Pyridiinisulfonyyli-isotiosyanaatit voidaan valmistaa K. Dickere:n ja E. Kuhle:n esittämällä menetelmällä U.S. patentissa 3 346 590. Sopivan pyridiinisulfonyyli-iminoditiokarbonaatin annetaan reagoida fosgeenin kanssa tolueenin tai ksyleenin kaltaisen liuottimen läsnäollessa.

Erilaista menetelmää käytetään valmistettaessa kaavan IV (W=O) mukaista sulfonyyli-isosyanaatti-välituotetta, kun välituote on o-sulfamoyylibentseenisulfonyyli-isosyanaatti. Tämä menetelmä havainnollistetaan yhtälöllä 2a-e.

Yhtälö 2a-e

jossa R_3 , R_{10} ja R_{11} ovat samat kuin edellä.

Vaiheessa (2a) kaavan a mukaisia o-nitrobentseenisulfonyyli-klorideja, jotka ovat hyvin tunnettuja, käsitellään amiinilla $R_{10}R_{11}NH$ inertissä orgaanisessa liuottimessa, kuten metyleenikloridissa, etyylietterissä tai tetrahydrofuraanissa 0-50°C:ssa. Amiinia voidaan ottaa ylimäärä toimimaan happoakseptorina; vaihtoehtoisesti voidaan käyttää tertiääristä amiinia, kuten trietyyliamiinia tai pyridiiniä happoakseptorina. Amiinihydrokloridi-sivutuote suodatetaan tai pestään pois liuottimesta ja tuote eristetään haihduttamalla liuotin.

Vaiheessa (2b) kuvattu pelkistys suoritetaan käsittelemällä kaavan b mukaisten yhdisteiden liuosta liuottimessa, kuten etanolissa, etyyliasetaatissa tai DMF:ssä, paineastiassa, jossa on 100-1000 naulaa/neliötuumaa vetyä 80-150°C:ssa hydrogenointikatalyytin läsnäollessa, kuten 5-10 % palladiumia absorboituna hiileen. Kun teoreettinen määrä vetyä on absorboitunut, liuos jäähdytetään ja katalyytti poistetaan suodattamalla. Tuote eristetään sen jälkeen haihduttamalla liuotin.

Vaiheessa (2c) esitetty diatsotisointi ja liittäminen rikki-dioksidin kanssa suoritetaan seuraavalla tavalla. Kaavan c mukaista o-sulfamoyylianiiliini-liuosta seoksessa, jossa on väkevää kloorivetyhappoa ja jääetikkaa, käsitellään liuoksella, jossa on natriumnitraattia vedessä -5-0°C:ssa. Sen jälkeen kun on sekoitettu 10-15 minuuttia 0°C:ssa diatsotisoitumisen päättymisen varmistamiseksi, tämä liuos lisätään seokseen, jossa on ylimäärä rikkidioksidia ja katalyyttinen määrä kuparikloridia jääetikassa 0-5°C:ssa. Lämpötila pidetään 0-5°C:ssa 1/4-1 tuntia ja sen jälkeen nostetaan 20-25°C:een ja ylläpidetään tätä lämpötilaa 2-4 tuntia. Tämä liuos kaadetaan sen jälkeen suureen ylimäärään jäävettä. Sulfonyylikloridi-tuotteet, d, voidaan eristää suodattamalla tai uuttamalla liuottimeen, kuten etyylietteriin tai metyleenikloridiin, jonka jälkeen liuotin haihdutetaan.

Vaiheessa (2d) esitetty aminointi suoritetaan edullisesti käsittelemällä kaavan d mukaista sulfonyylikloridi-liuosta ylimäärällä vedetöntä ammoniakkia liuottimessa, kuten etyylietterissä tai metyleenikloridissa 0-25°C:ssa. Jos sulfonamidi-tuote on liukenematon, se voidaan eristää suodattamalla, jonka jälkeen pestään suolat pois vedellä. Jos sulfonamidi-tuote on liukoinen reaktioliuok-

seen, se voidaan eristää suodattamalla saostunut ammoniumkloridi ja haihduttamalla liuotin.

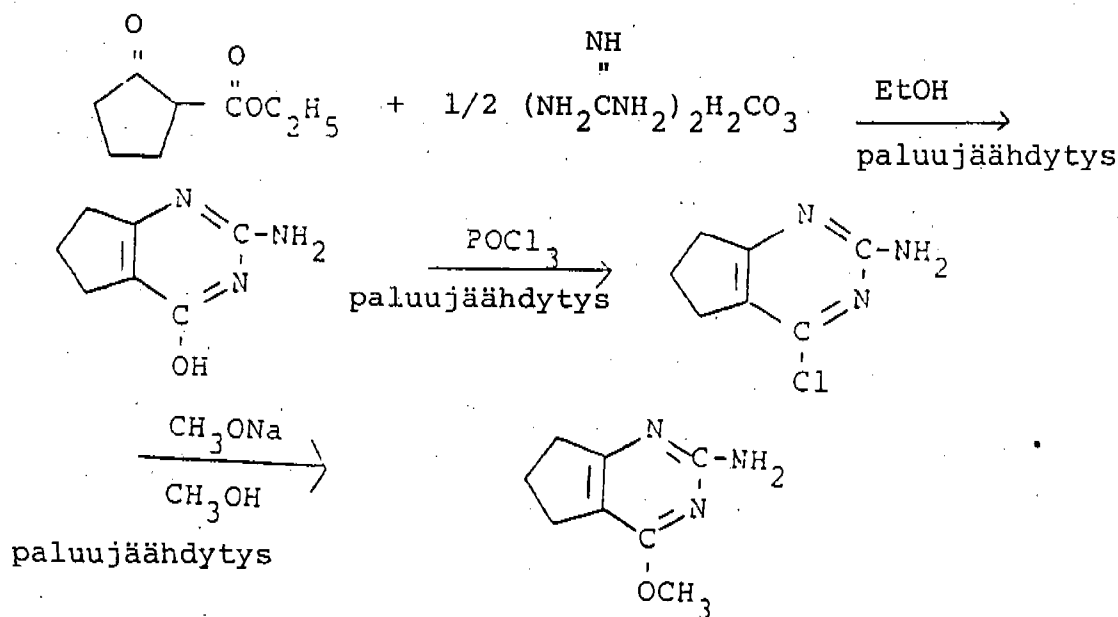
Kaavan IV mukaisia sulfonyyli-isosyanaatteja, joissa R_2 on $SO_2OCH_2CCl_3$, $SO_2OCH_2CF_3$ tai $SO_2N(CH_3)OCH_3$, voidaan valmistaa reaktioilla, joka on analoginen yhtälössä 2a-e esitetylle.

b. Aminopyrimidiini-välituotteet

Heterosyklisten amiini-johdannaisten, kuten sellaisten, joita esitettiin kaavalla III, synteesi on selostettu "The Chemistry of heterocyclicCompounds"-sarjassa, jonka on julkaissut Interscience Publ., New York ja Lontoo. D.J. Brown on esittänyt aminopyrimidiinit edellä mainitussa sarjassa osassa XVI "The Pyrimidines".

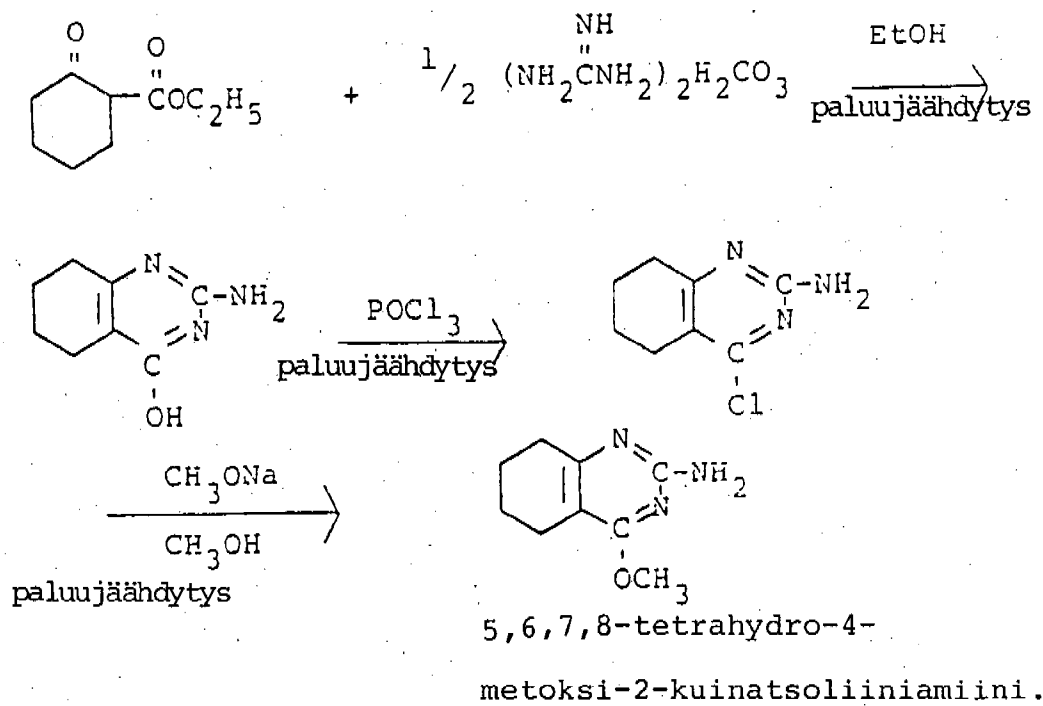
Kaavan III mukaisen yhdisteen valmistus vaihtelee X:n, Y:n ja q:n määrittelyn mukaan.

Braker, Sheehan, Spitzmiller ja Lott, J. Am. Chem. Soc. 69, 3072 (1947) esittävät 6,7-dihydro-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidiini-2-amiinin valmistuksen seuraavilla reaktioyhtälöillä.

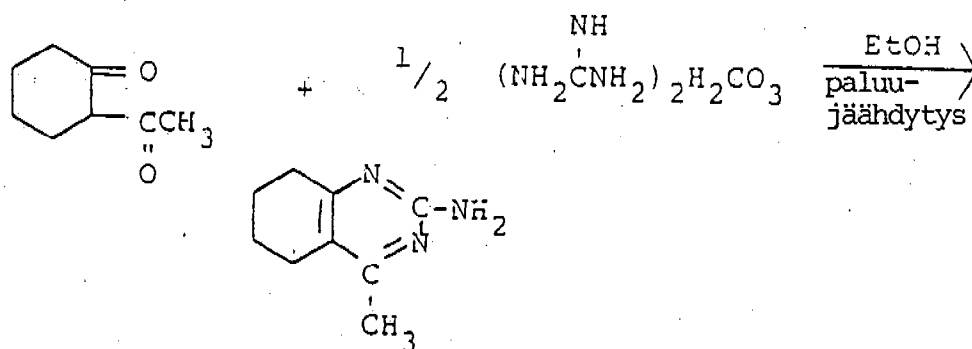


6,7-dihydro-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidiini-2-amiini.

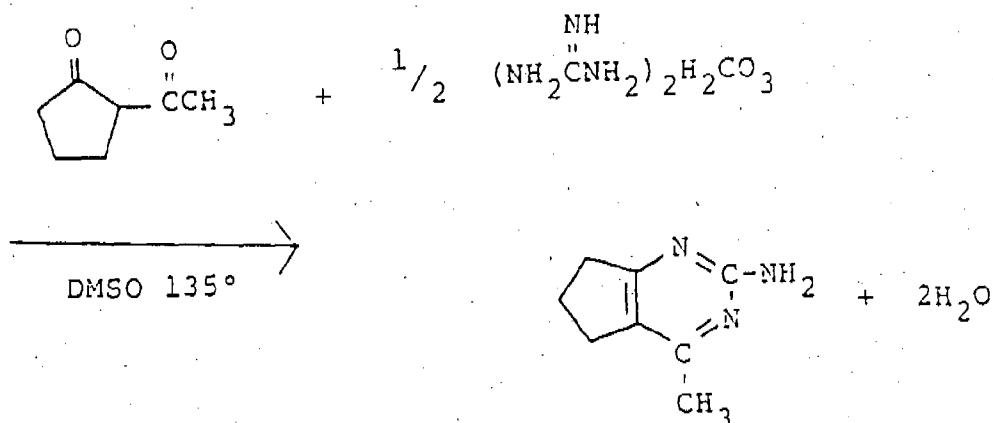
Analogisia reaktioyhtälöitä voidaan käyttää 5,6,7,8-tetrahydro-4-metoksi-2-kinatsoliiniamiinin valmistamiseksi.



Mitter ja Bhattacharya, Quart. J. Indian Chem. Soc. 4, 152. (1927) esittävät 5,6,7,8-tetrahydro-4-metyyli-2-kinatsoliini-amiinin valmistuksen seuraavasti:

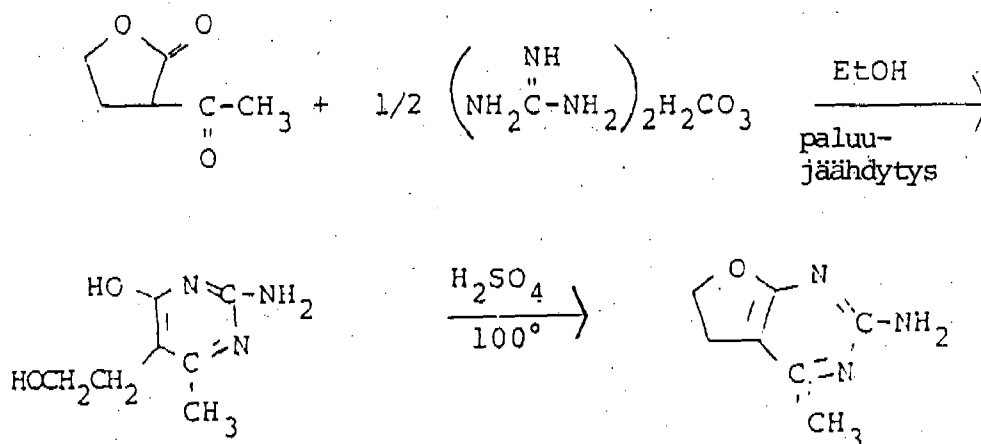


Vastaavasti voidaan 6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopenta-pyrimidiini-2-amiini valmistaa kondensoimalla 2-asetyylisyklopentanoni guanidiinikarbonaatilla, mutta edullisemmin kuumentamalla dimetyylisulfoksidissa 135°C:ssa useita tunteja.

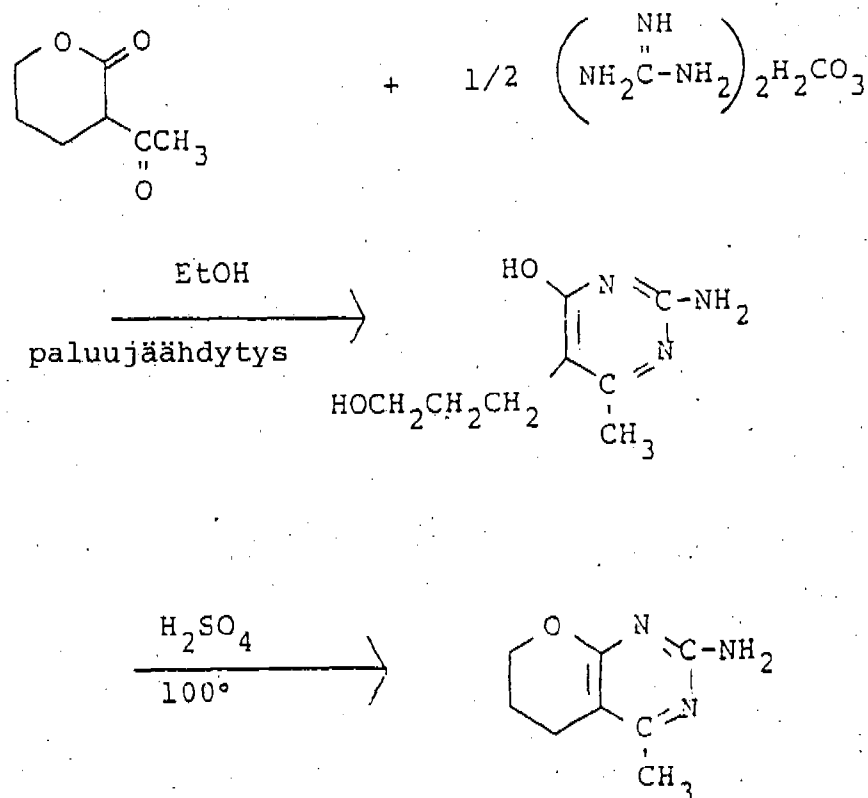


6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidiini-2-amiini.

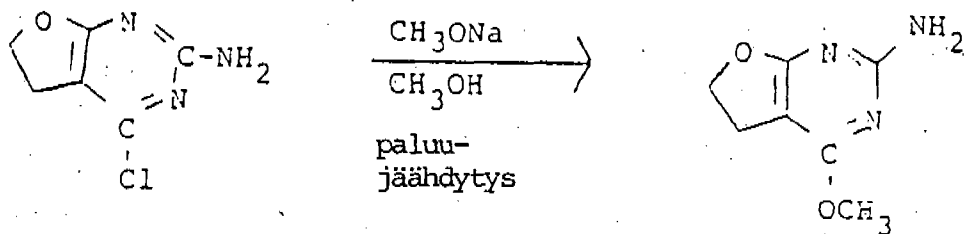
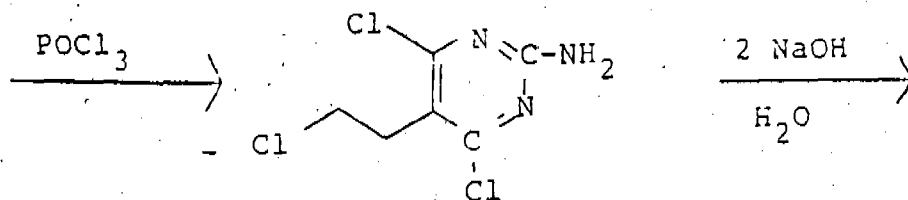
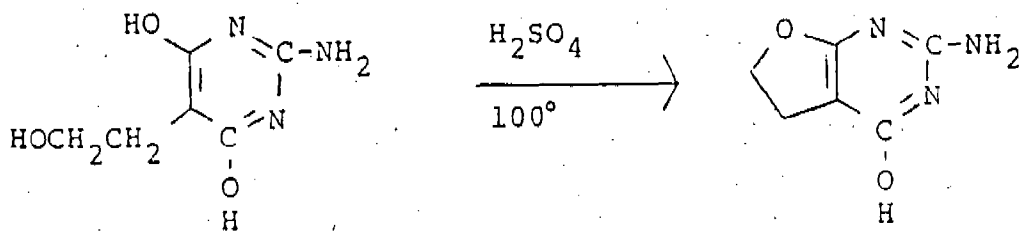
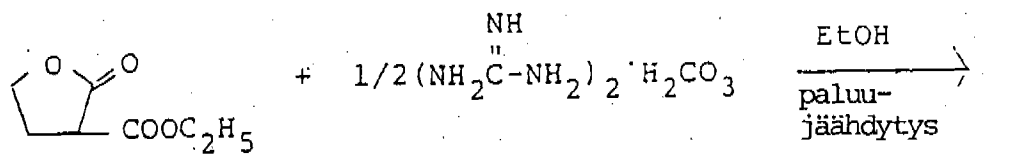
Shrage ja Hitchings, J. Org. Chem. 16, 1153 (1951) esittävät 5,6-dihydro-4-metyylifuro-[2,3-d]pyrimidiini-2-amiinin valmistuksen seuraavilla reaktioyhtälöillä



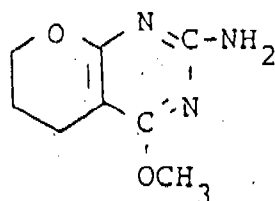
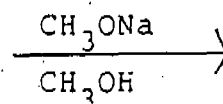
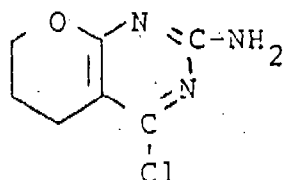
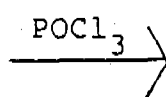
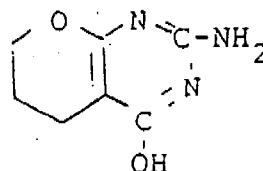
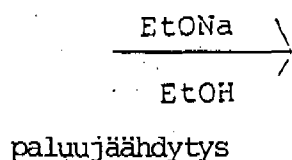
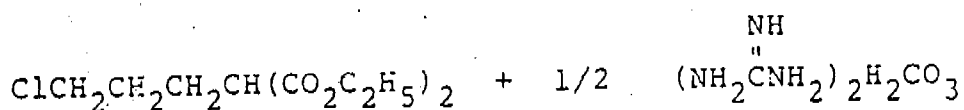
Analogisilla reaktioyhtälöillä voidaan valmistaa 6,7-dihydro-4-metyyli-5H-pyrano[2,3-d]pyrimidiini-2-amiini lähtien 2-asetyyli-8-valerolaktonista [Korte ja Wusten, Tetrahedron 19, 1423 (1963)].



5,6-dihydro-4-hydroksifuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiini [Svab, Budesinski ja Vavrina, Kollektion Czech. Chem. Commun. 32, 1582 (1967)] voidaan muuttaa 2-amino-5-(2-kloorietyyli)-4,6-diklooripyrimidiiniksi kuumentamalla fosforioksidikloridin kanssa. Tuote voidaan myöhemmin syklisoida käsittelemällä kahdella ekvivalentilla vesipitoista natriumhydroksidia, jolloin saadaan 4-kloori-5,6-dihydrofuro[2,3-d]-pyrimidiini-2-amiinia, joka sen jälkeen muutetaan 5,6-dihydro-4-metoksifuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiiniksi kuumentamalla natriummetoksidi-ylimäärän kanssa metanolissa.



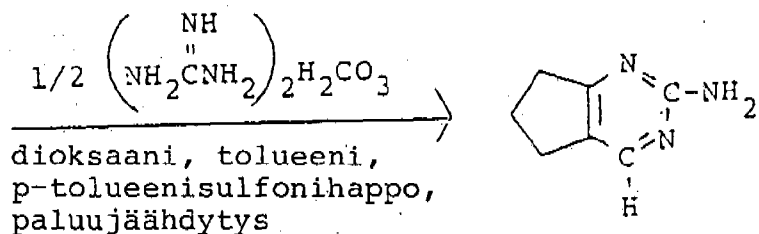
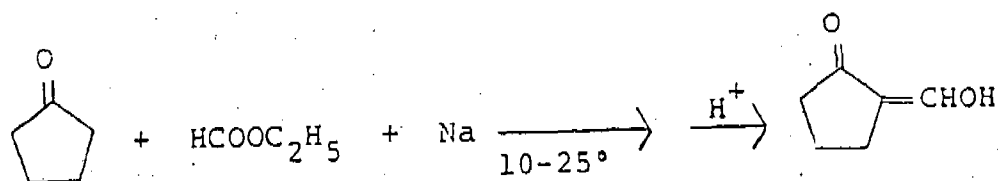
6,7-dihydro-4-hydroksi-5H-pyrano[2,3-d]pyrimidiini-2-amiini voidaan valmistaa dietyyli-3-klooripropyylimalonaatista, guanidiini-karbonaatista ja natriumetoksidista etanolissa. Käsittelemällä tuote



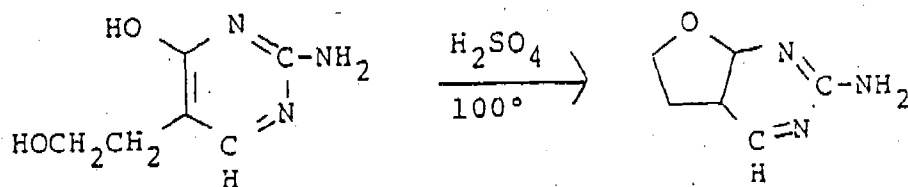
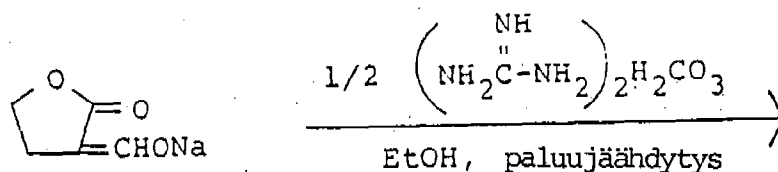
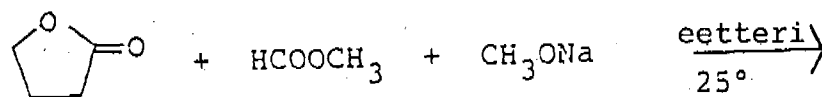
fosforioksikloridilla, saadaan 4-kloori-6,7-dihydro-5H-pyrano[2,3-d]-pyrimidiini-2-amiini ja seuraava reaktio natrium-metoksidin kanssa paluujäähdyttären metanolissa antaa 6,7-dihydro-4-metoksi-5H-pyrano[2,3-d]-pyrimidiini-2-amiinia.

Kaavojen I ja II mukaiset yhdisteet, joissa X on etoksi, voidaan valmistaa menetelmällä, joka on analoginen metoksi-johdannaisille.

Caldwell, Kornfeld ja Donnell, J. Am. Chem. Soc. 63, 2188 (1941), esittävät 6,7-dihydro-5H-syklopentapyrimidiini-2-amiinin valmistuksen seuraavilla reaktioyhtälöillä.



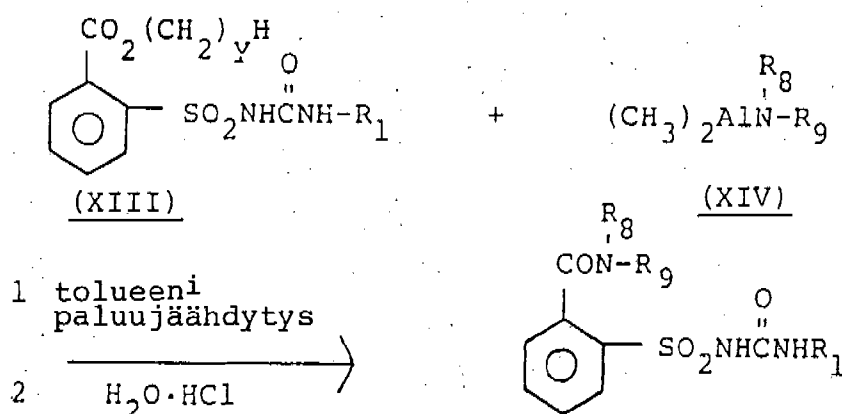
Fissekis, Myles ja Brown, J. Org. Chem. 29, 2670 (1964), esittävät 2-amino-4-hydroksi-5-(2-hydroksietyyli)pyrimidiinin valmistuksen, joka voidaan muuttaa 5,6-dihydrofuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiiniksi dehydraamalla.



c. Erikoistilanteet

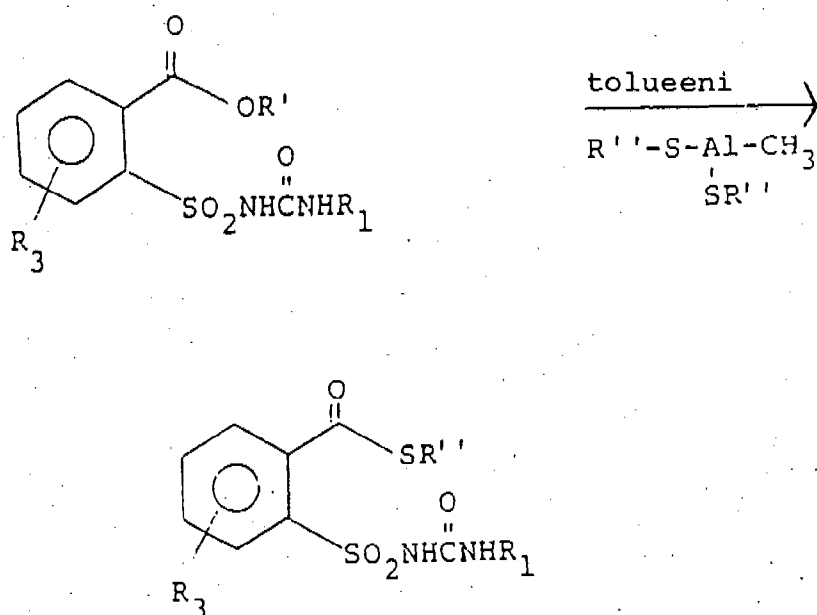
Kun R_5 on NR_8R_9 kaavassa I, voidaan esillä olevan keksinnön mukaiset yhdisteet valmistaa antamalla sopivan kaavan XIII mukaisen yhdisteen reagoida sopivan alkyyliaminodialkyylialumiini-johdannaisen kanssa, jolla on kaava XIV. Tätä havainnollistetaan yhtälöllä 6, jossa $y=1-6$.

Yhtälö 6



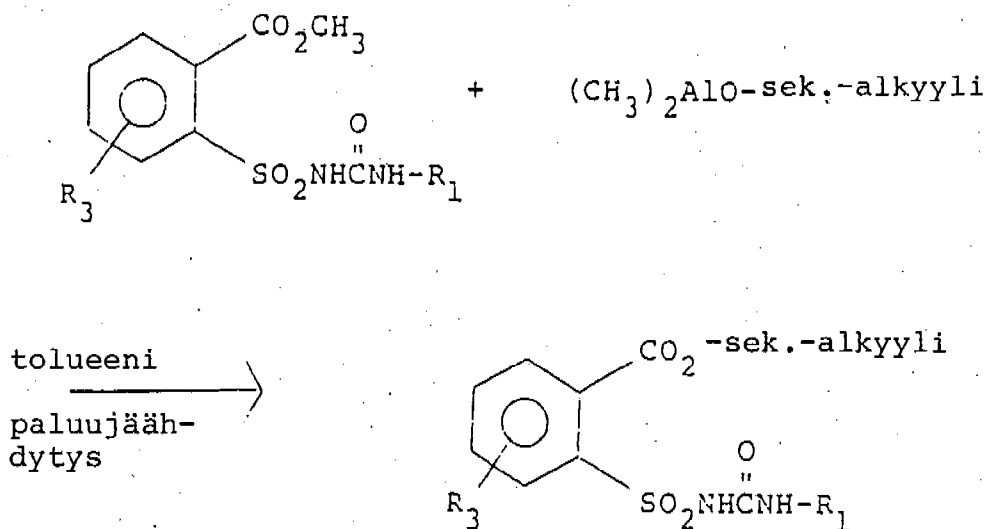
Kaavan XIII mukaiset yhdisteet valmistetaan edellä kuvatulla tavalla. Kaavan XIV mukaiset alkyyliaminodialkyylialumiini-välituotejohdannaisia, jotka valmistetaan A. Basha, M. Liptonin ja S. Weinrebin, Tetrahedron Letters, 4171 (1977) mukaan, käsitellään sopivien esterien suspensioilla tolueenissa tai vastaavassa inertissä liuottimessa ja seosta paluujäähdytetään 1-6 tuntia. Tuote voidaan eristää haihduttamalla tolueeni, lisäämällä metyleenikloridi, vesi ja kloorivetyhappo hajottamaan jäännösreaktiomassa ja uutamalla tuote metyleenikloridissa. Haihduttamalla metyleenikloridi saadaan haluttu tuote riittävän puhtaana esillä olevan keksinnön tarkoituksiin.

Kun R_5 on C_1-C_4 -alkyyli, nämä yhdisteet voidaan valmistaa tämän keksinnön mukaisista estereistä, joissa R_5 on C_1-C_4 -alkoksi, antamalla estereiden reagoida sopivan dialkyylialumiinialkyyli- laatin kanssa yhtälön 7 mukaisesti.

Yhtälö 7

Alumiinitiolaatti-välituote voidaan valmistaa kuten ovat esittäneet R. P. Hatch ja S. W. Weinreb, Journal of Organic Chemistry, Vol. 42, 3960 (1977). Tiolaatin reaktio esillä olevan keksinnön mukaisen esterin kanssa suoritetaan edullisimmin neutraalissa liuottimessa, kuten tolueenissa tai ksyleenissä, paluujäähdyttäen 1-3 tuntia. Paras tulos saadaan kun alumiinitiolaattiyhdistettä on läsnä oli vaaditun stökiometrisen määrän.

Vaihtoehtoinen tapa yhdisteiden, joissa R_5 on sekundäärinen alkoholi jäännös, valmistamiseksi käsittää sopivan dialkyylialumiini-alkoholaatin ja esillä olevan keksinnön mukaisen esterin, jossa R' on alempi primaarinen alkyyli-ryhmä, edullisesti metyyli, reaktion yhtälön 8 mukaisesti.

Yhtälö 8

Reaktio suoritetaan neutraalissa liuottimessa, kuten toluenissa, jolla on riittävän korkea kiehumispiste aikaansaamaan haluttu reaktio paluujäähdytettäessä. Parhaan saannon vuoksi dialkyyliamiinialkoholaattia on läsnä suurempi kuin ekvivalenttinen määrä esteriin nähden. Sen jälkeen kun paluujäähdytetty 1-15 tuntia, reaktioseos hajotetaan laimealla kloorivetyhapolla ja tuote uutetaan metyleenikloridilla. Haihduttamalla metyleenikloridi saadaan haluttu tuote riittävän puhtaana esillä olevan keksinnön tarkoituksiin. Tuote voidaan hieroa jauheeksi liuottimen, esim. 1-klooributaanin, kanssa epäpuhtauksien poistamiseksi.

Kaikkien edellä lainettujen viittausten esittäminen sisällytetään tässä viittauksin.

Kaavojen I tai II mukaisten yhdisteiden maanviljelyksellisesti sopivat suolat ovat myös käyttökelpoisia herbisideinä ja voidaan valmistaa lukuisilla tunnetuilla tavoilla. Esimerkiksi metallisuolat voidaan valmistaa käsittelemällä kaavojen I tai II mukaisia yhdisteitä alkali- tai maa-alkalimetalli-suolaliuoksella, jolla riittävän emäksinen anioni (esim. hydroksidi, alkoksidi, karbonaatti tai hydridi). Kvartääriset amiini-suolat voidaan valmistaa vastaavilla menetelmillä.

Kaavojen I tai II mukaisten yhdisteiden suolat voidaan myös valmistaa vaihtamalla kationi toiseen. Kationin vaihto voidaan saada aikaan käsittelemällä suoraan kaavan I tai II mukaisen yhdisteen

suolan (esim. alkalimetalli- tai kvartäärinen amiini-suola) vesi-oitoista liuosta liuoksella, jossa on vaihdettava kationi. Tämä menetelmä on tehokkain, kun haluttu suola, mikä sisältää vaihdetun kationin, on liukenematon veteen, esim. kuparisuola, ja voidaan erottaa suodattamalla.

Vaihto voidaan myös aikaansaada siirtämällä kaavan I tai II mukaisen yhdisteen suolan vesipitoinen liuos tai kolonnin, jossa on kationinvaihtohartsia, joka sisältää vaihdettavan kationin. Tässä menetelmässä hartsin kationi vaihdetaan alkuperäisen suolan kationiksi ja haluttu tuote eluoidaan kolonnista. Tämä menetelmä on erityisen käyttökelpoinen kun haluttu suola on veteen liukoinen, esim. kalium-, natrium- tai kalsium-suola.

Esillä olevassa keksinnössä käyttökelpoiset happoadditio-suolat voidaan saada antamalla kaavan I tai II mukaisen yhdisteen reagoida sopivan hapon, esim. p-tolueenisulfonyl-, trikloorietikkahapon tai kaltaisten, kanssa.

Esillä olevan keksinnön mukaisia yhdisteitä ja niiden valmistusta havainnollistetaan edelleen seuraavilla esimerkeillä, joissa lämpötilat ovat C-asteita.

Esimerkki 1

2-amino-5-(2-kloorietyyli)-4,6-diklooripyrimidiini

Seosta, jossa oli 10 g 6,7-dihydro-4-hydroksifuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiinia, 100 ml fosforioksykloridia ja 0,5 ml N,N-dimetyylianiiliinia, kuumennettiin 100-110^o:ssa 2 tuntia. Ylimäärä fosforioksykloridia poistettiin alennetussa paineessa ja jäännös sekoitettiin 500 g jäätä jonka jälkeen neutralisoitiin pH:ksi 7 ammoniumhydroksidilla. Kiinteä tuote otettiin talteen suodattamalla, huuhdottiin vedellä ja kuivattiin, jolloin saatiin 12 g 2-amino-5-(2-kloorietyyli)-4,6-diklooripyrimidiiniä, sp. 210-213^oC. Massaspektri esitti kantaonia m/e:ssä 225, 227, 229 ja ydinmagneettinen resonanssispektri osoitti kaksi triplettiä, 3,40 ja 3,88 ppm (60 MHz) osoittaen otsikkoyhdisteen.

Esimerkki 2

4-kloori-5,6-dihydrofuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiini

Suspensiota, jossa oli 6,0 g 2-amino-5-(2-kloorietyyli)-4,6-diklooripyrimidiiniä, 29 ml 2N vesipitoista natriumhydroksidiliuosta, 35 ml vettä ja 75 ml t-butanolia, kuumennettiin paluujääh-

dytteiseksi (60°) 24 tuntia, jonka jälkeen se jäähdytettiin. Kiinteä aine otettiin talteen suodattamalla, huuhdottiin vedellä ja kuivattiin, jolloin saatiin 2,4 g 4-kloori-5,6-dihydrofuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiinia, sp. 258-263 $^{\circ}$. Ydinmagneettisessa resonanssispektrissä (60 MHz) tuote osoitti tunnusomaiset tripletti-absorptio-nauhat 3,40 ja 5,10 ppm osoittaen otsikkoyhdisteen.

Esimerkki 3

5,6-dihydro-4-metoksifuro[2,3-d]-pyrimidiini-2-amiini

Suspensioon, jossa oli 27 g 4-kloori-5,6-dihydrofuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiinia 500 ml:ssa vedetöntä metanolia, lisättiin 22 g natriummetoksidia ja seosta kuumennettiin paluujäähdytteiseksi (66°) 5,5 tunnin ajan. Sen jälkeen liuotin poistettiin alennetussa paineessa ja jäännös hierottiin jauheeksi veden (500 ml) kanssa, sitten suodatettiin ja huuhdottiin hyvin vedellä. Kiinteä aine ilmakuiivattiin, jolloin saatiin 20 g 5,6-dihydro-4-metoksifuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiinia, sp. 172-177 $^{\circ}$. Otsikkoyhdiste osoitettiin ydinmagneettisella resonanssispektrillä (60 MHz), jossa oli kaksi triplettiabsorptiota 3,42 ja 5,02 ppm ja singletti-absorptio 4,21 ppm.

Esimerkki 4

2-([6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidiini-2-yyli]-aminokarbonyyli/aminosulfonyyli)bentsoehappo-syklopentyyli-esteri

20 ml:aan kuivaa tolueenia lisättiin 2,4 ml 2M trimetyyli-alumiinia tolueenissa typpi-atmosfäärissä. Myöhemmin lisättiin 0,82 g syklopentanolia 1 ml:ssa tolueenia käsiruiskulla ja seosta sekoitettiin ympäröivässä lämpötilassa 15 minuuttia. Sen jälkeen kun seokseen oli lisätty 1,56 g metyyli-2-([6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli]aminokarbonyyli/aminosulfonyyli)bentsoaattia, reaktioseosta kuumennettiin 80° :ksi 3,5 tunnin ajan. Sen jälkeen seos jäähdytettiin jäässä samalla kun lisättiin 40 ml 5 % vesipitoista kloorivetyhappoa. Sen jälkeen lisättiin etyyliasetaatia ja ravistamalla kaksifaasisista seosta aikaansaatiin tuotteen kiteytyminen, joka otettiin talteen ja kuivattiin, jolloin saatiin 1,5 g 2-([6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli]-aminokarbonyyli/aminosulfonyyli)bentsoehappo-syklopentyyli-esteriä, sp. 183-184 $^{\circ}$. Tuote osoitti tunnusomaista absorptiota 3120, 1725, 1720 cm^{-1} :ssä infrapunaspektrissä ja ydinmagneettisessa resonanssispektrissä 1,7-2,35, 2,50, 2,95, 5,4, 7,6, 8,4, 8,5 ja 13,0 ppm:ssa osoittaen otsikkoyhdisteen.

Esimerkki 5N-/(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli/-2-nitrobentseenisulfonamidi

Kuivaan sekoitettuun liuokseen, jossa oli 10 g 6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidiini-2-amiinia 800 ml:ssa metyleenikloridia ympäröivässä lämpötilassa ja paineessa, lisättiin 14,9 g 2-nitrobentseenisulfonyyli-isosyanaattia. Saatua seosta sekoitettiin paluujäähdytteisessä lämpötilassa (42°) 2 tunnin ajan, jonka jälkeen metyleenikloridi poistettiin alennetussa paineessa. Saatu kiinteä aine hierottiin jauheeksi metanolin tai 1-klooributaanin kanssa ja suodatettiin, jolloin saatiin 15 g N-/(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)aminokarbonyyli/-2-nitrobentseenisulfonamidia, sp. 202-205°. Tuote osoitti tunnusomaiset absorptiionauhat infrapunaspektrissä 1675 cm⁻¹:ssä ja ydinmagneettisessa resonanssispektrissä 1,7, 3,2 ja 7,7-8,5 ppm:ssa (60 MHz), osoittaen otsikkoyhdisteen.

Esimerkki 62-kloori-N/(5,6-dihydro-4-metyylifuro/2,3-d/pyrimidin-2-yyli)aminotioksometyyli/bentseenisulfonamidi

Kuivaan sekoitettuun seokseen, jossa oli 4,9 g 5,6-dihydro-4-metyylifuro/2,3-d/pyrimidiini-2-amiinia 125 ml:ssa asetonitriiliä ympäröivässä lämpötilassa, lisättiin 7,6 g 2-kloorifenyyliisulfonyyli-isotiosyanaattia. Saatua seosta sekoitettiin paluujäähdytteisessä lämpötilassa (84°) 24 tuntia. Sen jälkeen kun reaktioseos oli jäähdytetty, valkoinen kiinteä aine suodatettiin ja pestiin asetonitriilillä, jolloin saatiin 10,8 g tuotetta, sp. 190-191°. Otsikkoyhdiste todettiin alkuaineanalyysillä, infrapunaspektrillä ja ydinmagneettisella resonanssispektrillä.

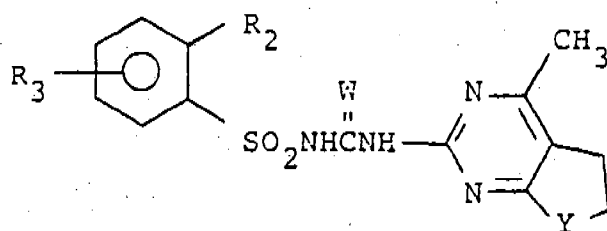
Esimerkki 7Metyyli-2-/(6,7-dihydro-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)aminotioksometyyli/aminosulfonyyli/ bentsoaatti

Seosta, jossa oli 4,3 g metyyli-2-(aminosulfonyyli)bentsoaattia, 4,2 g 6,7-dihydro-2-isotiosyanato-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidiiniä ja 2,2 g vedetöntä kaliumkarbonaattia 70 ml:ssa asetonia, kuumennettiin 40°:ksi samalla sekoittaen. Kahden tunnin kuluttua paksu saostuma muodostui ja sekoittamista jatkettiin ympäröi-

vässä lämpötilassa kolme tuntia. Saostuma suodatettiin, suspensioitiin 150 ml:aan vettä, sekoitettiin ja pH säädettiin 2:ksi lisäämällä kloorivetyhappoa. Valkoinen kiinteä aine suodatettiin, pestiin kylmällä vedellä ja kuivattiin, jolloin saatiin 4,2 g tuotetta.

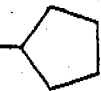
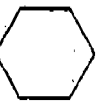
Käyttämällä yhtä tai useampaa esimerkkien 1-7 mukaista menettelyä ja/tai edellä kuvattua menettelyä ja sopivia reagoivia aineosia, voidaan taulukon I mukaiset yhdisteet valmistaa.

Taulukko I-A



<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
-H	H	O	CH ₂	
-Cl	H	O	CH ₂	190-192°
-F	H	O	CH ₂	
-Br	H	O	CH ₂	
-SCH ₃	H	O	CH ₂	
-SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
-CF ₃	H	O	CH ₂	
-NO ₂	H	O	CH ₂	202-205°
-CO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	193-194°
-CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	153-154°
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	O	CH ₂	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	O	CH ₂	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ Br	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	207-210°
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	O	CH ₂	167-172°
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	O	CH ₂	160-161°
CO ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH-CH ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₃)CH=CH ₂	H	O	CH ₂	190-191°

Taulukko I-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	O	CH ₂	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_4\text{Cl}$	H	O	CH ₂	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_6\text{Cl}$	H	O	CH ₂	
CO_2 — 	H	O	CH ₂	183-184°
CO_2 — 	H	O	CH ₂	193-195°
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{CH}_3$	H	O	CH ₂	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{C}_2\text{H}_5$	H	O	CH ₂	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	O	CH ₂	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	H	O	CH ₂	
$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	H	O	CH ₂	
$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$	H	O	CH ₂	
$\text{CON}-\text{CH}_3$	H	O	CH ₂	
$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$				
CONH_2	H	O	CH ₂	
CONHCH_3	H	O	CH ₂	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	H	O	CH ₂	
$\text{CON}(\text{CH}(\text{CH}_3)_2)_2$	H	O	CH ₂	
$\text{CONCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	O	CH ₂	
CH_3 $\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	H	O	CH ₂	
$\text{CON} \begin{array}{l} \text{OCH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
$\text{CON} \begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array} \text{O}$	H	O	CH ₂	

Taulukko I-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s.p.</u>
Cl	5-Cl	O	CH ₂	201-203°
Cl	6-Cl	O	CH ₂	
Cl	4-Cl	O	CH ₂	
Cl	3-Cl	O	CH ₂	
F	5-Cl	O	CH ₂	
F	3-Cl	O	CH ₂	
F	4-Cl	O	CH ₂	
F	5-F	O	CH ₂	
Cl	5-OCH ₃	O	CH ₂	
Cl	5-CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂	
Cl	4-CH ₃	O	CH ₂	
Cl	4-F	O	CH ₂	
Cl	5-Br	O	CH ₂	
Cl	6-CH ₃	O	CH ₂	
NO ₂	5-Cl	O	CH ₂	
NO ₂	6-Cl	O	CH ₂	
NO ₂	5-F	O	CH ₂	
Cl	5-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	O	CH ₂	
Br	5-F	O	CH ₂	
SCH ₃	5-Cl	O	CH ₂	
Cl	5-C ₂ H ₅	O	CH ₂	

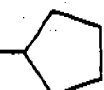
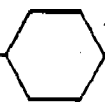
Taulukko I-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
SCH ₃	4-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	5-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	6-Cl	O	CH ₂	
SCH ₃	6-Cl	O	CH ₂	
SCH ₃	4-OCH ₃	O	CH ₂	
CF ₃	5-Cl	O	CH ₂	
CF ₃	5-CH ₃	O	CH ₂	
CF ₃	5-F	O	CH ₂	
CF ₃	4-Cl	O	CH ₂	
CF ₃	4-CH ₃	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	5-CH ₃	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	6-CH ₃	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	5-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	3-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	6-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃	O	CH ₂	
SO ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	O	CH ₂	
SOCH ₃	H	O	CH ₂	
SOCH ₂ CH ₃	5-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH=CH ₂	H	O	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₃	6-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH=CHCH ₃				
SO ₂ N(CH ₂ -CH ₂) ₂	5-F	O	CH ₂	

Taulukko I-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s p.</u>
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CSCH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CSCH} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	5-OCH ₃	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CSCH} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H	O	CH ₂	175-177°
-SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	O	CH ₂	
-SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	H	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{OCH}_3 \\ \nearrow \\ -\text{SO}_2\text{N} \\ \searrow \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
H	H	O	O	
-Cl	H	O	O	202-205°
-F	H	O	O	
-Br	H	O	O	
-SCH ₃	H	O	O	
-SO ₂ CH ₃	H	O	O	
-CF ₃	H	O	O	
-NO ₂	H	O	O	180-187°
-CO ₂ CH ₃	H	O	O	194.5-197°
-CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	O	187-188°
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	O	O	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	O	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	O	O	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ Br	H	O	O	
-SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	O	O	
-SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	H	O	O	
$\begin{array}{c} \text{OCH}_3 \\ \nearrow \\ -\text{SO}_2\text{N} \\ \searrow \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	O	

Taulukko I-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	O	196-199°
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	O	O	205-206°
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	O	O	
CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	O	O	163-165°
CO ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH=CH-CH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH(CH ₃)CH=CH ₂	H	O	O	192-194°
CO ₂ CH ₂ CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ (CH ₂) ₄ Cl	H	O	O	
CO ₂ (CH ₂) ₆ Cl	H	O	O	
CO ₂ - 	H	O	O	169-171°
CO ₂ - 	H	O	O	178-179°
CO ₂ (CH ₂ CH ₂ O) ₂ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ (CH ₂ CH ₂ O) ₂ C ₂ H ₅	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	O	O	
CON(CH ₃) ₂	H	O	O	
CON(C ₂ H ₅) ₂	H	O	O	
CON-CH ₃	H	O	O	
CH(CH ₃) ₂				
CONH ₂	H	O	O	
CONHCH ₃	H	O	O	

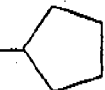
Taulukko I-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	O	O	
CON(CH(CH ₃) ₂) ₂	H	O	O	
CONCH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	O	
CH ₃ CON(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	O	
OCH ₃ CON CH ₃	H	O	O	
Cl	5-Cl	O	O	
Cl	6-Cl	O	O	
Cl	4-Cl	O	O	
Cl	3-Cl	O	O	
F	5-Cl	O	O	
F	3-Cl	O	O	
F	4-Cl	O	O	
F	5-F	O	O	
Cl	5-OCH ₃	O	O	
Cl	5-CH(CH ₃) ₂	O	O	
Cl	4-CH ₃	O	O	
Cl	4-F	O	O	
Cl	5-Br	O	O	
Cl	6-CH ₃	O	O	
NO ₂	5-Cl	O	O	
NO ₂	6-Cl	O	O	
NO ₂	5-F	O	O	
Cl	5-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	O	O	
Br	5-F	O	O	
SCH ₃	5-Cl	O	O	
Cl	5-C ₂ H ₅	O	O	
SCH ₃	4-Cl	O	O	
SO ₂ CH ₃	5-Cl	O	O	
SO ₂ CH ₃	6-Cl	O	O	

Taulukko I-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s P.</u>
SCH ₃	6-Cl	O	O	
SCH ₃	4-OCH ₃	O	O	
CF ₃	5-Cl	O	O	
CF ₃	5-CH ₃	O	O	
CF ₃	5-F	O	O	
CF ₃	4-Cl	O	O	
CF ₃	4-CH ₃	O	O	
CO ₂ CH ₃	5-CH ₃	O	O	
CO ₂ CH ₃	6-CH ₃	O	O	
CO ₂ CH ₃	5-Cl	O	O	
CO ₂ CH ₃	3-Cl	O	O	
CO ₂ CH ₃	6-Cl	O	O	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃	O	O	
SOCH ₃	H	O	O	
SOCH ₂ CH=CH ₂	5-Cl	O	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	O	188-193°
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH=CH}_2 \end{array}$	5-F	O	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	6-CH ₃	O	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_2 \diagdown \text{O} \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_2 \diagup \text{O} \end{array}$	4-OCH ₃	O	O	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{S}-\text{CH} \end{array}$ $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	O	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CS}-\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	5-Cl	O	O	
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	O	O	

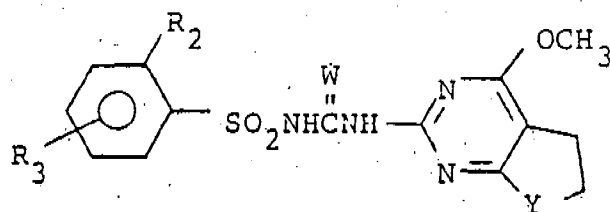
Taulukko I-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{S}-\text{CH} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H	O	O	
H	H	S	CH ₂	
Cl	H	S	CH ₂	
SCH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
NO ₂	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ - 	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	S	CH ₂	
CONH ₂	H	S	CH ₂	
CON(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
CON[CH(CH ₃) ₂] ₂	H	S	CH ₂	
CON(OCH ₃)CH ₃	H	S	CH ₂	
CH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	H	S	CH ₂	
SOCH ₃	H	S	CH ₂	
O				
"				
CSCH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	S	CH ₂	
Cl	5-Cl	S	CH ₂	
F	4-Cl	S	CH ₂	

Taulukko I-A (jatkoa)

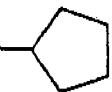
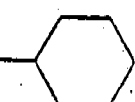
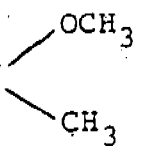
<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sP.</u>
NO ₂	5-CH ₃	S	CH ₂	
CF ₃	5-F	S	CH ₂	
OCH ₃	5-OCH ₃	S	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	6-Br	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	5-Cl	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₃	4-CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{cases} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2 \end{cases}$	6-Cl	S	CH ₂	
O "CSCH(CH ₃) ₂	5-OCH ₃	S	CH ₂	
H	H	S	O	
CH ₃	H	S	O	
OCH ₃	H	S	O	
Cl	H	S	O	
F	H	S	O	
CF ₃	H	S	O	
NO ₂	H	S	O	
CO ₂ CH ₃	H	S	O	
CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	S	O	
CO ₂ (CH ₂) ₃ Cl	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	S	O	
O "CSCH ₂ CH ₃	H	S	O	
CON(C ₂ H ₅) ₂	H	S	O	
CONHCH ₃	H	S	O	
CON(OCH ₃)CH ₃	H	S	O	
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	S	O	
SO ₂ OCH ₂ Cl ₃	H	S	O	
Cl	5-Cl	S	O	
OCH ₃	5-OCH ₃	S	O	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃	S	O	
F	5-F	S	O	
Cl	6-CH ₃	S	O	

Taulukko I-B



<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
Cl	H	O	CH ₂	224°
Cl	5-Cl	O	CH ₂	231.5-232°
NO ₂	H	O	CH ₂	211-212°
CO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	169-184°
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	207-209°
-F	H	O	CH ₂	
-Br	H	O	CH ₂	
-SCH ₃	H	O	CH ₂	
-SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
-CF ₃	H	O	CH ₂	
-CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	178-179°
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	O	CH ₂	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	O	CH ₂	137-140°
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	O	CH ₂	149-151°
CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH-CH ₃	H	O	CH ₂	
H	H	O	CH ₂	

Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
$\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	H	O	CH_2	176-177°
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_4\text{Cl}$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_6\text{Cl}$	H	O	CH_2	
CO_2 — 	H	O	CH_2	174-175°
CO_2 — 	H	O	CH_2	171-172°
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{CH}_3$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{C}_2\text{H}_5$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	H	O	CH_2	
$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	H	O	CH_2	
$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$	H	O	CH_2	
$\text{CON}-\text{CH}_3$ $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	O	CH_2	
$\text{CON}(\text{CH}(\text{CH}_3)_2)_2$	H	O	CH_2	
$\text{CONCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ CH_3	H	O	CH_2	
$\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	H	O	CH_2	
CON — 	H	O	CH_2	

Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
Cl	6-Cl	C	CH ₂	
Cl	4-Cl	O	CH ₂	
Cl	3-Cl	O	CH ₂	
F	5-Cl	O	CH ₂	
F	3-Cl	O	CH ₂	
F	4-Cl	O	CH ₂	
F	5-F	O	CH ₂	
Cl	5-OCH ₃	O	CH ₂	
Cl	5-CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂	
Cl	4-CH ₃	O	CH ₂	
Cl	4-F	O	CH ₂	
Cl	5-Br	O	CH ₂	
Cl	6-CH ₃	O	CH ₂	
NO ₂	5-Cl	O	CH ₂	
NO ₂	6-Cl	O	CH ₂	
NO ₂	5-F	O	CH ₂	
Cl	5-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	O	CH ₂	
Br	5-F	O	CH ₂	
SCH ₃	5-Cl	O	CH ₂	
SCH ₃	4-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	5-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	6-Cl	O	CH ₂	
SCH ₃	6-Cl	O	CH ₂	
SCH ₃	4-OCH ₃	O	CH ₂	
CF ₃	5-Cl	O	CH ₂	
CF ₃	5-CH ₃	O	CH ₂	
CF ₃	5-F	O	CH ₂	
CF ₃	4-Cl	O	CH ₂	
CF ₃	4-CH ₃	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	5-CH ₃	O	CH ₂	

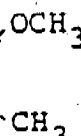
Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s p.</u>
CO ₂ CH ₃	6-CH ₃	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	5-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	3-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	6-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃	O	CH ₂	
SOCH ₃	H	O	CH ₂	
SOCH ₃	5-Br	O	CH ₂	
SOCH $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	6-CH ₃	O	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	5-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$	4-OCH ₃	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH}_2\text{CH} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	3-F	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{S}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	5-CH ₂ CH ₃	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H	O	CH ₂	

Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
$\begin{array}{c} \text{OCH}_3 \\ \diagup \\ \text{-SO}_2\text{N} \\ \diagdown \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
-SO ₂ OCH ₂ CF ₃	5-Cl	O	CH ₂	
-SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	3-F	O	CH ₂	
Cl	H	O	O	
Cl	5-Cl	O	O	
NO ₂	H	O	O	
CO ₂ CH ₃	H	O	O	203-206°
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	O	222-224°
-F	H	O	O	
-Br	H	O	O	
-SCH ₃	H	O	O	
-SO ₂ CH ₃	H	O	O	
-CF ₃	H	O	O	
-CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	O	211-214°
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	O	O	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	O	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	O	O	193-195°
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	O	O	
CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	O	O	168-171°
CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH=CH-CH ₃	H	O	O	
H	H	O	O	

Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s.p.</u>
$\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	H	O	O	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	O	O	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_4\text{Cl}$	H	O	O	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_6\text{Cl}$	H	O	O	
CO_2 — 	H	O	O	195-197°
CO_2 — 	H	O	O	171-173°
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{CH}_3$	H	O	O	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{C}_2\text{H}_5$	H	O	O	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	O	O	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	H	O	O	
$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	H	O	O	
$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$	H	O	O	
$\text{CON}-\text{CH}_3$	H	O	O	
$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$				
$\text{CON}(\text{CH}(\text{CH}_3)_2)_2$	H	O	O	
$\text{CONCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	O	O	
CH_3				
$\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	H	O	O	
CON — 	H	O	O	

Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
Cl	6-Cl	0	0	
Cl	4-Cl	0	0	
Cl	3-Cl	0	0	
F	5-Cl	0	0	
F	3-Cl	0	0	
F	4-Cl	0	0	
F	5-F	0	0	
Cl	5-OCH ₃	0	0	
Cl	5-CH(CH ₃) ₂	0	0	
Cl	4-CH ₃	0	0	
Cl	4-F	0	0	
Cl	5-Br	0	0	
Cl	6-CH ₃	0	0	
NO ₂	5-Cl	0	0	
NO ₂	6-Cl	0	0	
NO ₂	5-F	0	0	
Cl	5-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	0	0	
Br	5-F	0	0	
SCH ₃	5-Cl	0	0	
SCH ₃	4-Cl	0	0	
SO ₂ CH ₃	5-Cl	0	0	
SO ₂ CH ₃	6-Cl	0	0	
SCH ₃	6-Cl	0	0	
SCH ₃	4-OCH ₃	0	0	
CF ₃	5-Cl	0	0	
CF ₃	5-CH ₃	0	0	
CF ₃	5-F	0	0	
CF ₃	4-Cl	0	0	
CF ₃	4-CH ₃	0	0	
CO ₂ CH ₃	5-CH ₃	0	0	

Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sP.</u>
CO ₂ CH ₃	6-CH ₃	O	O	
CO ₂ CH ₃	5-Cl	O	O	
CO ₂ CH ₃	3-Cl	O	O	
CO ₂ CH ₃	6-Cl	O	O	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃	O	O	
SOCH ₃	H	O	O	
SOCH ₃	5-Cl	O	O	
SOCH ₂ CH=CH ₃	6-F	O	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \end{array}$	H	O	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \end{array}$				
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \end{array}$	H	O	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \diagdown \end{array}$				
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2 \\ \diagdown \end{array}$	5-OCH ₃	O	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2 \\ \diagdown \end{array}$				
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2-\text{CH}_2 \\ \diagdown \text{CH}_2-\text{CH}_2 \end{array}$	3-Br	O	O	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH}_3 \end{array}$	H	O	O	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \end{array} \end{array}$	5-F	O	O	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{S}-\text{CH} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H	O	O	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{S}-\text{C} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	6-CH ₃	O	O	

Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
-SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	O	O	
-SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	5-Cl	O	O	
-SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{OCH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	O	
H	H	S	CH ₂	
Cl	H	S	CH ₂	
NO ₂	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
SCH ₃	H	S	CH ₂	
SOCH ₃	H	S	CH ₂	
CF ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ Br	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	S	CH ₂	
CO ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ (CH ₂ CH ₂ O) ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
CON(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
CON(OCH ₃)CH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$ O	H	S	CH ₂	
O CSCH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	S	CH ₂	
Cl	5-Cl	S	CH ₂	
CH ₃	5-F	S	CH ₂	
OCH ₃	5-OCH ₃	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₃	4-F	S	CH ₂	

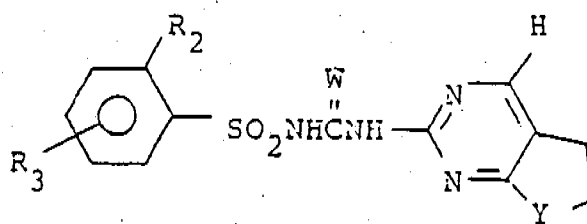
Taulukko I-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>SP.</u>
SO ₂ CH ₃	5-CH ₃	S	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	4-OCH ₃	S	CH ₂	
O "CSCH ₃	5-Cl	S	CH ₂	
SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	3-F	S	CH ₂	
CH ₃	H	S	O	
Cl	H	S	O	
NO ₂	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	O	
SO ₂ CH ₃	H	S	O	
CF ₃	H	S	O	
CO ₂ (CH ₂) ₃ OCH ₃	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H	S	O	
CON(OCH ₃)CH ₃	H	S	O	
CON(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]	H	S	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$ CH ₂	H	S	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	S	O	
O "CS-CH ₂ CH ₃	H	S	O	
SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	H	S	O	
Cl	5-Cl	S	O	
NO ₂	5-Cl	S	O	
CO ₂ CH ₃	4-Br	S	O	
SOC ₂ H ₅	4-F	S	O	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{OCH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	5-Cl	S	O	

Taulukko I-B (jatkoa)

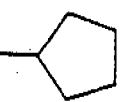
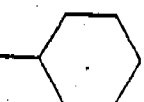
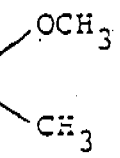
<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s p.</u>
OCH ₃	5-OCH ₃	S	O	
$\overset{\text{O}}{\parallel}$ CSCH(CH ₃) ₂	4-CH ₃	S	O	
SO ₂ OCH ₂ CF ₃	5-Cl	S	O	

Taulukko I-C



R_2	R_3	W	Y	s p.
Cl	H	O	CH_2	193-195°
Cl	5-Cl	O	CH_2	
NO_2	H	O	CH_2	
CO_2CH_3	H	O	CH_2	208-209°
$CO_2CH(CH_3)_2$	H	O	CH_2	
-F	H	O	CH_2	
-Br	H	O	CH_2	
-SCH ₃	H	O	CH_2	
-SO ₂ CH ₃	H	O	CH_2	
-CF ₃	H	O	CH_2	
-CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH_2	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	O	CH_2	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH_2	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	O	CH_2	
$CO_2CH(CH_3)_2$	H	O	CH_2	
$CO_2CH_2CH=CH_2$	H	O	CH_2	
$CO_2CH_2CF_3$	H	O	CH_2	
$CO_2(CH_2)_3CH_3$	H	O	CH_2	
$CO_2(CH_2)_5CH_3$	H	O	CH_2	
$CO_2CH(CH_3)CH_2CH_3$	H	O	CH_2	
$CO_2CH(CH_2CH_3)_2$	H	O	CH_2	
$CO_2CH_2C(CH_3)_3$	H	O	CH_2	
$CO_2CH_2CH=CH-CH_3$	H	O	CH_2	
H	H	O	CH_2	

Taulukko I-C (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s p.</u>
$\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_4\text{Cl}$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_6\text{Cl}$	H	O	CH_2	
CO_2 — 	H	O	CH_2	
CO_2 — 	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{CH}_3$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{C}_2\text{H}_5$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	O	CH_2	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	H	O	CH_2	
$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	H	O	CH_2	
$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$	H	O	CH_2	
$\text{CON}-\text{CH}_3$	H	O	CH_2	
$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$				
$\text{CON}(\text{CH}(\text{CH}_3)_2)_2$	H	O	CH_2	
$\text{CONCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	O	CH_2	
CH_3				
$\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	H	O	CH_2	
CON — 	H	O	CH_2	

Taulukko I-C (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>V</u>	<u>s p.</u>
Cl	6-Cl	0	CH ₂	
Cl	4-Cl	0	CH ₂	
Cl	3-Cl	0	CH ₂	
F	5-Cl	0	CH ₂	
F	3-Cl	0	CH ₂	
F	4-Cl	0	CH ₂	
F	5-F	0	CH ₂	
Cl	5-OCH ₃	0	CH ₂	
Cl	5-CH(CH ₃) ₂	0	CH ₂	
Cl	4-CH ₃	0	CH ₂	
Cl	4-F	0	CH ₂	
Cl	5-Br	0	CH ₂	
Cl	6-CH ₃	0	CH ₂	
NO ₂	5-Cl	0	CH ₂	
NO ₂	6-Cl	0	CH ₂	
NO ₂	5-F	0	CH ₂	
Cl	5-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	0	CH ₂	
Br	5-F	0	CH ₂	
SCH ₃	5-Cl	0	CH ₂	
SCH ₃	4-Cl	0	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	5-Cl	0	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	6-Cl	0	CH ₂	
SCH ₃	6-Cl	0	CH ₂	
SCH ₃	4-OCH ₃	0	CH ₂	
CF ₃	5-Cl	0	CH ₂	
CF ₃	5-CH ₃	0	CH ₂	
CF ₃	5-F	0	CH ₂	
CF ₃	4-Cl	0	CH ₂	
CF ₃	4-CH ₃	0	CH ₂	
CC ₂ CH ₃	5-CH ₃	0	CH ₂	

Taulukko I-C (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CO ₂ CH ₃	6-CH ₃	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	5-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	3-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	6-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃	O	CH ₂	
SOCH ₃	H	O	CH ₂	
SOCH ₃	5-Br	O	CH ₂	
SOCH $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	6-CH ₃	O	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2 \end{array}$	H	O	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$	5-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$	4-OCH ₃	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH}_3 \end{array}$	H	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH}_2\text{CH} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	3-F	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{S}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	5-CH ₂ CH ₃	O	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{OCH}_3 \\ \diagup \\ -\text{SO}_2\text{N} \\ \diagdown \\ \text{CH}_3 \end{array}$	5-Cl	O	CH ₂	

Taulukko I-C (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
Cl	H	0	0	
Cl	5-Cl	0	0	
NO ₂	H	0	0	
CO ₂ CH ₃	H	0	0	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	0	0	
-F	H	0	0	
-Br	H	0	0	
-SCH ₃	H	0	0	
-SO ₂ CH ₃	H	0	0	
-CF ₃	H	0	0	
-CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	0	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	0	0	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	0	
-CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	0	
-SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	0	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	0	0	
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	0	0	
CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	0	0	
CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	H	0	0	
CO ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	0	0	
CO ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	0	0	
CO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	0	0	
CO ₂ CH ₂ CH=CH-CH ₃	H	0	0	
H	H	0	0	

Taulukko I-C (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
$\text{CO}_2\text{CH}_2-\text{C} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_2 \\ \searrow \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	O	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	O	O	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_4\text{Cl}$	H	O	O	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2)_6\text{Cl}$	H	O	O	
$\text{CO}_2-\text{Cyclopentyl}$	H	O	O	
$\text{CO}_2-\text{Cyclohexyl}$	H	O	O	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{CH}_3$	H	O	O	
$\text{CO}_2(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{C}_2\text{H}_5$	H	O	O	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	O	O	
$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	H	O	O	
$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	H	O	O	
$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$	H	O	O	
$\text{CON}-\text{CH}_3$	H	O	O	
$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$				
$\text{CON}(\text{CH}(\text{CH}_3)_2)_2$	H	O	O	
$\text{CONCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	O	O	
CH_3				
$\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	H	O	O	
$\text{CON} \begin{array}{l} \nearrow \text{OCH}_3 \\ \searrow \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	O	

Taulukko I-C (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s.p.</u>
Cl	6-Cl	0	0	
Cl	4-Cl	0	0	
Cl	3-Cl	0	0	
F	5-Cl	0	0	
F	3-Cl	0	0	
F	4-Cl	0	0	
F	5-F	0	0	
Cl	5-OCH ₃	0	0	
Cl	5-CH(CH ₃) ₂	0	0	
Cl	4-CH ₃	0	0	
Cl	4-F	0	0	
Cl	5-Br	0	0	
Cl	6-CH ₃	0	0	
NO ₂	5-Cl	0	0	
NO ₂	6-Cl	0	0	
NO ₂	5-F	0	0	
Cl	5-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	0	0	
Br	5-F	0	0	
SCH ₃	5-Cl	0	0	
SCH ₃	4-Cl	0	0	
SO ₂ CH ₃	5-Cl	0	0	
SO ₂ CH ₃	6-Cl	0	0	
SCH ₃	6-Cl	0	0	
SCH ₃	4-OCH ₃	0	0	
CF ₃	5-Cl	0	0	
CF ₃	5-CH ₃	0	0	
CF ₃	5-F	0	0	
CF ₃	4-Cl	0	0	
CF ₃	4-CH ₃	0	0	
CO ₂ CH ₃	5-CH ₃	0	0	

Taulukko I-C (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s.p.</u>
CO ₂ CH ₃	6-CH ₃	0	0	
CO ₂ CH ₃	5-Cl	0	0	
CO ₂ CH ₃	3-Cl	0	0	
CO ₂ CH ₃	6-Cl	0	0	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃	0	0	
SOCH ₃	H	0	0	
SOCH ₃	5-Cl	0	0	
SOCH ₂ CH=CH ₃	6-F	0	0	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \end{array}$	H	0	0	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \end{array}$	H	0	0	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$				
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH=CH}_2 \\ \diagdown \end{array}$	5-OCH ₃	0	0	
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH=CH}_2 \\ \diagdown \end{array}$				
SO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2-\text{CH}_2 \\ \diagdown \text{CH}_2-\text{CH}_2 \end{array}$	3-Br	0	0	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH}_3 \end{array}$	H	0	0	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{SCH} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	5-F	0	0	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{S}-\text{CHCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{S}-\text{C} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	6-CH ₃	0	0	

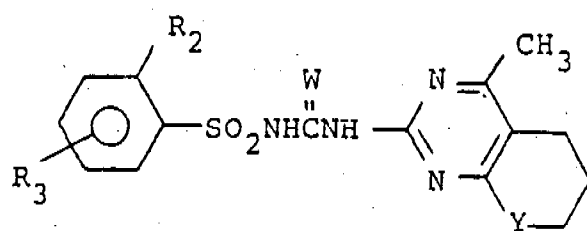
Taulukko I-C (jatkoa)

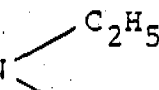
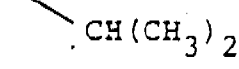
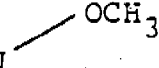
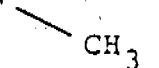
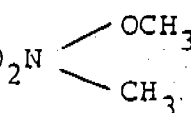
<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
$-\text{SO}_2\text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{OCH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	O	
$-\text{SO}_2\text{OCH}_2\text{CCl}_3$	3-Cl	O	O	
H	H	S	CH ₂	
Cl	H	S	CH ₂	
Br	H	S	CH ₂	
NO ₂	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
S-CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
OCH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
CF ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	S	CH ₂	
CO ₂ CHCH=CH ₂	H	S	CH ₂	
CH ₃				
CON(C ₂ H ₅) ₂	H	S	CH ₂	
CONH ₂	H	S	CH ₂	
$\text{SO}_2\text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \\ \text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$	H	S	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{CSCH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	S	CH ₂	
SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	S	CH ₂	
Cl	5-Cl	S	CH ₂	
Br	5-Br	S	CH ₂	
OCH ₃	5-OCH ₃	S	CH ₂	
CH ₃	6-CH ₃	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	4-F	S	CH ₂	

Taulukko I-C (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>s.p.</u>
SCH ₃	3-Cl	S	CH ₂	
SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	6-Cl	S	CH ₂	
O "CSCH ₃	6-OCH ₃	S	CH ₂	
H	H	S	O	
Cl	H	S	O	
F	H	S	O	
NO ₂	H	S	O	
SCH ₃	H	S	O	
OCH ₃	H	S	O	
SOCH(CH ₃) ₂	H	S	O	
CF ₃	H	S	O	
CO ₂ CH ₃	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ Br	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CCl ₃	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	S	O	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	S	O	
CON(OCH ₃)CH ₃	H	S	O	
CON[CH(CH ₃) ₂] ₂	H	S	O	
CON $\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$ CH ₂	H	S	O	
O "CS-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	O	
SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	H	S	O	
H	5-F	S	O	
Cl	5-Cl	S	O	
CO ₂ CH ₃	5-OCH ₃	S	O	
NO ₂	6-Cl	S	O	
OCH ₃	5-OCH ₃	S	O	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	4-Cl	S	O	
CON(CH ₃) ₂	5-Br	S	O	
SO ₂ OCH ₂ CF ₃	5-CH ₃	S	O	

Taulukko I-D

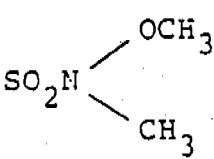
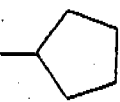
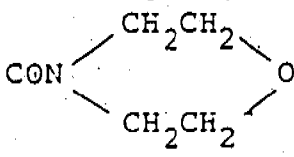
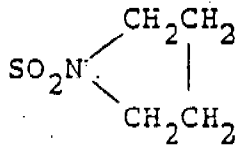


<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	190.5-192°
CO ₂ CH ₃	3-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	4-C ₂ H ₅	O	CH ₂	
CO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₂	
CO ₂ C ₂ H ₅	4-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	4-F	O	CH ₂	
CO ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	3-Cl	O	CH ₂	
CO ₂ (CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H	O	CH ₂	
CO ₂ - 	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	O	CH ₂	
CO ₂ (CH ₂) ₃ O-CH ₃	4-CH ₃	O	CH ₂	
CON  C ₂ H ₅	Cl	O	CH ₂	
CON  CH(CH ₃) ₂				
CON  OCH ₃	H	O	CH ₂	
CON  CH ₃				
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	O	CH ₂	
SO ₂ N  OCH ₃ CH ₃	H	O	CH ₂	

Taulukko I-D (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
COSCH ₃	H	O	CH ₂	
COS-CH $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	5-Cl	O	CH ₂	
COSCH ₂ CH ₃	6-OCH ₃	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH ₃	3-Cl	O	O	
CO ₂ CH ₃	4-C ₂ H ₅	O	O	
CO ₂ C ₂ H ₅	H	O	O	
CO ₂ C ₂ H ₅	4-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	4-F	O	O	
CO ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	3-Cl	O	O	
CO ₂ (CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H	O	O	
CO ₂ - 	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	O	O	
CO ₂ (CH ₂) ₃ O-CH ₃	4-CH ₃	O	O	
CON $\begin{array}{l} \diagup \text{C}_2\text{H}_5 \\ \diagdown \text{CH}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$	Cl	O	O	
CON $\begin{array}{l} \diagup \text{OCH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	O	O	
COSCH ₃	H	O	O	
COSCH-CH ₂ CH ₃ CH ₃	3-Br	O	O	
COS-CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Cl	O	O	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	O	O	
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	O	O	

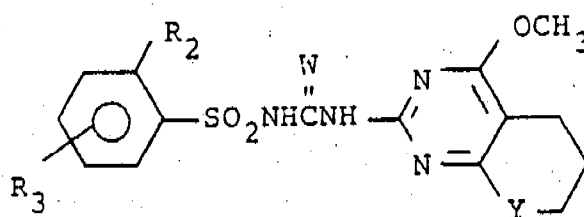
Taulukko I-D (jatkoa)

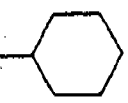
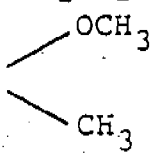
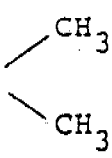
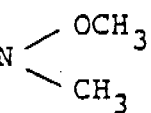
<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
	H	O	O	
CO ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	S	CH ₂	
CO ₂ - 	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
CON(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
O "CSCH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	5-Cl	S	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	4-CH ₃	S	CH ₂	
SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	6-F	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	H	S	O	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H	S	O	
CON(OCH ₃)CH ₃	H	S	O	
CON- 	H	S	O	
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	S	O	
SO ₂ N- 	H	S	O	

Taulukko I-D (jatkoa)

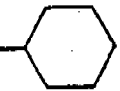
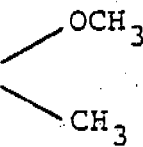
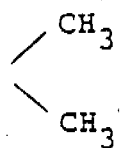
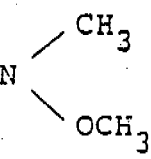
<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CO ₂ CH ₃	5-F	S	O	
CO ₂ CH ₃	5-OCH ₃	S	O	
CON(CH ₃) ₂	6-Cl	S	O	
SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	3-Cl	S	O	
O C-SCH ₃	4-CH ₃	S	O	

Taulukko I-E

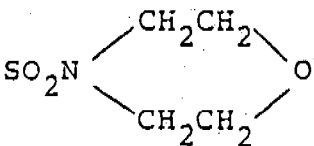


<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃ O	O	CH ₂	
CO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₂	
CO ₂ C ₂ H ₅	Cl	O	CH ₂	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ -CH=CH ₂	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CHCH ₂ CH ₃	5-Br	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH-CH ₂ Br Br	H	O	CH ₂	
CO ₂ - 	H	O	CH ₂	
CO ₂ (CH ₂ CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	H	O	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	O	CH ₂	
CON(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	
CON 	H	O	CH ₂	
COSCH ₃	H	O	CH ₂	
COSCH ₂ CH 	H	O	CH ₂	
COSCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	3-Cl	O	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	O	CH ₂	
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	O	CH ₂	
SO ₂ N 	H	O	CH ₂	

Taulukko I-E (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CO ₂ CH ₃	H	O	O	
CO ₂ CH ₃	4-CH ₃ O	O	O	
CO ₂ C ₂ H ₅	H	O	O	
CO ₂ C ₂ H ₅	Cl	O	O	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ -CH=CH ₂	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH=CHCH ₂ CH ₃	5-Br	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH-CH ₂ Br Br	H	O	O	
CO ₂ - 	H	O	O	
CO ₂ (CH ₂ CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	H	O	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	O	O	
CON(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂	H	O	O	
CON 	H	O	O	
COSCH ₃	H	O	O	
COSCH ₂ CH 	H	O	O	
CO-SCH ₂ CH ₂ CH ₃	6-CH ₃	O	O	
COS-CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	3-F	O	O	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	O	O	
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	O	O	
SO ₂ N 	H	O	O	

Taulukko I-E (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CO ₂ CH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	S	CH ₂	
CON(C ₂ H ₅) ₂	H	S	CH ₂	
CON(OCH ₃)CH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	H	S	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
O CS-CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	5-CH ₃	S	CH ₂	
CON(CH ₃) ₂	5-OCH ₃	S	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	6-Cl	S	CH ₂	
O CS-CH ₃	4-F	S	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	O	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH ₂ Br	H	S	O	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	S	O	
CO ₂ (CH ₂ CH ₂ O) ₂ CH ₃	H	S	O	
CON[CH(CH ₃) ₂] ₂	H	S	O	
SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	H	S	O	
CO ₂ CH ₃	6-CH ₃	S	O	
CO ₂ CH(CH ₃) ₂	5-Cl	S	O	
CON(OCH ₃)CH ₃	5-OCH ₃	S	O	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	4-F	S	O	
SO ₂ N- 	3-Br	S	O	

Taulukon II mukaiset yhdisteet valmistetaan antamalla pyridiinisulfonyyli-isosyanaatin tai pyridiinisulfonyyli-isotiosyanaatin reagoida sopivan 2-aminopyrimidiinin kanssa, kuten on havainnollistettu esimerkeissä 8 ja 9.

Esimerkki 8

2-kloori-3-pyridiinisulfonyyli-isosyanaatti

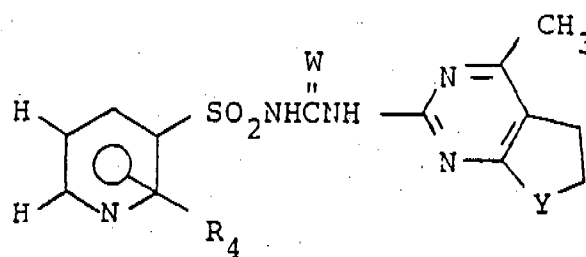
125 ml:aan kuivaa ksyleeniä lisättiin samalla sekoittaen 20,7 g 2-kloori-N-(butyylikarbamoyyli)-3-pyridiinisulfonamidia. Tämä liuos kuumennettiin paluujäähdytteiseksi ja lisättiin fosgeeniä kunnes tämän kaasun ottoa ei enää havaittu. Sen jälkeen liuos jäähdytettiin, suodatettiin ja liuotin poistettiin tyhjiössä, jolloin saatiin 2-kloori-3-pyridiinisulfonyyli-isosyanaattia öljynä, sp. 108-110° (0,6 mm Hg). Tämä tuote osoitti terävän absorptiopiikin infrapuna-alueella 2220 cm⁻¹:ä.

Esimerkki 9

2-kloori-N-[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)aminokarbonyyli]pyridiini-3-sulfonamidi

Kuivaan sekoitettuun liuokseen, jossa on 7,5 g 6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidiini-2-amiinia 200 ml:ssa metyleenikloridia ympäröivässä lämpötilassa ja paineessa, lisätään 13 g 2-klooripyrimidiini-3-sulfonyyli-isosyanaattia. Saatua seosta sekoitetaan paluujäähdyttämällä 2 tunnin ajan ja sen jälkeen väkevöidään alennetussa paineessa. Jäännös hierotaan jauheeksi 1-klooributaanin kanssa ja suodatetaan, jolloin saadaan haluttu kiinteä tuote.

Taulukko II-A



<u>R_4</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-F	O	CH_2
2-Br	O	CH_2
2- CH_3	O	CH_2
2- OCH_3	O	CH_2
2- NO_2	O	CH_2
2- CO_2CH_3	O	CH_2
2- $CO_2CH(CH_3)_2$	O	CH_2
2- $CO_2CH(CH_3)CH_2CH_3$	O	CH_2
2- SCH_3	O	CH_2
4-Cl	O	CH_2
4-F	O	CH_2
4-Br	O	CH_2
4- C_2H_5	O	CH_2
4- $CH_2CH_2CH_2CH_3$	O	CH_2
4- $OCH_2CH_2CH_2CH_3$	O	CH_2
4- NO_2	O	CH_2
4- $CO_2C_2H_5$	O	CH_2
4- $CO_2CH_2CH_2CH_3$	O	CH_2
4- $CO_2CH_2CH(CH_3)_2$	O	CH_2
4- $CO_2(CH_2)_4CH_3$	O	CH_2
4- $CO_2(CH_2)_5CH_3$	O	CH_2
4- SCH_3	O	CH_2
H	O	CH_2
2-S(CH_2) $_3$ CH $_3$	O	CH_2

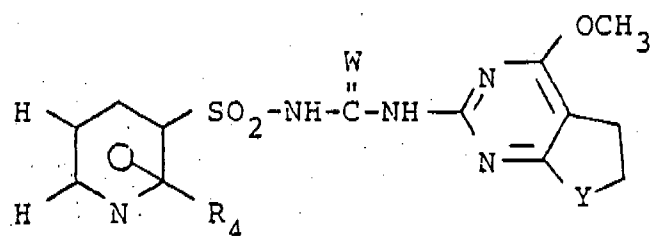
Taulukko II-A (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-F	O	O
2-Br	O	O
2-CH ₃	O	O
2-OCH ₃	O	O
2-NO ₂	O	O
2-CO ₂ CH ₃	O	O
2-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	O
2-CO ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	O	O
2-SCH ₃	O	O
4-Cl	O	O
4-F	O	O
4-Br	O	O
4-C ₂ H ₅	O	O
4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
4-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
4-NO ₂	O	O
4-CO ₂ C ₂ H ₅	O	O
4-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
4-CO ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	O	O
4-CO ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	O	O
4-CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	O	O
4-SCH ₃	O	O
2-Cl	O	O
2-S(CH ₂) ₃ CH ₃	O	O

Taulukko II-A (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
H	S	CH ₂
2-Cl	S	CH ₂
2-F	S	CH ₂
2-CH ₃	S	CH ₂
2-OCH ₃	S	CH ₂
2-NO ₂	S	CH ₂
2-CO ₂ CH ₃	S	CH ₂
2-SCH ₃	S	CH ₂
4-Cl	S	CH ₂
4-Br	S	CH ₂
4-CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂
4-OC ₂ H ₅	S	CH ₂
4-NO ₂	S	CH ₂
4-CO ₂ C ₂ H ₅	S	CH ₂
H	S	O
2-Cl	S	O
2-Br	S	O
2-CH ₃	S	O
2-OCH ₃	S	O
2-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	S	O
2-SCH ₃	S	O
4-Cl	S	O
4-F	S	O
4-C ₂ H ₅	S	O
4-OCH(CH ₃) ₂	S	O
4-NO ₂	S	O
4-CO ₂ CH ₃	S	O

Taulukko II-B



<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-Br	O	CH ₂
2-CH ₃	O	CH ₂
2-CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	O	CH ₂
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-OCH ₃	O	CH ₂
2-NO ₂	O	CH ₂
2-CO ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	O	CH ₂
2-CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
4-Cl	O	CH ₂
4-F	O	CH ₂
4-Br	O	CH ₂
4-CH ₃	O	CH ₂
4-C ₂ H ₅	O	CH ₂
4-CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂
4-OCH ₃	O	CH ₂
4-NO ₂	O	CH ₂
4-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂
4-SCH ₃	O	CH ₂
2-Cl	O	CH ₂
2-F	O	CH ₂
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
H	O	CH ₂

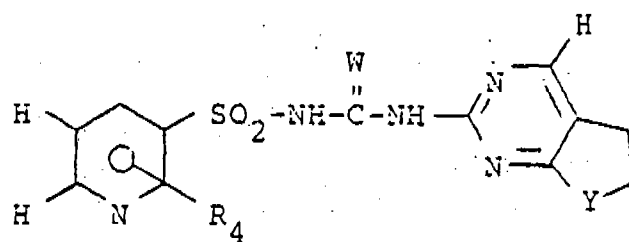
Taulukko II-B (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-Br	O	O
2-CH ₃	O	O
2-CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	O	O
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
2-OCH ₃	O	O
2-NO ₂	O	O
2-CO ₂ CH ₃	O	O
2-CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	O	O
2-CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
4-Cl	O	O
4-F	O	O
4-Br	O	O
4-CH ₃	O	O
4-C ₂ H ₅	O	O
4-CH(CH ₃) ₂	O	O
4-OCH ₃	O	O
4-NO ₂	O	O
4-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	O
4-SCH ₃	O	O
2-Cl	O	O
2-F	O	O
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
H	O	O

Taulukko II-B (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
H	S	CH ₂
2-Cl	S	CH ₂
2-Br	S	CH ₂
CH ₃		
2-CHC ₂ H ₅	S	CH ₂
2-OC ₂ H ₅	S	CH ₂
2-NO ₂	S	CH ₂
2-CO ₂ CH ₃	S	CH ₂
4-Cl	S	CH ₂
4-F	S	CH ₂
4-Br	S	CH ₂
4-CH ₃	S	CH ₂
4-OCH ₃	S	CH ₂
4-NO ₂	S	CH ₂
4-SCH ₃	S	CH ₂
H	S	O
2-Cl	S	O
2-Br	S	O
2-F	S	O
2-CH ₃	S	O
2-OCH ₃	S	O
2-NO ₂	S	O
2-CO ₂ CH ₃	S	O
4-Cl	S	O
4-F	S	O
4-C ₂ H ₅	S	O
4-NO ₂	S	O
4-CO ₂ C ₂ H ₅	S	O

Taulukko II-C



<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-Br	O	CH ₂
2-CH ₃	O	CH ₂
2-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-OCH ₃	O	CH ₂
2-NO ₂	O	CH ₂
2-CO ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	O	CH ₂
2-CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
4-Cl	O	CH ₂
4-F	O	CH ₂
4-Br	O	CH ₂
4-CH ₃	O	CH ₂
4-C ₂ H ₅	O	CH ₂
4-CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂
4-OCH ₃	O	CH ₂
4-NO ₂	O	CH ₂
4-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂
4-SCH ₃	O	CH ₂
2-Cl	O	CH ₂
2-F	O	CH ₂
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
H	O	CH ₂

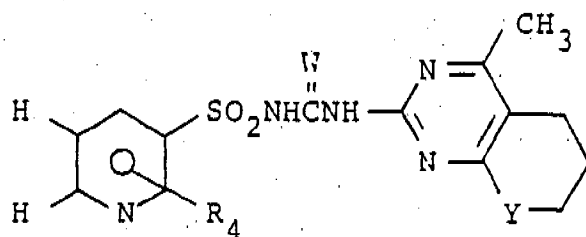
Taulukko II-C (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-S(CH ₂) ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-Br	O	O
2-CH ₃	O	O
2-CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	O	O
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
2-OCH ₃	O	O
2-NO ₂	O	O
2-CO ₂ CH ₃	O	O
2-CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	O	O
2-CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
4-Cl	O	O
4-F	O	O
4-Br	O	O
4-CH ₃	O	O
4-C ₂ H ₅	O	O
4-CH(CH ₃) ₂	O	O
4-OCH ₃	O	O
4-NO ₂	O	O
4-CO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	O
4-SCH ₃	O	O
2-Cl	O	O
2-F	O	O
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
H	O	O
-2-S(CH ₂) ₂ CH ₃	O	O

Taulukko II-C (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
H	S	CH ₂
2-Cl	S	CH ₂
2-Br	S	CH ₂
2-F	S	CH ₂
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	CH ₂
2-O(CH ₂) ₃ CH ₃	S	CH ₂
2-NO ₂	S	CH ₂
2-CO ₂ CH ₃	S	CH ₂
2-SCH ₃	S	CH ₂
4-Cl	S	CH ₂
4-F	S	CH ₂
4-CH ₃	S	CH ₂
4-OCH ₃	S	CH ₂
4-NO ₂	S	CH ₂
4-CO ₂ C ₂ H ₅	S	CH ₂
2-Cl	S	O
2-Br	S	O
2-CH ₃	S	O
2-OCH ₃	S	O
2-NO ₂	S	O
2-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	S	O
2-SCH ₃	S	O
4-Cl	S	O
4-F	S	O
4-CH ₃	S	O
4-OCH ₃	S	O
4-CO ₂ CH ₃	S	O

Taulukko II-D



<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-Cl	O	CH ₂
2-F	O	CH ₂
2-Br	O	CH ₂
2-CH ₃	O	CH ₂
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-NO ₂	O	CH ₂
2-CO ₂ CH ₃	O	CH ₂
2-CO ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂
2-SCH ₃	O	CH ₂
4-Cl	O	CH ₂
4-F	O	CH ₂
4-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CH ₂
4-CH ₃	O	CH ₂
4-CH ₃ O	O	CH ₂
4-NO ₂	O	CH ₂
4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂
4-SCH ₃	O	CH ₂
2-S(CH ₂) ₃ CH ₃	O	CH ₂
2-Cl	O	O
2-F	O	O
2-Br	O	O
2-CH ₃	O	O
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
2-NO ₂	O	O

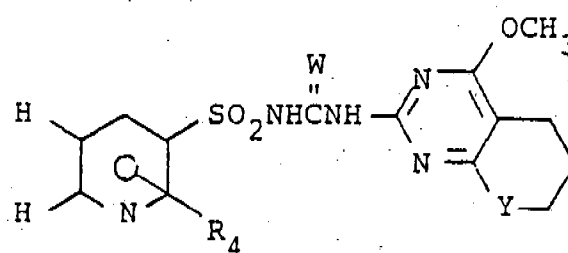
Taulukko II-D (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-CO ₂ CH ₃	O	O
2-CO ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	O	O
2-SCH ₃	O	O
4-Cl	O	O
4-F	O	O
4-CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	O
4-CH ₃	O	O
4-CH ₃ O	O	O
4-NO ₂	O	O
4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	O
4-SCH ₃	O	O
2-S(CH ₂) ₃ CH ₃	O	O
2-Cl	S	CH ₂
2-F	S	CH ₂
2-CH ₃	S	CH ₂
2-OCH ₃	S	CH ₂
2-NO ₂	S	CH ₂
2-CO ₂ CH ₃	S	CH ₂
2-SCH ₃	S	CH ₂
4-Cl	S	CH ₂
4-Br	S	CH ₂
4-C ₂ H ₅	S	CH ₂
4-OCH ₃	S	CH ₂
4-NO ₂	S	CH ₂
4-CO ₂ C ₂ H ₅	S	CH ₂
4-SC ₂ H ₅	S	CH ₂
2-Cl	S	O
2-F	S	O

Taulukko II-D (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
2-Br	S	O
2-C ₂ H ₅	S	O
2-OC ₂ H ₅	S	O
2-NO ₂	S	O
2-CH ₂ CH ₃	S	O
2-SCH(CH ₃) ₂	S	O
4-Cl	S	O
4-F	S	O
4-CH ₃	S	O
4-OCH ₃	S	O
4-NO ₂	S	O
4-CO ₂ CH ₃	S	O

Taulukko II-E



<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
4-Cl	O	CH ₂
4-Br	O	CH ₂
4-CH ₃	O	CH ₂
4-OCH ₃	O	CH ₂
4-NO ₂	O	CH ₂
4-CO ₂ CH ₃	O	CH ₂
4-CO ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	O	CH ₂
4-SCH ₃	O	CH ₂
2-Cl	O	CH ₂
2-F	O	CH ₂
2-Br	O	CH ₂
2-CH(CH ₃) ₂	O	CH ₂
2-CH ₃ O	O	CH ₂
2-NO ₂	O	CH ₂
2-COOC ₂ H ₅	O	CH ₂
2-SCH ₃	O	CH ₂
4-SCH ₂ CH ₃	O	CH ₂

Taulukko II-E (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
4-Cl	O	O
4-Br	O	O
4-CH ₃	O	O
4-OCH ₃	O	O
4-NO ₂	O	O
4-CO ₂ CH ₃	O	O
4-CO ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	O	O
4-SCH ₃	O	O
2-Cl	O	O
2-F	O	O
2-Br	O	O
2-CH(CH ₃) ₂	O	O
2-CH ₃ O	O	O
2-NO ₂	O	O
2-COOC ₂ H ₅	O	O
2-SCH ₃	O	O
4-SCH ₂ CH ₃	O	O
2-Cl	S	CH ₂
2-F	S	CH ₂
2-Br	S	CH ₂
2-CH ₃	S	CH ₂
2-OCH ₃	S	CH ₂
2-NO ₂	S	CH ₂
2-CO ₂ CH ₃	S	CH ₂
2-SCH ₃	S	CH ₂
4-Cl	S	CH ₂
4-F	S	CH ₂
4-CH ₃	S	CH ₂
4-OC ₂ H ₅	S	CH ₂

Taulukko II-E (jatkoa)

<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>Y</u>
4-NO ₂	S	CH ₂
4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	S	CH ₂
4-SC ₂ H ₅	S	CH ₂
2-Cl	S	O
2-F	S	O
2-Br	S	O
2-C ₂ H ₅	S	O
2-OCH(CH ₃) ₂	S	O
2-NO ₂	S	O
2-CO ₂ CH ₃	S	O
2-SCH ₃	S	O
4-Cl	S	O
4-Br	S	O
4-CH ₃	S	O
4-OCH ₃	S	O
4-NO ₂	S	O
4-CO ₂ CH ₃	S	O

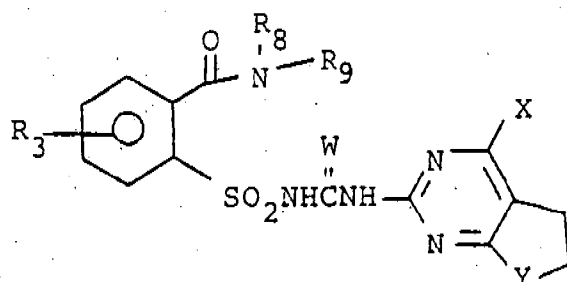
Esimerkki 10

2-isopropyyliaminokarbonyyli-N-[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)aminokarbonyyli/bentseenisulfonamidi.

21,2 ml:aan 25 % trimetyyli-alumiinia heksaanissa (2,35 moollista) typpi-atmosfäärissä lisätään 2,9 g isopropyyliamiinia 100 ml:ssa kuivattua metyleenikloridia. Seosta sekoitetaan ympäröivässä lämpötilassa kunnes metaanikaasun kehittyminen lakkaa, ja sen jälkeen lisätään 19,5 g metyyli-2-[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli/aminosulfonyyli] bentsoaattia ja 200 ml kuivaa tolueenia. Saatua seosta kuumennetaan metyleenikloridin ja heksaanin poistislaamiseksi, jonka jälkeen kuumentamista jatketaan tolueenin paluujäähdytteisessä lämpötilassa. Kahden tunnin kuluttua tolueeni poistetaan tyhjiössä ja lisätään 200 ml metyleenikloridia ja 100 ml 10 % kloorivetyhappoa. Faasit erotetaan ja metyleenikloridifaasi pestään kerran vedellä, kuivataan magnesiumsulfaatilla ja suodatetaan ja metyleenikloridi tislataan, jolloin saadaan haluttu tuote.

Käyttämällä esimerkin 10 mukaisessa menetelmässä ekvivalenttista määrää sopivasti substituotua bentsoehappoesteriä ja alkyylia-minodialkyylialumiinia voidaan taulukon III mukaiset yhdisteet valmistaa.

Taulukon III-A



<u>R₃</u>	<u>R₉</u>	<u>R₈</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
H	CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₂
H	C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	CH ₂
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₃	CH ₂
5-Cl	CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₂
6-Cl	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₃	CH ₂
H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₂
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₃	CH ₂
5-Cl	C ₂ H ₅	H	O	OCH ₃	CH ₂
6-Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃	CH ₂
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	O	CH ₃	CH ₂
H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O	CH ₃	CH ₂
H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₃	CH ₂
H	(CH ₂) ₄ H	(CH ₂) ₄ H	O	CH ₃	CH ₂
H	H	H	O	CH ₃	CH ₂
H	CH ₃	H	O	H	CH ₂
5-Cl	C ₂ H ₅	H	O	H	CH ₂
6-Cl	CH(CH ₃) ₂	H	O	H	CH ₂
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	O	H	CH ₂
H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O	H	CH ₂
H	H	H	O	H	CH ₂
H	CH ₃	CH ₃	O	Cl	CH ₂
H	C ₂ H ₅	H	O	Cl	CH ₂
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	Cl	CH ₂
H	CH ₃	H	O	Cl	CH ₂

Taulukko III-A (jatkoa)

<u>R₃</u>	<u>R₉</u>	<u>R₈</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
5-Cl	CH ₃	CH ₃	O	OC ₂ H ₅	CH ₂
6-Cl	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O	OC ₂ H ₅	CH ₂
H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	OC ₂ H ₅	CH ₂
H	CH ₃	H	O	CH ₃	O
H	C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	O
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₃	O
5-Cl	CH ₃	H	O	CH ₃	O
6-Cl	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₃	O
H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	O
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₃	O
5-Cl	C ₂ H ₅	H	O	OCH ₃	O
6-Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃	O
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	O	CH ₃	O
H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O	CH ₃	O
H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	O	CH ₃	O
H	(CH ₂) ₄ H	(CH ₂) ₄ H	O	CH ₃	O
H	H	H	O	CH ₃	O
H	CH ₃	H	O	H	O
5-Cl	CH ₃	H	O	H	O
6-Cl	C ₂ H ₅	H	O	H	O
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	O	H	O
H	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	O	H	O
H	(CH ₂) ₄ H	CH ₃	O	H	O
H	H	H	O	H	O
H	CH ₃	CH ₃	O	Cl	O
H	C ₂ H ₅	H	O	Cl	O
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	Cl	O
H	CH ₃	H	O	Cl	O
5-Cl	CH ₃	CH ₃	O	OC ₂ H ₅	O
6-Cl	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O	OC ₂ H ₅	O
H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O	OC ₂ H ₅	O

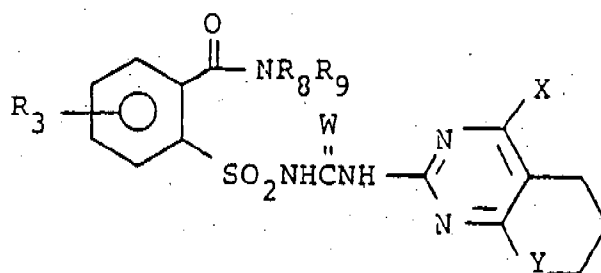
Taulukko III-A (jatkoa)

<u>R₃</u>	<u>R₉</u>	<u>R₉</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
H	H	H	S	CH ₃	O
H	CH ₃	H	S	CH ₃	O
H	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₃	O
H	CHC ₂ H ₅ CH ₃	H	S	CH ₃	O
H	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃	O
H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	CH ₃	O
5-Cl	C ₂ H ₅	H	S	CH ₃	O
6-Cl	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃	O
H	H	H	S	OCH ₃	O
H	CH ₃	H	S	OCH ₃	O
H	CH ₃	CH ₃	S	OCH ₃	O
5-Cl	CH ₃	CH ₃	S	OCH ₃	O
H	CH ₃	H	S	H	O
H	CH ₃	C ₂ H ₅	S	H	O
H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	S	H	O
H	CH ₃	H	S	Cl	O
H	CH ₃	CH ₃	S	Cl	O
6-Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	Cl	O
H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	Cl	O
H	H	H	S	OC ₂ H ₅	O
H	CH ₃	CH ₃	S	OC ₂ H ₅	O
5-Cl	CH ₃	H	S	OC ₂ H ₅	O
H	-CH ₂ CH ₂ O-CH ₂ CH ₂ -		S	OC ₂ H ₅	O
H	H	H	S	CH ₃	O
H	CH ₃	H	S	CH ₃	O
H	C ₂ H ₅	H	S	CH ₃	O
H	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃	O
H	CH ₃	C ₂ H ₅	S	CH ₃	O
6-Cl	-CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₃	O
5-Cl	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃	O

Taulukko III-A (jatkoa)

<u>R₃</u>	<u>R₈</u>	<u>R₉</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
H	H	H	S	OCH ₃	O
H	CH ₃	H	S	OCH ₃	O
H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	OCH ₃	O
S-Cl	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	S	OCH ₃	O
H	CH ₃	H	S	H	O
H	-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	S	H	O
H	CH ₃	CH ₃	S	H	O
H	C ₂ H ₅	H	S	Cl	O
H	C ₂ H ₅	CH ₃	S	Cl	O
H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	Cl	O
S-Cl	CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	S	Cl	O
H	H	H	S	OC ₂ H ₅	O
H	CH ₃	CH ₃	S	OC ₂ H ₅	O
H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		S	OC ₂ H ₅	O
H	-CH(CH ₃) ₂	CH ₃	S	OC ₂ H ₅	O
6-Cl	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	OC ₂ H ₅	O

Taulukko III-B



<u>R₃</u>	<u>R₉</u>	<u>R₈</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
H	C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	CH ₂
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₃	CH ₂
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₂
5-Cl	CH(CH ₃) C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	CH ₂
H	CH ₃	CH ₃	O	CH ₃	CH ₂
H	C ₂ H ₅	CH ₃	O	CH ₃	CH ₂
H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O	CH ₃	CH ₂
H	H	H	O	CH ₃	CH ₂
H	C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	O
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	CH ₃	O
H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	O
5-Cl	CH(CH ₃) C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	O
H	CH ₃	CH ₃	O	CH ₃	O
H	C ₂ H ₅	CH ₃	O	CH ₃	O
H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O	CH ₃	O
H	H	H	O	CH ₃	O
H	C ₂ H ₅	CH ₃	O	OCH ₃	CH ₂
H	CH(CH ₃) ₂	H	O	OCH ₃	CH ₂
H	CH ₃	CH ₃	O	OCH ₃	O
H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O	OCH ₃	O

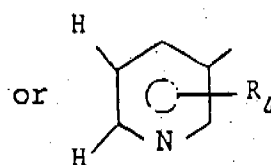
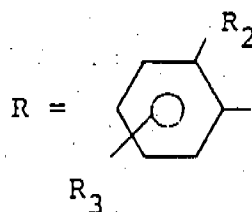
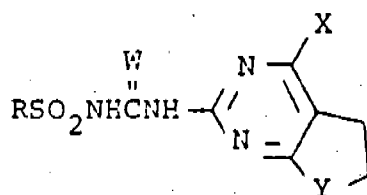
Taulukko III-B (jatkoa)

<u>R₃</u>	<u>R₉</u>	<u>R₈</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
H	CH ₃	H	S	CH ₃	CH ₂
H	CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₃	CH ₂
H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	S	CH ₃	CH ₂
5-Cl	-C ₂ H ₅	H	S	CH ₃	CH ₂
H	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃	CH ₂
H	C ₂ H ₅	CH ₃	S	CH ₃	CH ₂
6-Cl	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃	CH ₂
H	H	H	S	OCH ₃	CH ₂
H	CH ₃	H	S	OCH ₃	CH ₂
H	CH ₃	CH ₃	S	OCH ₃	CH ₂
H	C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	S	OCH ₃	CH ₂
H	CH ₃	H	S	CH ₃	O
H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	S	CH ₃	O
H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	CH ₃	O
5-Cl	CH ₃	CH ₃	S	CH ₃	O
H	C ₂ H ₅	CH ₃	S	CH ₃	O
H	C ₂ H ₅	H	S	OCH ₃	O
H	CH ₂ (CH ₃) ₃	H	S	OCH ₃	O
H	CH ₃	CH ₃	S	OCH ₃	O
H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	S	OCH ₃	O
6-Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		S	OCH ₃	O

Käyttämällä edellä kuvattuja menetelmiä ja sopivia reagoivia ainesosia ja 4-kloori- tai 4-etoksi-5,6-dihydrofuro[2,3-d]pyrimidiini-2-amiinia tai 4-kloori- tai 4-etoksi-6,7-dihydro-5H-syklopentapyrimidiini-2-amiinia voidaan taulukon IV-A mukaiset yhdisteet valmistaa.

Vastaavasti taulukon IV-B mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa käyttäen sopivia reagoivia ainesosia ja lähtien 6,7-dihydro-5H-pyrano[2,3-d]pyrimidiini-2-amiinista, joka on substituoitu 4-asemesta vedyllä, kloorilla tai etoksilla.

Taulukko IV-A



<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
H	H	-	O	Cl	O	
CO ₂ CH ₃	H	-	O	Cl	O	215-219°
CO ₂ CH ₃	5-Cl	-	O	Cl	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	
Cl	H	-	O	OC ₂ H ₅	O	
NO ₂	H	-	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	
SO ₂ CH ₃	H	-	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	-	O	OC ₂ H ₅	O	
CON(CH ₃) ₂	H	-	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	
	H	-	O	OC ₂ H ₅	O	
F	H	-	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	2-CO ₂ CH ₃	O	Cl	O	
-	-	4-CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	Cl	CH ₂	
-	-	4-NO ₂	O	Cl	O	
-	-	2-CH ₃ O	O	Cl	O	
-	-	2-Br	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	2-CH ₃	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	2-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	OC ₂ H ₅	O	
-	-	4-F	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	2-NO ₂	O	OC ₂ H ₅	CH ₂	

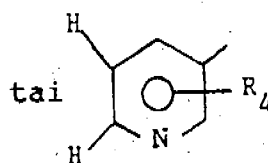
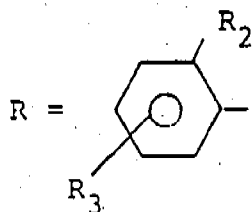
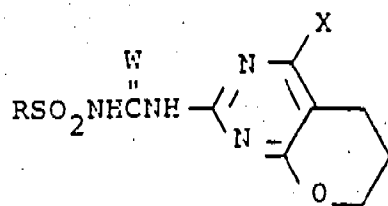
Taulukko IV-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>S p.</u>
Cl	H	-	S	Cl	O	
NO ₂	H	-	S	Cl	O	
CO ₂ CH ₃	H	-	S	Cl	O	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-	S	Cl	O	
Cl	5-Cl	-	S	Cl	O	
Cl	H	-	S	OC ₂ H ₅	O	
NO ₂	H	-	S	OC ₂ H ₅	O	
CO ₂ C ₂ H ₅	H	-	S	OC ₂ H ₅	O	
CON $\begin{array}{l} \diagup \text{OCH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	-	S	OC ₂ H ₅	O	
OCH ₃	5-OCH ₃	-	S	OC ₂ H ₅	O	
SCH ₃	H	-	S	OC ₂ H ₅	O	
SO ₂ C ₂ H ₅	H	-	S	OC ₂ H ₅	O	
Cl	H	-	S	Cl	CH ₂	
NO ₂	H	-	S	Cl	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	H	-	S	Cl	CH ₂	
Cl	5-Cl	-	S	Cl	CH ₂	
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	-	S	Cl	CH ₂	
Cl	H	-	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
NO ₂	H	-	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
CO ₂ CH ₃	H	-	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
SCH ₃	5-SCH ₃	-	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
CON(CH ₃) ₂	H	-	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	2-Cl	S	Cl	O	
-	-	4-F	S	Cl	O	
-	-	2-NO ₂	S	Cl	O	
-	-	4-CO ₂ CH ₃	S	Cl	O	
-	-	2-OCH ₃	S	Cl	O	
-	-	2-CH ₃	S	Cl	O	

Taulukko IV-A (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
-	-	4-Cl	S	Cl	CH ₂	
-	-	4-NO ₂	S	Cl	CH ₂	
-	-	2-CO ₂ CH ₃	S	Cl	CH ₂	
-	-	4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	S	Cl	CH ₂	
-	-	2-Cl	S	OC ₂ H ₅	O	
-	-	2-NO ₂	S	OC ₂ H ₅	O	
-	-	4-CO ₂ C ₂ H ₅	S	OC ₂ H ₅	O	
-	-	4-SCH ₃	S	OC ₂ H ₅	O	
-	-	2-OCH ₃	S	OC ₂ H ₅	O	
-	-	4-CH ₃	S	OC ₂ H ₅	O	
-	-	4-F	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	2-Br	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	2-NO ₂	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	4-CO ₂ CH ₃	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	
-	-	2-C ₂ H ₅	S	OC ₂ H ₅	CH ₂	

Taulukko IV-B



<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>X</u>
H	H	-	0	Cl
CO ₂ CH ₃	H	-	0	Cl
CO ₂ CH ₃	5-Cl	-	0	Cl
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-	0	OC ₂ H ₅
Cl	H	-	0	OC ₂ H ₅
NO ₂	H	-	0	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	H	-	0	OC ₂ H ₅
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	-	0	OC ₂ H ₅
CON(CH ₃) ₂	H	-	0	OC ₂ H ₅
	H	-	0	OC ₂ H ₅
F	H	-	0	OC ₂ H ₅
-	-	2-CO ₂ CH ₃	0	Cl
-	-	4-CO ₂ CH ₂ CH ₃	0	Cl
-	-	4-NO ₂	0	Cl
-	-	2-CH ₃ O	0	Cl
-	-	2-Br	0	OC ₂ H ₅
-	-	2-CH ₃	0	OC ₂ H ₅
-	-	2-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	0	OC ₂ H ₅
-	-	4-F	0	OC ₂ H ₅
-	-	2-NO ₂	0	OC ₂ H ₅

Taulukko IV-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>X</u>
Cl	H	-	S	Cl
NO ₂	H	-	S	Cl
CO ₂ CH ₃	H	-	S	Cl
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-	S	Cl
Cl	5-Cl	-	S	Cl
Cl	H	-	S	OC ₂ H ₅
NO ₂	H	-	S	OC ₂ H ₅
CO ₂ C ₂ H ₅	H	-	S	OC ₂ H ₅
CON $\begin{array}{l} \diagup \text{OCH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$	H	-	S	OC ₂ H ₅
OCH ₃	5-OCH ₃	-	S	OC ₂ H ₅
SCH ₃	H	-	S	OC ₂ H ₅
SO ₂ C ₂ H ₅	H	-	S	OC ₂ H ₅
Cl	H	-	S	Cl
NO ₂	H	-	S	Cl
CO ₂ CH ₃	H	-	S	Cl
Cl	5-Cl	-	S	Cl
SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	-	S	Cl
Cl	H	-	S	OC ₂ H ₅
NO ₂	H	-	S	OC ₂ H ₅
CO ₂ CH ₃	H	-	S	OC ₂ H ₅
SCH ₃	5-SCH ₃	-	S	OC ₂ H ₅
CON(CH ₃) ₂	H	-	S	OC ₂ H ₅
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-	S	OC ₂ H ₅
-	-	2-Cl	S	Cl
-	-	4-F	S	Cl
-	-	2-NO ₂	S	Cl
-	-	4-CO ₂ CH ₃	S	Cl
-	-	2-OCH ₃	S	Cl
-	-	2-CH ₃	S	Cl

Taulukko IV-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>X</u>
-	-	4-Cl	S	Cl
-	-	4-NO ₂	S	Cl
-	-	2-CO ₂ CH ₃	S	Cl
-	-	4-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	S	Cl
-	-	2-Cl	S	OC ₂ H ₅
-	-	2-NO ₂	S	OC ₂ H ₅
-	-	4-CO ₂ C ₂ H ₅	S	OC ₂ H ₅
-	-	4-SCH ₃	S	OC ₂ H ₅
-	-	2-OCH ₃	S	OC ₂ H ₅
-	-	4-CH ₃	S	OC ₂ H ₅
-	-	4-F	S	OC ₂ H ₅
-	-	2-Br	S	OC ₂ H ₅
-	-	2-NO ₂	S	OC ₂ H ₅
-	-	4-CO ₂ CH ₃	S	OC ₂ H ₅
-	-	2-C ₂ H ₅	S	OC ₂ H ₅

Taulukko IV-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>X</u>
H	H	-	O	H
CO ₂ CH ₃	H	-	O	H
CO ₂ CH ₃	5-Cl	-	O	H
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-	O	H
Cl	H	-	O	H
NO ₂	H	-	O	H
SO ₂ CH ₃	H	-	O	H
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	-	O	H
CON(CH ₃) ₂	H	-	O	H
$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{OCH}_3 \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagdown \quad \parallel \\ \quad \quad \text{CH}_3 \end{array}$	H	-	O	H
F	H	-	O	H
-	-	2-CO ₂ CH ₃	O	H
-	-	4-CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	H
-	-	4-NO ₂	O	H
-	-	2-CH ₃ O	O	H
-	-	2-Br	O	H
-	-	2-CH ₃	O	H
-	-	2-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	H
-	-	4-F	O	H
-	-	2-NO ₂	O	H

Taulukko IV-B (jatkoa)

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₄</u>	<u>W</u>	<u>X</u>
H	H	-	S	H
CO ₂ CH ₃	H	-	S	H
CO ₂ CH ₃	5-Cl	-	S	H
SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-	S	H
Cl	H	-	S	H
NO ₂	H	-	S	H
SO ₂ CH ₃	H	-	S	H
CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	-	S	H
CON(CH ₃) ₂	H	-	S	H
$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{OCH}_3 \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagdown \quad \parallel \\ \quad \quad \text{CH}_3 \end{array}$	H	-	S	H
F	H	-	S	H
-	-	2-CO ₂ CH ₃	S	H
-	-	4-CO ₂ CH ₂ CH ₃	S	H
-	-	4-NO ₂	S	H
-	-	2-CH ₃ O	S	H
-	-	2-Br	S	H
-	-	2-CH ₃	S	H
-	-	2-CO ₂ CH(CH ₃) ₂	S	H
-	-	4-F	S	H
-	-	2-NO ₂	S	H

Kaavan II mukaiset yhdisteet valmistetaan yhtälöiden 2 ja 5 ja esimerkkien 11, 12 ja 13 mukaisilla menetelmillä, joissa lämpötilat on annettu celsiusasteina.

Esimerkki 11

Metyyli-N'-(2-kloorifenyyli)sulfonyyli)-N-(5,6-dihydro-4-metyylifuro/2,3-d)pyrimidin-2-yyli)karbamimidotioaatti

Suspensioon, jossa oli 3,85 g 2-kloori-N-[(5,6-dihydro-2-metyylifuro-2,3-d)pyrimidin-2-yyli)aminotioksometyyli]bentseenisulfonamidia 150 ml:ssa vedetöntä tetrahydrofuraania, lisättiin 4,3 ml 3M NaOCH₃/CH₃OH-liuosta. Reaktioseosta paluujäähdytettiin 1,25 tuntia, minkä jälkeen lisättiin 1,85 g metyylijodidia 10 ml:ssa vedetöntä tetrahydrofuraania. Sen jälkeen kun oli paluujäähdytetty ja sekoitettu vielä 12 tuntia, reaktioseos jäähdytettiin, liuotin poistettiin tyhjiössä ja jäännös uudelleenkiteytettiin asetonitriilistä, jolloin saatiin 1 g tuotetta.

Esimerkki 12

Metyyli-2-{1-(6,7-dihydro-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli-amino)-1-(etyylitio)metyleeni}aminosulfonyyli} bentsoaatti

Suspensioon, jossa oli 4,2 g metyyli-2-{1-(6,7-dihydro-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)aminotioksometyyli}aminosulfonyyli} bentsoaattia 200 ml:ssa vedetöntä tetrahydrofuraania, lisättiin 4,3 ml 3M NaOCH₃/CH₃OH-liuosta. Reaktioseosta paluujäähdytettiin 15 minuuttia, minkä jälkeen lisättiin 2 g etyylijodidia 10 ml:ssa vedetöntä tetrahydrofuraania. Sen jälkeen kun oli sekoitettu ja paluujäähdytetty vielä 6 tuntia, reaktioseos jäähdytettiin, liuotin poistettiin tyhjiössä ja jäännös uudelleenkiteytettiin asetonitriilistä, jolloin saatiin 0,5 g tuotetta.

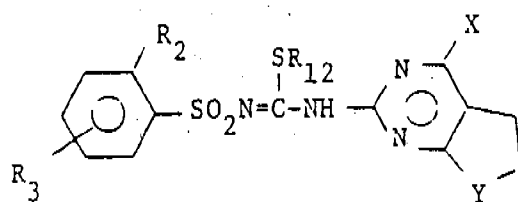
Esimerkki 13

Metyyli-N-(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)N'-(2,5-dimetoksifenyyli)sulfonyyli)karbamimidotioaatti

1,5 g 6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidiini-2-amiinia liuotettiin seokseen, jossa oli 20 ml vedetöntä tetrahydrofuraania ja 60 ml vedetöntä dimetyyliformamidia. Lisättiin 0,48 g natriumhydridiä (50 % mineraaliöljy-dispersio). Reaktiota sekoitettiin kunnes vedyn kehittyminen lakkasi. Lisättiin heti 2,75 g

N(2,5-dimetoksifenyyli)sulfonyyli)hiili-imiditionihapon 5,5-dime-
tyyliesteriä. Reaktioseosta sekoitettiin 24 tuntia ympäröivässä
lämpötilassa. Seos kaadettiin 300 ml:aan vettä ja tehtiin happa-
meksi pH: on 5. 20 % kloorivetyhapolla. Seos suodatettiin. Saatu
kiinteä aine uudelleenkiteytettiin etyyliasetaatista, jolloin
saatiin 1 g tuotetta.

Taulukko V-a



<u>R₁₂</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CH ₃	Cl	5-Cl	CH ₃ O	O	
CH ₃ CH ₂	Cl	5-Cl	CH ₃	O	
CH ₃	Cl	5-Cl	CH ₃ CH ₂ O	O	
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃	H	O	
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃	CH ₃	O	
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃ O	O	
CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	O	
CH ₃ (CH ₂) ₃	H	H	CH ₃ O	O	
CH ₃	H	H	CH ₃	O	
CH ₃ CH ₂	Cl	H	H	O	
CH ₃	F	H	CH ₃	O	
CH ₃	CH ₃ O	5-Cl	CH ₃	O	
CH ₃	Cl	6-Cl	CH ₃	O	
CH ₃	Cl	5-CH ₃	H	O	
CH ₃	F	H	CH ₃ O	O	
CH ₃	CH ₃ O	5-Cl	CH ₃ O	O	
CH ₃	NO ₂	H	CH ₃	O	
CH ₃	NO ₂	H	CH ₃ O	O	
CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₃	O	
CH ₃	CH ₃ SO-	H	CH ₃	O	
CH ₃	Cl	3-Cl	H	O	
(CH ₃) ₂ CHCH ₂	CH ₃ O	5-CH ₃ O	CH ₃	O	
CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	O	
CH ₃	CH ₃ O	H	Cl	O	
CH ₃	H	3-Cl	CH ₃	O	
CH ₃	H	3-F	CH ₃	O	

Taulukko V-a (jatkoa)

<u>R₁₂</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CH ₃	H	3-CH ₃	CH ₃	O	
(CH ₃) ₂ CH	H	3-Br	CH ₃ O	O	
CH ₃	SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	H	CH ₃	O	
CH ₃	F	6-F	H	O	
CH ₃	F	5-F	CH ₃	O	
CH ₃	SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CH ₃	O	
CH ₃	SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	H	H	O	
CH ₃	Cl	5-CH ₃	CH ₃	O	
CH ₃	Cl	H	CH ₃	CH ₂	
CH ₃	Cl	5-Cl	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃	Cl	3-F	CH ₃	CH ₂	
CH ₃ CH ₂	Br	5-Br	Cl	CH ₂	
CH ₃	Cl	6-Cl	CH ₃	CH ₂	
CH ₃	CH ₃ S	H	Cl	CH ₂	
CH ₃	CH ₃	5-Br	CH ₃	CH ₂	
CH ₃ CH ₂	CH ₃	5-Cl	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃	CH ₃	5-F	CH ₃	CH ₂	
CH ₃	CH ₃ O	5-Cl	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
(CH ₃) ₂ CH	H	H	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃ CH ₂	Cl	H	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃ CH ₂	Cl	5-Cl	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃ CH ₂	CH ₃ O	5-CH ₃ O	Cl	CH ₂	
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃	Cl	6-Cl	Cl	CH ₂	
CH ₃ CH ₂	Br	H	CH ₃	CH ₂	
CH ₃	CH ₃	H	Cl	CH ₂	
CH ₃	CF ₃	H	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃	NO ₂	H	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃	F	H	H	CH ₂	
CH ₃	F	6-F	Cl	CH ₂	
CH ₃ CH ₂	Cl	6-Cl	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂	
CH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂	
CH ₃	Br	H	CH ₃	CH ₂	

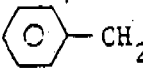
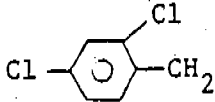
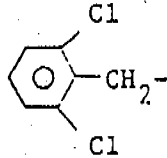
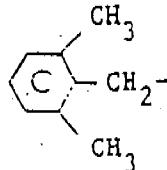
102
Taulukko V-a (jatkoa)

<u>R₁₂</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>s.p.</u>
CH ₃ CH ₂	NO ₂	H	CH ₃	CH ₂	
CH ₃ (CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	Cl	5-Cl	CH ₃ O	CH ₂	
(CH ₃) ₂ CHCH ₂	NO ₂	H	H	CH ₂	
CH ₃	CH ₃ SO ₂	5-C ₂ H ₅	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃	CH ₃ SO ₂	6-Cl	CH ₂ CH ₃ O	CH ₂	
(CH ₃) ₂ CH	Cl	H	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃ (CH ₂) ₃	Cl	H	Cl	O	
(CH ₃) ₂ CHCH ₂	Cl	H	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃ (CH ₂) ₃	Cl	H	CH ₃ O	CH ₂	
(CH ₃) ₂ CH	CH ₃ O	5-CH ₃ O	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃ CH ₂	CH ₃ O	5-CH ₃ O	CH ₃ O	O	
CH ₃ (CH ₂) ₅	Cl	H	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃ (CH ₂) ₃ CH CH ₃	CH ₃ O	5-CH ₃ O	H	O	
CH ₃ (CH ₂) ₃	CH ₃	H	CH ₃ O	O	
(CH ₃) ₂ CH	CH ₃	H	CH ₃	O	
CH ₃ (CH ₂) ₄	H	H	CH ₃	O	
(CH ₃) ₂ CH	Cl	H	CH ₃	CH ₂	
(CH ₃) ₂ CHCH ₂	Cl	H	CH ₃	CH ₂	
CH ₃ CH ₂ CH CH ₃	Cl	H	H	CH ₂	
CH ₃	Cl	H	CH ₃ O	O	
n-C ₇ H ₁₅	Cl	H	CH ₃	CH ₂	
n-C ₁₀ H ₂₁	Cl	H	Cl	O	
CH(CH ₂) ₇ CH ₃ CH ₃	Cl	H	CH ₃	O	
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	H	CH ₃	CH ₂	
CH ₃	O "CSCH ₃	H	CH ₃	O	
CH ₂ CN	O "CSC ₂ H ₅	H	CH ₃ O	O	

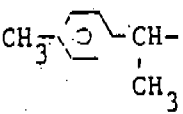
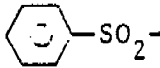
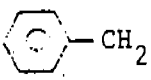
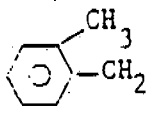
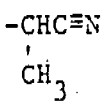
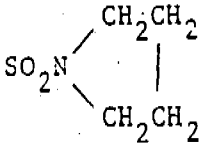
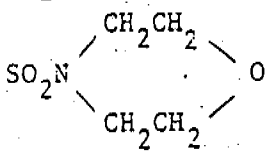
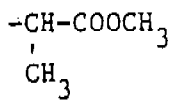
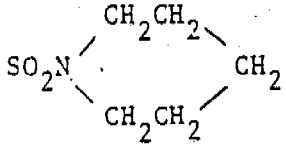
Taulukko V-a (jatkoa)

<u>R₁₂</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>s p.</u>
CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CH ₃	CH ₂	
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	CH ₃	CH ₂	
CH ₂ CO ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH ₂	
CH ₂ CO ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl	H	CH ₃	CH ₂	
CH ₂ CO ₂ n-C ₄ H ₉	Cl	H	CH ₃	CH ₂	
CHCO ₂ CH ₃ CH ₃	Cl	H	Cl	O	
CH-CO ₂ CH(CH ₃) ₂ CH ₃	F	H	CH ₃	O	
-CH ₂ CN	Cl	H	CH ₃	O	
-CH ₂ COOH	Cl	H	CH ₃	O	
-CHCOOH CH ₃	Cl	H	Cl	O	
CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	H	CH ₃	O	
CH-C ₆ H ₅ CH ₃	Cl	H	CH ₃	O	
CH ₂ -  -Cl	Cl	H	H	O	
CH ₂ -  -CH ₃	Cl	H	CH ₃	O	
CH ₂ CN	CO ₂ CH ₃	H	CH ₃	O	
-CH ₂ CH=CH ₂	CO ₂ CH ₃	H	CH ₃	O	
-CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	O	
CH ₂ CH=CH-CH ₃	Cl	H	CH ₃ O	O	
CH ₂ C=CH	CO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	O	
CH ₂ C≡CH	Cl	H	CH ₃	CH ₂	

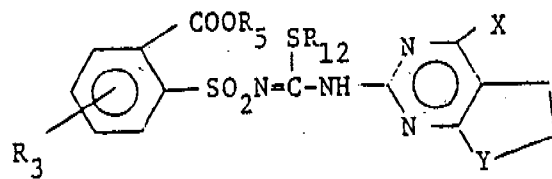
Taulukko V-a (jatkoa)

<u>R₁₂</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$	CO_2CH_3	H	CH_3	CH_2	
$-\text{CH}-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ CH_3	CO_2CH_3	H	CH_3	CH_2	
$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5$	CO_2CH_3	H	H	CH_2	
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	H	CH_3	CH_2	
$-\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ CH_3	Cl	H	CH_3	CH_2	
$-(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	Cl	H	CH_3O	O	
$-(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	Cl	H	CH_3O	O	
$n\text{-C}_{12}\text{H}_{25}$	Cl	H	Cl	O	
$-\text{CH}_2\text{CN}$	Cl	H	CH_3O	CH_2	
$-\text{CH}_2\text{COOH}$	F	H	CH_3O	CH_2	
$-\text{CHCOOH}$ CH_3	CH_3O	$5\text{-CH}_3\text{O}$	CH_3O	O	
$-\text{CH}_2\text{CN}$	CF_3	H	CH_3	CH_2	
$-\text{CH}_3$	CH_3O	$5\text{-CH}_3\text{O}$	CH_3O	O	
$-\text{CH}_2\text{CN}$	F	H	H	O	
	NO_2^-	H	CH_3	O	
	Br	5-Br	CH_3	O	
$-\text{CH}_2\text{COOH}$ CH_3	$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	H	CH_3O	O	
	Cl	5-Cl	CH_3	CH_2	
	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_5\text{SO}_2$	H	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	O	

Taulukko V-a (jatkoa)

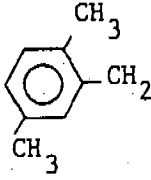
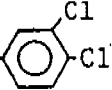
$\underline{R_{12}}$	$\underline{R_2}$	$\underline{R_3}$	$\underline{X}$	$\underline{Y}$	$\underline{sp.}$
		5-CH ₃	Cl	O	
	NO ₂	H	Cl	CH ₂	
	CH ₃	5-CH ₃	CH ₃	O	
	(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂	H	H	O	
-CH ₃	SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	CH ₃	O	
-C ₂ H ₅		H	CH ₃	O	
-CH ₃	SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CH ₃	O	
-CH(CH ₃) ₂	SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	H	CH ₃ O	O	
-CH ₂ CN		H	H	CH ₂	
		H	CH ₃	CH ₂	
-CH ₂ COOH	SO ₂ N(OCH ₃)CH ₃	H	CH ₃	CH ₂	
-CH(CH ₃) ₂	SO ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CH ₃ O	CH ₂	
-CH ₂ COOCH ₃	SO ₂ OCH ₂ CCl ₃	5-Cl	Cl	CH ₂	

Taulukko V-b



R_{12}	R_3	R_5	X	Y
CH_3	H	CH_3	CH_3	O
CH_3	H	CH_3	CH_3O	O
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_4$	H	CH_3	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	CH_2
CH_3	5-F	CH_3	H	CH_2
CH_3CH_2	5-Cl	CH_3	CH_3O	O
$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	5-Br	CH_3	CH_3	O
CH_3CH_2	5-Cl	CH_3	CH_3	O
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_3$	5- CH_3O	CH_3	CH_3	O
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_5$	5- CH_3	CH_3	CH_3	CH_2
$(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2$	5- CH_3O	CH_3	CH_3	O
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_3\overset{\text{CH}_3}{\underset{ }{\text{CH}}}$	5- CH_3	CH_3	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	CH_2
CH_3	5- CH_3O	CH_3	CH_3	O
CH_3	5-Cl	CH_2CH_3	H	CH_2
CH_3	H	$\text{CH}_3\text{CH}_2\overset{\text{CH}_3}{\underset{ }{\text{CH}}}$	H	O
$\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}$	H	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_3$	CH_3	O
$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$	H	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	CH_2
CH_3CH_2	5-F	CH_3	H	CH_2
CH_3	5- CH_3O	CH_3	CH_3O	O
CH_3	3- CH_3	CH_3CH_2	CH_3	O
$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	6-Cl	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	CH_2
CH_3	5-Br	$\text{CH}_3\text{CH}_2\overset{\text{CH}_3}{\underset{ }{\text{CH}}}$	CH_3O	CH_2
CH_3	5- C_2H_5	CH_3	CH_3O	CH_2
C_2H_5	H	CH_3	CH_3O	O
$-\text{CHCOOCH}_3$ $ $ CH_3	H	CH_3	CH_3O	O

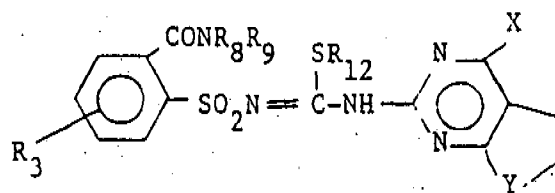
Taulukko v-b (jatkoa)

R_{12}	R_3	R_5	$\underline{X}$	$\underline{Y}$
CH_3	H	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3O	O
CH_3	H	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	O
$-\text{CH}_2\text{CN}$	H	CH_3	CH_3O	CH_2
$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$	CH_3	O
	H	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2$	H	CH_2
$-\text{CHC}=\text{N}$ $\quad $ CH_3	H		H	O
$-\text{CH}_2\text{COOH}$	H	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$	CH_3O	CH_2
$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	5-Cl	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$	CH_3O	O
$n\text{-C}_{11}\text{H}_{23}$	5-F	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{CH}-$ $\quad $ CH_3	H	O
$-\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$	6-Cl	$\text{CH}_3\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2$	CH_3O	O
$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$	5-Br	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-$	CH_3O	O
$-\text{CHCO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ $\quad $ CH_3	H	CH_3	CH_3	O
$-\text{CH}_2$ 	H	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$	H	O
$-\text{CH}_2$ 	3- CH_3O	C_2H_5	CH_3O	CH_2
CHCOOH $\quad $ CH_3	5- CH_3	$n\text{-C}_4\text{H}_9-$	CH_3O	CH_2
$\text{CH}_2\text{COOCH}_3$	H	$n\text{-C}_6\text{H}_{13}-$	CH_3	O
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	$\text{CH}_2=\text{CH}-\text{CH}_2-$	H	O
CH_3	H	CH_3	Cl	CH_2
CH_2CN	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	CH_2
CHCOOCH_3 $\quad $ CH_3	H	$-\text{CH}_2\text{CF}_3$	Cl	CH_2
$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$-\text{CHC}=\text{CH}$ $\quad \quad $ $\text{Cl} \quad \text{Cl}$	Cl	O

Taulukko v-b (jatkoa)

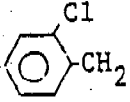
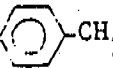
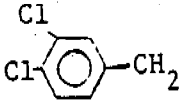
<u>R₁₂</u>	<u>R₃</u>	<u>R₅</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	5-Cl		Cl	O
$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{COOCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	CH ₃	CH ₃ O	O
$-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$	3-F	CH ₃ CH ₂	CH ₃	O
$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	6-CH ₃	CH ₃ (CH ₂) ₂	H	O
$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$	H	CH ₂ =CH(CH ₂) ₂	CH ₃ O	CH ₂
$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_3$	H	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_3\text{CH}_3 \end{array}$	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	6-Cl	$-\text{CH}_2\text{CCl}_3$	Cl	O
$\begin{array}{c} -\text{CHCN} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	$-(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	Cl	O
$-\text{C}_2\text{H}_5$	3-CH ₃	$\begin{array}{c} -\text{CHCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	CH ₂
CH ₂ COOCH(CH ₃)	5-OCH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	CH ₂
$-(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	H	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	O
$-\text{CH}_2\text{COOH}$	5-Br	C ₂ H ₅	H	O

Taulukko V-c



R_{12}	R_3	R_8	R_9	X	Y
$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}$ CH_3	H	CH_3	CH_3	CH_3O	CH_2
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_5$	H	CH_3	CH_3	CH_3O	O
$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}$ CH_3	H	CH_3	CH_3	CH_3O	CH_2
CH_3	5-Cl	CH_3CH_2	CH_3CH_2	CH_3O	O
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2$	H	CH_3O	CH_3	CH_3O	CH_2
CH_3	H	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2$	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2$	CH_3O	CH_2
CH_3	H	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	CH_3O	CH_2
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_3$	6-Cl	CH_3	H	CH_3O	O
$(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2$	H	CH_3	CH_3	CH_3O	CH_2
CH_3CH_2	H	CH_3	CH_3	CH_3O	O
$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	H	CH_3CH_2	CH_3CH_2	CH_3O	CH_2
CH_3	3- CH_3	CH_3O	CH_3	CH_3O	O
CH_3	H	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2$	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2$	H	O
CH_3	H	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	CH_2
$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	H	H	H	CH_3O	CH_2
CH_3	H	H	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	CH_3O	O
$-\text{CHCOOCH}_3$ CH_3	H	CH_3	CH_3	CH_3O	O
$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}-$ CH_3	5- CH_3	CH_3O	CH_3	H	O
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_9\text{CH}-$ CH_3	H	CH_3	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_4$	CH_3O	CH_2
CH_3 $\text{CH}(\text{CH}_2)_8-$	H	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2$	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2$	CH_3O	O
CH_3 $-\text{CH}_3$	H	CH_3	CH_3	H	O
$-\text{CH}_2\text{CN}$	H	H	CH_3	H	CH_2
$-\text{C}_2\text{H}_5$	H	CH_3	CH_3	Cl	O

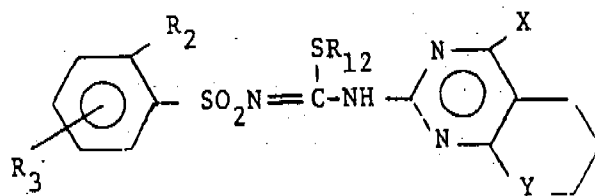
Taulukko V-c (jatkoa)

$\frac{R_{12}}{-CH_2COOH}$	$\frac{R_3}{5-Cl}$	$\frac{R_8}{H}$	$\frac{R_9}{H}$	$\frac{X}{Cl}$	$\frac{Y}{CH_2}$
$CHCO_2(CH_2)_3CH_3$ CH_3	H		$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$	CH_3CH_2O	O
	H		$-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$	CH_3CH_2O	CH_2
CH_3 -  - CH_2	5- CH_3O		$-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2-$	H	O
$-n-C_{12}H_{25}$	H	CH_3O	CH_3	CH_3	O
$-n-C_{10}H_{21}-$	6-Cl	H	H	CH_3	O
$CH_3OCH_2CH_2$	5-F	H	CH_3	CH_3O	O
$-n-C_{10}H_{21}$	H	H	$CH_2=CHCH_2$	CH_3CH_2O	CH_2
	H	H	$(CH_3)_2CH$	CH_3O	CH_2
$CH_2C\equiv N$	6- CH_3	CH_3	CH_3	CH_3O	CH_2
$CH_2CO_2CH_3$	5- CH_3	CH_3CH_2	CH_3	H	O
$CH-CO_2CH(CH_3)_2$ CH_3	H	$n-C_4H_9$	$n-C_4H_9$	H	O
CH_2COOH	H	CH_3O	CH_3	CH_3	CH_2
$CHCOOH$ CH_3	H		$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$	CH_3O	CH_2
$CHC\equiv N$ CH_3	H		$-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2-$	CH_3	O
CH_2 - 	H		$-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$	CH_3CH_2O	O
CH_2 - 	6-Cl	CH_3O	CH_3	CH_3O	O
$CH_2CH\equiv CH_2$	5- CH_3O	H	H	CH_3O	O
$CH_2CH\equiv CH$	H	H	$CH_3CH=CHCH_2$	CH_3O	CH_2
$CHCOOCH_3$ CH_3	H	CH_3O	CH_3	Cl	CH_2

Taulukko V-c (jatkoa)

R_{12}	R_3	R_8	R_9	X	Y
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	H	CH_3	Cl	CH_2
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	C_2H_5-	CH_3	Cl	O
$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	Cl	O

Taulukko V-d

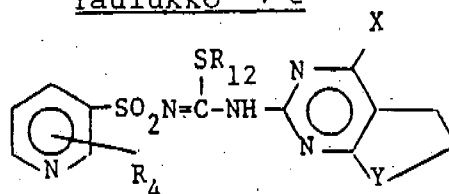


$\frac{R_{12}}$	$\frac{R_2}{SO_2N}$	$\frac{R_3}{H}$	$\frac{X}{CH_3}$	$\frac{Y}{O}$
CH_3	$SO_2N(CH_3)_2$	H	CH_3	O
$-CH(CH_3)_2$	CO_2CH_3	H	CH_3O	O
$-CHCH_2CH_3$ CH_3	$SO_2N(C_2H_5)_2$	H	CH_3	O
$-(CH_2)_4CH(CH_3)_2$	$CON(CH_3)_2$	H	H	O
$-(CH_2)_7CH_3$	$SO_2N \begin{array}{c} CH_2CH_2 \\ \diagup \quad \diagdown \\ O \end{array}$	H	CH_3	O
$-(CH_2)_9CH_3$	$SO_2N(CH_3)_2$	H	CH_3	O
$-(CH_2)_{11}CH_3$	$CON(OCH_3)CH_3$	5-Cl	C_2H_5O	O
CH_2COOH	$SO_2N(CH_3)_2$	H	CH_3	O
$CHCOOH$ CH_3	$SO_2N(OCH_3)CH_3$	H	CH_3O	O
CH_2COOCH_3	$SO_2N \begin{array}{c} CH_3 \\ \diagup \\ CH(CH_3)_2 \end{array}$	H	Cl	O
$CHCOOC_2H_5$ CH_3	$O \begin{array}{c} CH_3 \\ \diagup \\ CSCH_3 \end{array}$	H	CH_3O	O
$CH_2 \begin{array}{c} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	$CO_2CH(CH_3)_2$	H	CH_3	O
$CH_2 \begin{array}{c} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \end{array}$	$CON(C_2H_5)_2$	H	CH_3O	O
$CH_2 \begin{array}{c} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} CH_3 \end{array}$	$SO_2N(CH_3)_2$	6-OCH ₃	C_2H_5O	O
$CH_2CH=CH_2$	$SO_2N \begin{array}{c} CH_2CH_2 \\ \\ CH_2CH_2 \end{array}$	H	CH_3O	O
$-CH_2C \equiv CH$	CO_2CH_3	H	Cl	O

Taulukko V-d (jatkoa)

$\underline{R_{12}}$	$\underline{R_2}$	$\underline{R_3}$	$\underline{X}$	$\underline{Y}$
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$\text{CON} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	CH_3O	O
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	5-F	CH_3	O
$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$	$\text{SO}_2\text{N}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$	H	H	O
CH_3	CO_2CH_3	H	CH_3	CH_2
$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	H	CH_3O	CH_2
$(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	$\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	H	CH_3	CH_2
$\text{CH}(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	$\text{SO}_2\text{N} \begin{array}{l} \text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \\ \text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$	H	CH_3O	CH_2
CH_3	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	CH_3	CH_2
$(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	6- CH_3	CH_3O	CH_2
CHCOOH	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	CH_3	CH_2
CH_3	$\text{CON}(\text{OCH}_3)\text{CH}_2$	H	CH_3O	CH_2
CH_2COOH	$\text{SO}_2 \begin{array}{l} \text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array} \text{O}$	H	CH_3	CH_2
$\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$	$\text{SO}_2\text{N}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$	5-Cl	CH_3O	CH_2
CHCOOCH_3	$\text{SO}_2\text{N} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$	H	CH_3	CH_2
CH_3	$\text{CON} \begin{array}{l} \text{CH}_2\text{CH}_2 \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_2\text{CH}_2 \end{array}$	H	CH_3O	CH_2
$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$	$\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	3- CH_3	CH_3	CH_2
$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4\text{Cl}_2$	$\text{O} \parallel \text{CSCH}(\text{CH}_3)_2$	H	CH_3O	CH_2
$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_3$	$\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$	5- OCH_3	CH_3	CH_2
$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$	CONH_2	H	CH_3O	CH_2
$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CONHCH_3	H	CH_3	CH_2
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$				
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$				
$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$				

Taulukko V-e

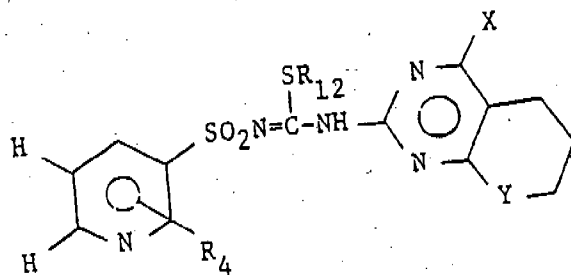


$\frac{R_{12}}{}$	$\frac{R_4}{}$	$\frac{X}{}$	$\frac{Y}{}$
CH_3	H	CH_3O	O
CH_3	2-Cl	CH_3	O
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_3$	4-F	CH_3	O
CH_3	2- CH_3	CH_3	CH_2
CH_3	4- OCH_3	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	CH_2
CH_3	2- NO_2	CH_3O	CH_2
$(\text{CH}_3)_2\text{CH}$	4- CO_2CH_3	CH_3O	CH_2
$\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}$	2- SCH_3	CH_3O	O
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_5$	4-Cl	CH_3O	CH_2
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_3\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}$	2-Br	CH_3O	O
$n\text{-C}_{17}\text{H}_{35}$	2-F	CH_3	CH_2
$n\text{-C}_{25}\text{H}_{51}$	4- C_2H_5	CH_3O	CH_2
$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_3\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}$	2- OC_2H_5	CH_3O	O
$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	4- NO_2	CH_3O	O
$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$	2- CO_2CH_3	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	CH_2
$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$	4- SC_2H_5	CH_3O	CH_2
$\text{CHC}\equiv\text{N}$ CH_3	4-Br	CH_3O	CH_2
CH_2COOH	2-F	CH_3O	O
$\text{CH}_2\text{COOCH}_3$	2- $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$	O
CH-COOCH_3 CH_3	4- OCH_3	CH_3O	O

Taulukko V-e (jatkoa)

$\frac{R_{12}}{CHCH=CH_2}$ CH ₃	$\frac{R_4}{2-(CH_2)_2CH_3}$	$\frac{X}{CH_3O}$	$\frac{Y}{CH_2}$
CH_2 - 	2-NO ₂	CH ₃ O	CH ₂
CH ₃ C≡CCH ₂	4-CO ₂ CH ₃	H	CH ₂
CH ₃ CH ₂	2-SO ₂ CH ₃	Cl	O
(CH ₃) ₂ CH	4-NO ₂	Cl	CH ₂
Cl-  -CH ₂	4-Cl	H	CH ₂
CH ₃ -  -CH ₂	2-F	H	O
Cl-  -CH ₂	4-SCH ₃	Cl	O
CH ₃ (CH ₂) ₂	4-Cl	H	CH ₂
CH ₃ O(CH ₂) ₃	2-Br	H	O
CH ₃ O(CH ₂) ₂	2-CH ₃	Cl	CH ₂
 -CH ₂	2-CO ₂ C ₂ H ₅	H	O
CH ₂ =CHCH ₂ CH ₂	2-NO ₂	Cl	O
CH(CH ₃)CN	4-F	H	CH ₂
CH(CH ₃)CO ₂ CH ₃	2-CO ₂ C ₂ H ₅	H	CH ₂
 -CH ₂ CH ₃	4-Cl	Cl	O
CH ₃ CHCH ₂ C≡CCH ₃	4-OCH ₃	H	CH ₂

Taulukko V-f (jatkoa)



<u>R₁₂</u>	<u>R₄</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>sp.</u>
CH ₃	2-Cl	CH ₃ O	O	
CH ₃ CH ₂	4-Cl	H	O	
CH ₃ (CH ₂) ₂	2-F	CH ₃	O	
CH ₃	4-Br	C ₂ H ₅ O	O	
CH ₃	2-CH ₃	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃	4-OCH ₃	CH ₃	CH ₂	
CH ₃	2-NO ₂	CH ₃ O	CH ₂	
(CH ₃) ₂ CH	4-NO ₂	CH ₃ O	O	
(CH ₃) ₂ CHCH ₂	2-CO ₂ CH ₃	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃ CH ₂ (CH ₃)CH	4-SCH ₃	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃ (CH ₂) ₅				
n-C ₁₀ H ₂₁	2-F	CH ₃	CH ₂	
-CHCOOCH ₃	4-Cl	CH ₃ O	CH ₂	
CH ₃				
-CH ₂ CH=CH ₂	2-C ₂ H ₅	Cl	O	
Cl				
CH ₂ -	2-OCH ₃	CH ₃	O	
CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	4-NO ₂	CH ₃ O	CH ₂	
CHCOOH	4-CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	O	
CH ₃				
-CH ₂ COOH	2-SC ₂ H ₅	H	O	
CH ₂ C≡N	2-SCH ₃	CH ₃ O	CH ₂	
CH-	2-Cl	CH ₃	O	
CH ₃				
CH ₃ OCH ₂ CH ₂	2-Br	C ₂ H ₅ O	O	

Koostumukset

Kaavojen I ja II mukaiset käyttökelpoiset koostumukset voidaan valmistaa tunnetuilla menetelmillä. Näihin lukeutuvat jauheet, rakeet, pillerit, suspensiot, emulsiot, kostutettavat jauheet, emulsoitavat väkevöitteet ja niiden kaltaiset. Monia näistä voidaan käyttää suoraan. Suihkutettavat koostumukset voidaan sekoittaa sopivaan väliaineeseen ja käyttää hehtaaria kohden suihkutustilavuuksina muutamasta litrasta useisiin satoihin litroihin. Yleisesti koostumukset sisältävät noin 0,1-99 paino-% aktiivista aineosaa ja vähintään a) noin 0,1-20 % pinta-aktiivisia aineita ja b) noin 1-99,9 % nestemäistä tai kiinteää liuotinta. Erityisemmin ne sisältävät nämä aineosat noin taulukossa VI esitettyinä osuuksina.

Taulukko VI

	Aktiivinen aineosa	Paino-% *	
		Ohennin	Pinta-aktiivinen aine
Kostutettavat jauheet	20-90	0,74	1-10
Öljy suspensiot, liuokset, emulsiot, (mukaanlukien emulsoitavat väkevöitteet)	3-50	40-95	0-15
Vesipitoiset suspensiot	10-50	40-84	1-20
Hienot jauheet	1-25	70-99	0-5
Rakeet ja pillerit	0,1-95	5-99,9	0-15

* Aktiivisen aineosan lisäksi vähintään yksi pinta-aktiivinen aine tai ohennin vastaa 100 paino-%.

Tietenkin aktiivista aineosaa voi olla läsnä enemmän tai vähemmän riippuen aiotusta käytöstä ja yhdisteen fysikaalisista ominaisuuksista. Suurempi pinta-aktiivinen aine/aktiivinen aineosa suhde on joskus toivottavaa, ja se saavutetaan lisäämällä koostumukseen tai sekoittamalla säiliössä.

Joitakin tyypillisiä kiinteitä ohentimia on kuvannut Watkins, et al., "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2. painos, Dorland Books, Caldwell, New Jersey, mutta

muista kiinteitä aineita, joko louhittuja tai valmistettuja, voidaan käyttää. Absorboivammat liuottimet ovat edullisia kostutettavia jauheita varten ja tiheämmät hienoja jauheita varten. Tyypillisiä nestemäisiä ohentimia ja liuottimia on esittänyt Marsden, "Solvents Guide", 2. painos, Interscience, New York, 1950. Alle 0,1 %:n liukoisuus on edullinen suspensioväkevöitteille, liuosväkevöitteet ovat edullisesti stabiileja faasierottelulle 0°C:ssa.

"McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", Mc Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, samoinkuin Sisely ja Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chemical Publishing Co., Inc., New York, 1964 luetteloivat pinta-aktiiviset aineet ja niiden suositellut käytöt. Kaikki koostumukset voivat sisältää vähäisiä määriä lisäaineita vaahtoamisen, kokkaroitumisen, korroosion, mikrobiologisen kasvun, jne. vähentämiseksi.

Menetelmät sellaisten koostumusten valmistamiseksi ovat hyvin tunnettuja. Liuokset valmistetaan yksinkertaisesti sekoittamalla ainesosat. Hienot kiinteät koostumukset valmistetaan sekoittamalla ja usein jauhamalla vasara- tai neste-energiamylyssä. Suspensiot valmistetaan märkäjauhamalla (katso esimerkiksi Littler, U.S. patentti 3 060 084). Rakeet ja pillerit voidaan valmistaa suihkuttamalla aktiivinen aine tabletoidulle raekantoaineelle tai agglomeraatiomenetelmillä. Katso J. E. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, jouluk. 4, 1967, s. 147 ja "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 4. painos, McGraw-Hill, New York, 1963, s. 8-59.

Lisäinformaatiota koskien formulointitapaa ovat esittäneet:

H. M. Loux, U.S. Patent 3 235 361, kappale 6, riviltä 16 mukaanlukien kappale 7, rivi 19 ja esimerkit 10 - 41.

R. W. Luckenbaught, U.S. patentti 3 309 192, kappale 5, riviltä 43 mukaanlukien kappale 7, rivi 62 ja esimerkit 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167, 169-182.

H. Gysin ja E. Knusli, U.S. patentti 2 891 855, kappale 3, riviltä mukaanlukien kappale 5, rivi 17 ja esimerkit 1-4.

G. C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley & Sons, Inc., New York, 1961, s. 81-96.

J. D. Fryer ja S. A. Evans, "Weed Control Handbook", 5. painos, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, s. 101-103.

Edellä lainattujen viittauksien selostukseen viitataan tässä yhteydessä.

Ellei toisin esitetä, ovat seuraavissa esimerkeissä kaikki osuudet paino-osia.

Esimerkki 14

Kostutettavat jauheet

N-[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli]-2-nitrobentseenisulfonamidia		40 %
dioktyliinatriumsulfosukkinaattia		1,5 %
natriumligniinisulfonaattia		3 %
matalaa viskoottista metyyliiselluloosaa		1,5 %
attapulgiitti		54 %

Ainesosat sekoitetaan läpikotaisin, viedään läpi ilmamyllyn, jotta saataisiin keskimäinen partikkelikoko alle 15 mikronia, sekoitetaan uudelleen ja sihdataan läpi U.S.S. no 50 seulan (0,3 mm:n aukko) ennen pakkaamista.

Esimerkki 15

Rakeet

Esimerkin 14 mukaista kostutettavaa jauhetta	10 %
attapulgiittia rakeita	90 %
(U.S.S. # 20-40; 0,84-0,42 mm)	

Kostutettavan jauheen liete, jossa on 25 % kiinteitä aineita, sulikutetaan attapulgiittirakeiden pinnalle kaksoiskartiokoittimessa. Rakeet kuivataan ja pakataan.

Esimerkki 16

Kostutettavat jauheet

N-[(6,7-dihydro-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli]-2-nitrobentseenisulfonamidia		80 %
natriumalkyyli-naftaleenisulfonaattia		2 %
natriumligniinisulfonaattia		2 %
synteettistä amorfista piidioksidia		3 %
kaolinittia		13 %

Aineosat sekoitetaan ja jauhetaan vasaramyllyssä, jotta saataisiin keskimääräinen partikkelikoko alle 100 mikronia. Aine sekoitetaan uudelleen, sihdataan läpi U.S.S. no. 50 seulan ja pakataan.

Esimerkki 17Rakeet

esimerkin 16 mukaista kostutettavaa jauhetta	15 %
kipsiä	69 %
kalium-sulfaattia	16 %

Ainesosat sekoitetaan pyörösekoittimessa ja rakeistumisen saavuttamiseksi suihkutetaan vettä. Kun ensin osa aineesta on saavuttanut halutun välin 1,0-0,42 mm (U.S.S. no. 18-40 seulat), rakeet poistetaan, kuivataan ja seulotaan. Ylikokoinen aine murskaataan, jotta saataisiin lisää ainetta halutulle välille. Nämä rakeet sisältävät 12 % aktiivista ainesosaa.

Esimerkki 18Kostutettavat jauheet

N-[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli]-2-(metoksikarbonyyli)bentseenisulfonamidia	65 %
dodesyyliifenolipolyetyleni glykolieetteriä	2 %
natriumligniinisulfonaattia	4 %
natriumsilikoaluminaattia	6 %
montmorillonittiä (kalsinoitu)	23 %

Aineosat sekoitetaan läpikotaisin. Nestemäinen pinta-aktiivinen aine lisätään suihkuttamalla kiinteille ainesosille sekoittimessa. Sen jälkeen, kun jauhaminen vasaramyllyssä oleellisesti kaikkien partikkelien saamiseksi alle 100 mikronia on suoritettu, aine sekoitetaan uudelleen, sihdataan läpi U.S.S. no. 50 seulan (0,3 mm:n aukko) ja pakataan.

Esimerkki 19Suuri-lujuiset väkevöitteet

N-[(6,7-dihydro-4-metoksi-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli]-2-nitrobentseenisulfonamidia	98,5 %
piidioksidi-aerogeeliä	0,5 %
synteettistä amorfista hienopiidioksidia	1,0 %

Aineosat sekoitetaan ja jauhetaan vasaramyllyssä, jotta saataisiin suuri-lujuinen väkevöite, jonka kaikki partikkelit oleellisesti läpäisevät U.S.S. no. 50 seulan (0,3 mm aukot). Tämä aine voidaan sen jälkeen formuloida lukuisilla eri tavoilla.

Esimerkki 20Vesipitoinen suspensio

N-[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli]-2-(metoksykarbonyyli)bentseenisulfonamidia	25 %
hydratoitua attapulgiittia	3 %
raakaa kalsiumlignisulfonaattia	10 %
natriumvetyfosfaattia	0,5 %
vettä	61,5 %

Aineosat jauhetaan kaikki kuula- tai valssimyllyssä kunnes kiinteät partikkelit ovat pienentyneet halkaisijaltaan alle 10 mikronia.

Esimerkki 21Öljysuspensio

N-[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli]-2-nitrobentseenisulfonamidia	25 %
polyoksietyleenisorbitoliheksaoleaattia	5 %
hyvin alifaattista hiilivetyöljyä	70 %

Aineosat jauhetaan yhdessä hiekkamyllyssä, kunnes kiinteät partikkelit ovat pienentyneet alle n. 5 mikronia. Saatua suspensiota voidaan käyttää suoraan, mutta edullisesti sen jälkeen kun sen on sekoitettu öljyihin tai emulsoitu vedessä.

Esimerkki 22Puristetut pillerit

N-[(6,7-dihydro-4-metyyli-5H-syklopentapyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli]-2-(metoksykarbonyyli)bentseenisulfonamidia	25 %
vedetöntä natriumsulfaattia	10 %
raakaa kalsiumlignisulfonaattia	5 %
kalsium/magnesiumbentoniittia	59 %

Aineosat sekoitetaan, jauhetaan vasaramyllyssä ja sen jälkeen kostutetaan noin 12 % vettä. Seos puristetaan sylintereiksi, joilla on noin 3 mm:n halkaisija, jotka leikataan noin 3 mm pitkiksi pillereiksi. Näitä voidaan käyttää suoraan kuivaamisen jälkeen tai kuivatut pillerit voidaan murskata, jotta ne läpäisisivät U.S.A. no. 20 seulan (0,84 mm:n aukot). Rakeet, jotka jäävät U.S.S.

no. 40 seulalle (0,42 mm:n aukot) voidaan pakata käytettäväksi ja keinot käsitellä uudelleen.

Käyttökelpoisuus

Esillä olevan keksinnön mukaiset yhdisteet ovat voimakkaita herbisidejä. Niiden käyttökelpoisuus ulottuu laajalle alueelle ennen kohoamista ja/tai kohoamisen jälkeen rikkaruohon torjunnassa alueilla, joissa halutaan täydellistä kaiken kasvillisuuden torjuntaa, kuten polttoainevarastosäiliöiden, ammusvarastojen, teollisuuden varastoalueiden, pysäköintipaikkojen, drive-in-teatterien, ilmoitustaulujen, valtateiden ja rautateiden rakennelmien ympäriltä. Vaihtoehtoisesti esillä olevat yhdisteet ovat käyttökelpoisia selektiivisinä ennen kohoamista ja kohoamisen jälkeen vaikuttavina rikkaruohon torjunnassa viljelystuotteilla, kuten vehnällä ja soijapavulla.

Keksinnön mukaisten yhdisteiden annosmäärät määräytyvät lukuisista tekijöistä, mukaanlukien niiden käyttö selektiivisinä tai yleisinä herbisideinä, kyseiset viljelyslajikkeet, torjuttavat rikkaruohotyypit, sää ja ilmasto, valitut koostumukset, levitystapa, läsnä olevan lehdistön määrä, jne. Yleisesti esillä olevia yhdisteitä tulisi levittää määrinä 0,02-10 kg/ha, alempien määrien ollessa ehdotettuna käytettäväksi kevyemmille ja/tai sellaiselle maaperälle, jossa on alhainen pitoisuus orgaanista ainetta, selektiivisessä rikkaruohon torjunnassa tai tilanteissa, joissa vaaditaan vain lyhytaikaista kestävyyttä.

Keksinnön mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää yhdessä minkä tahansa muun kaupallisen herbisidin kanssa, joista esimerkkeinä ovat triatsiini-, triatsoli-, urasiili-, urea-, amidi-, difenyyli-eetteri-, karbamaatti- ja bipyridylium-tyypit.

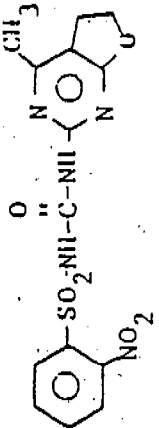
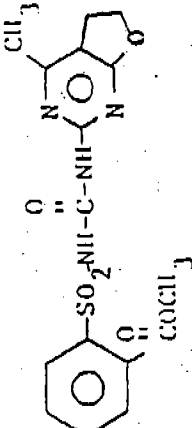
Esillä olevien yhdisteiden herbisidiset ominaisuudet havaittiin lukuisissa kasvihuonekokeissa. Jäljessä seuraavat koemenettelyt ja tulokset.

Koe A

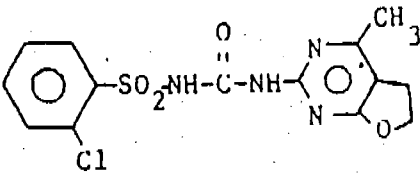
Verihirssin (*Digitaria* spp.), tallinpiharuohon (*Echinochloa crusgalli*), villikauran (*Avena fatua*), kanelipuun (*Cassia tora*), päivänsinen (*Ipomoea* spp.), sappiruohon (*Xanthium* spp.), durran, maissin, soijapavun, riisin ja vehnän siemeniä sekä pähkinäsaran juurimukuloita istutettiin kasvuväliaineeseen ja käsiteltiin ennen

kohoamista kemikaaleilla, jotka oli liuotettu kasveille myrkyttömään liuottimeen. Samanaikaisesti suihkutettiin puuvilla, jossa oli viisi lehteä (mukaanlukien sirkkalehdet), pensaspapu, jolla oli kolmas kolmielehtinen lehti avautumassa, verihirssi, tallinpiharuoho ja villikaura, joissa oli kaksi lehteä, päivänsini ja sappiruoho, joissa oli neljä lehteä (mukaanlukien sirkkalehdet), neljälehtinen durra ja maissi, soiwapapu, jossa oli kaksi sirkkalehteä, riisi, jossa oli kolme lehteä, yksielehtinen vehnä ja pähkinäsara, jolla oli 3-5 lehteä. Käsitellyt kasvit ja kontrollikasvit säilytettiin kasvihuoneessa 16 päivää, minkä jälkeen kaikkia lajeja verrattiin kontrollikasveihin ja visuaalisesti arvioitiin käsittelyn vaikutusta. Arviot perustuvat numeroskaalaan 0 = ei vauriota - 10 = täydellinen kuolema. Liittyvillä kuvaavilla symboleilla on seuraavat merkitykset G = kasvun hidastuminen, C = viherkato/kuolio, D = lehdenlähtö, S = valkomuunteisuus, 6Y = irronneita nappuja tai kukkia, U = epätavallinen pigmentoituminen, E = kohoamisen esto ja H = johdannaisvaikutuksia. Tällä menettelyllä testattujen yhdisteiden arviot on esitetty taulukossa A. On nähtävissä, että tietyt testatut yhdisteet ovat käyttökelpoisia selektiivisinä ennen kohoamista vaikuttavina rikkaruohon torjujina vehnällä ja soiwapavulla.

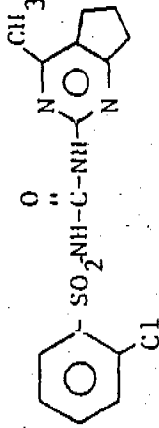
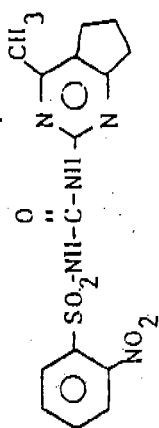
Taulukko A

		
kg/ha	0.4	0.4
kohoamisen jälk.		
pensasapu	9C	9C
puuvilla	9G, 6C	10C
päivänsini	10C	10C
sappiruoho	9C	9C
kanelipuu	9C	9C
pähkinäsara	10C	2C, 8G
verihirssi	9C	5C, 8G
tallinpiharuoho	10C	9C
villikaura	9G, 5C	9C
vehnä	8G, 2C	9C
maissi	9H, 5U	9C
soijapapu	9C	9C
riisi	9C	6C, 9G
durra	9H, 2U	9C
ennen kohoamista		
päivänsini	9G	9G
sappiruoho	9G	9G
kanelipuu	9G	9G
pähkinäsara	10E	10E
verihirssi	9G, 5C	10E
tallinpiharuoho	9H	10H
villikaura	9G, 2C	5C, 9H
vehnä	9H	9H
maissi	9G	10H
soijapapu	9H	9H
riisi	10E	10E
durra	9G, 1C	9H

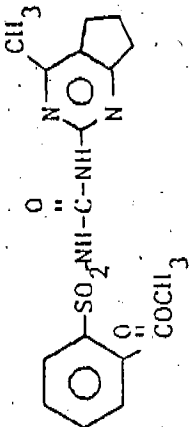
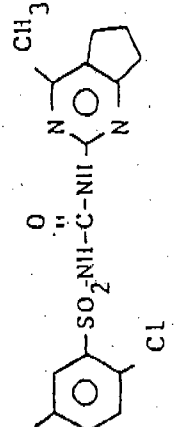
Taulukko A (jatkoa)

		
kg/ha	2	0.4
kohoamisen jälk.		
pensasapu	9C	9C
puuvilla	9C	6C, 9G
päivänsini	10C	8C
sappiruoho	9C	9C
kanelipuu	9C	9C
pähkinäsara	8C	5C, 9G
verihirssi	9C	9C
tallinpiharuoho	9C	6C, 9G
villikaura	9C	3C, 7G
vehnä	8C	3C, 8G
maissi	9U, 9G	9C
soijapapu	9C	6C, 9G
riisi	5C, 8G	5C, 9G
durra	5U, 9G	9G
ennen kohoamista		
päivänsini	9G	9G
sappiruoho	9G	9G
kanelipuu	9G	9G
pähkinäsara	10E	10E
verihirssi	1C, 9G	2C, 9G
tallinpiharuoho	9H	5C, 9H
villikaura	1C, 8G	1C, 9G
vehnä	9H	9H
maissi	9G	1C, 9G
soijapapu	9H	9H
riisi	10E	10E
durra	5C, 9H	1C, 9G

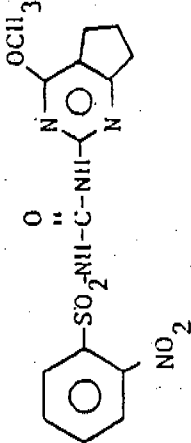
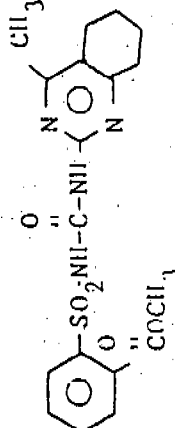
Taulukko A (jatkoa)

			
kg/ha	2	0.4	0.4
kohoamisen jälk.			
pensasapu	9D, 9G	5C, 7G, 6Y	6C, 8G, 6Y
puuvilla	3C, 5G	1C, 2G	3C, 5G
päivänsini	3C, 9G	1C, 8G	10C
sappiruoho	5C, 9G	2C, 7G	9C
kanelipuu	3C	1H	1C, 8G
pähkinäsara	4G	2C	5C, 9G
verihirssi	2C, 6G	2C	3C, 8G
tallinpiharuoho	2C	2C	3C, 8H
villikaura	1C	0	2C
vehnä	2C	0	1C, 6G
maissi	1C, 5H	6H	2C, 9H
soijapapu	6H	8H	3H, 9G
riisi	8G	5G	5C, 9G
durra	8H	6H	7H
ennen kohoamista			
päivänsini	9G	9G	9G
sappiruoho	9G	9G	9G
kanelipuu	8G	1C, 7G	7G
pähkinäsara	9G	8G	9G
verihirssi	3G	2G	4G
tallinpiharuoho	9H	7G	9H
villikaura	2G	0	6G
vehnä	5G	0	3G
maissi	2C, 8G	1C, 6G	2C, 9G
soijapapu	3H	2H	5H
riisi	9H	9H	9H
durra	8H	1C, 8H	2C, 9G

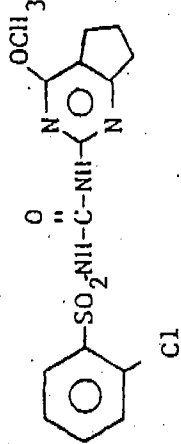
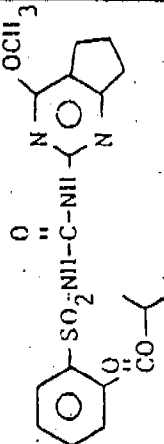
Taulukko A (jatkoa)

				
kg/ha	2	0.4	2	0.4
kohoamisen jälk.				
pensasapu	9C	9C	1C	0
puuvilla	8C, 9G	9C, 9G	0	0
päivänsini	10C	10C	1C	2C
sappiruoho	10C	10C	0	0
kanelipuu	5C, 8G	5C, 8G	0	0
pähkinäsara	9C	10C	0	0
verihirssi	9C	9C	0	0
tallinpiharuoho	10C	10C	0	0
villikaura	5C, 8G	5C, 9G	0	0
vehnä	5U, 8G	5U, 8G	0	0
maissi	9C	10C	0	0
soijapapu	9C	9C	0	0
riisi	9C	9C	0	0
durra	9C	9C	0	0
ennen kohoamista				
päivänsini	9C	9G	9G	5G
sappiruoho	9G	9G	9G	4G
kanelipuu	9G	9G	2H	0
pähkinäsara	10E	10E	0	0
verihirssi	9H	9H	0	0
tallinpiharuoho	10H	10H	0	0
villikaura	2C, 8G	2C, 9G	0	0
vehnä	10H	10E	0	0
maissi	10E	10E	0	0
soijapapu	10E	9H	0	0
riisi	10E	10E	3G	0
durra	10H	10H	2G	0

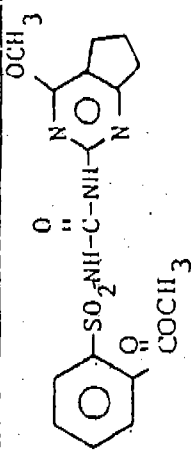
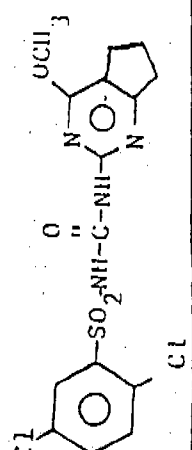
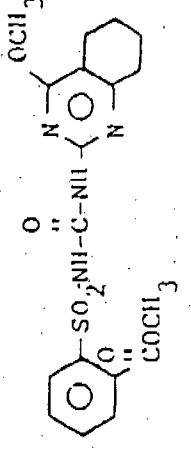
Taulukko A (jatkoa)

			
kg/ha	2	0.4	2
kohoamisen jälk.			
pensasapu	5C, 9G	5C, 9G	9D, 9G
puuvilla	2C, 2H, 4G	2C, 2H	5C, 6G
päivänsini	10C	5C, 9G	5C, 7G
sappiruoho	2C, 9G	1C	1C
kanelipuu	5C, 7G	5C, 9G	4H
pähkinäsara	0	0	2C, 7G
verihirssi	3C, 7G	2C, 7G	1C, 5G
tallinpiharuoho	9C	3C, 7H	2C, 9H
villikaura	2C, 6G	3G	2C, 7G
vehnä	1C, 6G	2G	9H
maissi	2C, 9H	1C, 4H	9H
soijapapu	1C, 9H	6H	5H, 9G
riisi	5C, 9G	5C, 9G	4C, 9G
durra	3H, 9G	1C, 6G	2C, 9G
ennen kohoamista			
päivänsini	9G	9G	9G
sappiruoho	9G	8G	9G
kanelipuu	10E	9G	7G
pähkinäsara	9G	6G	9G
verihirssi	2C, 9G	7G	4G
tallinpiharuoho	9H	9H	9H
villikaura	2C, 8H	8G	7G
vehnä	9G	8G	9G
maissi	2C, 9G	2C, 9G	9G
soijapapu	9H	8H	4H
riisi	10E	9H	10E
durra	9H	9G	9H

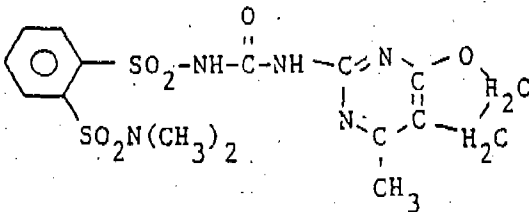
Taulukko A (jatkoa)

			
kg/ha	2	0.4	0.4
kohoamisen jälk.			
pensaspapu	2C	1C, 1H	9C
puuvilla	1C	0	2C, 6G
päivänsini	1C	0	5C, 9G
sappiruoho	0	0	2C
kanelipuu	1C	0	3C
pähkinäsara	0	0	2G
verihirssi	0	0	1C
tallinpiharuoho	2H	0	2C, 7G
villikaura	0	0	1C
vehnä	0	0	1C
maissi	6H	0	1C, 6G
soijapapu	6H	0	3C, 8G
riisi	5G	0	7G
durra	5G	0	1C, 6G
ennen kohoamista			
päivänsini	4G	9G	8G
sappiruoho	2G	8G	8G
kanelipuu	6G	5G	2G
pähkinäsara	5G	0	8G
verihirssi	0	3G	0
tallinpiharuoho	2C, 5G	5G	1C, 9G
villikaura	1C	0	1G
vehnä	1C	0	1G
maissi	3G	3G	1C, 5G
soijapapu	0	0	1H
riisi	8H	7G	8H
durra	2G	4G	2C, 8G

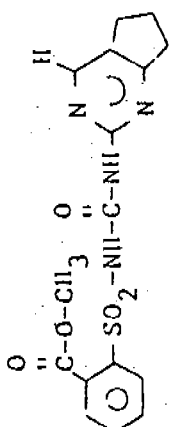
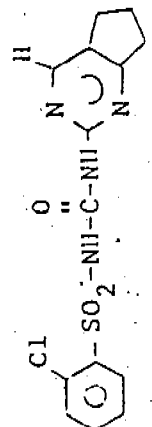
Taulukko A (jatkoa)

			
kg/ha	0.4	0.4	0.4
kohoamisen jälk.			
pensasapu	9C	3C, 5G, 6Y	8C
puuvilla	2C, 6G	1C	2C
päivänsini	9C	3G	5C, 8G
sappiruoho	1C, 3H	1C	2C
kanelipuu	2C, 7G	-	1C
pähkinäsara	2G	0	2G
verihirssi	2C, 7G	0	0
tallinpiharuoho	5C, 9H	0	3C, 5G
villikaura	1C, 8G	0	1C
vehnä	2C, 7G	0	0
maissi	2C, 9G	0	1C, 3G
soijapapu	5C, 9G	0	1C
riisi	3C, 8G	0	1C, 3G
durra	2C, 9G	0	2C, 7G
ennen kohoamista			
päivänsini	9G	3G	8G
sappiruoho	9G	0	8G
kanelipuu	9G	0	0
pähkinäsara	9G	0	0
verihirssi	3C, 8G	0	1C
tallinpiharuoho	9H	0	2C, 8H
villikaura	2C, 8G	0	2G
vehnä	9H	0	2G
maissi	2C, 9G	0	1C, 3G
soijapapu	8H	0	0
riisi	10E	0	1C, 7G
durra	1C	1C	1C, 8G

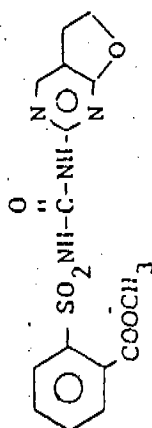
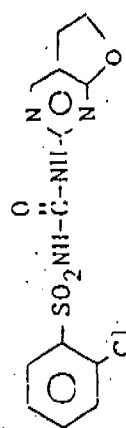
Taulukko A (jatkoa)

	
kg/ha	1/10
kohoamisen jälk.	
pensasapu	9D, 9G, 6Y
puuvilla	5C, 9G
päivänsini	9C
sappiruoho	3C, 9G
kanelipuu	3C, 9G
pähkinäsara	1C, 7G
verihirssi	9C
tallinpiharuoho	10C
villikaura	9C
vehnä	1C, 7G
maissi	9C
soijapapu	9C
riisi	9C
durra	10C
ennen kohoamista	
päivänsini	9G
sappiruoho	9G
kanelipuu	1C, 9G
pähkinäsara	10E
verihirssi	1C, 9G
tallinpiharuoho	2C, 9H
villikaura	2C, 9G
vehnä	9G
maissi	1C, 9G
soijapapu	9H
riisi	10E
durra	9H

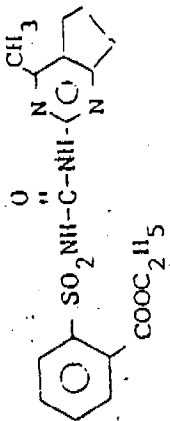
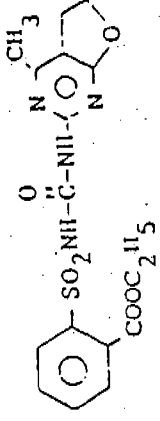
Taulukko A (jatkoa)

				
kg/ha	2	0.4	2	0.4
kohoamisen jälk.				
pensasapu	5C, 9G, 6Y	6C, 9G, 6Y	2H, 6F	0
puuvilla	3C, 9G	2C, 2H, 8G	1H	0
päivänsini	10C	2C, 5G	2H	1H
sappiruoho	1C, 8G	2C	1C	0
kanelipuu	2C, 5G	3C	0	0
pähkinäsara	1C, 9G	7G	0	0
verihirssi	1C, 7G	2G	0	0
tallinpiharuoho	9C	3C, 9H	0	0
villikaura	1C, 7G	3C, 5G	0	0
vehnä	4C, 8G	2C, 4G	0	0
maissi	5C, 9G	2C, 7H	0	0
soijapapu	3C, 9G	2C, 8G	4H	2H
riisi	3C, 9G	5C, 9G	-	0
durra	2C, 9G	9G	0	0
ennen kohoamista				
päivänsini	9G	9G	7G	5G
sappiruoho	9G	-	8G	5G
kanelipuu	1C, 9G	8G	5H	0
pähkinäsara	10E	9G	0	0
verihirssi	4G	0	0	0
tallinpiharuoho	2C, 9H	2C, 9H	2C	0
villikaura	2C, 9G	8G	0	0
vehnä	9G	5G	0	0
maissi	3U, 9G	1C, 9G	2C	0
soijapapu	9H	2C, 8H	1C, 5H	0
riisi	10E	10E	2G	0
durra	10H	2C, 9H	0	0

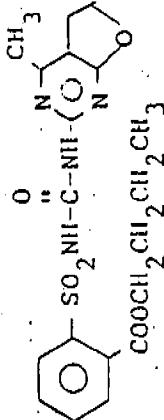
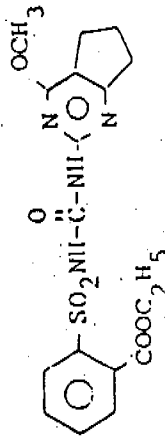
Taulukko A (jatkoa)

			
kg/ha	0.4	2	0.4
kohoamisen jälk.			
pensasapu	7C 9G	6C 9G 6Y	6C 8G 6Y
puuvilla	6C 9G	9C	5C 9G
päivänsini	5C 9G	10C	10C
sappiruoho	9C	10C	9C
kanelipuu	5C 7G	9C	3C 6G
pähkinäsara	1C 8G	1C 9G	3G
verihirssi	9C	9C	2C 8G
tallinpiharuoho	9C	9C	9C
villikaura	9C	1C 3G	0
vehnä	9C	2C 7G	1C 5G
maissi	3U 9G	2C 9G	2C 7H
soijapapu	10C	6C 9G	3C 8G
riisi	9C	7G	2C 7G
durra	9C	2C 9G	1C 7H
ennen kohoamista			
päivänsini	9G	9G	9G
sappiruoho	9G	9H	9H
kanelipuu	9G	9G	7G
pähkinäsara	10E	10E	9G
verihirssi	1C 9G	1C 8G	2G
tallinpiharuoho	5C 9H	9H	1C 9H
villikaura	4C 9H	6G	5G
vehnä	2C 9H	8H	6G
maissi	9G	1C 9G	1C 9G
soijapapu	9H	9H	2G 7H
riisi	10E	10E	9H
durra	9H	1C 9G	9G

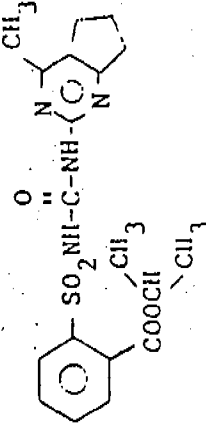
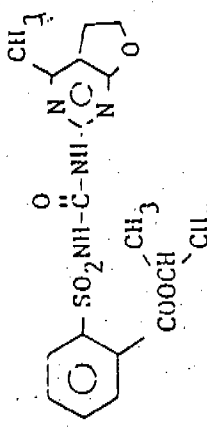
Taulukko A (jatkoa)

		
kg/ha	0.4	0.4
kohoamisen jälk.		
pensasapu	9D 9G 6Y	7C 9G
puuvilla	9C	9C
päivänsini	10C	10C
sappiruoho	3C 9G	9C
kanelipuu	5C 9G	9C
pähkinäsara	1C 8G	4C 9G
verihirssi	3C 6G	4C 9G
tallinpiharuoho	5E 9H	10C
villikaura	2C 8H	5C 9G
vehnä	3C 7G	4C 9G
maissi	8U 9G	9C
soijapapu	3C 9G	9C
riisi	6C 9G	5C 9G
durra	3C 9G	10C
ennen kohoamista		
päivänsini	9G	9G
sappiruoho	9H	9H
kanelipuu	9G	9G
pähkinäsara	10E	10E
verihirssi	2C 9G	5C 9G
tallinpiharuoho	3C 9H	9H
villikaura	2C 9H	9H
vehnä	1C 9C	10E
maissi	9G	10E
soijapapu	8H	9H
riisi	10E	10E
durra	3C	10E

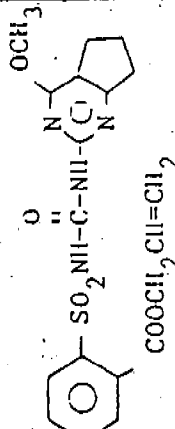
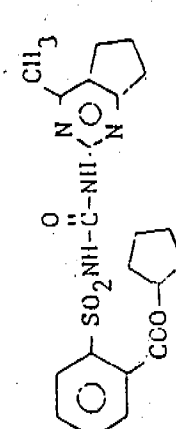
Taulukko A (jatkoa)

		
kg/ha	0.4	0.4
kohoamisen jälk.		
pensasapu	3C 9G 6Y	6C 9G 6Y
puuvilla	4C 9G	3C 3H 9G
päivänsini	10C	10C
sappiruoho	3C 9G	1C 4G
kanelipuu	3C 5G	2C 6G
pähkinäsara	2G	5G
verihirssi	2G	5C 9G
tallinpiharuoho	3C 9H	5C 9H
villikaura	8G	1C 5G
vehnä	6G 5X	1C 5G
maissi	2C 9H	4C 9G
soijapapu	3C 9G	2C 8G 5X
riisi	5C 9G	7C
durra	5C 9G	2C 9G
ennen kohoamista		
päivänsini	9G	9G
sappiruoho	9H	9H
kanelipuu	1C 8G	2C 9G
pähkinäsara	7G	1C 9G
verihirssi	1C 6G	1C 5G
tallinpiharuoho	9H	9H
villikaura	-	1C 7G
vehnä	1C 8G	9G
maissi	1C 9G	2U 9G
soijapapu	1C 4H	1C 4H
riisi	9H	9H
durra	4C	1C 9G

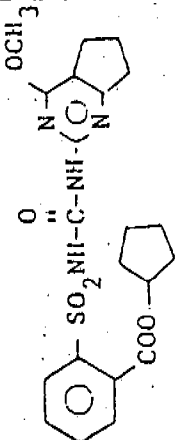
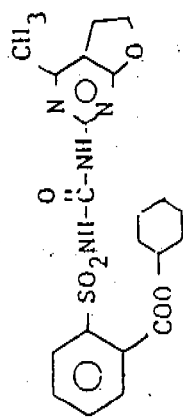
Taulukko A (jatkoa)

		
kg/ha	0.4	0.4
kohoamisen jälk		
pensasapu	5C, 9G	3S, 9G, 6Y
puuvilla	5C, 9G	2C, 7G
päivänsini	9C	2C, 9G
sappiruoho	5C, 9G	1C, 6G
kanelipuu	3C	2C, 5G
pähkinäsara	0	0
verihirssi	1C, 5G	2G
tallinpiharuoho	3C, 9H	2C, 5H
villikaura	4G	0
vehnä	0	0
maissi	8H	1C, 8G
soijapapu	2C, 9G	1C, 6G
riisi	9C	1C, 3G
durra	9H	1C, 7H
ennen kohoamista		
päivänsini	9G	9G
sappiruoho	9G	8G
kanelipuu	9G	9G
pähkinäsara	9G	5G
verihirssi	2G	1C, 5G
tallinpiharuoho	2C, 9H	2C, 9H
villikaura	1C, 6G	5G
vehnä	3G	0
maissi	9H	1C, 6G
soijapapu	1H, 3G	2C
riisi	9H	1C, 8H
durra	9H	1C, 9G

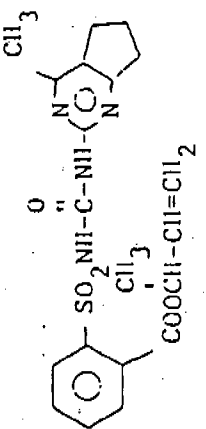
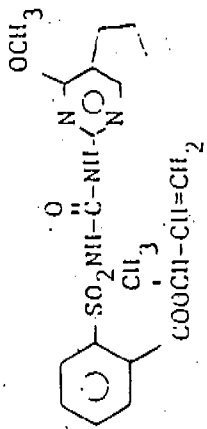
Taulukko A (jatkoa)

		
kg/ha	0.4	0.4
kohoamisen jälk.		
pensasapu	3S, 9G, 6Y	4S, 7G, 6Y
puuvilla	2C, 2H, 8G	3C, 5G
päivänsini	3C, 9H	9C
sappiruoho	3C, 9G	1C, 3H
kanelipuu	3C, 4H	1C
pähkinäsara	1C, 4G	0
verihirssi	0	0
tallinpiharuoho	4H	1C, 5H
villikaura	0	0
vehnä	0	0
maissi	2C, 9H	2C, 7G
soijapapu	2H, 8G	2C, 8G
riisi	1C	1C, 7G
durra	2C, 9H	2C, 9G
ennen kohoamista		
päivänsini	9G	10E
sappiruoho	9H	8G
kanelipuu	8G	8G
pähkinäsara	7G	3G
verihirssi	1C	0
tallinpiharuoho	1C, 5G	2C, 8G
villikaura	3G	2G
vehnä	0	2G
maissi	1C, 6G	2C, 7G
soijapapu	3G	1C, 2H
riisi	1C, 6G	9H
durra	1C, 8G	1C, 9G

Taulukko A (jatkoa)

		
kg/ha	0.4	0.4
kohoamisen jälk.		
pensasapu	2C, 6G	5C, 8G, 6Y
puuvilla	1C, 3G	3C, 2H
päivänsini	1C	10C
sappiruoho	1C	2C, 9H
kanelipuu	0	2C, 9G
pähkinäsara	0	2G
verihirssi	1C, 3G	2C, 4G
tallinpiharuoho	1C, 4G	2C, 8H
villikaura	0	1C, 2G
vehnä	0	1C, 6G
maissi	1C, 3H	2C, 9H
soijapapu	4H	3C, 6G
riisi	2C, 7G	1C, 9G
durra	2C, 7G	2C, 9H
ennen kohoamista		
päivänsini	10E	9G
sappiruoho	9G	9H
kanelipuu	5G	8G
pähkinäsara	4G	4G
verihirssi	0	3G
tallinpiharuoho	2C, 5G	1C, 9H
villikaura	0	1C, 7G
vehnä	3G	1C, 8G
maissi	1C, 7G	1U, 9G
soijapapu	2C	1C, 1H
riisi	9H	9H
durra	1C, 9G	9H

Taulukko A (jatkoa)

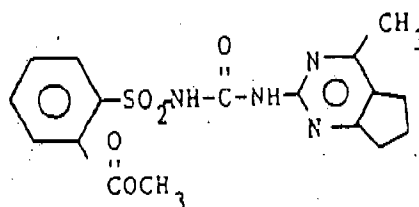
		
kg/ha	0.4	0.4
kohoamisen jälk.		
pensasapu	9D, 9G, 6Y	3C, 7G, 6Y
puuvilla	3C, 3H, 9G	3B
päivänsini	10C	1C, 9G
sappiruoho	3C, 8G	2H
kanelipuu	1C, 5G	1C, 4G
pähkinäsara	1C, 5G	0
verihirssi	2C	3G
tallinpiharuoho	2C, 9H	1C, 3H
villikaura	0	0
vehnä	4G	0
maissi	2C, 9H	6G
soijapapu	2C, 7G, 5X	2H, 6G
riisi	2C, 9G	5G
durra	2C, 9G	3G
ennen kohoamista		
päivänsini	8G	8G
sappiruoho	8H	9H
kanelipuu	7G	5G
pähkinäsara	6G	0
verihirssi	2G	0
tallinpiharuoho	1C, 6G	4G
villikaura	3G	0
vehnä	3G	0
maissi	1C, 8G	1C, 3G
soijapapu	1H	2G
riisi	10E	9H
durra	9H	1C, 9G

Koe B

Kaksi muovista sipulivatia täytettiin lannoitetulla ja kalkitulla Fallsington-hiesusavimullalla. Toiseen vatiin istutettiin maissia, durraa, Kentucky siniruohoa ja useita ruohomaisia rikkaruohoja. Toiseen vatiin istutettiin puuvillaa, soi-japapuja, purppuraa pähkinäsaraa (*Cyperus rotundus*) ja useita leveälehtisiä rikkaruohoja. Seuraavat ruohomaiset ja leveälehtiset rikkaruohot istutettiin: verihirssi (*Digitaria sanguinalis*), tallinpiharuoho (*Echinochloa crusgalli*), villikaura (*Avena fatua*), johnsonruoho (*Sorghum halepense*), fallisruoho (*Paspalum dilatatum*), suuri ketunhätä (*Setaria faberii*), ruiskuttaa (*Bromus secalinus*), sinappi (*Brassica arvensis*), sappiruoho (*Xanthium pennsylvanicum*), revonhätä (*Amaranthus retroflexus*), päivänsini (*Ipomoea hederacea*), kanelipuu (*Cassia tora*), teeruoho (*Sida spinosa*), samettiruoho (*Abutilon theophrasti*), ja jimsonruoho (*Datura stramonium*). Halkaisijaltaan 12,5 cm:n muoviastia täytettiin myös käsitellyllä mullalla ja siihen istutettiin riisiä ja vehnää. Toiseen 12,5 cm:n astiaan istutettiin sokerijuurikasta. Neljä edellä mainittua astiaa käsiteltiin ennen kohoamista useilla koeyhdisteillä, jotka kuuluvat keksinnön piiriin.

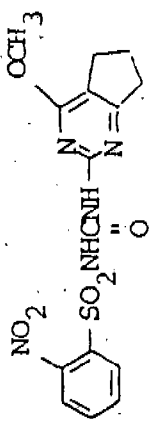
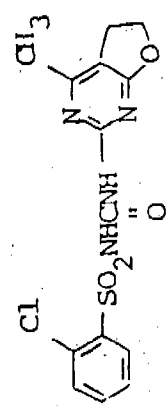
28 päivää käsittelyn jälkeen kasvit tarkistettiin ja visuaalisesti arvioitiin kemikaalikäsittelyjen vaikutusta käyttäen aiemmin kokeelle A kuvattua arviointimenettelyä. Tiedot on koottu taulukkoon B. Huomatkaa, että tietyt yhdisteet ovat käyttökelpoisia käsiteltäessä ennen kohoamista rikkaruohojen torjumiseksi viljelystuotteista, kuten soi-japavuista ja vehnästä.

Ennen kohoamista Fallsington-hiesusavessa

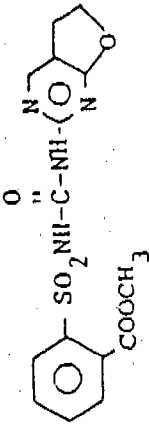
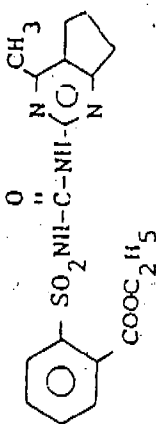


Määrä kg/ha	0.007	0.03	0.06
verihirssi	0	0	4G
tallinpihanruoho	5G	6G, 3C	8G, 5H
durra	6G, 3H	9G, 5H	10F
villikaura	2G	3G	3G
johsonruoho	4G	6G, 5H	7G, 5H
dallisruoho	5G	5G	6G
suuriketunhätä	3G	4G, 2C	8G, 7C
ky. siniruoho	5G	8G, 4C	8G, 8C
ruiskattara	7G	8G, 8C	8G, 9C
sokerijuurikas	4G	7G, 4C	8C, 8C
maissi	5G, 3H	7G, 7H	8G, 8H
sinappi	7G	7G, 3C	7G, 5C
sappiruoho	3G	7G	7G
revonhätä	3G	10E	10E
pähkinäsara	6G	8G	9G
puuvilla	3G	5G, 3H	6G, 3H
päivänsini	0	7G	8G
kanelipuu	0	8G, 8C	8G, 8C
teeruoho	0	10C	10C
samettilehti	0	4G	6G, 2C
hulluruoho	0	3G	3G
soijapapu	3G	0	6G, 5H
riisi	7G, 7C	10E	10E
vehnä	3G	5G	6G, 3C

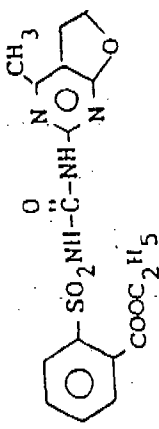
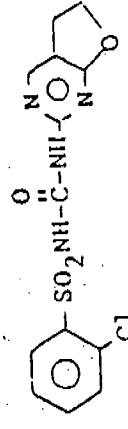
Ennen kohoamista Fallsington-hiesusavessa

				
Määrä kg/ha	0.06	0.25	0.06	0.25
verihirssi	0	4G	5G	9G, 8C
tallinpihanruoho	0	4G	5G	7G, 5C
durra	0	4G	4G	8G, 3H
villikaura	0	0	0	0
johsonruoho	0	3G	5G	7G
dalliruoho	0	5G	8G	9G, 8C
suuriketunhätä	0	3G	6G	8G, 5H
ky. siniruoho	4G	8G	8G, 5C	10C
ruiskattara	5G	8G, 5H	10E	10E
sokerijuurikas	7G, 5C	7G, 8C	-	-
maissi	0	0	5G	7G, 5H
sinappi	6G	7G	8G	10C
sappiruoho	0	3G	0	7G
revonhätä	0	3G	-	-
pähkinäsara	0	0	8G	10E
puuvilla	0	0	4G	7G
päivänsini	0	5G	0	6G
kanelipuu	0	0	6G	7G
teeruoho	0	0	10C	10C
samettilehti	0	0	2G	5G, 3H
hulluruoho	0	0	0	5G
soijapapu	2G	7G, 5H	5G, 3H	7G, 5H
riisi	3G	6G, 3H	7G, 5C	10E
vehnä	0	3G	5G	7G, 4C

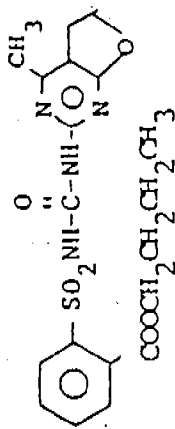
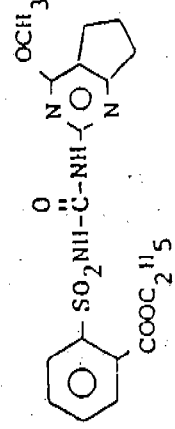
Ennen kohoamista Fallsington-hiesusavassa

				
Määrä kg/ha	0.03	0.125	0.03	0.125
verihirssi	0	6G, 2C	0	9G, 8C
tallinpiharuoho	4G	8G, 5C	0	9G, 8C
durra	7G, 5H	9G, 9C	6G, 3H	10C
villikaura	0	4G	0	6G, 4C
johsonruoho	7G	8G, 4C	5G, 5H	8G, 5H
dallisruoho	5G	7G	3G	8G, 5H
suuriketunhanta	5G	8G	3G	9G, 9C
ky. siniruoho	6G, 3C	8G, 7C	7G, 3C	7G, 5C
ruiskattara	3C	9G, 9C	8G, 8C	10E
sokerijuurikas	3G	7G, 6C	5G, 3C	7G, 7C
maissi	0	0	5G, 3H	8G, 5H
sinappi	6G	8G, 3C	7G	8G, 5C
sappiruoho	0	0	7G, 5H	8G, 8H
revonhanta	-	-	-	-
pähkinäsara	5G	9G	7G	9G
puuvilla	0	7G	5G	6G
päivänsini	0	4G	0	7G
kanelipuu	0	6G, 4C	6G	7G, 3C
teeruoho	3G	5G, 5C	5G	5G
samettilehti	0	0	0	7G, 8C
hulluruoho	0	4G	4G	5G
soijapapu	0	2H	0	3G
riisi	5G, 6C	10C	6G, 3H	10E
vehnä	2G	5G	3G	4G

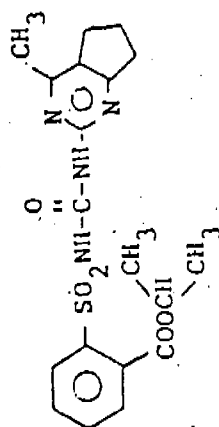
Ennen kohoamista Fallsington-hiesusavessa

				
Määrä kg/ha	0.03	0.125	0.06	0.25
verihirssi	5G	7G, 2C	0	0
tallinpihanruoho	8G, 5C	9G, 9C	0	3G
durra	10C	10C	9	3G
villikaura	6G, 5C	7G, 6C	0	0
johsonruoho	8G, 3C	9G, 9C	0	0
dalliruoho	8G, 4C	9G, 9C	0	4G
suuriketunhätä	7G, 3C	10C	0	5G
ky. siniruoho	7G, 7C	8G, 9C	0	5G
ruiskattara	10E	10E	0	4G
sokerijuurikas	7G, 7C	7G, 7C	0	3G, 4C
maissi	7G, 3E	10C	0	0
sinappi	8G, 3C	9G, 5C	5G	6G
sappiruoho	7G, 5H	8G, 8H	0	-
revonhätä	-	-	-	-
pähkinäsara	10E	10E	0	5G
puuvilla	6G	8G	0	0
päivänsini	3G	8G	0	0
kanelipuu	6G	7G, 3C	0	0
teeruoho	5G	7G	-	4G
samettilehti	0	6G, 5C	3G	3G, 3H
hulluruoho	3G	7G, 5C	0	0
soijapapu	0	3G	0	2G
riisi	10E	10E	0	0
vehnä	7G, 5C	8G, 7C	0	0

Ennen kohoamista Fallsington-hiesusavessa

				
Määrä kg/ha	0.03	0.125	0.06	0.25
verihirssi	0	0	0	0
tallinpihanruoho	0	3G	4G	4G, 3C
durra	0	4G, 2H	6G, 3H	10G
villikaura	0	2G	0	3G
johsonruoho	0	3G	0	4G, 3H
dallisruoho	0	3G	3G	-
suuriketunhätä	5G	8G	-	9G
ky. siniruoho	5G	7G	5G	6G, 3H
ruiskattara	4G	8G, 3C	6G	7G, 4C
sokerijuurikas	0	2G	5G	7G, 3C
maissi	0	0	0	6G, 5H
sinappi	6G	7G	6G	7G
sappiruoho	6G	7G, 3H	-	5G
revonhätä	-	-	-	-
pähkinäsara	4G	3G	5G	5G
puuvilla	0	0	0	6G, 3H
päivänsini	0	0	0	6G
kanelipuu	0	4G	4G	6G
teeruoho	0	5G	0	0
samettilehti	0	0	0	0
hulluruoho	0	0	0	0
soijapapu	0	0	0	0
riisi	0	2G	5G	7G, 5C
vehnä	0	0	4G	4G

Ennen kohoamista Fallsington-hiesusavessa

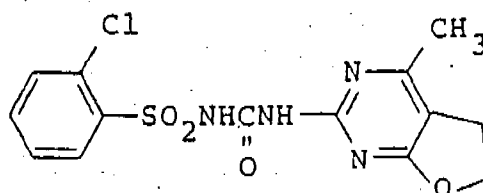


Määrä kg/ha	0.06	0.25
verihirssi	0	3G
tallinpihanruoho	2G	7G, 3H
durra	0	6G, 3H
villikaura	0	6G
johsonruoho	0	5G, 3H
dallisruoho	-	6G
suuriketunhätä	3G	10E
ky. siniruoho	4G	6G, 3C
ruiskattara	7G	8G, 8C
sokerijuurikas	4G	6G, 3H
maissi	0	6G, 3H
sinappi	6G	6G
sappiruoho	4G	5G, 3H
revonhätä	-	-
pähkinäsara	0	6G
puuvilla	3G	6G, 3H
päivänsini	3G	7G
kanelipuu	2G	5G
teeruoho	0	0
samettilehti	0	3G
hulluruoho	0	0
soijapapu	0	2H
riisi	3G	6G
vehnä	2G	3G

Koe C

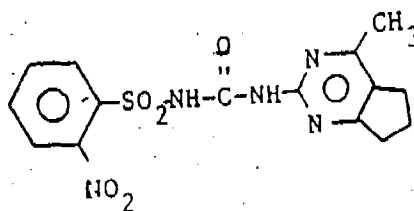
25 cm:n halkaisijan muoviastioihin, joissa oli Fallsington-hiesusavea, istutettiin soiijapapuja, puuvillaa, sinimailasta, maissia, riisiä, vehnää, durraa, samettilehtiä (*Abutilon theophrasti*), sesbanijoita (*Sesbania exaltata*), kanelipuita (*Cassia tora*), päivänsinejä (*Ipomoea hederacea*), jimsonruohoja (*Datura stramonium*), sappiruohoja (*Xanthium pennsylvanicum*, verihirssejä (*Digitaria spp*), pähkinäsaroja (*Cyperus rotundus*), tallinpiharuohoja (*Echinochloa crusgalli*), suuria ketunhäntiä (*Setaria faberii*) ja villikauroja (*Avena fatua*). Noin 2-1/2 viikkoa istuttamisen jälkeen nuoret kasvit ja multa niiden ympäristä suihkutettiin koeyhdisteillä, jotka oli liuotettu kasveille myrkyttömään liuottimeen. 14 päivää käsittelyn jälkeen kaikkia lajeja verrattiin käsittelemättömiin kontrollikasveihin ja visuaalisesti arvioitiin käsittelyn vaikutusta. Arviointisysteemi oli sama kuin edellä kokeessa A. Tiedot on esitetty taulukossa C. On ilmeistä, että koeyhdisteet omaavat suuren kohoamisen jälkeisen aktiviteetin.

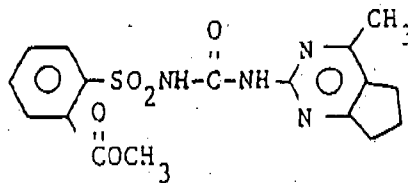
[illegible]

[illegible]

Koe D

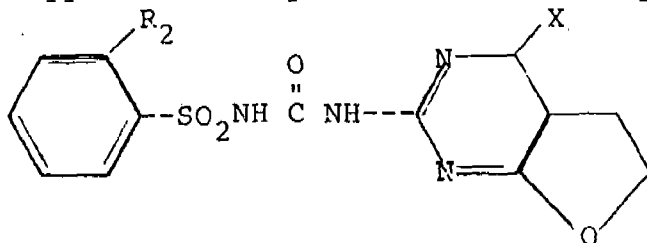
Purppuran pähkinäsaran (*Cyperus rotundus*) mukuloita istutettiin noin 2 cm syvyydelle Fallsington hiesusavimultaan, joka oli 10 cm halkaisijan muoviastioissa. Jokaiseen astiaan istutettiin viisi mukulaa. Esillä olevan keksinnön mukaisia yhdisteet liuotettiin kasveille myrkyttömään liuottimeen ja suihkutettiin 560 l/ha neljällä levitysmenetelmällä: mullan pinnalle, mukulaan/multaan, sekoitettuna multaan ja kohoamisen jälkeen. Mullan pinnan suihkutetus käsitti yhdisteen suihkuttamisen tiitistetynt pintamullan pinnalle. Mukula/multa-suihkutus käsitti yhdisteen suihkuttamisen paljaille mukuloille ja vastaava kohta mullasta ennenkuin lisättiin käsittelemätön pintamulta. Multaan sekoitettu käsittely koostui yhdisteen sekoittamisesta pintamullan kanssa ennenkuin sillä peitetään mukulat. Kohoamisen jälkeen käsittelyssä suihkutettiin pähkinäsaran lehdille ja ympäröivään multa pinnalle, sen jälkeen kun pähkinäsara oli kohonnut ja kasvanut noin 12 cm:n korkeuteen. Kohoamisen jälkeen käsiteltävät astiat sijoitettiin suoraan kasvihuoneeseen. Astiat, jotka saisivat muun käsittelyn, kostutettiin noin 0,3 cm vettä, ennenkuin ne siirrettiin kasvihuoneeseen. Neljän viikon jälkeen tehdyt vaikutusarviot kirjattiin taulukkoon D perustuen samaan arviointisysteemiin kuin kokeessa A kuvattiin. Arvot osoittavat, että testatut yhdisteet ovat hyvin aktiivisia pähkinäsaran torjunnassa.

[illegible]

[illegible]

Patenttivaatimukset

1. Maanviljelyskemikaaleina käytettäviä substituoituja fenyyliisulfonyyliureidodihydrofurano /2,3-d/ pyrimidiinejä, joilla on kaava



jossa kaavassa R_2 on CH_3 , Cl , NO_2 , COR_5 tai $\text{SO}_2\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$; R_5 on C_1 - C_4 -alkoksi, C_3 - C_4 - alkenyylialkoksi, C_6 -sykloalkoksi tai NR_8R_9 ; R_8 ja R_9 ovat C_1 - C_2 -alkyylejä tai R_8 ja R_9 muodostavat ryhmän $(\text{CH}_2)_4$ tai $\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$; R_{10} ja R_{11} ovat C_1 - C_3 -alkyylejä; ja X on H , CH_3 tai OCH_3 ; sekä niiden maanviljelyksellisesti hyväksyttävät suolat.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on 2-kloori-N-[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli) aminokarbonyyli]bentseenisulfonamidi.

3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on N-[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli]-2-nitrobentseenisulfonamidi.

4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on 2 { [(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)-aminokarbonyyli] aminosulfonyyli } bentsoehappo-metyyliesteri.

5. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on N'-[(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)aminokarbonyyli]-N,N-dimetyyli-1,2-bentseenidisulfonamidi.

6. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on 2- { [(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)aminokarbonyyli] aminosulfonyyli } bentsoehappo-etyyliesteri.

7. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on 2- { [(5,6-dihydro-4-metyylifuro[2,3-d]pyrimidin-2-yyli)aminokarbonyyli] aminosulfonyyli } bentsoehappo-sykloheksyyliesteri.

8. Koostumus ei-halutun kasvillisuuden torjuntaan, t u n n e t t u siitä, että se sisältää oleellisesti minkä tahansa patenttivaatimuksen 1-7 mukaisen yhdisteen ja vähintään yhden (a) pinta-aktiivisen aineen ja (b) kiinteään tai nestemäisen ohentimen.

9. Menetelmä ei-halutun kasvillisuuden torjuntaan, t u n n e t t u siitä, että levitetään sellaisen kasvillisuuden

alueelle herbisidisesti vaikuttava määrä mitä tahansa patenttivaatimuksen 1-7 mukaista yhdistettä.

10. Menetelmä pähkinäsaran torjumiseksi, t u n n e t t u siitä, että levitetään sellaiselle pähkinäsara-alueelle herbisidisesti vaikuttava määrä mitä tahansa patenttivaatimuksen 1-7 mukaista yhdistettä.