

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razon Social

NIHON BAYER AGROCHEM KK

No de identificación

Representante Legal (Persona Juridica)

Pais de Domicilio

Japon

Departamento o Estado

10-8 Takanawa 4 chome Minato Ku

Direccion

Ciudad

Tokyo 108

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

EMILIO FERRERO

Direccion y Domicilio

Carrera 4 no 72 35 piso 4o

Ciudad

BOGOTA COLOMBIA

DATOS DEL INVENTOR

(7) Nombre del Inventor(es)

- 1 Yukiyoishi WATANABE
- 2 Toshio GOTO
- 3 Chieko UENO
- 4 Dr Mark Wilhelm DREWES
- 5 Dr Dieter FEUCHT

Identificación

Direccion

Ciudad

- 1 2-8-24 Hanagaki-cho Oyama shi Tochigi 323-0027 Japon
- 2 214-18 Koganei Kokubunji machi Shimotsuga gun
Tochigi 329-0414 Japon
- 3 7 2 1 Joto Oyama shi Tochigi 323-0807 Japon
- 4 Goethestr 38 40764 Langenfeld Alemania
- 5 Ackerweg 9 40789 Monheim Alemania

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

() Titulo de la Invención

NUEVAS 1 3 5 TRIAZINAS

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI ☒

NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) Pais

JP

JP

Convención de París

Fecha

9 de Septiembre de 1999

2 de Marzo de 2000

No Solc tud

Hei 11 255577

2000 J7578

Para Publicar a los ☐ 6 meses

☐ 12 meses

☒ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

Colo 08733 801 005 8

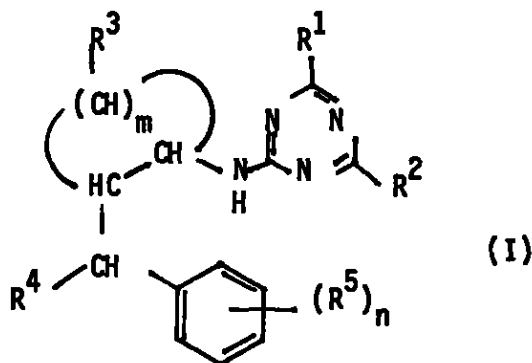
JJC/Mmm 25

(1) CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

A01N 43/707, C07D 213/02³⁰

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

La presente invencion describe se refiere a nuevos derivados de 1 3 5 triazina representados por la formula general (I)



En la que

R¹ R² R³ R⁴ m n y R⁵ se definen segun se describe en la memoria descriptiva y a multiples procedimientos intermedios para su preparacion asi como a su uso como herbicidas

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representacion Legal cuando el solicitante sea Persona Juridica	☒
Los poderes debidamente otorgados o mencion de su protocolización ante la SIC	☒
Recibo de la tasa respectiva	☒
Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicacion	☐
Si se reivindica prioridad Andina	☐
Copia de la primera solicitud	☐
Traducción oficial	☐
Si se reivindica prioridad Unionista	☐
Copia certificada de la primera solicitudes <i>Japonesa No. Hei 18 235577 4</i>	☒
Nota Debe presentarse dentro de los tres (3) meses contados a partir de la fecha de radicacion de la solicitud posterior <i>2000 53538</i>	☐
Traduccion simple (2)	☒
Capitulo descriptivo	☒
Dibujos planos necesarios	☐
Capitulo reivindicatorio	☒
Tarjeta archivo propietarios segun formato	☒
Tarjeta archivo tematico segun formato	☒
Extracto para publicacion segun formato	☒
Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms	☒
Otros Documentos	☐

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA

NOMBRE EMILIO FERRERO

CC 438 019 de Usaquén

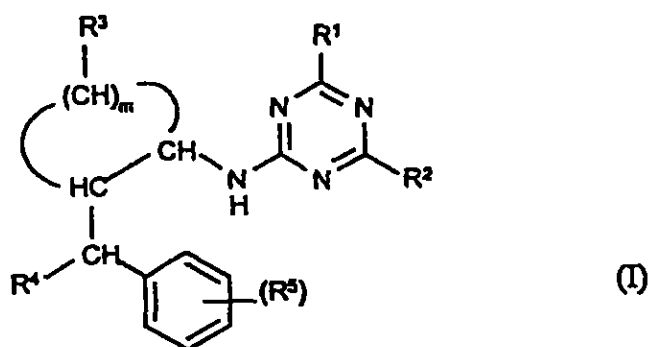
TP No 31 929

NUEVAS 1,3,5-TRIAZINAS

La presente invencion se refiere a nuevas 1 3 5 triazinas a multiples procedimientos y productos intermedios para su preparacion y a su uso como herbicidas

Ya se sabe que ciertos tipos de triazinas muestran actividad herbicida (cfr WO 97/31904 WO 97/08156 WO 97/29095 etc)

Se han encontrado ahora nuevas 1 3 5 triazinas de la formula (I)



en la que

R^1 representa alquilo de 1 a 5 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 atomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 atomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente susti

tuido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenil carbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halogeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representan cada uno independientemente un átomo de hidrogeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^5 representa halogeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un numero entero de 1-4 y

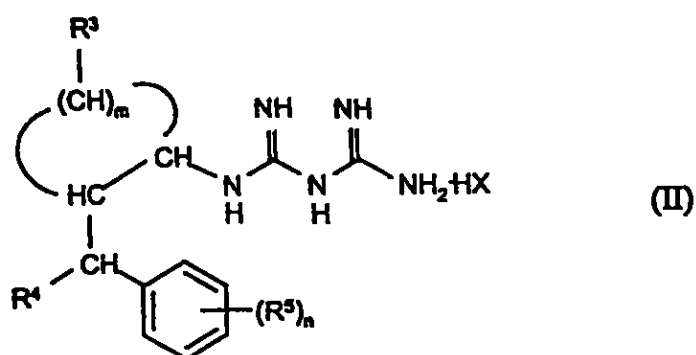
los sustituyentes R^3 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un numero entero de 2 ó mas

n representa un numero entero de 0-5 y

los sustituyentes R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un numero entero de 2 o mas

Los compuestos de la formula (I) de acuerdo con la invencion, pueden obtenerse mediante un procedimiento en el que

- a) en caso de que R^2 represente amino compuestos de la formula (II)



en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

X representa halogeno preferiblemente cloro o bromo

se hacen reaccionar con compuestos de la formula (III)

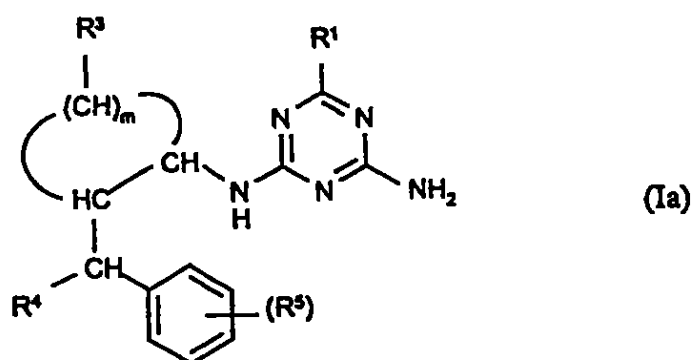


en la que

R^1 tiene la misma definición que se menciona anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente metilo o etilo en presencia de un disolvente inerte y si es apropiado en presencia de un agente que se une a los ácidos o

- b) en caso de que R^2 represente formulamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halogeno compuestos de la formula (Ia)



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente
se hacen reaccionar con compuestos de la formula (IV)



en la que

R^6 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente

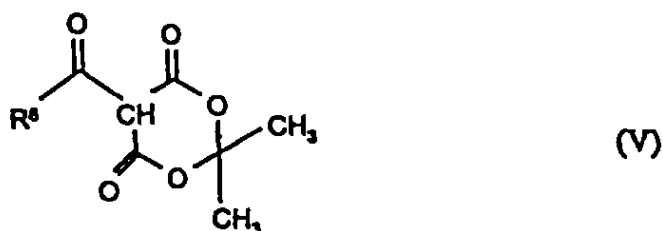
R^7 representa un atomo de hidrogeno alquilo de 1 a 4 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 6 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 atomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con alcoxide de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halógeno

en presencia de un disolvente inerte y si es apropiado en presencia de un agente que se une a los acidos

o

c) en caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilacetilamino

los compuestos de la formula (Ia) se hacen reaccionar con compuestos de la formula (V)



en la que

R^8 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 átomos de carbono en presencia de un disolvente inerte,

o

d) en caso de que R^2 represente di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

los compuestos de la fórmula (Ia)

se hacen reaccionar con compuestos de la fórmula (VI)



en la que

R^6 tiene la misma definición que se menciona anteriormente,

R^9 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 átomos de carbono y

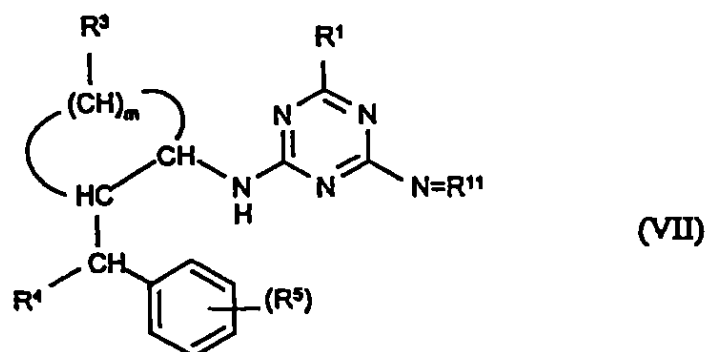
R^{10} representa un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono preferiblemente un átomo de hidrógeno metilo o etilo

en presencia de un disolvente inerte y si es apropiado en presencia de un catalizador ácido

o

e) en caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino

compuestos de la fórmula (VII)



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

R^{11} representa alquílido de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquílido de 1 a 3 átomos de carbono

se reducen en presencia de un disolvente inerte y en presencia de catalizador

Las triazinas de la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención, muestran una acción herbicida más fuerte en comparación con los compuestos descritos en la literatura de la técnica anterior mencionada previamente

En las fórmulas

Halógeno representa fluor cloro bromo o yodo y preferiblemente representa fluor cloro o bromo

Alquilo puede ser de cadena lineal o cadena ramificada y puede representar por ejemplo alquilo de 1 a 4 átomos de carbono y pueden mencionarse específicamente metilo etilo n o iso-propilo n iso sec o terc-butilo

Como cicloalquilo pueden mencionarse por ejemplo ciclopropilo ciclo-butilo ciclo-pentilo o ciclohexilo

Haloalquilo es alquilo de cadena lineal o cadena ramificada sustituido con

halogeno y pueden mencionarse por ejemplo alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con 1 a 9 átomos de fluor cloro y/o bromo específicamente fluorometilo fluoroclorometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobromometilo trifluorometilo clorometilo diclorometilo triclorometilo bromometilo 1-fluoroetilo 2-fluoroetilo 2,2,2-trifluoroetilo 1,2,2,2-tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1-cloroetilo 1,2-dicloroetilo 1-bromo 1-metiletilo 1 (trifluorometil) 2,2,2-trifluoroetilo 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilo 3-fluoropropilo 3-cloropropilo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo 1,2,2,3,3,3-hexafluoropropilo o perfluorobutilo

Alcoxí es alquil O del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede representar por ejemplo alcoxí de 1 a 4 átomos de carbono Pueden mencionarse específicamente metoxí etoxí n o iso propoxí n iso sec o terc-butoxí

Alquiltio es alquil S del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio Pueden mencionarse específicamente metiltio etiltio n o iso propiltio n iso sec- o terc-butiltio

Alquilsulfinilo es alquil SO del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo Pueden mencionarse específicamente metilsulfinilo etilsulfinilo n o iso propilsulfinilo n iso sec- o terc butilsulfinilo

Alquilsulfonilo es alquil SO₂ del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo Pueden mencionarse específicamente metilsulfonilo etilsulfonilo n o iso-propilsulfonilo n iso sec- o terc butilsulfonilo

Alquilamino es alquil NH del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino. Pueden mencionarse específicamente metilamino etilamino n o iso propilamino n iso sec- o terc-butilamino.

Alquilcarbonilamino es alquil CONH del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede representar por ejemplo alquilcarbonilamino de 2 a 5 átomos de carbono en total. Pueden mencionarse específicamente metilcarbonilamino etilcarbonilamino n o iso propilcarbonilamino n- iso-sec o terc butilcarbonilamino.

Cicloalquilcarbonilamino es cicloalquil CONH del que la parte de cicloalquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede representar por ejemplo cicloalquilcarbonilamino de 4 a 7 átomos de carbono. Pueden mencionarse específicamente ciclopropilcarbonilamino o ciclobutilcarbonilamino ciclopentilcarbonilamino y ciclohexilcarbonilamino.

Haloalquilcarbonilamino es haloalquil CONH del que la parte de haloalquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo haloalquilcarbonilamino de 2 a 5 átomos de carbono. Pueden mencionarse específicamente fluorometilcarbonilamino difluorometilcarbonilamino difluoroclorometilcarbonilamino difluorobromometilcarbonilamino trifluorometilcarbonilamino 1 fluoroetilcarbonilamino 2 fluoroetilcarbonilamino 2 2 2 trifluoroetilcarbonilamino 1 2 2 2 tetrafluoroetilcarbonilamino perfluoroetilcarbonilamino o perfluoropropilcarbonilamino perfluorobutilcarbonilamino.

En bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo y bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo los átomos de halógeno son los mismos que se mencionan anteriormente para halógeno y la parte de alquilo tiene el mismo

significado que el alquilo mencionado anteriormente. Como ejemplos específicos de bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse bencilo 2 (3 y 4) fluorobencilo o 2 (3 y 4) clorobencilo 2-(3 y 4) metilbencilo 2,3 (2,4- 2,5 2,6 3,4 3,5) difluorobencilo y como ejemplos específicos de bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse bencilcarbonilamino 2 3 o 4 fluorobencilcarbonilamino 2 3 o 4 clorobencilcarbonilamino 2 3 o 4 metilbencilcarbonilamino 2,3 2,4 2,5 2,6 3,4 o 3,5 difluorobencilcarbonilamino

En fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo los átomos de halógeno son los mismos que se mencionan anteriormente para halógeno y la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente. Como ejemplos específicos de fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse fenilo 2 3 ó 4 fluorofenilo 2 3 o 4-clorofenilo 2 3 o 4 metilfenilo 2,3 2,4- 2,5 2,6 3,4 o 3,5 difluorofenilo 2,3 2,4 2,5 2,6 3,4 o 3,5 diclorofenilo o 2,3 2,4- 2,5 2,6 3,4 o 3,5-dimetilfenilo

En fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo sustituido con alcoxi o sustituido con halógeno la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente la parte de alcoxi tiene el mismo significado que el alcoxi mencionado anteriormente y los átomos de halógeno tienen el mismo significado que se menciona anteriormente para halógeno. Como ejemplos específicos de fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo sustituido con alcoxi o sustituido con halógeno pueden mencionarse fenilcarbonilamino 2 3 o 4 fluorofenilcarbonilamino 2 3 o 4 clorofenilcarbonilamino 2 3 o 4 metilfenilcarbonilamino 2 3 o 4 metoxi

fenilcarbonilamino 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4- o 3 5 difluorofenilcarbonilamino 2 3
2 4 2 5 2 6- 3 4 6 3 5 diclorofenilcarbonilamino o 2 3 2 4 2 5 2 6- 3 4 o 3 5
dimetilfenilcarbonilamino

En alquilcarbonilacetilamino" la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente y como ejemplos específicos de alquil carbonilacetilamino pueden mencionarse acetoacetilamino propionilacetilamino butirilacetilamino isobutirilacetilamino valerilacetilamino isovalerilacetilamino o pivaloilacetilamino

En dialquilaminoalquilidenamino la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente y la parte de alquilideno mencionada anteriormente puede ser de cadena lineal o cadena ramificada y puede representar por ejemplo alquilideno de 1 a 4 átomos de carbono. Como ejemplos de dialquila minoalquilidenamino pueden mencionarse dimetilaminometilidenamino 1 (dimetilamino)etilidenamino 1 (dimetilamino)(n propiliden)amino 1 (dimetil amino)(n butiliden)amino 1 (dimetilamino)(iso butiliden)amino dietilaminometili denamino di(n propil)aminometilidenamino di(n butil)aminometilidenamino (N metil N etilamino)metilidenamino o (N metil N (n propil)amino)metilidenamino

Como un grupo preferible de compuestos de la presente invención, pueden mencionarse compuestos en los que en la fórmula (I)

R¹ representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con al quilo de 1 a 3 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R² representa amino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino formilamino

(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 5 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con cloro (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 3 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^5 representa fluor cloro bromo metilo etilo n propilo isopropilo terc-butilo halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono) (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 2-4 y

los sustituyentes R^3 pueden ser idénticos o diferentes

n representa un número entero de 0-4 y

los sustituyentes R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o mas

Y como un grupo mas preferible de compuestos pueden mencionarse com

puestos en los que en la formula (I) mencionada anteriormente

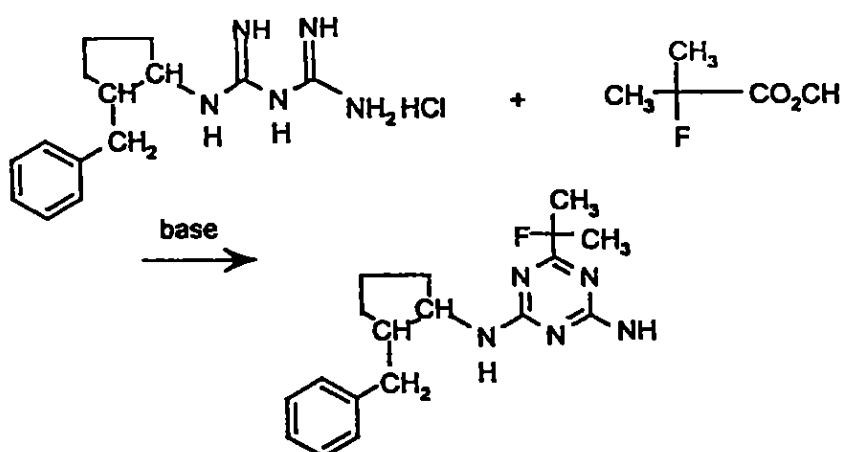
- R^1 representa metilo etilo n propilo isopropilo terc butilo ciclopropilo ciclo butilo fluorometilo fluoroclorometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobromometilo trifluorometilo clorometilo trclorometilo bromometilo 1 fluoroetilo 2 2 2 trifluoroetilo 1 2 2 2 tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1 cloroetilo 1 2 dicloroetilo 1 bromoetilo perfluoropropilo 1 fluoro 1 metiletilo 1 cloro 1 metiletilo 1 bromo 1 metiletilo 1 (trifluorometil)-2 2 2 trifluoroetilo bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con metilo
- R^2 representa amino metilamino etilamino formilamino acetilamino etilcarbamilamino ciclopropilcarbamilamino fluorometilcarbamilamino trifluorometilcarbamilamino 1 fluoroetilcarbamilamino perfluoroetilcarbamilamino bencilcarbamilamino que puede estar opcionalmente sustituido con cloro o sustituido con metilo fenilcarbamilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro sustituido con metilo o sustituido con metoxi acetoacetilamino o dimetilaminometilidenamino
- R^3 o R^4 representan cada uno independientemente un atomo de hidrogeno metilo o etilo
- R^5 representa fluoro cloro metilo etilo trifluorometilo metoxi etoxi trifluorometoxi metiltio trifluorometiltio metilsulfinilo metilsulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo nitro o ciano
- m representa un numero entero de 3 o 4 y

los sustituyentes R^3 pueden ser idénticos o diferentes

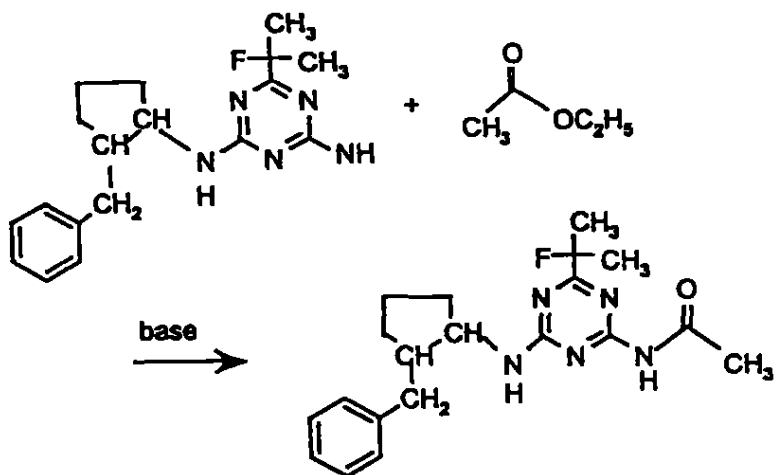
n representa un numero entero de 0-3 y

los sustituyentes R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un numero entero de 2 ó 3

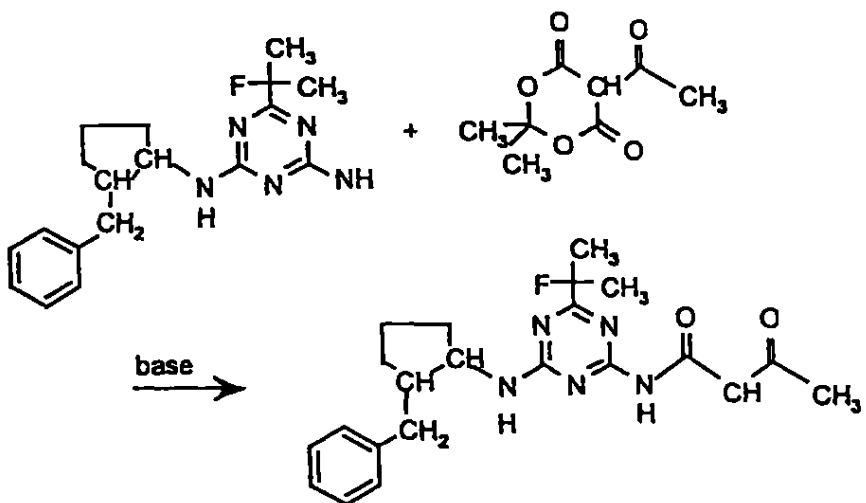
El procedimiento de preparación (a) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocloreuro de 2 bencilciclopentilbiguanida y α fluoro- α metilpropionato de metilo como los materiales de partida, puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



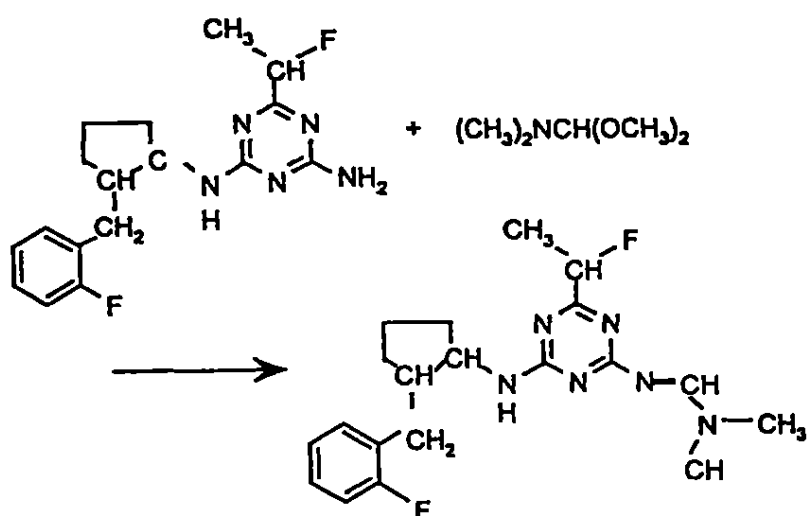
El procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen 2 amino-4-(2 bencilciclopentilamino)-6 (α fluoro-isopropil) 1 3 5 triazina y acetato de etilo como los materiales de partida, puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



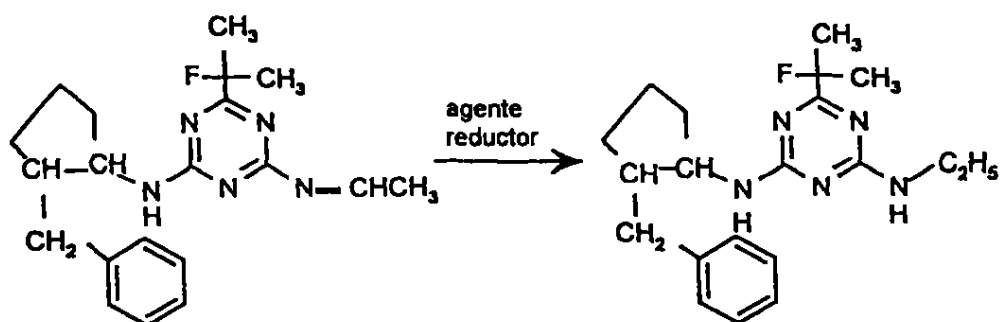
El procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocloreuro de 2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina y acetil acido de Meldrum como los materiales de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



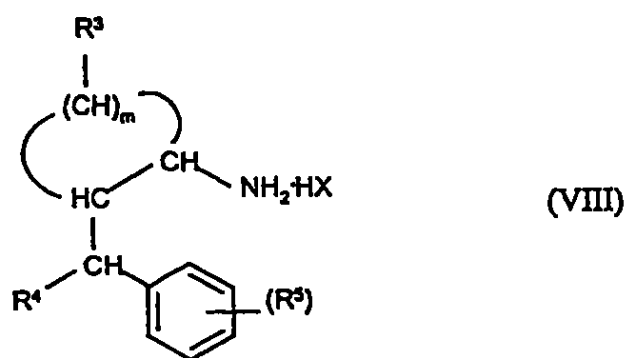
El procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocloreuro de 2 amino-4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino)-6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina y dimetilacetal de N N dimetilformamida como los materiales de partida, puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



El procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se use 2 etilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina como el material de partida, puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



Los compuestos de la formula (II) los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente son nuevos compuestos que no estan descritos en la literatura y pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en las Solicitudes de Patente Japonesa Abiertas a Consulta por el Publico N° 246279/1989 264465/1988 222166/1988 N° 146876/1988 N° 51379/1988 haciendo reaccionar por ejemplo un compuesto de la formula (VIII)



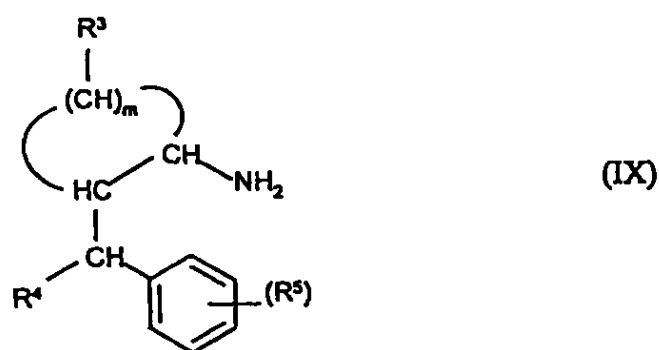
en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

X representa halogeno

con cianoguanidina en un diluyente apropiado por ejemplo n decano

Los compuestos de la formula (VIII) mencionada anteriormente pueden prepararse haciendo reaccionar compuestos de la formula (IX)



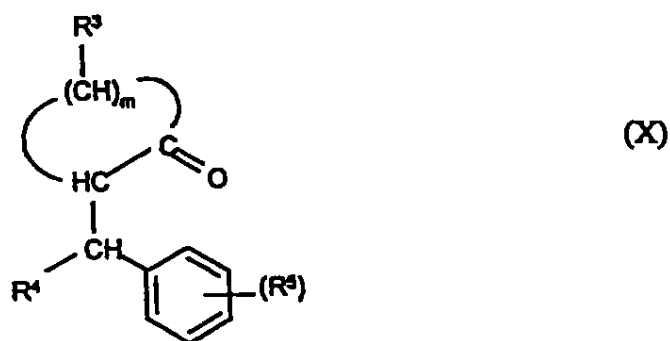
en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente

con un acido halohidrico apropiado tal como acido clorhidrico

Los compuestos de la formula (IX) mencionada anteriormente una parte de los cuales es nueva y no esta descrita en la literatura, pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento (reaccion de Leuckart) descrito en, por ejemplo Organic Reaction, Vol 5 p 301 (1962) John Wiley & Sons, INC haciendo reaccionar com

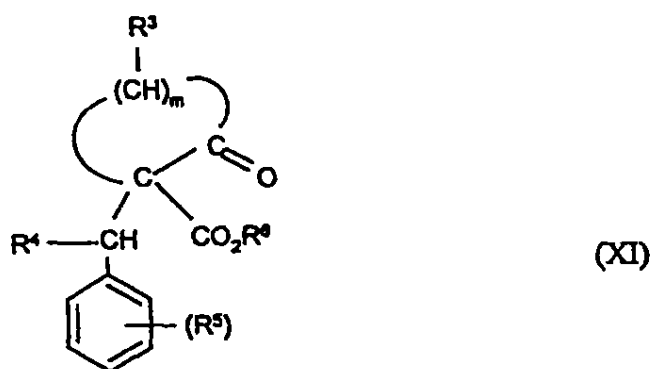
puestos de la formula (X)



en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente, con formamida y ácido fórmico

Los compuestos de la formula (X) mencionada anteriormente una parte de los cuales es nueva y no esta descrita en la literatura, pueden prepararse facilmente haciendo reaccionar por ejemplo en la descarboxilacion comunmente bien conocida de β -cetoesteres a saber compuestos representados por la formula (XI)



en la que

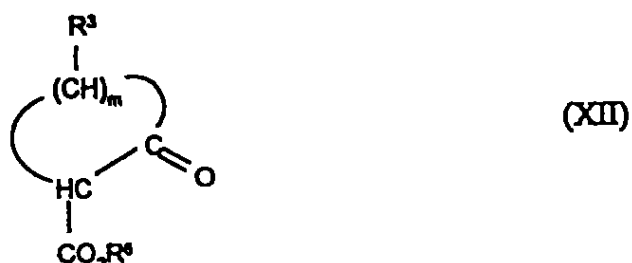
R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono

con un acido mineral apropiado por ejemplo ácido bromhídrico

Los compuestos de la formula (XI) mencionada anteriormente una parte de

los cuales es nueva y no esta descrita en la literatura, pueden obtenerse fácilmente por ejemplo mediante el procedimiento descrito en SEIMITSU YUKI GOSEI (Precise organic syntheses) Nankodo p 160 1983 a saber haciendo reaccionar compuestos de la formula (XII)

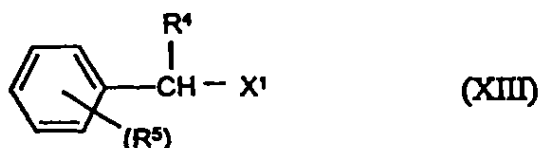


en la que

R^3 y m tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

con compuestos de la formula



en la que

R^4 , R^5 y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

X^1 representa halogeno

usando un agente que se une a los ácidos apropiado por ejemplo una solución acuosa de hidróxido sódico en un diluyente apropiado por ejemplo diclorometano en presencia de un catalizador de transferencia de fase por ejemplo hidrosulfato de tetrametilamonio

Los compuestos de la formula (XII) mencionados anteriormente una parte de los cuales es nueva y no esta descrita en la literatura, pueden prepararse fácilmente

de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en Organic Reaction, Vol 15 p 1 (1967) John Wiley & Sons INC

Los compuestos de la formula (XIII) mencionada anteriormente son compuestos conocidos y pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito en, por ejemplo SHIN JIKKEN KAGAKU KOZA (New experimental chemistry lectures) editado por Chemical Society of Japan, Vol 14(I) p 331 1962 publicado por Maruzen

Como compuestos de la formula (II) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

hidrocloruro de 2 bencilciclopentilbiguanida,
 hidrocloruro de 2-(2 fluorobencil)ciclopentilbiguanida,
 hidrocloruro de 2 (3 fluorobencil)ciclopentilbiguanida,
 hidrocloruro de 2-(3 metilbencil)ciclopentilbiguanida,
 hidrocloruro de 2 bencilciclohexilbiguanida
 hidrocloruro de 2-(2 fluorobencil)ciclohexilbiguanida,
 hidrocloruro de 2-(3 fluorobencil)ciclohexilbiguanida, y
 hidrocloruro de 2-(3 metilbencil)ciclohexilbiguanida

Los compuestos de la formula (III) son compuestos conocidos y pueden obtenerse comercialmente Tambien pueden prepararse fácilmente de acuerdo con el procedimiento descrito en EP A 850911

Como compuestos de la formula (III) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

fluoroacetato de etilo
 fluorocloroacetato de etilo

- fluorobromoacetato de etilo
- difluorocloroacetato de etilo
- dibromofluoroacetato de etilo
- trifluoroacetato de etilo
- pentafluoropropionato de metilo
- α fluoropropionato de etilo
- α fluoro- α metilpropionato de etilo
- acetato de etilo
- propionato de etilo
- n butirato de etilo
- isobutirato de etilo
- ciclopropanocarboxilato de etilo
- ciclopentanocarboxilato de etilo y
- ciclohexanocarboxilato de etilo

Los compuestos de la formula (Ia) usados como los materiales de partida en los procedimientos de preparacion (b) (d) mencionados anteriormente son una parte de los compuestos de la formula (I) de la presente invencion y pueden prepararse facilmente mediante el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente

En la formula (IV) de acuerdo con el procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente R^7 representa preferiblemente un atomo de hidrogeno alquilo de 1 a 3 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 atomos de carbono) bencilo que puede estar sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 atomos de carbono o fenilo que puede estar sustituido con alquilo de 1 a 3 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 3 atomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con cloro

— — — — —
—
— — — — —

Los compuestos de la formula (IV) son compuestos conocidos y pueden obtenerse segun estan disponibles comercialmente O pueden sintetizarse fácilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en EP A 850911

Como compuestos de la formula (Ia) usados como los materiales de partida en los procedimientos de preparacion (b)-(d) mencionados anteriormente que se incluyen en la formula (I) pueden mencionarse los siguientes

- 2 amino-4-(2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino)-6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6-(α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (trifluorometil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4-(2 (3 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclopentilamino)-6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 -(3 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (trifluorometil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclohexilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclohexilamino)-6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclohexilamino) 6 isopropil 1 3 5 triazina y
- 2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclohexilamino) 6-etil 1 3 5 triazina

Como compuestos de la formula (IV) usados como materiales de partida en el

procedimiento de preparación (b) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

acetato de etilo
 propionato de etilo
 n butirato de etilo
 isobutirato de etilo
 pivalato de etilo
 ciclopropanocarboxilato de etilo
 ciclopentanocarboxilato de etilo
 ciclohexanocarboxilato de etilo
 fenilacetato de etilo
 benzoato de etilo
 3 metilbenzoato de etilo
 2 clorobenzoato de etilo y
 trifluoroacetato de etilo

Los compuestos de formula (V) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente, son compuestos conocidos y pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en Chem Pharm Bull (1987) 35(5) 1860 1870

Como compuestos de la formula (V) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

5 acetil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona,
 5 propionil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona,
 5 butiril 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona,
 5 isobutiril 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona,

- 5 ciclopropilcarbonil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6-diona,
- 5 ciclohexilcarbonil 2 2-dimetil 1 3 dioxan-4 6-diona y
- 5 (2 fluorobenzoil) 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6-diona

Como compuestos de formula (VI) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente estan compuestos conocidos y pueden prepararse fácilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Publico N° 277251/1996

Entre los compuestos de la formula (VI) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

- dimetilacetal de N N dimetilformamida,
- dimetilacetal de N N dietilformamida,
- dimetilacetal de N N dipropilformamida,
- dimetilacetal de N metil N etilformamida,
- dimetilacetal de N metil N propilformamida,
- dietilacetal de N N dimetilformamida,
- dietilacetal de N N dietilformamida
- dimetilacetal de N N dimetilacetamida y
- dimetilacetal de N N dietilacetamida

Los compuestos de la formula (VII) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente son nuevos y no se describen en la literatura y pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento descrito en, por ejemplo la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Publico N° 51379/1988 por ejemplo haciendo reaccionar los compuestos de la formula (Ia) mencionada anteriormente con aldehidos alifaticos o cetonas alifaticas con de 1 a

- - - - -

4 átomos de carbono en total en los grupos alifáticos de la fórmula (XIV)



en la que R^{11} significa el grupo alifático restante que forma los aldehídos/cetonas alifáticos

Los compuestos de la fórmula (XIV) son compuestos conocidos y pueden obtenerse comercialmente

Como compuestos de la fórmula (VII) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparación (e) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

2 metilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino)-6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 etilidenamino-4-(2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 propilidenamino-4-(2 bencilciclopentilamino)-6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 isopropilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 metilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2-etilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2 propilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina

2 metilidenamino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 etilidenamino-4 (2 bencilciclohexilamino)-6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2 etilidenamino 4 (2 (3 fluorobencil)ciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 etilidenamino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroetil)-1 3 5 triazina y

2-etilidenamino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 isopropil 1 3 5 triazina

Como otra alternativa a la preparacion de acuerdo con el procedimiento (e) los compuestos de formula (I) tambien pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento (b) si en lugar de compuestos de la formula (IV) se usan compuestos de la formula (XV)



en la que

R^{12} representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono y

X^1 representa halógeno

La reaccion del procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos de tales diluyentes usados en ese caso pueden mencionarse eteres por ejemplo eter etilico metil etil eter eter isopropilico eter butilico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) o eter dimetilico de dietilenglicol (DGM) alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol butanol o etilenglicol amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona, 1,3 dimetil 2 imidazolidinona o triamida hexametilfosforica (HMPA) sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) o sulfolano bases por ejemplo piridina

El procedimiento de preparacion (a) puede efectuarse en presencia de un agente que se une a los acidos. Como agentes que se unen a los acidos utilizables en ese caso pueden mencionarse como bases inorganicas hidruros hidroxidos carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos y metales alcalinoterreos por ejemplo hidruro sodico hidruro de litio hidrogenocarbonato sodico hidrogenocarbonato potasico carbonato sodico carbonato potasico hidroxido de litio hidroxido sodico hidroxido potasico o hidroxido calcico amidas de metales alcalinos inorganicas por ejemplo amida de litio amida sodica o amida potasica y como bases organicas alcoholatos aminas terciarias dialquilaminoanilinas y piridinas por ejemplo meto

xido sodico etóxido sodico terc-butoxido potásico trietilamina, 1 1 4 4 tetrametiletilendiamina (TMEDA) N N-dimetilanilina, N N dietilanilina, piridina, 4 dimetilaminopiridina (DMAP) 1 4-diazabíciclo[2 2 2]octano (DABCO) o 1 8 diazabíciclo[5 4 0]undec-7 eno (DBU)

El procedimiento de preparación (a) puede efectuarse a diversas temperaturas Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 aproximadamente 100°C preferiblemente de aproximadamente 20 a aproximadamente 80°C Dicha reaccion puede efectuarse deseablemente bajo presion normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (a) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la fórmula (II) con 0.8 2.2 moles de un compuesto de la formula (III) en un diluyente por ejemplo metanol en presencia de 2.3 moles de metoxido sódico

Ademas en el procedimiento de preparacion (a) la reaccion para producir el compuesto de la formula (II) a partir de un compuesto de la formula (IX) a traves del compuesto intermedio de la formula (VIII) tambien puede efectuarse continuamente

La reaccion del procedimiento de preparación (b) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado Como ejemplos de tales diluyentes usados en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifáticos alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohexano eter de petroleo ligroina, benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1 2 dicloroetano clorobenceno diclorobenceno etc eteres por ejemplo eter etilico metil etil eter eter isopropilico eter butilico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) o eter dimetilico de dietilen glicol (DGM) cetonas por ejemplo acetona, metil etil cetona (MEK) metil

isopropil cetona o metil isobutil cetona (MIBK) nitrilos por ejemplo acetonitrilo propionitrilo o acrilonitrilo alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol butanol o etilenglicol esteres por ejemplo acetato de etilo o acetato de amilo amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona, 1 3 dimetil 2 imidazolidinona o triamida hexametilfosforica (HMPA) sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) o sulfolano bases por ejemplo piridina

El procedimiento de preparacion (b) puede efectuarse en presencia de un agente que se une a los acidos Como agentes que se unen a los acidos utilizables en ese caso pueden mencionarse como bases inorganicas hidruros hidroxidos carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos y metales alcalinoterreos por ejemplo hidruro sodico hidruro de litio hidrogenocarbonato sodico hidrogenocarbonato potasico carbonato sodico carbonato potasico hidroxido de litio hidroxido sódico hidróxido potasico o hidroxido calcico amidas de metales alcalinos inorganicas por ejemplo amida de litio amida sodica o amida potasica y como bases organicas alcoholatos aminas terciarias dialquilaminoanilinas y piridinas por ejemplo trietilamina, 1 1 4 4-tetrametiletilendiamina (TMEDA) N N dimetilaniлина N N dietilaniлина, piridina, 4 dimetilaminopiridina (DMAP) 1 4-diazabíciclo[2 2 2]octano (DABCO) o 1 8 diazabíciclo[5 4 0]undec-7 eno (DBU) compuestos de organolitio por ejemplo metil litio n butil litio sec-butil litio terc butil litio fenil litio dimetil cobre litio diisopropilamida de litio ciclohexilisopropilamida de litio diciticlohexilamida de litio n butil litio DABCO n butil litio DBU o n butil litio TMEDA

El procedimiento de preparacion (b) puede efectuarse a diversas temperaturas Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 aproximadamente 150°C preferiblemente de aproximadamente 40 aproximadamente 80°C Dicha reaccion puede efectuarse deseablemente bajo presion

normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presión elevada o bajo presión reducida

Al efectuar el procedimiento de preparación (b) el compuesto objetivo de la fórmula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la fórmula (Ia) con 2-20 moles de un compuesto de la fórmula (IV) en presencia de 1-2 moles de metóxido sódico

La reacción del procedimiento de preparación (c) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos de tales diluyentes usados en ese caso pueden mencionarse agua, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano, hexano, ciclohexano, éter de petróleo, ligroína, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno o diclorobenceno, éteres por ejemplo éter etílico, metil-etil éter, éter isopropílico, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF) o éter dimetílico de dietilenglicol (DGM), cetonas por ejemplo acetona, metil-etil cetona (MEK), metil isopropil cetona o metil isobutil cetona (MIBK), nitrilos por ejemplo acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo, alcoholes por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol o etilenglicol, etc., ésteres por ejemplo acetato de etilo o acetato de amilo, amidas de ácido por ejemplo dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona o triamida, hexametilfosforica (HMPA), sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) o sulfolano, bases por ejemplo piridina.

El procedimiento de preparación (c) puede efectuarse a diversas temperaturas. Temperaturas adecuadas están en el intervalo generalmente de aproximadamente 20 aproximadamente 180°C, preferiblemente aproximadamente 60-120°C aproximadamente 120°C. Dicha reacción puede efectuarse deseablemente bajo presión normal. Opcio

nalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presión elevada o bajo presión reducida

Al efectuar el procedimiento de preparación (c) el compuesto objetivo de la fórmula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la fórmula (Ia) con 1 2 moles de un compuesto de la fórmula (V) en un diluyente por ejemplo benceno

La reacción del procedimiento de preparación (d) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos de tales diluyentes usados en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifáticos alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohexano éter de petróleo ligroína, benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1 2 dicloroetano clorobenceno o diclorobenceno éteres por ejemplo éter etílico metil etil éter éter isopropílico éter butílico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) o éter dimetílico de dietilenglicol (DGM) cetonas por ejemplo acetona metil etil cetona (MEK) metil isopropil cetona o metil isobutil cetona (MIBK) nitrilos por ejemplo acetonitrilo propionitrilo o acrilonitrilo alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol butanol o etilenglicol ésteres por ejemplo acetato de etilo o acetato de amilo amidas de ácido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona, 1 3 dimetil 2 imidazolidinona o triamida hexametilfosforica (HMPA) sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) o sulfolano bases por ejemplo piridina

El procedimiento de preparación (d) puede efectuarse en presencia de un catalizador ácido. Como ejemplos de tales catalizadores ácidos utilizables en ese caso pueden mencionarse ácidos minerales por ejemplo ácido clorhídrico ácido sulfúrico ácido nítrico ácido bromhídrico o hidrogenosulfito sódico ácidos orgánicos por

ejemplo ácido fórmico ácido acético ácido trifluoroacético ácido propiónico ácido metanosulfónico ácido bencenosulfónico ácido p toluenosulfónico hidroclozuros de amina orgánica, por ejemplo hidroclozuro de piridina o hidroclozuro de trietilamina sulfonatos de amina, por ejemplo p toluenosulfonato de piridina o p-toluenosulfonato de trietilamina

El procedimiento de preparación (d) puede efectuarse a diversas temperaturas. Temperaturas adecuadas están en el intervalo generalmente, de aproximadamente 20 aproximadamente 180°C preferiblemente aproximadamente 60 aproximadamente 120°C. Dicha reacción puede efectuarse deseablemente bajo presión normal. Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presión elevada o bajo presión reducida.

Al efectuar el procedimiento de preparación (d) puede obtenerse el compuesto objetivo de la fórmula (I) por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la fórmula (Ia) con 2-4 moles de un compuesto de la fórmula (VI) en un diluyente por ejemplo benceno en presencia de una cantidad catalítica de ácido p toluenosulfónico.

La reacción del procedimiento de preparación (e) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos de tales diluyentes usados en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifáticos alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohexano éter de petróleo ligroína benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1,2 dicloroetano clorobenceno o diclorobenceno éteres por ejemplo éter etílico metil etil éter éter isopropílico éter butílico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) o éter dimetílico de dietilenglicol (DGM) cetonas por ejemplo acetona metil-etil cetona (MEK) metil isopropil cetona o metil isobutil cetona (MIBK) nitrilos por ejemplo acetonitrilo

propionitrilo o acilonitrilo alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol, butanol o etilenglicol esteres por ejemplo acetato de etilo o acetato de amilo amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona, 1 3 dimetil 2 imidazolidinona o triamida hexametilfosforica (HMPA) sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) o sulfolano bases por ejemplo piridina

El procedimiento de preparacion (e) puede efectuarse en presencia de un catalizador Como ejemplos de tales catalizadores utilizables en ese caso pueden mencionarse paladio al 10% carbono

El procedimiento de preparacion (e) puede efectuarse a diversas temperaturas Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 aproximadamente 120°C preferiblemente aproximadamente 25 aproximadamente 80°C Dicha reaccion puede efectuarse deseablemente bajo presion normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (e) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la formula (VII) con 1 2 moles de hidrogeno gaseoso en un diluyente, por ejemplo metanol en presencia de una cantidad catalitica de paladio al 10% carbono

Los compuestos activos de la formula (I) de acuerdo con la presente invencion pueden usarse como herbicidas En la presente memoria descriptiva malas hierbas significa, en el sentido mas amplio todas la plantas que crecen en lugares donde no se desean Los compuestos de la presente invencion actuan como herbicidas totales o selectivos dependiendo de la concentracion aplicada Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden usarse por ejemplo para las malas hierbas y los cultivos siguientes

Malas hierbas dicotiledoneas de los generos Sinapis Lepidium, Galium, Stellaria Chenopodium, Urtica Senecio Amaranthus Portulaca, Xanthium Ipomoea, Polygonum, Ambrosia, Cirsium, Sonchus Solanum, Rorippa, Lamium, Veronica, Datura, Viola Galeopsis Papaver Centaurea, Galinsoga, Rotala Lindernia, etc

Cultivos dicotiledoneos de los generos Gossypium Glycine Beta, Daucus Phaseolus Pisum, Solanum, Linum Ipomoea Vicia, Nicotiana Lycopersicon, Arachis Brassica, Lactuca, Cucumis Cucurbita, etc

Malas hierbas monocotiledoneas de los generos Echinochloa Setaria, Panicum Digitaria Phleum, Poa Festuca Eleusine Lolium, Bromus Avena Cyperus Sorghum, Agropyron, Monochoria, Fimbristylis Sagittaria Eleocharis Scirpus Paspalum, Ischaemum Agrostis Alopecurus Cynodon, etc

Cultivos monocotiledoneos de los generos Oryza Zea, Triticum Hordeum, Avena Secale Sorghum, Panicum Saccharum Ananas Asparagus Allium, etc

El uso de los compuestos de acuerdo con la presente invencion, no esta restringido a las plantas mencionadas anteriormente sino que puede aplicarse a otras plantas de la misma manera

De acuerdo con la invencion pueden tratarse todas las plantas y partes de plantas El termino plantas incluye todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas silvestres deseadas o no deseadas y plantas cultivadas (incluyendo variedades cultivadas presentes en la naturaleza) Las plantas cultivadas pueden ser variedades de plantas que se obtuvieron mediante procedimientos de mejora genetica y optimizacion convencionales o mediante metodos biotecnologicos y de manipulacion genetica o una combinacion de tales procedimientos y metodos incluyendo plantas transgenicas e incluyendo variedades de plantas que no pueden o pueden ser protegidas por patentes de plantas o derechos de variedades de plantas Partes de plantas son todas las partes y organismos de plantas presentes por encima o por de-

- - - - -
-

bajo de la superficie del suelo por ejemplo vastagos hojas agujas pedunculos y tallos troncos flores frutos y semillas así como raíces tuberculos bulbos y rizomas El termino partes de plantas tambien incluye cultivos recogidos y material de propagacion por ejemplo esquejes tuberculos bulbos rizomas vástagos y semillas

De acuerdo con la invencion las plantas y las partes de plantas se tratan usando los metodos habituales aplicando los ingredientes activos o las composiciones que los contienen directamente a las plantas o partes de las plantas o a sus alrededores (incluyendo el suelo) o almacén, por ejemplo anadiendo gota a gota, rociando es polvoreando nebulizando extendiendo y en el caso de material de propagacion, tambien al revestir usando una o multiples capas

Los compuestos activos de la presente invencion, dependiendo de la concentracion aplicada, pueden controlar no selectivamente malas hierbas y pueden usarse por ejemplo en terreno industrial vias de tren caminos lugares con o sin plantaciones de arboles

Por otra parte los compuestos activos de acuerdo con la presente invencion, pueden usarse para controlar malas hierbas en cultivos perennes y aplicarse en, por ejemplo deforestaciones plantaciones de arboles decorativos huertos de frutales vinedos arboledas de citricos huertos de nueces plantaciones de platanos plantaciones de café plantaciones de te plantaciones de caucho plantaciones de palma oleaginosa, plantaciones de cacao plantaciones de bayas campos de lupulo etc y pueden aplicarse ademas para el control selectivo de malas hierbas en cultivos anuales

Los compuestos activos de la formula (I) de acuerdo con la presente invencion, pueden elaborarse como las formulaciones normales en caso de uso Como tales formulaciones pueden mencionarse por ejemplo liquidos (concentrados emulsificables etc) polvos humectables emulsiones concentrados para suspensiones

polvos granulos dispersables en agua tabletas granulos concentrados para suspensiones-emulsiones microcapsulas en sustancias polimeras o formulaciones de gran tamaño

Las formulaciones pueden prepararse de acuerdo con metodos conocidos por ejemplo mezclando los compuestos activos con extendedores a saber diluyentes o portadores liquidos y/o solidos y opcionalmente con agentes tensioactivos a saber emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes formadores de espuma

Como diluyentes o portadores liquidos pueden mencionarse por ejemplo hidrocarburos aromaticos (por ejemplo xileno tolueno o alquilnaftaleno) hidrocarburos aromaticos clorados o alifáticos clorados (por ejemplo clorobencenos cloruros de etileno o cloruro de metileno) hidrocarburos alifáticos [por ejemplo ciclohexano o parafinas (por ejemplo fracciones de aceites minerales)] alcoholes (por ejemplo butanol o glicol) y sus eteres esterres etc cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona metil isobutil cetona o ciclohexanona) disolventes fuertemente polares (por ejemplo dimetilformamida o dimetilsulfoxido) o agua En el caso de usar agua como extendedor por ejemplo pueden usarse disolventes organicos como disolventes auxiliares

Como diluyentes o portadores solidos pueden mencionarse por ejemplo minerales naturales triturados (por ejemplo caolin arcilla talco yeso cuarzo atapulgita montmorillonita o tierra diatomacea) minerales sinteticos triturados (por ejemplo acido silicico altamente dispersado alumina o silicatos) etc Como portadores solidos para granulos pueden mencionarse rocas machacadas y fraccionadas (por ejemplo calcita marmol piedra pomez sepiolita y dolomita) o granulos sinteticos de harinas inorganicas y organicas o particulas de materiales organicos (por ejemplo serrin, cascara de coco mazorcas de maiz y pedunculos de tabaco)

Como emulsionantes y/o agentes formadores de espuma pueden mencionarse

por ejemplo emulsionantes no ionicos y anionicos [por ejemplo esterres de acidos grasos de polioxietileno eteres de alcoholes de acidos grasos de polioxietileno (por ejemplo alquilaril poliglicol eteres, alquilsulfonatos alquilsulfatos o arilsulfonatos)] o productos de la hidrolisis de la albumina

Como dispersantes se incluyen, por ejemplo liquido residual de lignin sulfito o metilcelulosa, etc

Tambien pueden usarse adherentes en las formulaciones (polvos granulos formulaciones de gran tamano emulsiones) Como dichos adherentes pueden mencionarse por ejemplo carboximetilcelulosa polimeros naturales y sinteticos (por ejemplo goma arabiga, poli(alcohol vinilico) o poli(acetato de vinilo))

Tambien pueden usarse colorantes Como dichos colorantes pueden mencionarse pigmentos inorganicos (por ejemplo oxido de hierro oxido de titanio y Azul de Prusia) y tintes organicos tales como tintes de alizarina, tintes azoicos o tintes de ftalocianina metalica, y ademas nutrientes traza tales como sales de metales tales como hierro manganeso boro cobre cobalto o molibdeno o zinc

Dichas formulaciones pueden contener en un intervalo de generalmente 0 1 95% en peso preferiblemente 0 5 90% en peso de los componentes activos mencionados anteriormente

Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden usarse como tales o en forma de formulaciones para controlar malas hierbas Tambien pueden usarse como un agente mixto con herbicidas conocidos Tal agente mixto puede prepararse previamente en una forma de formulacion final o puede prepararse mediante mezcladura en tanque con ocasion de la aplicacion Como una pareja de mezcladura para una posible combinacion pueden mencionarse por ejemplo herbicidas del tipo de la sulfonilurea para uso en arrozales

Ademas los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion

tambien pueden mezclarse con un asegurador y su aplicacion como un herbicida selectivo puede ampliarse mediante tal mezcladura. Como un ejemplo del asegurador para ese proposito puede mencionarse 1 (α α dimetilbencil) 3 p tolilurea.

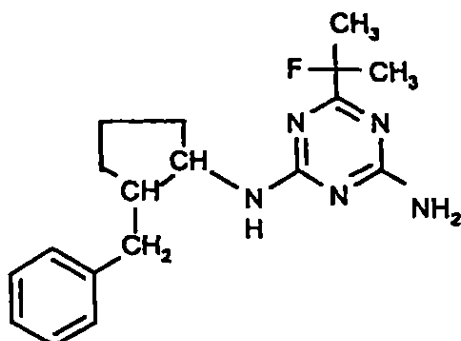
Sorprendentemente algunas de las parejas de mezcladura de los compuestos de la presente invencion muestran efectos sinergicos.

En el caso de usar los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion, pueden emplearse directamente como tales o en las formas de formulación mencionadas anteriormente o aplicarse en las formas de aplicacion preparadas mediante dilucion adicional. Pueden aplicarse por medio de, por ejemplo, rociadura, atomizacion, espolvoreo o aplicacion de granulos.

Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden aplicarse en cualesquiera fases antes y despues de la germinacion de las plantas. Tambien pueden absorberse en el suelo antes de sembrar.

La dosis de aplicacion de los compuestos activos de la presente invencion no esta estrictamente restringida sino que puede variarse en un amplio intervalo de acuerdo con el efecto deseado, el tipo de planta objetivo, el lugar y el periodo de aplicacion. En el caso de uso herbicida, como las dosis de aplicacion pueden mencionarse, por ejemplo, intervalos de aproximadamente 0.001 a aproximadamente 5 kg, preferiblemente de aproximadamente 0.05 a aproximadamente 2 kg de los compuestos activos por hectarea.

A continuacion, las preparaciones y las aplicaciones de los compuestos de la presente invencion se describiran mas especificamente mediante los siguientes ejemplos. Sin embargo, la presente invencion no debe restringirse a ellos de ningun modo. 'Partes' son 'partes en peso' a no ser que se especifique.

Ejemplo de Síntesis 1

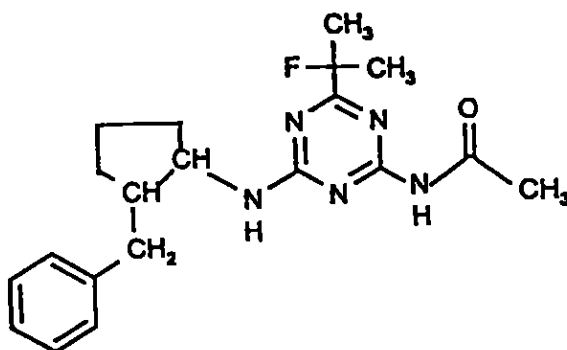
Se anadio lentamente gota a gota 2 bencilciclopentilamina (3 g) a acido clorhidrico concentrado (3.6 ml) bajo enfriamiento con hielo. Despues de la agitacion de la mezcla durante 30 minutos se separo por destilacion agua bajo presion reducida para obtener hidrocioruro de 2 bencilciclopentilamina (3.1 g).

Se suspendieron el hidrocioruro de 2 bencilciclopentilamina mencionado anteriormente (3.1 g) y cianoguanidina (1.23 g) en n decano (30 ml) y se calentaron a 130 °C durante 4.5 horas. Despues del enfriamiento los cristales depositados se filtraron, se lavaron con n hexano y se secaron bajo presion reducida para obtener hidrocioruro de 2 bencilciclopentilbiguanida (3 g).

Despues de anadir sodio (0.31 g) en 12 ml de metanol seco y agitar durante 5 minutos se anadio el hidrocioruro de 2 bencilciclopentilbiguanida mencionado anteriormente (2 g) y la mezcla se agito a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuacion se anadio a la mezcla α fluoro α metilpropionato de metilo (1.62 g) que se agito a temperatura ambiente durante 10 horas. Posteriormente se anadieron 50 ml de agua y el producto de reaccion se extrajo con acetato de etilo. Despues de secar con sulfato sodico anhidro el acetato de etilo se separo por destilacion bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente hexano acetato de etilo = 1:1) para obtener 2-amino-4-(2-benzylcyclopentyl)-6-(2,2-dimethyl-5-fluorophenyl)pyrimidine.

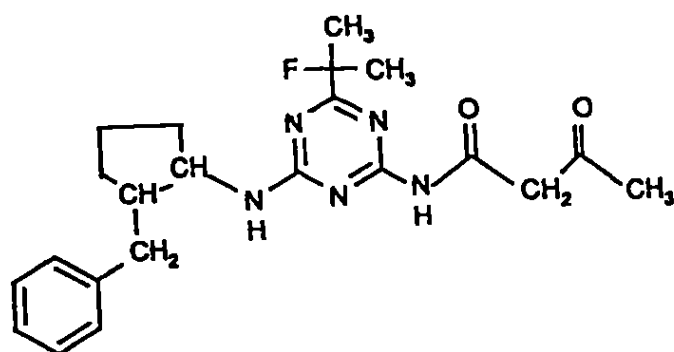
bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil)-1 3 5 triazina (1 65 g) p f 50 55 C

Ejemplo de Sintesis 2



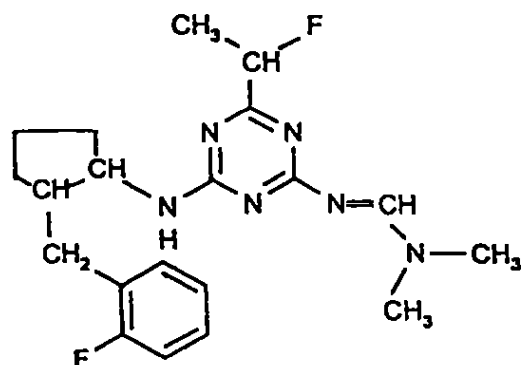
Despues de anadir sodio (0 1 g) en metanol seco (5 ml) y agitar durante 5 minutos se anadio 2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina (1 g) y la mezcla se agitó a 50°C durante 1 hora Despues de enfriar el metanol se separo por destilacion bajo presion reducida A continuacion, se anadio acetato de etilo (10 ml) y la mezcla se agito a 50°C durante 1 hora Despues de en friar se anadio agua (30 ml) y el producto de reaccion se extrajo con acetato de etilo Despues de secar con sulfato sodico anhidro el acetato de etilo se separo por destilacion bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente hexano acetato de etilo = 3 2) para obtener 2 acetilamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil)-1 3 5 triazina (0 57 g)

$n_{D_{20}}^{20}$ 1 5512

Ejemplo de Sintesis 3

Se disolvieron 2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina (0 5 g) y acetil acido de Meldrum (0 28 g) en benceno (20 ml) y se sometieron a reflujo durante 1 hora con calentamiento. Despues de enfriar el disolvente se separo por destilacion bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente hexano acetato de etilo = 3 2) para obtener 2 acetoacetilamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina (0 55 g)

n_D^{20} 1 5433

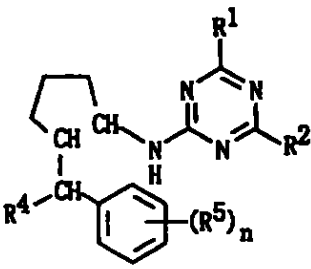
Ejemplo de Sintesis 4

Se disolvieron 2 amino 4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (1 fluoroetil) 1 3 5 triazina (0 3 g) dimetilacetal de N N dimetilformamida (0 32 g) y una cantidad catalitica de monohidrato de acido p toluenosulfonico en benceno (20

ml) y se sometieron a reflujo durante 1 5 horas con calentamiento. Después de enfriar el disolvente se separó por destilación bajo presión reducida y el residuo se trató mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente diclorometano/metanol = 90/5) para obtener 2 N N dimetilmetilenimino-4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (1 fluoroetil) 1 3 5 triazina (0 34 g)
 n_D^{20} 1 5776

Los compuestos que pueden obtenerse de la misma manera que en los Ejemplos de Síntesis 1 a 4 mencionados anteriormente se muestran en la Tabla 1 siguiente junto con compuestos sintetizados de acuerdo con los Ejemplos de Síntesis 1 a 4

Tabla 1



Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
1	CH ₃	NH ₂	H	H	
2	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
3	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
4	C ₃ H ₇ -iso	NH ₂	H	H	
5	C ₄ H ₉ n	NH ₂	H	H	
6	C ₄ H ₉ sec	NH ₂	H	H	
7	C ₄ H ₉ iso	NH ₂	H	H	
8	C ₄ H ₉ terc	NH ₂	H	H	
9	C ₆ H ₁₁ n	NH ₂	H	H	
10		NH ₂	H	H	
11		NH ₂	H	H	
12		NH ₂	H	H	
13		NH ₂	H	H	
14		NH ₂	H	H	
15	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
16	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
17	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
18	CHFCl	NH ₂	H	H	
19	CHFBBr	NH ₂	H	H	
20	CFCl ₂	NH ₂	H	H	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
21	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
22	CHF ₂	NH ₂	H	H	
23	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
24	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
25	CF ₃	NH ₂	H	H	
26	CCl ₃	NH ₂	H	H	
27	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	1 5557
28	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	1 5525
29	CH ₃ CHF	N=CN(CH ₃) ₂	H	2 F	1 5776
30	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3F	1 5485
31	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4F	
32	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	1 5420
33	CH ₂ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
34	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
35	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
36	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	50 55°C
37	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	1 5469
38	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	1 5239
39	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
40	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
41	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
42	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
43	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
44	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Br	
45	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
46	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	1 5359
47	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
48	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 C ₂ H ₅	
49	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₂ H ₅	
50	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ n	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
51	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ iso	
52	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₄ H ₉ terc	
53	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
54	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
55	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CF ₃	
56	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
57	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
58	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
59	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OC ₂ H ₅	
60	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OC ₂ H ₅	
61	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OC ₃ H ₇ iso	
62	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCF ₃	
63	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCF ₃	
64	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCHF ₂	
65	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₂ CF ₃	
66	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
67	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCH ₃	
68	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SC ₂ H ₅	
69	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 S(O)CH ₃	
70	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 S(O)CH ₃	
71	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SO ₂ CH ₃	
72	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SO ₂ CH ₃	
73	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCF ₃	
74	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCF ₃	
75	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₂ CF ₃	

Tabla 1 (continuación)

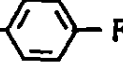
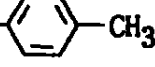
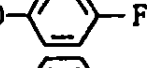
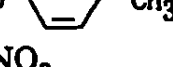
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
76	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
77	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4- 	
78	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
79	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
80	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
81	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
82	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
83	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
84	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 NO ₂	
85	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CN	
86	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 F ₂	
87	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 F ₂	
88	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
89	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 Cl ₂	
90	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 Cl ₂	
91	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 Cl ₂	
92	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 (CH ₃) ₂	
93	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (CH ₃) ₂	
94	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
95	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CF ₃) ₂	
96	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (OCH ₃) ₂	
97	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 3 4 Cl ₃	
98	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 6 (CH ₃) ₃	
99	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
100	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	1 5512

Tabla 1 (continuación)

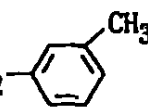
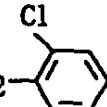
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
101	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
102	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ n	H	H	
103	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ -iso	H	H	
104	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H ₉ terc	H	H	
105	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
106	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
107	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
108	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
109	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
110	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
111	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
112	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
113	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
114	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
115	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

Tabla 1 (continuación)

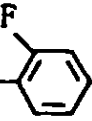
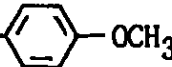
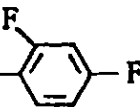
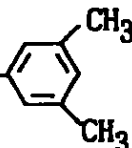
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
116	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
117	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
118	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
119	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
120	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
121	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	1 5433
122	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
123	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
124	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
125	ClCH ₂ ClCH ₂	NH ₂	H	H	
126	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
127	CHFCH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
128	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
129	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
130	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	

Tabla 1 (continuación)

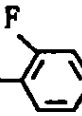
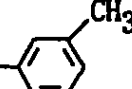
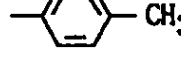
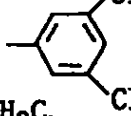
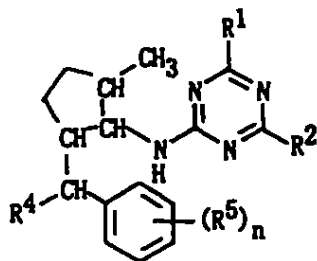
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pfo n ^D ₂₀
131	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
132	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
133	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
134	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
135	- 	NH ₂	H	H	
136	- 	NH ₂	H	H	
137	- 	NH ₂	H	H	
138	- 	NH ₂	H	H	
139	- 	NH ₂	H	H	
140	- 	NH ₂	H	H	
141	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
142	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
143	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
144	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
145	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
146	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
147	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	
148	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
149	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
150	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
151	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
152	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
153	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
154	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
155	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
156	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
157	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
158	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
159	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
160	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
161	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
162	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
163	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
164	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
165	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
166	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
167	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
168	CF ₃	NH ₂	H	H	
169	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
170	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
171	CF ₃	NH ₂	H	4-F	
172	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
173	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
174	CF ₃	NH ₂	H	4 Cl	
175	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
176	CF ₃	NH ₂	H	3 CF ₃	
177	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
178	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
179	CF ₃	NH ₂	H	4-CH ₃	
180	CF ₃	NH ₂	H	2 OCH ₃	
181	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
182	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
183	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
184	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
185	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
186	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
187	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
188	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
189	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
190	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	

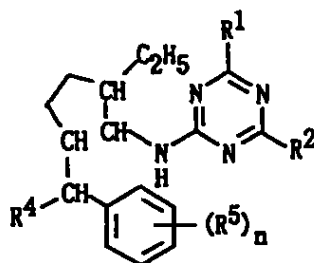
Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
191	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
192	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	
193	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
194	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
195	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 CH ₃	
196	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
197	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
198	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
199	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
200	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
201	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
202	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
203	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
204	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
205	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
206	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
207	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
208	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
209	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
210	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
211	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
212	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
213	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
214	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
215	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	

Tabla 1 (continuacion)

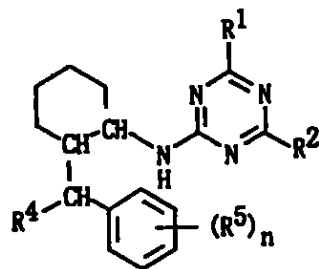
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
216	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
217	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
218	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
219	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
220	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
221	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
222	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
223	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	
224	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
225	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
226	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
227	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
228	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
229	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
230	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
231	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

Tabla 1 (continuación)



Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
232	CF ₃	NH ₂	H	H	
233	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
234	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
235	CF ₃	NH ₂	H	3 5 F ₂	
236	CF ₃	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
237	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
238	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
239	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
240	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
241	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
242	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
243	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
244	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
245	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
246	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
247	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
248	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
249	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
250	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
251	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
252	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

Tabla 1 (continuacion)



Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
253	CH ₃	NH ₂	H	H	
254	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
255	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
256	C ₃ H ₇ iso	NH ₂	H	H	
257	C ₄ H ₉ n	NH ₂	H	H	
258	C ₄ H ₉ sec	NH ₂	H	H	
259	C ₄ H ₉ iso	NH ₂	H	H	
260	C ₄ H ₉ terc	NH ₂	H	H	
261	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
262		NH ₂	H	H	
263		NH ₂	H	H	
264		NH ₂	H	H	
265		NH ₂	H	H	
266		NH ₂	H	H	
267	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
268	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
269	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
270	CHFCl	NH ₂	H	H	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
271	CHFB _r	NH ₂	H	H	
272	CFCl ₂	NH ₂	H	H	
273	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
274	CHF ₂	NH ₂	H	H	
275	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
276	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
277	CF ₃	NH ₂	H	H	
278	CCl ₃	NH ₂	H	H	
279	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
280	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
281	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	60 66°C
282	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
283	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
284	CH ₂ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
285	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
286	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
287	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	1 5332
288	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
289	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	72 80°C
290	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
291	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
292	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
293	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
294	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
295	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Br	
296	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
297	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
298	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
299	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 C ₂ H ₅	
300	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₂ H ₅	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
301	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ n	
302	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ iso	
303	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₄ H ₉ terc	
304	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
305	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
306	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CF ₃	
307	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
308	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
309	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
310	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OC ₂ H ₅	
311	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OC ₂ H ₅	
312	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ iso	
313	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCF ₃	
314	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCF ₃	
315	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCHF ₂	
316	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₂ CF ₃	
317	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
318	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCH ₃	
319	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SC ₂ H ₅	
320	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 S(O)CH ₃	
321	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 S(O)CH ₃	
322	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SO ₂ CH ₃	
323	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SO ₂ CH ₃	
324	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCF ₃	
325	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCF ₃	

Tabla 1 (continuación)

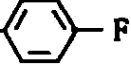
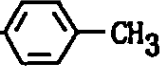
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
326	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCH ₂ CF ₃	
327	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
328	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4- 	
329	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
330	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
331	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
332	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
333	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 NO ₂	
334	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CN	
335	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 F ₂	
336	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 F ₂	
337	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
338	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 Cl ₂	
339	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 Cl ₂	
340	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 Cl ₂	
341	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 (CH ₃) ₂	
342	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (CH ₃) ₂	
343	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
344	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CF ₃) ₂	
345	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (OCH ₃) ₂	

Tabla 1 (continuación)

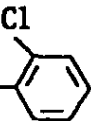
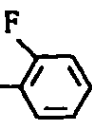
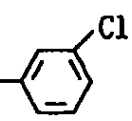
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
346	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 3 4 Cl ₃	
347	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 6 (CH ₃) ₃	
348	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
349	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	
350	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
351	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ n	H	H	
352	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ iso	H	H	
353	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H ₉ terc	H	H	
354	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
355	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
356	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
357	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
358	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
359	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
360	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
361	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
362	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
363	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
364	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
366	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

Tabla 1 (continuacion)

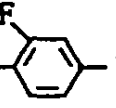
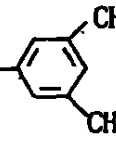
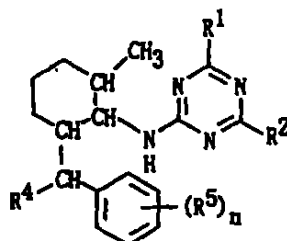
Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pfo n ^D ₂₀
366	(CH ₃) ₂ CF	NHCO-  -OCH ₃	H	H	
367	(CH ₃) ₂ CF	NHCO-  -F	H	H	
368	(CH ₃) ₂ CF	NHCO-  -CH ₃	H	H	
369	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	
370	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
371	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
372	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
373	CH ₂ ClCH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
374	CH ₃ CF ₃	NH ₂	H	H	
375	CHF CF ₃	NH ₂	H	H	
376	CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
377	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
378	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	
379	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
380	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
381	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
382	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
383	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
384	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
385	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
386	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
387	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
388	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
389	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
390	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
391	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
392	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
393	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
394	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
395	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
396	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
397	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
398	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
399	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
400	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
401	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
402	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
403	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
404	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
405	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

Tabla 1 (continuacion)

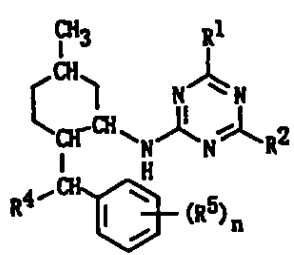


Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
406	CF ₃	NH ₂	H	H	
407	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
408	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
409	CF ₃	NH ₂	H	4 F	
410	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
411	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
412	CF ₃	NH ₂	H	4 Cl	
413	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
414	CF ₃	NH ₂	H	3 CF ₃	
415	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
416	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
417	CF ₃	NH ₂	H	4 CH ₃	
418	CF ₃	NH ₂	H	2 OCH ₃	
419	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
420	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
421	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
422	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
423	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
424	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
425	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
426	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
427	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
428	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	
429	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
430	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
431	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
432	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
433	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-CH ₃	
434	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
435	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
436	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
437	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
438	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
439	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
440	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
441	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
442	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
443	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
444	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-Cl	
445	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
446	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
447	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
448	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
449	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
450	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
451	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
452	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
453	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
454	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
455	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 SCH ₃	
456	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
457	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
458	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
459	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
460	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
461	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
462	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
463	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

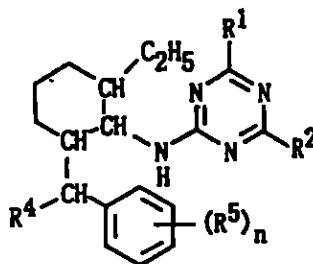
Tabla 1 (continuacion)



Comp					pf o n ^D ₂₀
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	
464	CF ₃	NH ₂	H	H	
465	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
466	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
467	CF ₃	NH ₂	H	4 F	
468	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
469	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
470	CF ₃	NH ₂	H	4 Cl	
471	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
472	CF ₃	NH ₂)	H	3 CF ₃	
473	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
474	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
475	CF ₃	NH ₂	H	4 CH ₃	
476	CF ₃	NH ₂	H	2-OCH ₃	
477	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
478	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
479	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
480	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
481	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-F	
482	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
483	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
484	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
485	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
486	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	
487	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
488	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	
489	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
490	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	

Tabla 1 (continuacion)

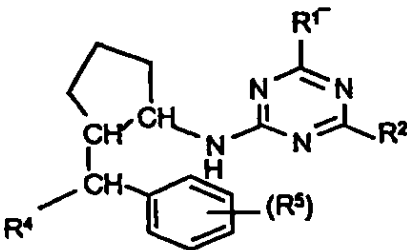
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
491	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 CH ₃	
492	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
493	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
494	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
495	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
496	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
497	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
498	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
499	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
500	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
501	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
502	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
503	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
504	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
505	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
506	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
507	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
508	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
509	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
510	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
511	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
512	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
513	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
514	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5-F ₂	
515	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
516	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
517	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
518	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
519	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
520	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
521	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
522	CF ₃	NH ₂	H	H	
523	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
524	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
525	CF ₃	NH ₂	H	3 5 F ₂	
526	CF ₃	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
527	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
528	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
529	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
530	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
531	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
532	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
533	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
534	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
535	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
536	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
537	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
538	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
539	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
540	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
541	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
542	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

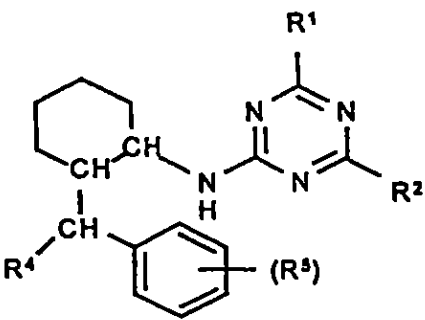
Los compuestos obtenidos usando yoduro de metilo yoduro de etilo o yoduro de propilo en lugar de los compuestos de la formula (IV) en el procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente se muestran en las siguientes Tablas 2 y 3

Tabla 2



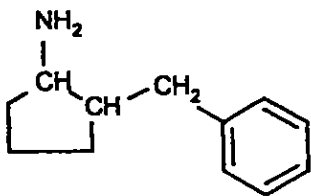
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
543	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
544	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
545	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H ₇ n	H	H	

Tabla 3



Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
546	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
547	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
548	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H ₇ n	H	H	

Ejemplo de Sintesis 5

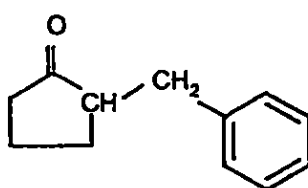


Se calento una mezcla de 2 bencilciclopentanona (11 51 g) y formamida (44 41 ml) a 140 150°C A continuacion, se anadio lentamente a la mezcla gota a gota acido formico (9 13 g) a la temperatura dada Despues de terminar la adiccion, la mezcla se calento a 150°C durante 2 horas mas Despues de enfriar se anadio agua a la mezcla y el producto de reaccion se extrajo con cloruro de metileno La capa de cloruro de metileno se lavo con agua y se seco con sulfato sodico anhidro Despues de que el cloruro de metileno se separara por destilacion bajo presion reducida, se anadio acido clorhidrico concentrado (36 85 ml) al residuo y se sometio a reflujo

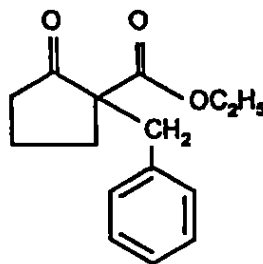
durante 2 horas mediante calentamiento. Después de enfriar se añadió agua, se alcalinizó con hidróxido sodico y el producto se extrajo con cloruro de metileno. La capa de cloruro de metileno se lavó con agua y se secó con carbonato potásico anhidro. Después de que el cloruro de metileno se separara por destilación bajo presión reducida, el residuo se purificó mediante destilación para obtener 2 bencilciclopentilamina (5.18 g)

$$n_D^{20} = 1.5371$$

Ejemplo de Síntesis 6



Se añadió ácido bromhídrico al 48% (50 ml) a 2-bencil-2-etoxycarbonilciclopentanona (23.7 g) y se sometió a reflujo a 120°C durante 4 horas calentando. Después de enfriar se añadió hielo (100 g) a la mezcla y el producto de reacción se extrajo con éter dietílico. Después de lavar la capa de éter dietílico con agua, una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sodico y una solución acuosa saturada de cloruro sodico se secó con sulfato sodico anhidro. Después de que el éter dietílico se separa por destilación bajo presión reducida, el residuo se purificó mediante destilación para obtener 2-bencilciclopentanona (11.51 g) $n_D^{20} = 1.5288$

Ejemplo de Síntesis 7

Se añadieron hidrogenosulfato de tetrabutilamonio (29.1 g) y yoduro de bencilo (37.37 g) a una solución de 2-etoxycarbonilciclopentanona (13.37 g) en cloruro de metileno (143 ml) y a continuación se añadió una solución de hidróxido sódico (6.86 g) en agua (143 ml). Después de que la mezcla se agitara a temperatura ambiente durante 4 horas, la capa de cloruro de metileno se separó y la capa acuosa se extrajo con cloruro de metileno (200 ml, 3 veces). Las capas de cloruro de metileno se reunieron, se lavaron con agua, solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico y solución acuosa saturada de cloruro sódico, y se secaron con sulfato sódico anhidro. Después de que el cloruro de metileno se separara por destilación bajo presión reducida, el residuo se trató mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente hexano/acetato de etilo = 9/1) para obtener 2-bencil-2-etoxycarbonilciclopentanona (16.8 g). $n_D^{20} = 1.5156$

Ejemplo de Ensayo 1 Ensayo para el efecto herbicida contra malas hierbas de arrozales

Preparación de una formulación del compuesto activo

Portador Acetona 5 partes en peso

Emulsionante Benciloxipoliglicoleter 1 parte en peso

Se obtiene una formulación de la sustancia activa como emulsión mezclando 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad mencionada anteriormente de portador y emulsionante. Una cantidad prescrita de dicha solución de ingredientes

activos se diluye con agua y se usa para el ensayo

Metodo de ensayo

En un invernadero se transplantaron 3 plantulas de arroz (cultivar Nihonbare) de la fase foliar 2 5 (15 cm de alto) a una maceta de 500 cm² con suelo de arrozal. A continuacion, se sembraron semillas de pata de gallina, flor chica, junquillo, monoconia y malas hierbas de hojas anchas (pimpinela falsa comun, *Rotala indica*, elatinacea de tallo largo, *Ammannia multiflora* Roxb, *Dopatrium junceum* Hammilt etc.) y se vertio agua hasta una altura de aproximadamente 2 3 cm.

Cinco dias despues del transplante del arroz, se aplico a la superficie del agua una solucion de cada compuesto activo preparado de acuerdo con el metodo de preparacion mencionado anteriormente. El efecto herbicida se examino el dia despues de 3 semanas desde el tratamiento, periodo durante el cual se mantenía la altura del agua de 3 cm. El efecto herbicida se valoro como 100% en el caso de la destruccion completa y como 0% en el caso de ausencia de efecto herbicida.

Como resultado, los compuestos de la presente invencion N° 27, 30, 32 y 36 mostraban en una dosis de aplicacion de 0 25 kg/ha de compuesto activo un efecto herbicida suficiente contra malas hierbas de arrozales y mostraban seguridad para el arroz transplantado.

Ejemplo de Formulaci3n 1 (Granulo)

Se anade agua (25 partes) a una mezcla del compuesto N° 36 de la presente invencion (10 partes), bentonita (montmorillonita) (30 partes), talco (58 partes) y sal de ligninsulfonato (2 partes). La mezcla se amasa bien, se convierte en granulos de malla 10 40 mediante una granuladora de extrusion y se seca a 40 50°C para obtener un granulo.

Ejemplo de Formulacion 2 (Granulo)

Se ponen en un mezclador giratorio particulas minerales de arcilla que tienen

una distribución del tamaño de las partículas de 0.2-2 mm (95 partes) Mientras se hace girar el compuesto N° 27 de la presente invención (5 partes) se rocía junto con un diluyente líquido se humedece uniformemente en el mezclador y se seca a 40 50°C para obtener un granulo

Ejemplo de Formulacion 3 (Concentrado emulsionable)

Se mezclan y se agitan para obtener una emulsion el compuesto N° 32 de la presente invencion (30 partes) xileno (5 partes) polioxietilentalquil fenil eter (8 partes) y alquilbencenosulfonato calcico (7 partes)

Ejemplo de Formulacion 4 (Polvo humectable)

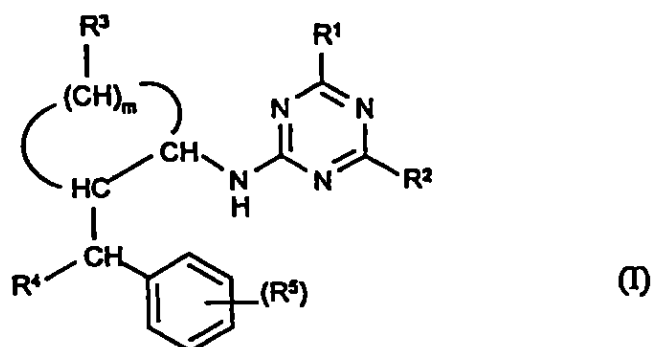
Se mezclan en forma de polvo y se convierten en un polvo humectable el compuesto N° 30 de la presente invencion (15 partes) una mezcla de carbono blanco (polvos finos de oxido de silicio amorfo hidratado) y arcilla en polvo (1.5) (80 partes) alquilbencenosulfonato sodico (2 partes) y polimero de alquilnaftalenosulfonato sodico-formalina (3 partes)

Ejemplo de Formulacion 5 (Granulo dispersable en agua)

Se mezclan bien el compuesto N° 36 de la presente invencion (20 partes) ligninsulfonato sodico (30 partes) bentonita (15 partes) y polvo de tierra diatomacea calcinada (35 partes) se anade agua se extruyen usando un tamiz de 0.3 mm y se secan para obtener granulos dispersables en agua

Reivindicaciones

1 Un compuesto de la formula general (I)



en el que

- R^1 representa alquilo de 1 a 5 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono
- R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenil carbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino
- R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de

1 a 4 átomos de carbono

R^5 representa halogeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 1 a 4

los sustituyentes R^3 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un número entero de 2 o más

n representa un número entero de 0-5 y

los sustituyentes R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

2 Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el que

R^1 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 5 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente susti

tuido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con cloro (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 3 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^5 representa fluoro cloro bromo metilo etilo n propilo isopropilo terc butilo halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono) (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 2-4 en donde los sustituyentes R^3 pueden ser idénticos o diferentes

n representa un número entero de 0-4 y

los sustituyentes R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

③ Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el que

R^1 representa metilo etilo n propilo isopropilo terc butilo ciclopropilo ciclo butilo fluorometilo fluoroclorometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobro

mometilo trifluorometilo clorometilo triclorometilo bromometilo 1
 fluoroetilo 2 2 2 trifluoroetilo 1 2 2 2 tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1
 cloroetilo 1 2 dicloroetilo 1 bromoetilo perfluoropropilo 1 fluoro 1
 metiletilo 1 cloro 1 metiletilo 1 bromo-1 metiletilo 1 (trifluorometil) 2 2 2
 trifluoroetilo bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o
 sustituido con metilo o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con
 fluoro sustituido con cloro o sustituido con metilo

R^2 representa amino metilamino etilamino formilamino acetilamino etilcar
 bonilamino ciclopropilcarbonilamino fluorometilcarbonilamino trifluoro
 metilcarbonilamino 1 fluoroetilcarbonilamino perfluoroetilcarbonilamino
 bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con cloro o
 sustituido con metilo fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sus
 tituido con fluoro sustituido con cloro sustituido con metilo o sustituido con
 metoxi acetoacetilamino o dimetilaminometilidenamino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno metilo o
 etilo

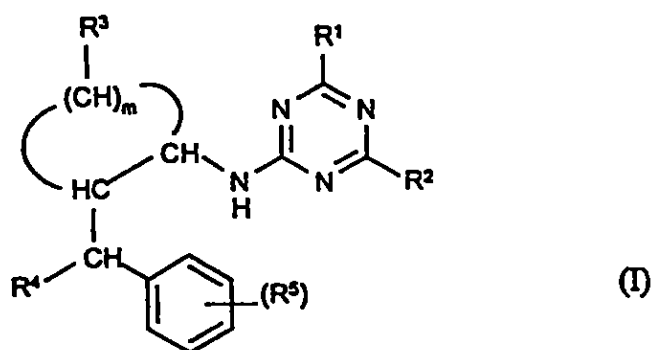
R^5 representa fluoro cloro metilo etilo trifluorometilo metoxi etoxi trifluo
 rometoxi metiltio trifluorometiltio metilsulfinilo metilsulfonilo fenilo que
 puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo fe
 noxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con
 metilo nitro o ciano

m representa un número entero de 3 4 en donde los sustituyentes R^3 pueden ser
 idénticos o diferentes

n representa un número entero de 0 3 y

los sustituyentes R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un
 número entero de 2 o 3

4 Un procedimiento para la preparacion de los compuestos de la formula (I)



en la que

R^1 representa alquilo de 1 a 5 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 atomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 atomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono fenil carbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halogeno (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 atomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 atomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un atomo de hidrogeno o alquilo de 1 a 4 atomos de carbono

R^3 representa halogeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 1-4

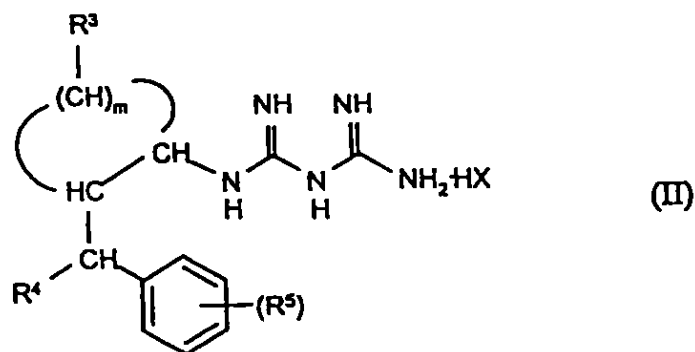
los sustituyentes R^3 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un número entero de 2 o más

n representa un número entero de 0-5 y

los sustituyentes R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

caracterizado porque

a) en caso de que R^2 represente amino
compuestos de la fórmula (II)



en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anterior

mente y

X representa halogeno preferiblemente cloro o bromo

se hacen reaccionar con compuestos de la formula (III)



en la que

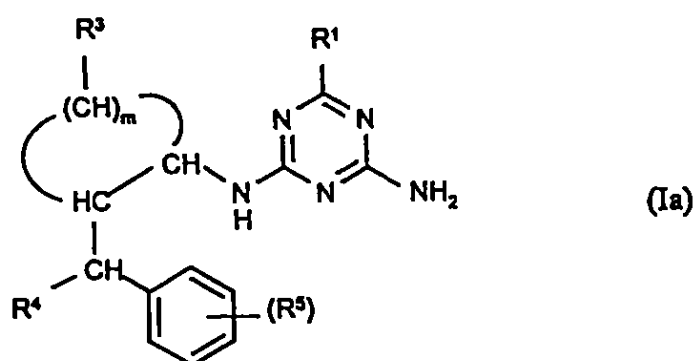
R^1 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente

R^6 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente metilo o etilo

en presencia de un disolvente inerte y si es apropiado en presencia de un agente que se une a los acidos

o

b) en caso de que R^2 represente formilamino (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 atomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halogeno compuestos de la formula (Ia)



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente

se hacen reaccionar con compuestos de la formula (IV)



en la que

R^6 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente

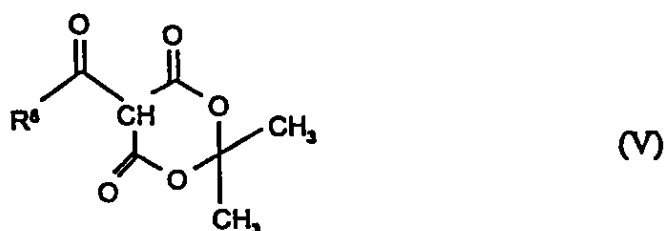
R^7 representa un atomo de hidrogeno alquilo de 1 a 4 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 6 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 atomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halogeno

en presencia de un disolvente inerte y si es apropiado en presencia de un agente que se une a los acidos

o

c) en caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilacetilamino

los compuestos de la formula (Ia) se hacen reaccionar con compuestos de la formula (V)



en la que

R^8 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 atomos de carbono en presencia de un disolvente inerte

o

d) en caso de que R^2 represente di(alquil de 1 a 4 atomos de carbono)(alquiliden de 1 a 4 atomos de carbono)amino

los compuestos de la formula (Ia) se hacen reaccionar con compuestos de la formula (VI)



en la que

R^6 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente

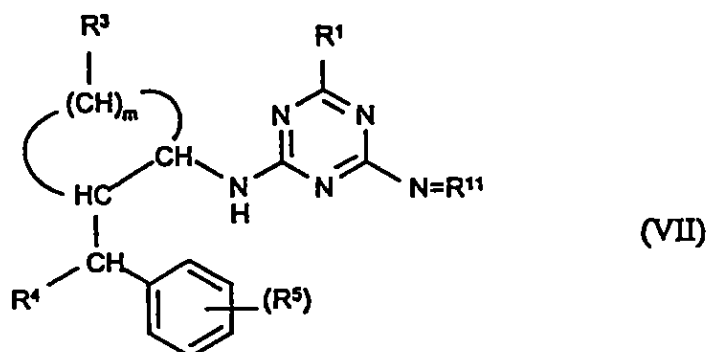
R^9 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 atomos de carbono y

R^{10} representa un atomo de hidrogeno o alquilo de 1 a 3 atomos de carbono preferiblemente un atomo de hidrogeno metilo o etilo

en presencia de un disolvente inerte y si es apropiado en presencia de un catalizador acido

o

- e) en caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino compuestos de la fórmula (VII)



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

R^{11} representa alquildeno de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquildeno de 1 a 3 átomos de carbono

se reducen en presencia de un disolvente inerte y en presencia de catalizador

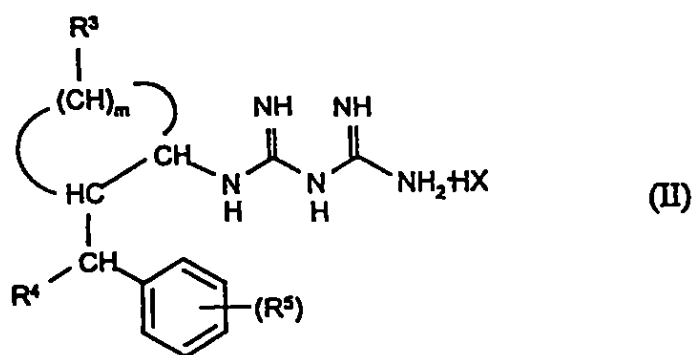
5 Una composición herbicida, caracterizada porque contiene al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1

6 Un procedimiento para combatir malas hierbas caracterizado porque se deja actuar un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 sobre malas hierbas y/o su hábitat

7 Uso de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 para combatir malas hierbas

8 Un procedimiento para la preparación de composiciones herbicidas caracterizado porque se mezcla un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 con extendedores y/o agentes tensioactivos

9 Un compuesto de la formula general (II)



en el que

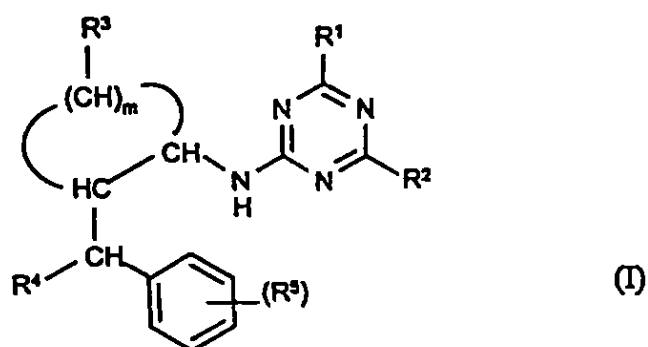
R^3 R^4 R^5 m y n tiene las mismas definiciones que se describen en la reivindicacion

1 y

X representa halogeno

Resumen

La invencion se refiere a nuevos derivados de 1 3 5 triazina representados por la formula general (I)



en la que

R^1 R^2 R^3 R^4 m , n y R^5 se definen segun se describe en la memoria descriptiva

y a multiples procedimientos y productos intermedios para su preparacion asi como a su uso como herbicidas



CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA
TOKIO JAPON

08733
06028

El suscrito Encargado de las Funciones Consulares en
Tokio vistos los siguientes documentos:

- 1) Certificado de registro mercantil de la
compañia
- 2) Certificado autentico sobre autorizacion para
otorgar el poder

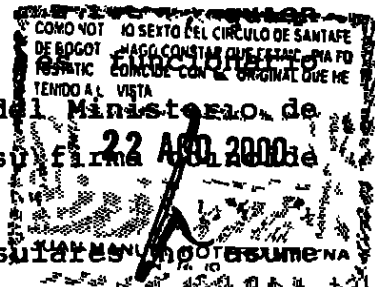
C E R T I F I C A

Que la compaña NIHON BAYER AGROCHEM K K - - - - -
es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes
del Japon y cumple su objeto social conforme a las
mismas

Que el señor KOICHI TATENO - - - - - en su
caracter de PRESIDENT
de la citada compaña esta autorizado para conferir
el poder adjunto

Que el señor TAKEO SAITO - - - - -
autentica el mencionado documento
autorizado de la Division Consular del Ministerio de
Relaciones Exteriores del Japon y su firma coincide
con la registrada en este Consulado

El Encargado de las Funciones Consulares asume
responsabilidad alguna por el contenido del documento
adjunto



Tokio 2 de Agosto de 1994



Ricardo Duarte
Segundo Secretario
Encargado de
Las Funciones Consulares

Berna de R. de M. Armas
Traductora e Interpret
Resolución 683 Ministerio 1994

Numero 82

Derechos US\$106 (Resolucion 2570 Sep 30/92)
(Ciento seis dolares)

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

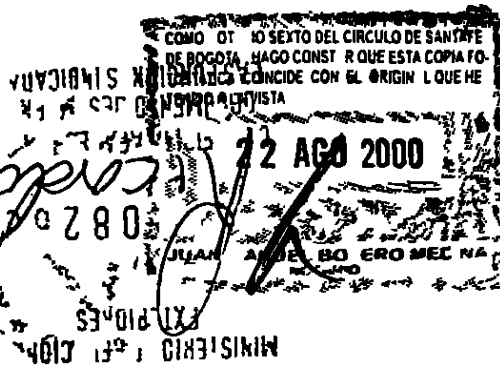


Demanda R. d. S. R. H. H. H.
Graduadora d. Temp. de Oficial
Resolución en el momento 1891

DEF. DE LA
SANTAFE DE BOGOTA D. C.

INLET - E. A. H. 45

RESPONSABILIDAD DE TEXTO



CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SUKAI
CARRERA 4ª N° 72-35
BOGOTÁ 8 COLOMBIA



REPRESENTACION Y PODER

Para patentes, modelos y dibujos marcas de fábrica y de servicios nombres comerciales y enseñas.

Für Patente Modelle und Zeichnungen Warenzeichen und Servicezeichen Handelsnamen-und zeichen

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)/Yo (nosotros) abajo firmado (s)
NIHON BAYER AGROCHEM K K

wohnhaft in/domiciliado(s) en
4-10-8 Takanawa Minato-Ku, Tokyo, Japan

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832 GONZALO PERDOMO tpa. 831 ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519 y EMILIO FERRERO tpa. 31929 domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35 Bogotá Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el para grafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero o el tercero al segundo. En tales casos el representante principal, o el primero o segundo suplente en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público o Cónsul de Colombia en el extranjero y si se tratare de impedimento con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente en su caso podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso asumiéndola por el solo hecho de ejercerla cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso. Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo(amos) a los dichos apoderados para que me(nos) representen ante cualesquiera entidades o personas ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo contencioso administrativo y judicial en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales el registro de marcas de fábrica colectivas defensivas y de servicios el depósito de nombres comerciales y enseñas su renovación, traspaso cambio de nombre o domicilio cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares con cesión de licencias y en general los juicios civiles penales administrativos o contencioso administrativos relacionados con estos derechos acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato transigir desistir cancelar recibir renunciar y ratificar los actos hechos por agentes oficiosos

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832 GONZALO PERDOMO tpa. 831 ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519 und EMILIO FERRERO tpa. 31929 wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72 35 Bogotá Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter beziehungsweise als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Fälle der Hauptvertreter oder der erste oder der zweite Stellvertreter beziehungsweise oder beide werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung auszuüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten oder Kolumbianischen Konsul im Auslande und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise beendeten, einer oder anderen, ordnungswise werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise. Ausserdem und unter demselben Recht, wir verleihen den genannten Bevollmächtigten die Vollmacht und um den Schutz meines unsers industriellen Eigentums zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb zu dessen Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n) damit sie uns vorbehaltigen Institutionen oder Personen die die Rechtsprechung ausüben oder nicht vor allem von denen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs- und juristischem Charakter in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen und Zeichnungen Registrierung von Waren Sammel-Defensive- und Servicezeichen Aufbewahrung von Handelsnamen und zeichen ihre Erneuerung und Übertragung Names und Wohnsitzänderung freiwillige Annulierung und die Registrierung von Vertragslizenzen b) Die Oppositionsklagen Annulierung Ungültigkeit Vorsichtsmaßnahmen Lizenzen und im allgemeinen die Zivil Straf Verwaltungs oder streitigen Verwaltungsprozesse die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln davon Abstand nehmen annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unte e chnet heute am / Dado y firmado hoy July 22 1994 at Tokyo Jap
NIHON BAYER AGROCHEM K K

In / en

NIT 287-CO

Koichi Tateno

Firma

Koichi Tateno (President)

Unterschrift

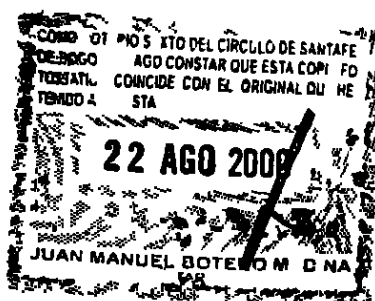
Bernarda R d M rinas

Traductora e Interpret Oficial

Resolución 653 Minjusticia 1991

BEMERKUNG FÜR ÜBERTRAGER Die konsularische Legalisierung ist notwendig mit konsularischer Bestätigung über die jetzigen Existenz der Gesellschaften, die Vollziehung seiner gesellschaftlichen Zwecke und daß seine Vertreter die diese Urkunde ausfertigen berechtigt sind es zu tun Dafür bitte dem Konsul die entsprechenden Dokumente vorzeigen

LEGALISIERUNG



Die konsularische Legalisierung ist notwendig

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO Según los artículos 65 del C de P C y 480 del C de Co si el poderdante es una sociedad el señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia que ejerce su objeto social que quien con el poder es su representante y puede otorgar el poder y seguidamente autenticar la firma de éste

平成 6 年 登 簿 第 0756 号

認 証

同級の委任状における作成名義人日本パイ
エルアグロケム株式会社代表取締役館野浩
一の代理人渡辺晃吉は当職の面前において
本人が作成名義人の署名を自認していると
陳述した。以下余白

よつて これを認証する

平成 6 年 7 月 27 日 本公証役場において

東京都千代田区之内 2 丁目 1 番 2 号

東京法務局所属

公証人

豎 山 真 一

総公証 No 021072 号

証 明

上記署名は 東京法務局所属公証人の署名に相違な
りかつ その押印は 真実のものであることを証

平成 6 年 7 月 27 日

東京法務局長 荒木友雄

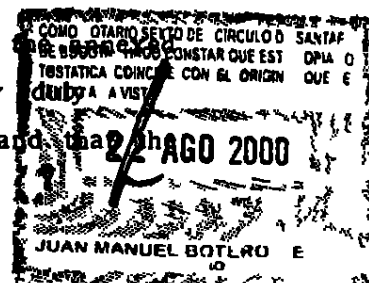
Berna da R d M tines
Traductora e Int p i ficial
Resolución 683 Minjusticia 1991

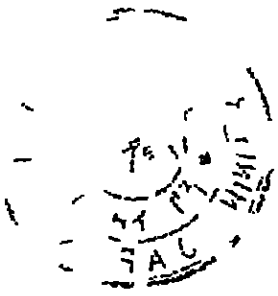
CERTIFICATE

This is to certify that the signature affixed to
Notarial Certificate has been provided by Notary
authorized by the Tokyo Legal Affairs Bureau and
Official Seal appearing on the same is genuine

Date JUL 27 1994

Tomoo AR4HI
Director of the Tokyo Legal Affairs Bureau



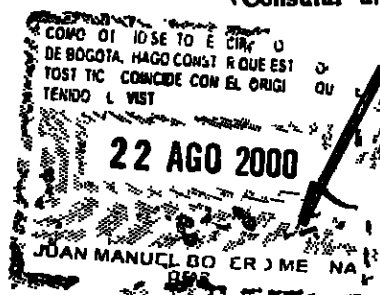


For legalization by the foreign consul in Japan
this is to certify that the Seal affixed to
the surface is genuine.

Tokyo JUL 28 1994

Official

Ministry of Foreign Affairs
(Consular and Migration Policy Division)



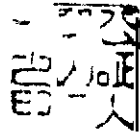
Bernarda R de Martinez
Traductora I l pret Oficial
Resolucion 653 M justicia 1991

NOTARIAL CERTIFICATE

This is to certify that Kokichi Watanabe an agent of Koichi Tateno who is President of NIHON BAYER AGROCHEM K K and who is authorized to sign to the attached document on behalf of the said company organized and existing according to the laws of Japan located at No 10 8 Takanawa 4 chome Minato ku Tokyo Japan
stated in my very presence that said Koichi Tateno

acknowledge(s)
himself-(themselves)to have signed to the attached document

Dated this 27th day of July 1994

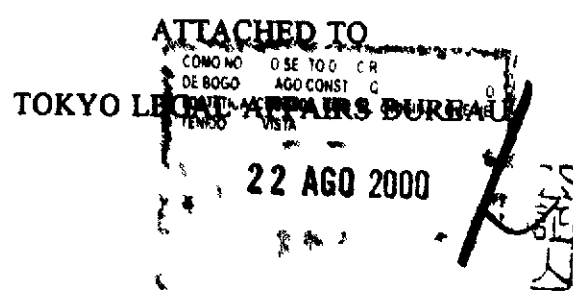


Shinichi Tateyama

SHINICHI TATEYAMA

NOTARY

1 2 MARUNOUCHI 2 CHOME
CHIYODA KU TOKYO JAPAN



Bernarda R d Martinez
Traductora Int p i Oficial
Resolucion 663 Ministerio 1991

88

TRADUCCION OFICIAL No 9 154 94 de un documento escrito en ingles el cual para su identificacion se sella con el sello del Traductor al mismo tiempo que la presente Esta traduccion ha sido preparada por Bernarda R de Martinez Traductora Oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y aprobada por el Ministerio de Justicia de Colombia mediante Resolucion No 683 de 1991

(Se traducen sellos y legalizaciones que aparecen a continuacion de un Poder escrito en ingles y español otorgado por la sociedad NIHON BAYER AGROCHEM K K a favor de los Doctores GERMAN CAVELIER GONZALO PERDOMO ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO)

Dado y firmado hoy 22 de julio de 1994 en Tokio Japon por Koichi Tateno (Presidente)

CERTIFICADO NOTARIAL

Por medio del presente se certifica que Kokichi Watanabe representante de Koichi Tateno quien es el Presidente de NIHON BAYER AGROCHEM K K y quien es el representante para firmar el documento adjunto a nombre de la sociedad mencionada constituida y existente de acuerdo con las leyes del Japon la cual esta ubicada en No 10-8 Takanawa 4-Chome Minatu-ku Tokio Japon

declaro en mi presencia que el mencionado Koichi Tateno

reconoce (reconocen tachado) haber firmado el documento adjunto
Fechado hoy 27 de julio de 1994

-2-

(Firmado) Shinichi Tateyama

Notario

1-2 MARUNOUCHI 2-CHOME

CHIYODA-KU TOKIO JAPON

ADSCRITO A

LA OFICINA DE ASUNTOS LEGALES DE TOKIO

(Sello en tinta roja en japones)

(Se traduce del ingles texto escrito en ingles y japones)

CERTIFICADO

Por medio del presente se certifica que la firma que aparece en el Certificado Notarial adjunto fue estampada por un Notario debidamente autorizado por la Oficina de Asuntos Legales de Tokio y que el sello oficial que aparece allí es autentico

Fecha 27 de julio de 1994

Tomoo ARAKI

Director de la Oficina de Asuntos Legales
de Tokio

(Sello en tinta azul) MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES JAPON
(Sellos en tinta roja en japones)

(Al dorso) Para la legalizacion del consul extranjero en el Japon por medio del presente se certifica que el sello estampado en la superficie es autentico

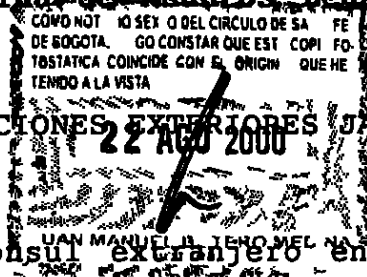
Tokio 28 de julio de 1994

(Firmado) T Saito

Funcionario

Ministro de Relaciones Exteriores

(Division de Politica Consular y de Migracion)



(En español) Certificacion de la firma y cargo de TAKEO SAITO de la constitucion legal de la sociedad NIHON BAYER AGROCHEM K K y de la autorizacion que tenia su Presidente KOICHI TATENO para conferir el poder antes mencionado Esta certificacion fue expedida por el CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA en TOKIO-JAPON bajo el No 82 del 2 de agosto de 1994 y firmada por Ricardo Duarte Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares Pagados Impuesto de Timbre y Derechos Consulares por valor de ciento seis dolares

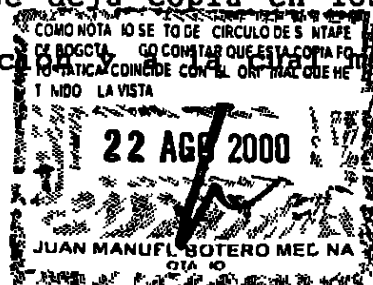
(Al dorso) Legalizacion de la firma que antecede expedida por el MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES bajo el No 0826(ilegible) de fecha 06 de septiembre de 1994 y firmada por el Jefe de Legalizaciones

Es traduccion fiel y completa de la cual se deja copia en los archivos de esta oficina para su confrontacion y se remito

Bogota 07 de septiembre de 1994

COLO 8733-801 001 7

BRM 4



Bernarda R. de Martínez
Bernarda R. de Martínez
Traductora e Interpret Oficial
Resolución 653 Ministerio 1991

COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO DE SANTAFE DE BOGOTA HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA DE

C C
COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (CLLA) EN ESTA NOTARIA

09 SEP 1994
SANTAFE DE BOGOTA D C



L L U J

RFc 19001 10
LT YTD

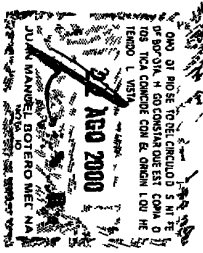
005200

1 T 13 1273

Dr. BARBARA Martinez

01 11 11 11 11
L J U J L J

L S C U L



CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49 No 72 35

BOGOTA 8 COLOMBIA

CO EO E C ON CO M N CAVE

TE E ONO (S) (1) 2 2

C CAVELEYES

Te () () 235
T E CAVE CO
() 0 5 CAVE UC

Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E S D

Poderdante NIHON BAYER AGROCHEM K K

Poder conferido el 22-07-94

Yo GERMAN CAVELIER obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor EMILIO FERRERO Abogado con Tarjeta Profesional No 31 929 con todas las facultades que me fueron conferidas

Hago la anterior sustitucion conforme al articulo 66 delCodigo de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento

Señor Jefe

German Cavelier

GERMAN CAVELIER

T P A No 832

C C No 2 877 924 de Bogota

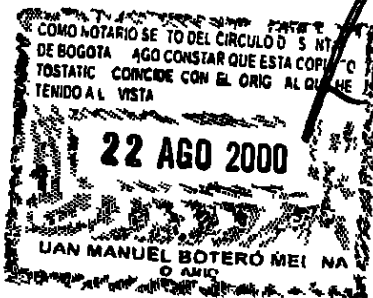
Acepto

Emilio Ferrero

EMILIO FERRERO

T P A No 31 929

C C No 438 019 de Usaquen



2e-780-2

NOTARIA SEXTA DE SANTIAGO DE BOGOTÁ
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACIÓN PERSONAL
28 SEP 1999

Santafé de Bogotá D. C.
Apte MI PABLO MENDEZ BARAJAS
NOTARIO SEXTO ENCARGADO DEL CÍRCULO DE SANTIAGO
DE BOGOTÁ

Comparecieron

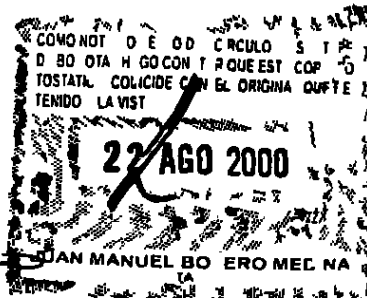
quien(es) exhibió(n) el (los) (los)

y la(s) libref (los) (los) (los)

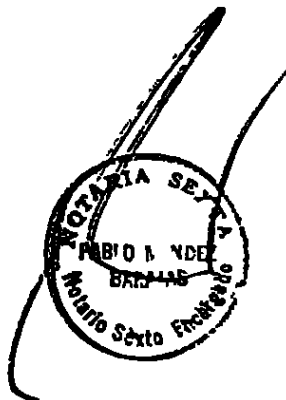
domiciliado(s) en Santafé de Bogotá y declaró(n) que la(s) firma(s)
que aparece(n) en el presente documento es (son) la(s) suya(s) y que
el contenido del mismo es cierto

En constancia se firmó esta fe pública y se imprimió huella dactilar

Benito



Emilio Fener



**EXTRACTO PARA PUBLICACION
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION**

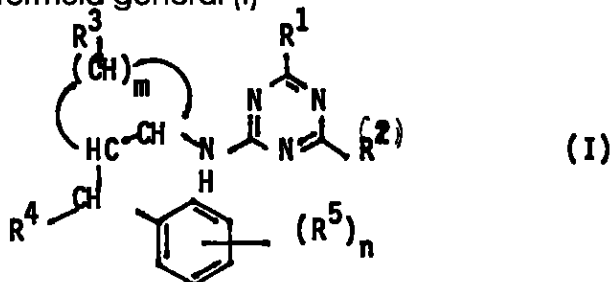
(21) No. SOLICITUD	(51) INT CL	C07D 253/000
(22) FECHA DE PRESENTACIÓN	(71) SOLICITANTE	NIHON BAYER AGROCHEM K K
(30) PRIORIDAD		
(31) No. DE SOLICITUD	(72) INVENTOR(ES)	1 Yukiyoishi WATANABE 2 Toshio GOTO 3 Chieko UENO ()
(32) FECHA DE PRESENTACIÓN		
(33) PAÍS	(74) APODERADO	EMILIO FERRERO

(54) TÍTULO
NUEVAS 1 3 5 TRIAZINAS

() 4 Dr Mark Wilhelm DREWES 5- Dr Dieter FEUCHT
(57) RESUMEN

REIVINDICACIÓN

1 Un compuestos de la formula general (I)



En el que

R¹ representa alquilo de 1 a 5 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R² representa amino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono) carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono) carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halogeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

R³ o R⁴ representa cada uno independientemente un átomo de hidrogeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R⁵ representa halogeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4

átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono) sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitró o ciano

m representa un número entero de 1-4
Los sustituyentes R₃ pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un número entero de 2 o más

n representa un número entero de 0-5 y

los sustituyentes R₅ pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

NOTA FAVOR NO PUBLICAR ANTES DE LOS 18 MESES A PARTIR DE LA FECHA DE PRESENTACIÓN DE LA SOLICITUD

日本国特許庁
PATENT OFFICE
JAPANESE GOVERNMENT

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office

出願年月日
Date of Application

1999年 9月 9日

出願番号
Application Number

平成11年特許願第255577号

出願人
Applicant(s)

日本バイエルアグロケム株式会社

or legalization by the foreign consul in Japan,
this is to certify that the Seal affixed hereto
is genuine
Tokyo

APR 19 2000

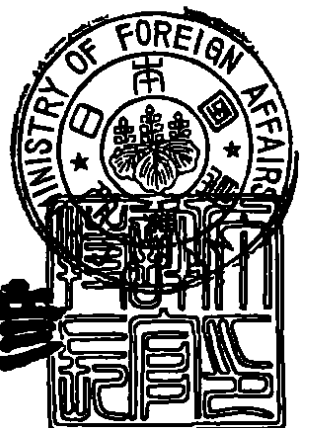
T. Mochizuki

Official
Ministry of Foreign Affairs
(Consular and Migration Policy Division)

2000年 3月17日

特許庁長官
Commissioner
Patent Office

近藤 隆彦



出証番号 出証特2000-3016769

【 類名】 特許願

【整理番号】 9909021

【提出日】 平成11年 9月 9日

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 C07D251/18

A01N 43/64

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県小山市花垣町 2 - 8 - 2 4

【氏名】 渡辺 幸喜

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県下都賀郡国分寺町小金井 2 1 4 - 1 8

【氏名】 五島 敏男

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県小山市城東 7 - 2 - 1

【氏名】 上野 知恵子

【発明者】

【住所又は居所】 トイノ連邦共和国デー 4 0 7 6 4 ランゲンフェルト
ゲーテノユトラノセ 3 8

【氏名】 マーク ウィルヘルム トレーヘス

【発明者】

【住所又は居所】 トイノ連邦共和国デー 4 0 7 8 9 モンハイム アム
ライン エーカーヘーク 9

【氏名】 ディーター フォイヒト

【特許出願人】

【識別番号】 000232564

【氏名又は名称】 日本バイエルアグロケム株式会社

【代理人】

【識別番号】 100060782

【弁理士】

CONSULADO DE COLOMBIA EN TOKIO JAPON

4/26/2000 Tokio Japón ABRIL 26 2000
No 386

El suscrito Cónsul de Colombia CERTIFICA
que el Señor T MOCHIZUKI que autoriza el presente documento ejerce
legalmente en la fecha allí expresada las funciones de MINISTERIO
RELACIONES EXTERIORES DE JAPON y que la firma y sello que en el
documento aparecen como suyos son las que usa y acostumbra en sus
ctos oficiales
El Cónsul no asume responsabilidad alguna por el contenido del
documento



Firma y Sello del Cónsul

Derechos US\$22

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

96

h

【氏名又は名称】 小田島 平吉

【選任した代理人】

【識別番号】 100074217

【弁理士】

【氏名又は名称】 江角 洋治

【選任した代理人】

【識別番号】 100103311

【弁理士】

【氏名又は名称】 小田嶋 平吾

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 019666

【納付金額】 21 000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【ブルーフの要否】 要

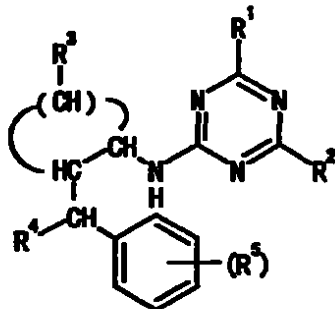
【書類名】 明細書

【発明の名称】 除草性 1,3,5-トリアゾノ類

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式

【化 1】



式中

R^1 は C_{1-5} アルキル C_{3-7} ノクロアルキル C_{1-4} ハロアルキル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノゾル 又は場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 はアミノ C_{1-4} アルキルアミノ ホルミルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-6} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-4} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノゾルカルボニルアミノ 場合により C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキソ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアセチルアミノ 又はノ (C_{1-4} アルキル) アミノ- C_{1-4} アルキリデンアミノを示し

R^3 又は R^4 はそれぞれ独立に水素原子又は C_{1-4} アルキルを示し

R^5 はハロゲン C_{1-4} アルキル C_{1-4} ハロアルキル C_{1-4} アルコキノ C_{1-4} ハロアルコキノ C_{1-4} アルキルチオ C_{1-4} ハロアルキルチオ C_{1-4} アルキルスルフィニル C_{1-4} アルキルスルホニル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェニル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

m は 1 ～ 4 の整数を示し

m が 2 以上の整数を示す場合 R^3 は同一もしくは相異なっているもよく

n は 0 ～ 5 の整数を示し そして

n が 2 以上の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なっているもよい

で表わされるトリアゾノ類

【請求項 2】 R^1 が C_{1-4} アルキル C_{3-5} ノクロアルキル C_{1-3} ハロアルキル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘンゾル 又は場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 がアミノ C_{1-3} アルキルアミノ ホルミルアミノ C_{1-3} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-5} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-3} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘンゾルカルボニルアミノ 場合により C_{1-3} アルキル置換

C_{1-3} アルコキノ置換 フルオル置換もしくはクロル置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ C_{1-3} アルキル-カルボニルアセチルアミノ 又はノ (C_{1-3} アルキル) アミノ- C_{1-3} アルキリデンアミノを示し

R^3 又は R^4 がそれぞれ独立に水素原子又は C_{1-3} アルキルを示し

R^5 がフルオル クロル ブロム メチル エチル n-プロピル iso-プロピル tert-ブチル C_{1-3} ハロアルキル C_{1-3} アルコキノ C_{1-3} ハロアルコキノ C_{1-3} アルキルチオ C_{1-3} ハロアルキルチオ C_{1-3} アルキルスルフィニル C_{1-3} アルキルスルホニル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェニル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

m が 2 ～ 4 の整数を示し このとき R^3 は同一もしくは相異なっているもよく

n が 0 ～ 4 の整数を示し そして

n が 2 以上の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なっているもよい

請求項 1 記載の化合物

【請求項3】 R^1 がメチル エチル n-プロピル iso-プロピル tert-ブチル nクロプロピル nクロブチル フルオロメチル フルオロクロロメチル フルオロブロモメチル フルオロnクロロメチル フルオロnブロモメチル nフルオロメチル nフルオロクロロメチル nフルオロブロモメチル トリフルオロメチル クロロメチル トリクロロメチル ブロモメチル 1-フルオロエチル 2,2,2-トリフルオロエチル 1,2,2,2-テトラフルオロエチル パーフルオロエチル 1-クロロエチル 1,2-ジクロロエチル 1-ブロモエチル パーフルオロプロピル 1-フルオロ-1-メチルエチル 1-クロロ-1-メチルエチル 1-ブロモ-1-メチルエチル 1-(トリフルオロメチル)-2,2,2-トリフルオロエチル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置換されていてもよいヘノール 又は場合によりフルオル置換 クロル置換もしくはメチル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 がアミノ メチルアミノ エチルアミノ ホルミルアミノ アセチルアミノ エチルカルボニルアミノ nクロプロピルカルボニルアミノ フルオロメチルカルボニルアミノ トリフルオロメチルカルボニルアミノ 1-フルオロエチルカルボニルアミノ パーフルオロエチルカルボニルアミノ 場合によりクロル置換もしくはメチル置換されていてもよいヘノールカルボニルアミノ 場合によりフルオル置換 クロル置換 メチル置換もしくはメトキノ置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ アセトアセチルアミノ 又はnメチルアミノメチリデンアミノを示し

R^3 又は R^4 がそれぞれ独立に水素原子 メチル又はエチルを示し

R^5 がフルオル クロル メチル エチル トリフルオロメチル メトキノ エトキノ トリフルオロメトキノ メチルチオ トリフルオロメチルチオ メチルスルフィニル メチルスルホニル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置換されていてもよいフェニル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置換されていてもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

mが3~4の整数を示し このとき R^3 は同一もしくは相異なってもよく

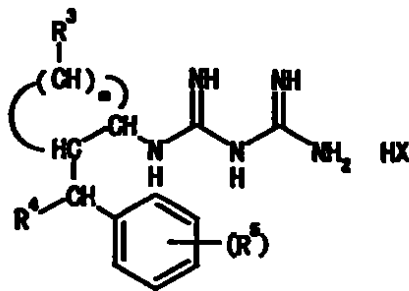
nが0~3の整数を示し そして

n が 2 又は 3 の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なっているもよい
請求項 1 記載の化合物

【請求項 4】 請求項 1 ～ 3 のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有する農薬

【請求項 5】 式

【化 2】



式中

R^3 R^4 R^5 及び n は請求項 1 に記載したと同義であり そして

X はハロゲン原子を示す

で表わされるピグアニト塩類

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は新規なトリアゾン類及び除草剤としての利用に関する 本発明はさらに該除草性トリアゾン類の製造方法に関する

【0002】

【従来の技術】

ある種のトリアゾン類が除草剤としての作用を示すことはすでに知られている (WO 97/31904 WO 97/08156 WO 97/29095 等参照)

【0003】

【発明が解決しようとする課題】

しかし 既知のトリアゾン誘導体は一般に除草剤としての効果並びに安全性の

点て十分に満足できるものではない

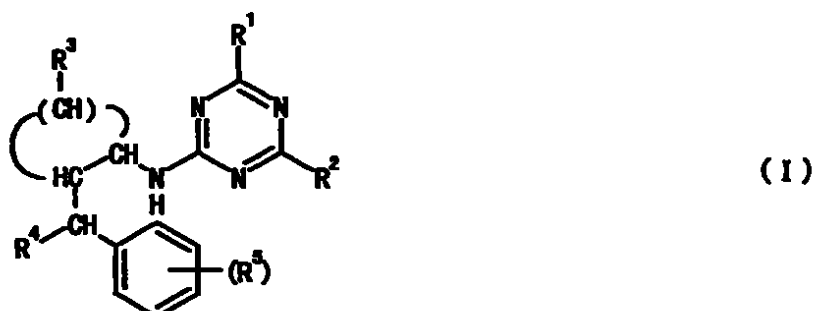
【0004】

【課題を解決するための手段】

本発明者等は 除草剤としてのより高い効果を有し より高い安全性を有する新規化合物を創製すべく研究を行なった その結果 今回 優れた生物活性を持つ下記式 (I) で表される新規なトリアゾン類が見出された

【0005】

【化3】



式中

R^1 は C_{1-5} アルキル C_{3-7} クロアルキル C_{1-4} ハロアルキル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノール 又は場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 はアミノ C_{1-4} アルキルアミノ ホルミルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-6} クロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-4} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノールカルボニルアミノ 場合により C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキニ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアセチルアミノ 又は $\text{ノ}(C_{1-4}\text{アルキル})$ アミノ- C_{1-4} アルキリデノアミノを示し

R^3 又は R^4 はそれぞれ独立に水素原子又は C_{1-4} アルキルを示し

R^5 はハロゲン C_{1-4} アルキル C_{1-4} ハロアルキル C_{1-4} アルコキノ C_{1-4} ハロアルコキノ C_{1-4} アルキルチオ C_{1-4} ハロアルキルチオ C_{1-4} アルキル

スルフィニル C_{1-4} アルキルスルホニル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェニル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェノキソ ニトロ又はノアノを示し

m は 1 ~ 4 の整数を示し

m が 2 以上の整数を示す場合 R^3 は同一もしくは相異なっているもよく

n は 0 ~ 5 の整数を示し そして

n が 2 以上の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なっているもよい

【0006】

本発明の上記式 (I) の化合物は 例えば 下記製法 (a) ~ (e) のいずれかによって合成することができる

【0007】

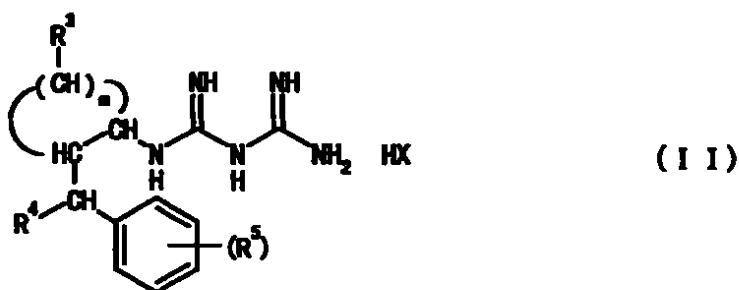
製法 (a)

R^2 がアミノを示す場合

式

【0008】

【化 4】



式中

R^3 R^4 R^5 m 及び n は前記と同義であり そして

X はハロゲン 好ましくはクロル又はブロムを示す

で表される化合物を式



式中

R^1 は前記と同義であり

R^6 は C_{1-4} アルキル 好ましくはメチル又はエチルを示す
で表されるカルボノ酸エステルと反応させる方法

【0009】

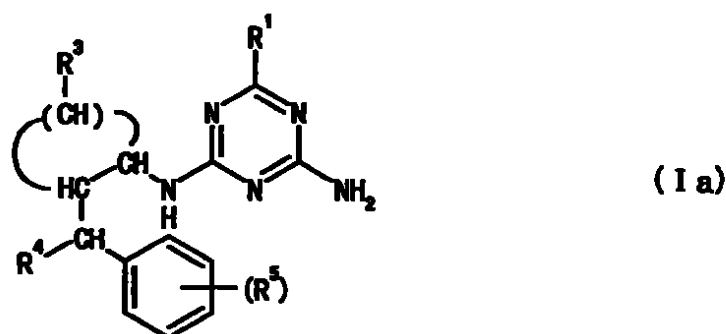
製法 (b)

R^2 がホルミルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-6} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-4} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノゾルカルボニルアミノ又は場合により C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキノ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノを示す場合

式

【0010】

【化5】



式中 R^1 R^3 R^4 R^5 n 及び m は前記と同義である
で表される化合物を式



式中

R^6 は前記と同義であり

R^7 は水素原子 C_{1-4} アルキル C_{3-6} ノクロアルキル C_{1-4} ハロアルキル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノゾル又は場合により C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキノ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルを示す

で表されるカルボノ酸エステルと反応させる方法

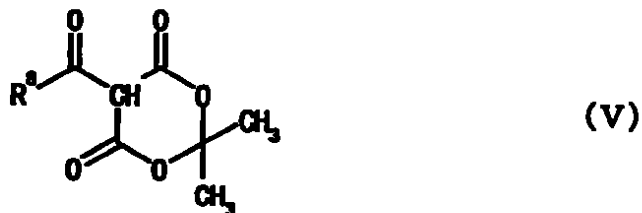
【0011】

製法 (c)

R^2 が C_{1-4} アルキル-カルボニルアセチルアミノを示す場合
上記式 (I a) の化合物を式

【0012】

【化6】



式中 R^8 は C_{1-4} アルキル 好ましくは C_{1-3} アルキルを示す
で表される化合物と反応させる方法

【0013】

製法 (d)

R^2 が $\text{ノ}(C_{1-4}\text{アルキル})-C_{1-4}$ アルキリデンアミノを示す場合
上記式 (I a) の化合物を式

【0014】

【化7】



式中

R^6 は前記と同義であり

R^9 は C_{1-4} アルキル 好ましくは C_{1-3} アルキルを示し

R^{10} は水素原子又は C_{1-3} アルキル 好ましくは水素原子 メチル又はエチルを
示す

で表される化合物と反応させる方法

製法 (e)

【0015】

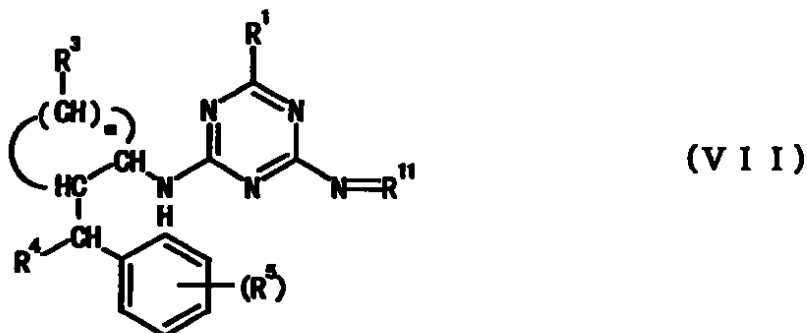
R^2 が C_{1-4} アルキルアミノを示す場合

PS 108

式

【0016】

【化8】



式中

R^1 R^3 R^4 R^5 及び n は前記と同義であり、そして

R^{11} は C_{1-4} アルキリデン、好ましくは C_{1-3} アルキリデンを示す

で表される化合物を還元反応に付す方法

【0017】

本発明により提供される式 (I) のトリアゾノ類は、前述した先行技術文献に記載の化合物に比較して、強力な除草作用を示す

【0018】

本明細書において

「ハロゲン」はフルオル、クロル、ブロム又はヨートを示し、好ましくはフルオル、クロル、ブロムである

【0019】

「アルキル」は直鎖状又は分岐鎖状であることができ、例えば C_{1-4} のアルキルを示すことができ、具体的には、メチル、エチル、 n -もしくは iso -プロピル、 n -、 iso -、 sec -もしくは $tert$ -ブチル等を例示することができる

【0020】

「ノクロアルキル」としては、例えば、ノクロプロピル、ノクロブチル、ノクロヘンチル、ノクロヘキシル等が挙げられる

【0021】

107
106

「ハロアルキル」はハロゲン置換された直鎖状又は分岐鎖状のアルキルであり
 例えば 1～9個のフルオル クロル及び／又はブロムにより置換されたC₁₋₄のアルキルを例示することができ 具体的には フルオロメチル フルオロクロロメチル フルオロブロモメチル フルオロジクロロメチル フルオロジブロモメチル ジフルオロメチル ジフルオロクロロメチル ジフルオロブロモメチル トリフルオロメチル クロロメチル ジクロロメチル トリクロロメチル ブロモメチル 1-フルオロエチル 2-フルオロエチル 2,2-トリフルオロエチル 1,2,2-テトラフルオロエチル パーフルオロエチル 1-クロロエチル 1,2-ジクロロエチル 1-ブロモエチル パーフルオロプロピル 1-フルオロ-1-メチルエチル 1-クロロ-1-メチルエチル 1-ブロモ-1-メチルエチル 1-(トリフルオロメチル)-2,2,2-トリフルオロエチル 2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチル 3-フルオロプロピル 3-クロロプロピル 2,2,3,3-ヘンタフルオロプロピル 1,2,3,3-ヘキサフルオロプロピル パーフルオロブチル等が挙げられる

【0022】

「アルコキン」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-O-であり
 例えば C₁₋₄のアルコキンを示すことができ 具体的には メトキン エトキン n-もしくはiso-プロポキン n- iso- sec-もしくはtert-ブトキン等を例示することができる

【0023】

「アルキルチオ」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-S-であり
 例えば C₁₋₄のアルキルチオを示すことができ 具体的には メチルチオ エチルチオ n-もしくはiso-プロピルチオ n- iso- sec-もしくはtert-ブチルチオ等を例示することができる

【0024】

「アルキルスルフィニル」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-S-O-であり 例えば C₁₋₄のアルキルスルフィニルを示すことができ 具体的には メチルスルフィニル エチルスルフィニル n-もしくはiso-プロピ

ルスルフィニル n- iso- sec-もしくはtert-ブチルスルフィニル等を例示することができる

【0025】

「アルキルスルホニル」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-SO₂-であり 例えば C₁₋₄のアルキルスルホニルを示すことができ 具体的には メチルスルホニル エチルスルホニル n-もしくはiso-プロピルスルホニル n- iso- sec-もしくはtert-ブチルスルホニル等を例示することができる

【0026】

「アルキルアミノ」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-NH-であり 例えば C₁₋₄のアルキルアミノを示すことができ 具体的には メチルアミノ エチルアミノ n-もしくはiso-プロピルアミノ n- iso- sec-もしくはtert-ブチルアミノ等を例示することができる

【0027】

「アルキル-カルボニルアミノ」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-CONH-であり 例えば 合計でC₂₋₅のアルキル-カルボニルアミノを示すことができ 具体的には メチルカルボニルアミノ エチルカルボニルアミノ n-もしくはiso-プロピルカルボニルアミノ n- iso- sec-もしくはtert-ブチルカルボニルアミノ等を例示することができる

【0028】

「ノクロアルキル-カルボニルアミノ」はノクロアルキル部分が上記の意味を有するノクロアルキル-CONH-であり 例えば 合計でC₄₋₇のノクロアルキル-カルボニルアミノを示すことができ 具体的には ノクロプロピルアミノ ノクロブチルアミノ ノクロヘンチルアミノ ノクロヘキシルアミノ等を例示することができる

【0029】

「ハロアルキル-カルボニルアミノ」はハロアルキル部分が上記の意味を有するハロアルキル-CONH-であり 例えば 合計でC₂₋₅のハロアルキル-カルボニルアミノを示すことができ 具体的には フルオロメチルカルボニルアミノ

ジフルオロメチルカルボニルアミノ ジフルオロクロロメチルカルボニルアミ
ノ ジフルオロブロモメチルカルボニルアミノ トリフルオロメチルカルボニル
アミノ 1-フルオロエチルカルボニルアミノ 2-フルオロメチルカルボニル
アミノ 2 2 2-トリフルオロエチルカルボニルアミノ 1 2 2 2-
テトラフルオロエチルカルボニルアミノ パーフルオロエチルカルボニルアミノ
パーフルオロプロピルカルボニルアミノ パーフルオロブチルカルボニルアミ
ノ等を例示できる

【0030】

「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいヘンゾル」
及び「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいヘンゾル
カルボニルアミノ」におけるハロゲン部分は上記の「ハロゲン」と同様の意味を
有し また アルキル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有する しかし
て 「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいヘンゾル
」の具体例としては ヘンゾル 2-(3-及び4-)フルオロヘンゾル 2-
(3-及び4-)クロロヘンゾル 2-(3-及び4-)メチルヘンゾル 2
3-(2 4- 2 5- 2 6- 3 4- 3 5-)ジフルオロヘンゾ
ル等を例示することができ また 「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル
置換されていてもよいヘンゾル」の具体例としては ヘンゾルアミノ 2- 3
-もしくは4-フルオロヘンゾルアミノ 2- 3-もしくは4-クロロヘンゾ
ルアミノ 2- 3-もしくは4-メチルヘンゾルアミノ 2 3- 2 4-
2 5- 2 6- 3 4-もしくは3 5-ジフルオロヘンゾルアミノ等
を例示することができる

【0031】

「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいフェニル」
におけるハロゲン部分は上記の「ハロゲン」と同様の意味を有し また アルキ
ル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有する しかして 「場合によりハ
ロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいフェニル」の具体例としては
フェニル 2- 3-もしくは4-フルオロフェニル 2- 3-もしくは4
-クロロフェニル 2- 3-もしくは4-メチルフェニル 2 3- 2 4

109 112

— 2 5— 2 6— 3 4—もしくは3 5—ノフルオロフェニル 2
3— 2 4— 2 5— 2 6— 3 4—もしくは3 5—ノクロロフェ
ニル 2 3— 2 4— 2 5— 2 6— 3 4—もしくは3 5—ノ
メチルフェニル等を例示することができる

【0032】

「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ」におけるハロゲン部分は上記の「ハロゲン」と同様の意味を有し また アルキル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有する しかして

「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいフェニル」の具体例としては アニリノ 2— 3—もしくは4—フルオロアニリノ 2— 3—もしくは4—クロロアニリノ 2— 3—もしくは4—メチルアニリノ 2— 3—もしくは4—メトキノアニリノ 2 3— 2 4— 2 5— 2 6— 3 4—もしくは3 5—ノフルオロアニリノ 2 3— 2 4— 2 5— 2 6— 3 4—もしくは3 5—ノクロロアニリノ 2 3— 2 4— 2 5— 2 6— 3 4—もしくは3 5—ノメチルアニリノ等を例示することができる

「アルキルカルボニルアセチルアミノ」におけるアルキル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有し 「アルキルカルボニルアセチルアミノ」の具体例としては アセトアセチルアミノ プロピオニルアセチルアミノ ブチリルアセチルアミノ イノブチリルアセチルアミノ バレリルアセチルアミノ イノバレリルアセチルアミノ ビバロイルアセチルアミノ等を例示することができる

【0033】

「ノアルキルアミノアルキリデンアミノ」のアルキル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有し また 上記のアルキリデン部分は直鎖状又は分岐鎖状であることができ 例えば C_{1-4} のアルキリデンを示すことができる しかして

「ノアルキルアミノアルキリデンアミノ」の例としては ノメチルアミノメチリデンアミノ 1—(ノメチルアミノ)エチリデンアミノ 1—(ノメチルアミノ)(n—プロピリデン)アミノ 1—(ノメチルアミノ)(n—ブチリデン)アミノ 1—(ノメチルアミノ)(iso—ブチリデン)アミノ ノエチルアミ

ノメチリデンアミノ ノ (n -プロピル) アミノメチリデンアミノ ノ (n -ブチル) アミノメチリデンアミノ (N-メチル-N-エチルアミノ) メチリデンアミノ (N-メチル-N-(n -プロピル) アミノ) メチリデンアミノ等を挙げる事ができる

【0034】

本発明の好適な群の化合物としては 式(I)において

R^1 が C_{1-4} アルキル C_{3-5} ノクロアルキル C_{1-3} ハロアルキル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘノル 又は場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 がアミノ C_{1-3} アルキルアミノ ホルミルアミノ C_{1-3} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-5} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-3} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘノルカルボニルアミノ 場合により C_{1-3} アルキル置換

C_{1-3} アルコキノ置換 フルオル置換もしくはクロル置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ C_{1-3} アルキル-カルボニルアセチルアミノ 又はノ(C_{1-3} アルキル) アミノ- C_{1-3} アルキリデンアミノを示し

R^3 又は R^4 がそれぞれ独立に水素原子又は C_{1-3} アルキルを示し

R^5 がフルオル クロル ブロム メチル エチル n -プロピル iso -プロピル $tert$ -ブチル C_{1-3} ハロアルキル C_{1-3} アルコキノ C_{1-3} ハロアルコキノ C_{1-3} アルキルチオ C_{1-3} ハロアルキルチオ C_{1-3} アルキルスルフィニル C_{1-3} アルキルスルホニル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェニル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

m が2~4の整数を示し このとき R^3 は同一もしくは相異なってもよく

n が0~4の整数を示し そして

n が2以上の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なってもよい

化合物が挙げられる

【0035】

そして 更に好ましい群の化合物としては 前記式 (I) の化合物において
 R^1 がメチル エチル n-プロピル iso-プロピル tert-ブチル
 nクロプロピル nクロブチル フルオロメチル フルオロクロロメチル フ
 ルオロブロモメチル フルオロnクロロメチル フルオロnブロモメチル nフ
 ルオロメチル nフルオロクロロメチル nフルオロブロモメチル トリフルオ
 ロメチル クロロメチル トリクロロメチル ブロモメチル 1-フルオロエチ
 ル 2, 2, 2-トリフルオロエチル 1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル
 パーフルオロエチル 1-クロロエチル 1, 2-nクロロエチル 1-プロ
 モエチル パーフルオロプロピル 1-フルオロ-1-メチルエチル 1-クロ
 ロ-1-メチルエチル 1-ブromo-1-メチルエチル 1-(トリフルオロメ
 チル)-2, 2, 2-トリフルオロエチル 場合によりフルオル置換もしくはメ
 チル置換されていてもよいヘノール 又は場合によりフルオル置換 クロル置換
 もしくはメチル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 がアミノ メチルアミノ エチルアミノ ホルミルアミノ アセチルアミ
 ノ エチルカルボニルアミノ nクロプロピルカルボニルアミノ フルオロメチ
 ルカルボニルアミノ トリフルオロメチルカルボニルアミノ 1-フルオロエチ
 ルカルボニルアミノ パーフルオロエチルカルボニルアミノ 場合によりクロル
 置換もしくはメチル置換されていてもよいヘノールカルボニルアミノ 場合によ
 りフルオル置換 クロル置換 メチル置換もしくはメトキノ置換されていてもよ
 いフェニルカルボニルアミノ アセトアセチルアミノ 又はnメチルアミノメチ
 リデンアミノを示し

R^3 又は R^4 がそれぞれ独立に水素原子 メチル又はエチルを示し

R^5 がフルオル クロル メチル エチル トリフルオロメチル メトキノ
 エトキノ トリフルオロメトキノ メチルチオ トリフルオロメチルチオ メチ
 ルスルフィニル メチルスルホニル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置
 換されていてもよいフェニル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置換され
 てもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

112215

m が 3 ~ 4 の整数を示し このとき R^3 は同一もしくは相異なっているもよく

n が 0 ~ 3 の整数を示し そして

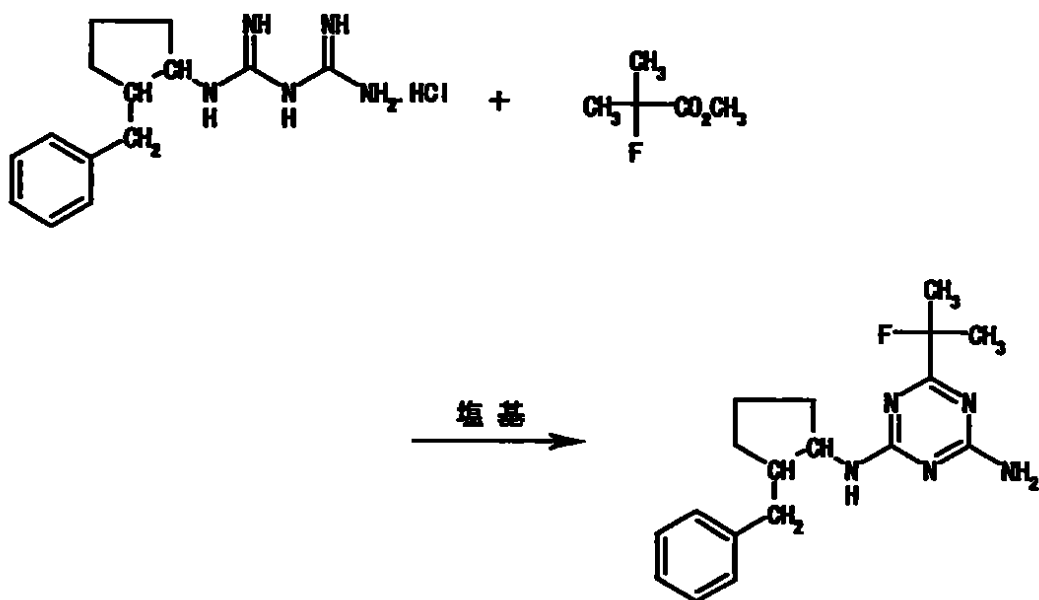
n が 2 又は 3 の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なっているもよい
化合物が挙げられる

【0036】

前記製法 (a) は 原料として 例えば 2-ヘノゾルノクロヘンチルピグア
ニト塩酸塩と α -フルオロ- α -メチルプロピオン酸メチルとを用いる場合 下
記の反応式で表される

【0037】

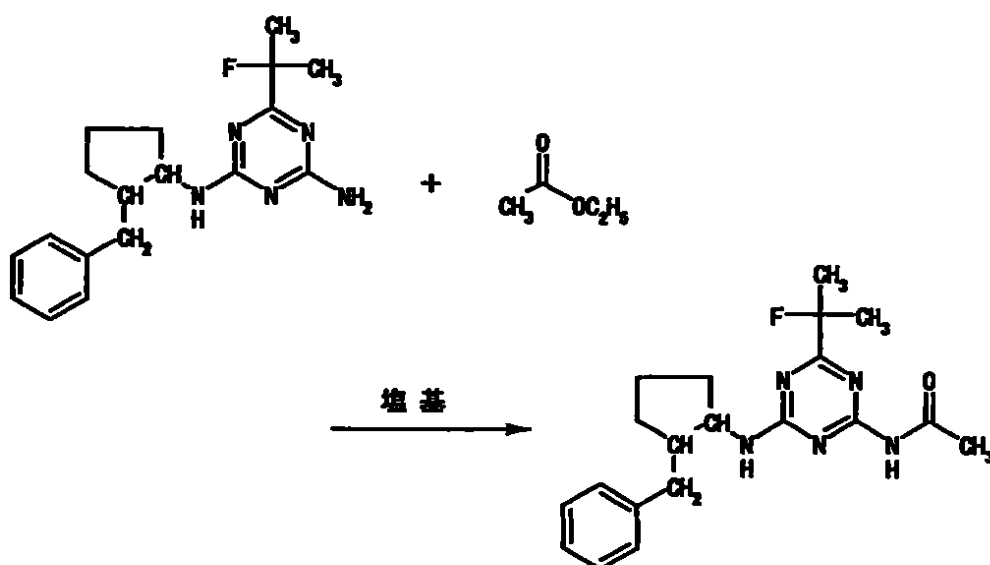
【化9】



前記製法 (b) は 原料として 例えば 2-アミノ-4-(2-ヘノゾル
ノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1 3 5-ト
リアゾンと酢酸エチルエステルとを用いる場合 下記の反応式で表される

【0038】

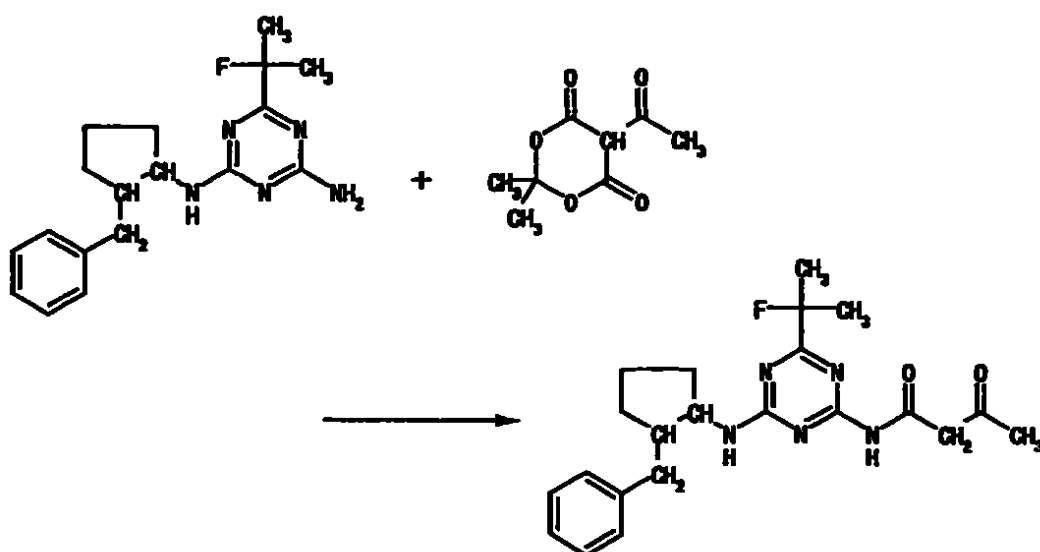
【化 10】



前記製法 (c) は 原料として 例えば 2-アミノ-4-(2 -ヘノノル
ノクロヘンチルアミノ) -6-(α -フルオロイノプロピル) -1 3 5-ト
リアノンとアセチルメルトラム酸とを用いる場合 下記の反応式で表される

【0039】

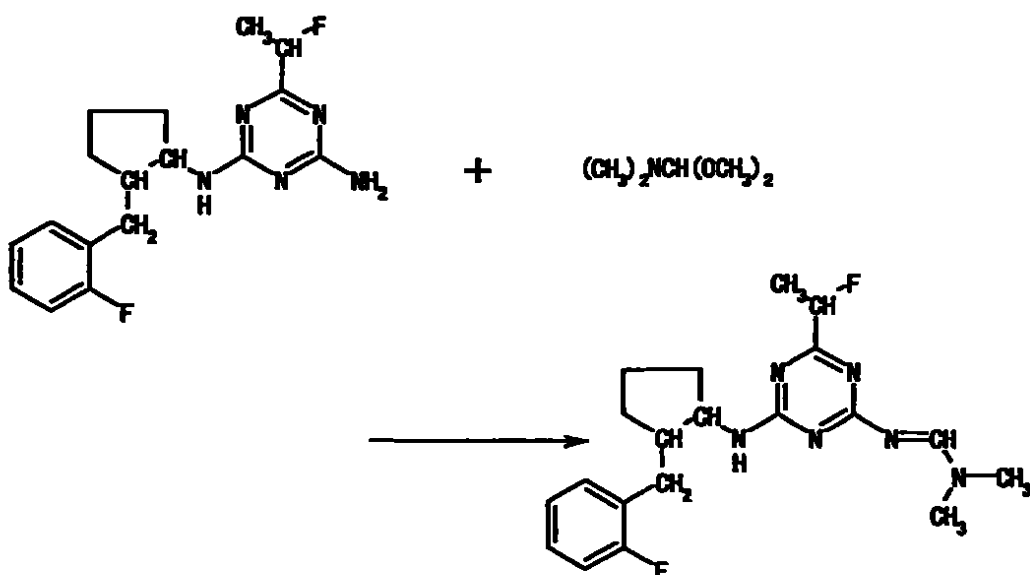
【化 11】



前記製法 (d) は 原料として 例えば 2-アミノ-4-(2 - (2-フ
ルオロヘノノル) ノクロヘンチルアミノ) -6-(α -フルオロエチル) -1
3 5-トリアノンとN N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタールとを用
いる場合 下記の反応式で表される

【0040】

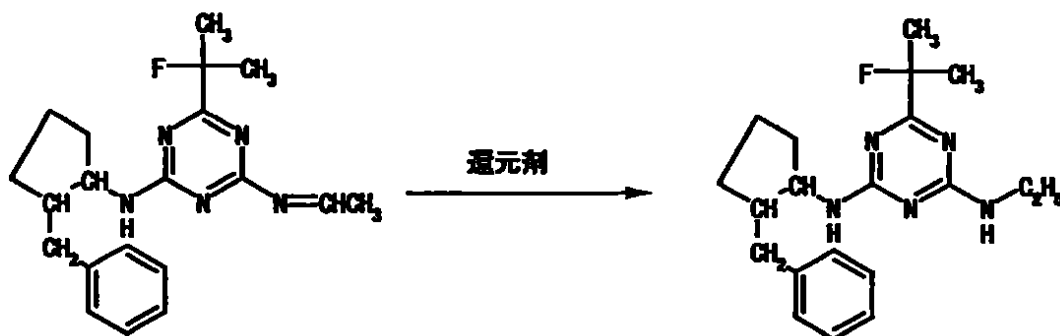
【化12】



前記製法 (e) は 原料として 例えば 2-エチリデノアミノ-4-(2'-
-ヘンゾルクロベンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1
3 5-トリアゾンをを用いる場合 下記の反応式で表される

【0041】

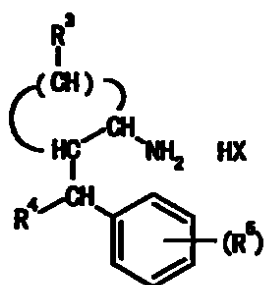
【化13】



上記製法 (a) において 原料である式 (II) の化合物は 従来の文献に未
記載の新規化合物であり 例えば 特開平 1-246279 号公報 特開昭 63
-264465 号公報 特開昭 63-222166 号公報 特開昭 63-146
876 号公報 特開昭 63-51379 号公報等に記載されている方法 例えば
式

【0042】

【化 14】



(VIII)

式中

R^3 R^4 R^5 m 及び n は前記と同義であり

Xはハロゲンを示す

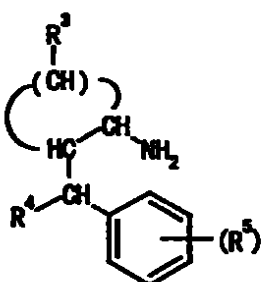
で表される化合物をノアノグアニンと 適当な希釈剤 例えば n-デカン中
て反応させることにより製造することができる

【0043】

上記式 (VIII) の化合物は 一部新規化合物を包含する下記式

【0044】

【化 15】



(IX)

式中 R^3 R^4 R^5 m 及び n は前記と同義である

て表される化合物を適当なハロゲン化水素酸 例えば 塩酸と反応させることにより製造することができる

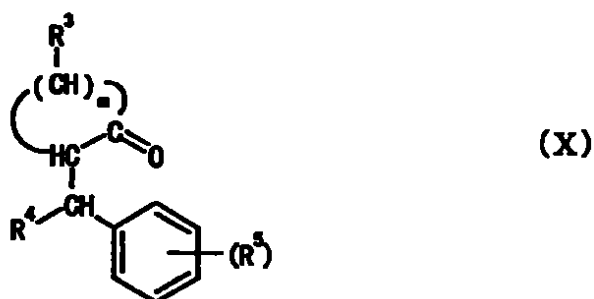
【0045】

上記式 (IX) の化合物は その一部は従来文献に未記載の新規化合物であるが 例えば Organic Reaction Vol 5 p 301 (1962) John Wiley & Sons
INC に記載されている方法 すなわち 式

【0046】

116

【化 1 6】



式中 R³ R⁴ R⁵ n及びnは前記と同義である

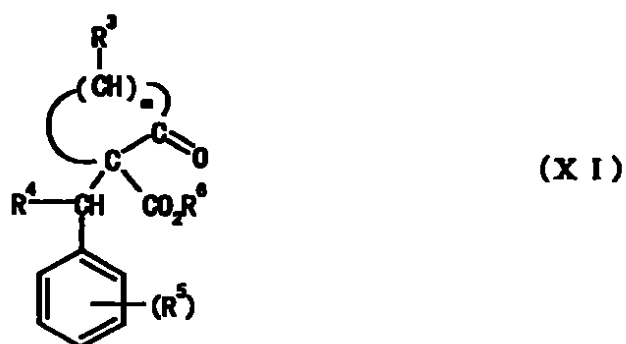
で表される化合物を ホルムアミトと蟻酸を用いた Leuckart 反応に付すことにより製造することができる

【0 0 4 7】

上記式 (X) の化合物は その一部は従来の文献に未記載の新規化合物であるが 例えば 一般的に知られている β-ケトエステルの脱カルボキソ反応 すなわち 式

【0 0 4 8】

【化 1 7】



式中

R³ R⁴ R⁵ n及びnは前記と同義であり

R⁶はC₁₋₄アルキルを示す

で表される化合物から 適当な鉱酸 例えば 臭化水素酸を用い 容易に製造することができる

【0 0 4 9】

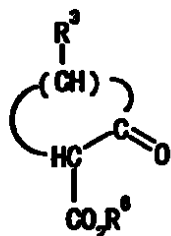
上記式 (X I) の化合物は その一部は従来の文献に未記載の新規化合物であ

117 120

るが 例えば 「精密有機合成」 南江堂 160頁 1983年に記載の方法
すなわち 式

【0050】

【化18】



(XII)

式中

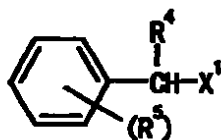
R^3 及び n は前記と同義であり

R^6 は C_{1-4} アルキルを示す

て表される化合物を 式

【0051】

【化19】



(XIII)

式中

R^4 R^5 及び n は前記と同義であり

X^1 はハロゲンを示す

で表わされる化合物と 適当な縮合剤 例えば 水酸化ナトリウム水溶液を用い

相間移動触媒 例えば テトラブチルアンモニウム ヒドロゲンスルフェイト

の存在下において 適当な希釈剤 例えば ノクロロメタン中で反応させること

により容易に得ることができる

【0052】

上記式 (XIII) の化合物は その一部は従来の文献に未記載の新規化合物で
あるが 例えば Organic Reaction Vol 15 p 1(1967) John Wiley & Sons

118-21

INC に記載されている方法により容易に製造することができる

【0053】

上記式 (XII) の化合物は既知の化合物であり 例えば 「新実験化学講座」 日本化学会編 第14巻 (I) 331頁 1962年 丸善発行に記載されている方法により容易に製造することができる

【0054】

上記製法 (a) において原料として用いられる式 (II) の化合物の代表例としては下記のを例示することができる

【0055】

- 2-ヘンゾルンクロヘンチルピグアニド塩酸塩
- 2-(2-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルピグアニド塩酸塩
- 2-(3'-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルピグアニト塩酸塩
- 2-(3'-メチルヘンゾル)ンクロヘンチルピグアニト塩酸塩
- 2-ヘンゾルンクロヘキシルピグアニド塩酸塩
- 2-(2-フルオロヘンゾル)ンクロヘキシルピグアニト塩酸塩
- 2-(3-フルオロヘンゾル)ンクロヘキシルピグアニド塩酸塩
- 2-(3-メチルヘンゾル)ンクロヘキシルピグアニト塩酸塩等

【0056】

式 (III) の化合物は 既知の化合物であり 市販品を用いてもよく 又は EP-A-850911に記載されている方法で容易に製造することもできる

【0057】

上記製法 (a) において原料として用いられる式 (III) の化合物の代表例としては下記のを例示することができる

【0058】

- フルオロ酢酸エチルエステル
- フルオロクロロ酢酸エチルエステル
- フルオロブロモ酢酸エチルエステル
- ノフルオロクロロ酢酸エチルエステル
- ノブロモフルオロ酢酸エチルエステル

トリフルオロ酢酸エチルエステル

ヘンタフルオロプロピオン酸メチルエステル

α -フルオロプロピオン酸エチルエステル

α -フルオロ- α -メチルプロピオン酸エチルエステル

酢酸エチルエステル

プロピオン酸エチルエステル

n-酪酸エチルエステル

イノ酪酸エチルエステル

ノクロプロパンカルボン酸エチルエステル

ノクロヘンタンカルボン酸エチルエステル

ノクロヘキサンカルボン酸エチルエステル等

【0059】

上記製法 (b) ~ (d) において 原料である式 (Ia) の化合物は 本発明の式 (I) の化合物の一部であり 上記製法 (a) により容易に製造することができる

【0060】

上記製法 (b) において 式 (IV) の化合物は 前記 R^6 の定義に基づいたものを意味し R^7 は水素原子 C_{1-4} アルキル C_{3-6} ノクロアルキル C_{1-4} ハロアルキル ハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノゾル

又は C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキノ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルを示す 好ましくは 前記 R^6 の好ましい定義に基づいたものを意味し R^7 は水素原子 C_{1-3} アルキル C_{3-5} ノクロアルキル C_{1-3} ハロアルキル フルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘノゾル 又は C_{1-3} アルキル置換 C_{1-3} アルコキノ置換もしくはフルオル置換もしくはクロル置換されていてもよいフェニルを示す

【0061】

式 (IV) の化合物は既知の化合物であり 市販品を用いてもよく 又は 例えば EP-A-850911 に記載の方法で容易に合成することもできる

【0062】

上記製法 (b) ~ (d) において原料として用いられる式 (I a) の化合物の代表例としては式 (I) に包含される下記のを例示することができる

【0063】

2-アミノ-4-(2'-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-(2-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-(2-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-(2-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(トリフルオロメチル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2'-(3-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-(3-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-(3-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(トリフルオロメチル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-(3-メチルヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2'-(3-メチルヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2'-(3-メチルヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘキシルアミノ)-6-(α-フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン

2-アミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘキシルアミノ)-6-(α-フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾン

724
121

2-アミノ-4-(2-(3-フルオロヘノール)ノクロヘキシルアミノ)
-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾール

2-アミノ-4-(2'-(3-フルオロヘノール)ノクロヘキシルアミノ)
-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾール

2-アミノ-4-(2'-(3-メチルヘノール)ノクロヘキシルアミノ)-
6-イノプロピル-1,3,5-トリアゾール

2-アミノ-4-(2'-(3-メチルヘノール)ノクロヘキシルアミノ)-
6-エチル-1,3,5-トリアゾール等

【0064】

上記製法 (b) において原料として用いられる式 (IV) の化合物の代表例と
しては下記のを例示することができる

【0065】

酢酸エチルエステル

プロピオン酸エチルエステル

n-酪酸エチルエステル

イノ酪酸エチルエステル

ピバリン酸エチルエステル

ノクロプロパンカルボン酸エチルエステル

ノクロヘンタンカルボン酸エチルエステル

ノクロヘキサノカルボン酸エチルエステル

フェニル酢酸エチルエステル

安息香酸エチルエステル

3-メチル安息香酸エチルエステル

2-クロロ安息香酸エチルエステル

トリフルオロ酢酸エチルエステル等

【0066】

上記製法 (c) において 原料である式 (V) の化合物は 既知の化合物であ
り 例えば Chem Pharm Bull (1987) 35(5) 1
860-1870に記載の方法により容易に製造することができる

75
172

【0067】

上記製法 (c) において原料として用いられる式 (V) の化合物の代表例としては下記のを例示することができる

【0068】

5-アセチル-2 2-メチル-1 3-オキサノ-4 6-オノ

5-プロピオニル-2 2-メチル-1 3-オキサノ-4 6-オノ

5-ブチリル-2 2-メチル-1 3-オキサノ-4 6-オノ

5-イノブチリル-2 2-メチル-1 3-オキサノ-4 6-オノ

5-ノクロプロピルカルボニル-2 2-メチル-1 3-オキサノ-4
6-オノ

5-ノクロヘキシルカルボニル-2 2-メチル-1 3-オキサノ-4
6-オノ

5-(2-フルオロヘンノイル)-2 2-メチル-1 3-オキサノ-
4 6-オノ等

【0069】

上記製法 (d) において 原料である式 (VI) の化合物は 既知の化合物であり 例えば 特開平 8-277251 号公報に記載の方法により容易に製造することができる

【0070】

上記製法 (d) において原料として用いられる式 (VI) の化合物の代表例としては下記のを例示することができる

【0071】

N N-メチルホルムアミドメチルアセタール

N N-エチルホルムアミドメチルアセタール

N N-プロピルホルムアミトメチルアセタール

N-メチル-N-エチルホルムアミトメチルアセタール

N-メチル-N-プロピルホルムアミトメチルアセタール

N N-メチルホルムアミドノエチルアセタール
N N-エチルホルムアミドノエチルアセタール
N N-メチルアセトアミドノメチルアセタール
N N-エチルアセトアミドノメチルアセタール等

【0072】

上記製法 (e) において 原料である式 (V I I) の化合物は 従来の文献に未記載の新規化合物であり 例えば 特開昭 6 3 - 5 1 3 7 9 号公報に記載される方法 例えば 前記式 (I a) の化合物を式



で表わされる総炭素数が C_{1-4} の脂肪族アルデヒドもしくは脂肪族ケトンと反応させることにより製造することができる

【0073】

式 (X I V) の化合物は既知の化合物であり 市販されているものを用いることができる

【0074】

上記製法 (e) において原料として用いられる式 (V I I) の化合物の代表例としては下記のを例示することができる

【0075】

2-メチリデンアミノ-4-(2-ヘノゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1, 3, 5-トリアゾン
2-エチリデンアミノ-4-(2'-ヘノゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1, 3, 5-トリアゾン
2-プロピリデンアミノ-4-(2'-ヘノゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1, 3, 5-トリアゾン
2-イノプロピリデンアミノ-4-(2-ヘノゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1, 3, 5-トリアゾン
2-メチリデンアミノ-4-(2-ヘノゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1, 3, 5-トリアゾン
2-エチリデンアミノ-4-(2-ヘノゾルノクロヘンチルアミノ)-6-

127
124

(α -フルオロエチル)-1 3 5-トリアゾ
 2-プロピリデンアミノ-4-(2'-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ)-6
 -(α -フルオロエチル)-1 3 5-トリアゾ
 2-メチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルノクロヘキソルアミノ)-6-
 (α -フルオロイノプロピル)-1 3 5-トリアゾ
 2-エチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルノクロヘキソルアミノ)-6-
 (α -フルオロエチル)-1 3 5-トリアゾ
 2-エチリデンアミノ-4-(2-(3-フルオロヘンゾル)ノクロヘンチ
 ルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1 3 5-トリアゾ
 2-エチリデンアミノ-4-(2-(3-メチルヘンゾル)ノクロヘンチル
 アミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1 3 5-トリアゾ
 2-エチリデンアミノ-4-(2'-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ)-6-
 イノプロピル-1 3 5-トリアゾ等

【0076】

なお 上記製法 (b) に従い 式 (IV) の化合物のかわりに 式



式中

R^{12} は C_{1-4} アルキルを示し

X^1 はハロゲンを示す

で表わされる化合物を用いることによっても 上記製法 (e) により製造される
 化合物 すなわち R^2 が C_{1-4} アルキルアミノを示す本発明の式 (I) の化合物を
 製造することができる

【0077】

上記製法 (a) の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用
 される希釈剤の例としては エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチ
 ルエーテル イノプロピルエーテル プチルエーテル ノオキサノ ジメトキン
 エタノ(DME) テトラヒドロフラン(THF) ジエチレングリコールジメチルエーテ
 ル(DGM)等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イノプロパノー
 ル プタノール エチレングリコール等 酸アミト類 例えば ジメチルホルム

アミド(DMF) ジメチルアセトアミト(DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン ヘキサメチルフォスフォリクトリアミト(HMPA)等 スルホン スルホキンド類 例えば ジメチルスルホキント(DMSO) スルホラン等塩基 例えば ピリノン等を挙げることができる

【0078】

製法(a)は酸結合剤の存在下で行うことができ その際に使用しうる酸結合剤としては 無機塩基として アルカリ金属並びにアルカリ土類金属の水素化物 水酸化物 炭酸塩 重炭酸塩等 例えば 水素化ナトリウム 水素化リチウム 炭酸水素ナトリウム 炭酸水素カリウム 炭酸ナトリウム 炭酸カリウム 水酸化リチウム 水酸化ナトリウム 水酸化カリウム 水酸化カルシウム等 無機アルカリ金属アミド類 例えば リチウムアミト ナトリウムアミト カリウムアミド等 また 有機塩基として アルコラート 第3級アミノ類 ジアルキルアミノアニリン類及びピリノン類 例えば ナトリウムメトキサイド ナトリウムエトキサイド カリウムtert-ブトキサイド トリエチルアミン 1,1,4,4-テトラメチルエチレンジアミン(TMEDA) N,N-ジメチルアニリン N,N-ジエチルアニリン ピリノン 4-ジメチルアミノピリノン(DMAP) 1,4-ジアザビニクロ[2,2]オクタン(DABCO) 1,8-ジアザビニクロ[5,4,0]ウンデク-7-エン(DBU)等が挙げられる

【0079】

製法(a)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般には約0~約100℃ 好ましくは約20~約80℃の間の温度が適当である また 該反応は常圧下で行うことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧下で操作することもできる

【0080】

製法(a)を実施するにあたっては 例えば 式(II)の化合物1モルに対し 希釈剤例えばメタノール中で 0.8~2.2モル量の式(III)の化合物を 2~3モル量のナトリウムメトキサイド存在下で反応させることによって 式(I)の目的化合物を得ることができる

【0081】

なお 製法 (a) において 式 (IX) の化合物から式 (VIII) の化合物を經由し式 (II) の化合物を製造する反応は連続して行なうこともできる

【0082】

上記製法 (b) の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用される希釈剤の例としては 水 脂肪族 脂環族および芳香族炭化水素類 (場合によっては塩素化されてもよい) 例えば ヘンタン ヘキサン ノクロヘキサン 石油エーテル リグロイン ヘンゼン トルエン キノレン ノクロロメタン クロロホルム 四塩化炭素 1,2-ノクロロエタン クロルヘンゼン ノクロロヘンゼン等 エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル イノプロピルエーテル ブチルエーテル ノオキサン ノメトキノエタン (DME)

テトラヒドロフラン (THF) ノエチレングリコールノメチルエーテル (DGM) 等 ケトン類 例えば アセトン メチルエチルケトン (MEK) メチル-イノプロピルケトン メチルイノブチルケトン (MIBK) 等 ニトリル類 例えば アセトニトリル プロピオニトリル アクリロニトリル等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イノプロパノール ブタノール エチレングリコール等 エステル類 例えば 酢酸エチル 酢酸アミル等 酸アミト類 例えば ノメチルホルムアミト (DMF) ノメチルアセトアミト (DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ノメチル-2-イミダゾリノノン ヘキサメチルフォスフォリクトリアミト (HMPA) 等

スルホン スルホキント類 例えば ノメチルスルホキノド (DMSO) スルホラン等 塩基 例えば ピリノンを挙げることもできる

【0083】

製法 (b) は塩基の存在下で行うことができ その際に使用しうる塩基としては 無機塩基として アルカリ金属並びにアルカリ土類金属の水素化物 水酸化物 炭酸塩 重炭酸塩等 例えば 水素化ナトリウム 水素化リチウム 炭酸水素ナトリウム 炭酸水素カリウム 炭酸ナトリウム 炭酸カリウム 水酸化リチウム 水酸化ナトリウム 水酸化カリウム 水酸化カルシウム等 無機アルカリ金属アミト類 例えば リチウムアミド ナトリウムアミト カリウムアミド等

また 有機塩基として アルコラート 第3級アミノ類 ノアルキルアミノアニリン類及びピリノン類 例えば トリエチルアミン 1,1,4,4-テトラメチルエ

チレノジアミン(TMEDA) N,N-ジメチルアニリン N,N-ジエチルアニリン ピリ
 ノン 4-ジメチルアミノピリノン(DMAP) 1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(
 DABCO)及び1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)等 有機リチウム
 化合物 例えば メチルリチウム n-ブチルリチウム sec-ブチルリチウム te
 rt-ブチルリチウム フェニルリチウム ジメチル銅リチウム リチウム
 イソプロピルアミド リチウムシクロヘキシルイソプロピルアミド リチウム
 シクロヘキシルアミド n-ブチルリチウム DABCO n-ブチルリチウム DBU n
 -ブチルリチウム TMEDA等を挙げることができる

【0084】

製法(b)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般
 には約0~約150℃ 好ましくは約40~約80℃の間の温度が適当である
 また 該反応は常圧下で行うことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧
 下で操作することもできる

【0085】

製法(b)を実施するにあたっては 例えば 式(Ia)の化合物1モルに対
 し 2~20モル量の式(IV)の化合物を 1~2モル量のナトリウムメトキ
 サイト存在下で反応させることによって式(I)の目的化合物を得ることができ
 る

【0086】

上記製法(c)の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用
 される希釈剤の例としては 水 脂肪族 脂環族および芳香族炭化水素類(場合
 によっては塩素化されてもよい) 例えば ヘンタン ヘキサン シクロヘキサ
 ン 石油エーテル リグロイン ヘンゼン トルエン キノレン ジクロロメタ
 ン クロロホルム 四塩化炭素 1,2-ジクロロエタン クロルヘンゼン ジクロ
 ロベンゼン等 エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル
 イソプロピルエーテル ブチルエーテル ジオキサン ジメトキシエタン(DME)
 テトラヒドロフラン(THF) ジエチレングリコールジメチルエーテル(DGM)等
 ケトン類 例えば アセトン メチルエチルケトン(MEK) メチルイソプロピル
 ケトン メチルイソブチルケトン(MIBK)等 ニトリル類 例えば アセトニトリ

ル プロピオニトリル アクリロニトリル等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イノプロパノール ブタノール エチレングリコール等 エステル類 例えば 酢酸エチル 酢酸アミル等 酸アミト類 例えば ノメチルホルムアミト(DMF) ノメチルアセトアミト(DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ノメチル-2-イミダゾリノノン ヘキサメチルフォスフォリノクトリアミト(HMPA)等 スルホン スルホキント類 例えば ノメチルスルホキント(DMSO) スルホラノ等 塩基 例えば ピリノ等を挙げることができる

【0087】

製法(c)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般には約20～約180℃ 好ましくは約60～約120℃の間の温度が適当である また 該反応は常圧下で行つことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧下で操作することもできる

【0088】

製法(c)を実施するにあたっては 例えば 希釈剤例えばヘンゼン中で 式(Ia)の化合物1モルに対し 1～2モル量の式(V)の化合物を反応させることによって式(I)の目的化合物を得ることができる

【0089】

上記製法(d)の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用される希釈剤の例としては 水 脂肪族 脂環族および芳香族炭化水素類(場合によっては塩素化されてもよい) 例えば ヘンタン ヘキサン ノクロヘキサン 石油エーテル リグロイン ヘンゼン トルエン キノレン ノクロロメタン クロロホルム 四塩化炭素 1,2-ノクロロエタン クロルヘンゼン ノクロロヘンゼン等 エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル イノプロピルエーテル ブチルエーテル ノオキサン ノメトキノエタン(DME) テトラヒドロフラン(THF) ノエチレングリコールノメチルエーテル(DGM)等 ケトン類 例えば アセトン メチルエチルケトン(MEK) メチル-イノプロピルケトン メチルイノブチルケトン(MIBK)等 ニトリル類 例えば アセトニトリル プロピオニトリル アクリロニトリル等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イノプロパノール ブタノール エチレングリコール等 エス

テル類 例えば 酢酸エチル 酢酸アミル等 酸アミト類 例えば ノメチルホルムアミト(DMF) ノメチルアセトアミト(DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ノメチル-2-イミダゾリノノン ヘキサメチルフォスフォリクトリアミト(HMPA)等

スルホン スルホキンド類 例えば ノメチルスルホキント(DMSO) スルホラン等 塩基 例えば ピリノンを挙げる事ができる

【0090】

製法(d)は酸触媒の存在下で行うことができる 其の際に使用する酸触媒の例としては 鉱酸類 例えば 塩酸 硫酸 硝酸 臭化水素酸 亜硫酸水素ナトリウム等 有機酸類 例えば 蟻酸 酢酸 トリフルオロ酢酸 プロピオン酸 メタンスルホン酸 ヘンゼンスルホン酸 p-トルエンスルホン酸等 有機アミノ塩酸塩 例えば ピリノン塩酸塩 トリエチルアミノ塩酸塩等 アミンスルホン酸塩 例えば ピリノンp-トルエンスルホン酸塩 トリエチルアミンスルホン酸等を挙げる事ができる

【0091】

製法(d)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般には約20~約180℃ 好ましくは約60~約120℃の間の温度が適当である また 該反応は常圧下で行う事が望ましいが 場合によっては加圧または減圧下で操作することもできる

【0092】

製法(d)を実施するにあたっては 例えば 希釈剤例えばヘンゼン中で 式(Ia)の化合物1モルに対し 2モル~4モル量の式(VI)の化合物を 触媒量のp-トルエンスルホン酸存在下で反応させることによって式(I)の目的化合物を得ることができる

【0093】

上記製法(e)の反応は適当な希釈剤中で実施することができる 其の際に使用される希釈剤の例としては 水 脂肪族 脂環族および芳香族炭化水素類(場合によっては塩素化されてもよい) 例えば ヘンタン ヘキサン ノクロヘキサン 石油エーテル リグロイン ヘンゼン トルエン キノレン ノクロロメタン クロロホルム 四塩化炭素 1,2-ノクロロエタン クロルヘンゼン ノクロ

ロヘンゼン等 エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル
イノプロピルエーテル ブチルエーテル ノオキサノ ノメトキノエタノ(DME)
テトラヒドロフラン(THF) ノエチレングリコールノメチルエーテル(DGM)等
ケトン類 例えば アセトン メチルエチルケトン(MEK) メチル-イノプロピル
ケトン メチルイノブチルケトン(MIBK)等 ニトリル類 例えば アセトニトリ
ル プロピオニトリル アクリロニトリル等 アルコール類 例えば メタノー
ル エタノール イノプロパノール ブタノール エチレングリコール等 エス
テル類 例えば 酢酸エチル 酢酸アミル等 酸アミト類 例えば ノメチルホ
ルムアミド(DMF) ノメチルアセトアミト(DMA) N-メチルピロリトノ 1,3-ノメ
チル-2-イミダゾリノノノ ヘキサメチルフォスフォリノクトリアミト(HMPA)等
スルホノ スルホキント類 例えば ノメチルスルホキント(DMSO) スルホラ
ン等 塩基 例えば ビリノノ等をあげることができる

【0094】

製法(e)は触媒の存在下で行うことができ その際に使用しうる触媒の例と
しては 10%パラノウム-炭素等を挙げることができる

【0095】

製法(e)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般
には約0~約120℃ 好ましくは約25~約80℃の間の温度が適当である
また 該反応は常圧下で行うことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧
下で操作することもできる

【0096】

製法(e)を実施するにあたっては 例えば 希釈剤例えばメタノール中で
式(VII)の化合物1モルに対し 1~2モル量の水素ガスを 触媒量の10
%パラノウム-炭素存在下で反応させることによって式(I)の目的化合物を得
ることができる

【0097】

本発明の式(I)の活性化合物は除草剤として使用することができる 本明細
において「雑草」は 広義に 望ましくない場所に生育するすべての植物を意
味する 本発明の化合物は 使用濃度によって非選択性または選択性除草剤とし

て作用する 本発明の式 (I) の活性化合物は 例えば下記の雑草と栽培植物との間で使用することができる

【0098】

双子葉雑草の属 カラン (Sinapis) マメグンバイナズナ (Lepidium) ヤエムグラ キヌタノウ (Galium) ハコヘ (Stellaria) アカザ アリタノウ (Chenopodium) イラクサ (Urtica) ハンゴンノウ ノボロギク キオン (Senecio) ヒユ ハゲイトウ (Amaranthus) スヘリヒユ マノバボタノ (Portulaca) オナモミ (Xanthium) アサガオ (Ipomoea) ミチヤナギ (Polygonum) ブタクサ (Ambrosia) ノアザミ フノアザミ (Cirsium) ノゲン (Sonchus) ナス ジャガイモ イヌホオズキ (Solanum) イヌガラシ (Rorippa) オトリコノウ (Lamium) クワガタノウ イヌノフグリ (Veronica) チョウセンアサガオ (Datura) スミレ バンジョー (Viola) チノマオドロ (Galeopsis) ケン (Papaver) ヤグルマギク (Centaurea) ハキダメギク (Galinsoga) キカングサ (Rotala) アゼナ (Lindernia) 等

【0099】

双子葉栽培植物の属 ワタ (Gossypium) ダイズ (Glycine) フダンノウ サトウダイコン (Beta) ニンジン (Daucus) インゲンマメ アオイマダ (Phaseolus) エントウ (Pisum) ナス ジャガイモ (Solanum) アマ (Linum) サノマイモ アサガオ (Ipomoea) ノラマメ ナンテンハギ (Vicia) タバコ (Nicotiana) トマト (Lycopersicon) ナンキンマメ (Arachis) アブラナ ハクサイ カブラ キャベツ (Brassica) アキノノゲン (Lactuca) キュウリ メロン (Cucumis) カボチャ (Cucurbita) 等

【0100】

単子葉雑草の属 ヒエ (Echinochloa) エノコロ アワ (Setaria) キビ (Panicum) メヒンバ (Digitaria) アワガエリ チモニー (Phleum) イチゴノナギ スズメノカタビラ (Poa) ウノケグサ トボノガラ (Festuca) オヒンバノコクビエ (Eleusine) ドクムギ (Lolium) キノネガヤ イヌムギ (Bromus) カラスムギ オートムギ (エノバク) (Avena) カヤノリグサ パピルス ノチトウイ ハマスゲ (Cyperus) モロコシ (Sorghum) カモノグサ (Agropyron)

コナギ (Monochoria) テノノキ (Fimbristylis) オモダカ クワイ (Sagittaria) ハリイ クログワイ (Eleocharis) ホタルイ ウキヤグラ フトイ (Scirpus) スズメノヒエ (Paspalum) カモノハシ (Ischaemum) ヌカボ (Agrostis) スズメノテッポウ (Alopecurus) ギョウギンバ (Cynodon) 等

【0101】

単子葉栽培植物の属 イネ (Oryza) トウモロコシ ホノブコーシ (Zea) コムギ (Triticum) オオムギ (Hordeum) カラスムギ オートムギ (エンバク) (Avena) ライムギ (Secale) モロコシ (Sorghum) キビ (Panicum) サトウキビ ワセオバナ (Saccharum) パイナップル (Ananas) アスパラガス (Asparagus) ネギ ニラ (Allium) 等

【0102】

本発明の化合物の使用は 上記の植物に限定されることはなく 他の植物に対しても同様に適用され得る また 使用濃度によって 本発明の活性化合物は 雑草を非選択的に防除することができ 例えば 工場等の産業用地 鉄道軌道 道路 植林地 非植林地等において使用することができる

【0103】

更に 本発明の活性化合物は 多年性植物栽培において 雑草防除のために使用することができ 例えば 植林 観賞用植林 果樹園 ブドウ園 カンキノ果樹園 ナツノ果樹園 バナナ栽培場 コーヒー栽培場 茶栽培場 ゴム栽培場 ギネアアブラヤシ栽培場 ココア栽培場 小果樹園 ホップ栽培地等に適用することができ また 一年性植物栽培において 選択的雑草防除のためにも適用することができる

【0104】

本発明の式 (I) の活性化合物は使用に際して通常の製剤形態にすることができ そしてかかる形態としては 例えば 液剤 (乳剤等) 水和剤 エマルジョン 懸濁剤 粉剤 水和顆粒剤 錠剤 粒剤 懸濁エマルジョン濃厚物 重合体物質中のマイクロカプセル ジャンボ剤等を挙げることができる

【0105】

これらの製剤は それ自体既知の方法で製造することができ 例えば 活性化

合物を 展開剤 即ち 液体及び／又は固体の希釈剤又は担体 場合によっては 界面活性剤 即ち 乳化剤及び／又は分散剤及び／又は泡沫形成剤を用いて混合することによって調製することができる

【0106】

液体の希釈剤又は担体としては 例えば 芳香族炭化水素類（例えば キノレン トルエン アルキルナフタレン等） クロル化芳香族又はクロル化脂肪族炭化水素類（例えば クロロベンゼン類 塩化エチレン類 塩化メチレン等） 脂肪族炭化水素類〔例えば ノクロヘキサノ等 パラフィン類（例えば鉱油留分等）〕 アルコール類（例えば ブタノール グリコール等）並びにそれらのエーテル エステル等 ケトン類（例えば アセトン メチルエチルケトン メチルイソブチルケトン又はノクロヘキサノン等） 強極性溶媒（例えば ジメチルホルムアミド ジメチルスルホキシド等） 水等を挙げることもできる 展開剤として水を用いる場合には 例えば 有機溶媒を補助溶媒として使用することができる

【0107】

固体の希釈剤又は担体としては 例えば 粉碎天然鉱物（例えば カオリン クレー タルク チョーク 石英 アタパルガイト モンモリロナイト又は珪藻土等） 粉碎合成鉱物（例えば 高分散ケイ酸 アルミナ ケイ酸塩等）などを挙げることもできる 粒剤のための固体担体としては 粉碎且つ分別された岩石（例えば 方解石 大理石 軽石 海泡石 白雲石等） 無機及び有機物粉の合成粒 そして有機物質（例えば おがくず ココヤシの実のから とつもろこしの穂軸そしてタバコの茎等）の細粒体などを挙げることもできる

【0108】

乳化剤及び／又は泡沫剤としては 非イオン及び陰イオン乳化剤〔例えば ポリオキシエチレン脂肪酸エステル ポリオキシエチレン脂肪酸アルコールエーテル（例えば アルキルアリールポリグリコールエーテル アルキルスルホン酸塩 アルキル硫酸塩 アリールスルホン酸塩等）〕 アルブミン加水分解生成物などを挙げることもできる

【0109】

分散剤としては 例えば リグニンサルファイト廃液 メチルセルロースなどが包含される

【0110】

固着剤も製剤（粉剤 粒剤 ノンボ剤 乳剤）に使用することができ 該固着剤としては 例えば カルボキメチルセルロース 天然及び合成ポリマー（例えば アラビアゴム ポリビニルアルコールそしてポリビニルアセテート等）などを挙げる事ができる

【0111】

着色剤を使用することもでき 該着色剤としては 無機顔料（例えば 酸化鉄 酸化チタンそしてブルーアンブルー） アリザリン染料 アノ染料又は金属フタロニアン染料のような有機染料 更に 鉄 マンガン ボロン 銅 コバルト モリブデン 亜鉛等の金属の塩のよつな微量元素を挙げる事ができる

【0112】

該製剤は 一般には 前記活性成分を0.1~95重量% 好ましくは0.5~90重量%の範囲内で含有することができ

【0113】

本発明の式（I）の活性化合物は それ自体又はそれらの製剤形態で 雑草防除のために使用することができ また 公知の除草剤との混合剤としても使用することができ そのような混合剤は予め最終的な製剤形態に調製されていてもよく 或いは使用に際してタンクミックスすることもできる 混合剤としての可能な組み合わせとしては 例えば スルホニルウレア系の水田用除草剤を例示することができる

【0114】

また 本発明の式（I）の活性化合物は 薬害軽減剤との混合も可能であり この混合により 選択性除草剤としての適用をより広げることができる そのための薬害軽減剤としては 例えば 1-（ α - α -ジメチルヘノゾル）-3- β -トリルウレアを例示することができる

【0115】

驚くべきことに 本発明の化合物のいくつかの混合剤はまた相乗効果を現わす

【0116】

本発明の式(I)の活性化合物を使用する場合 そのまま直接使用するか あるいは前記製剤の形態で使用するか 又は更に希釈して調製された使用形態で施用することができ 例えば 液剤散布(watering) 噴霧(spraying atomising) 散粉又は散粒等の方法で施用することができる

【0117】

本発明の式(I)の活性化合物は 植物の発芽前及び発芽後のいずれの段階においても施用することができる また それらは播種前に土壌中に取り込ませることもできる

【0118】

本発明の活性化合物の施用量は 厳密に制限されるものではなく 望むべき効果 対象とする植物の種類 施用場所 施用時期等に応じて広い範囲にわたり変えることができるが 除草剤として使用する場合 使用濃度としては 例えば 1ヘクタール当り 活性化合物として 約0.001~約5kg 好ましくは約0.05~約2kgの範囲内を例示することができる

【0119】

次に 本発明の化合物の製造及び用途を下記の実施例により さらに具体的に示すが 本発明はこれのみに限定されるべきものではない なお 「部」は特にことわらない限り「重量部」である

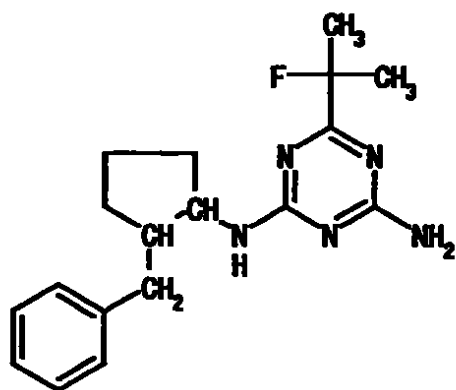
【0120】

【実施例】

合成例1

【0121】

【化 20】



濃塩酸 (3.6 ml) に氷冷下 2-ヘンゾルノクロヘンチルアミン (3 g) をゆっくり滴下した。そのまま 30 分間攪拌した後、減圧下水を留去し 2-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ塩酸塩 (3.1 g) を得た。

【0122】

上記の 2-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ塩酸塩 (3.1 g) およびノアノグアニノン (1.23 g) を n-デカノ (30 ml) に懸濁し、130℃ で 4.5 時間加熱した。冷後、析出した結晶を濾取し、n-ヘキサンで洗浄後、減圧下で乾燥し 2-ヘンゾルノクロヘンチルビグアニド塩酸塩 (3 g) を得た。

【0123】

乾燥メタノール 12 ml にナトリウム (0.31 g) を加え 5 分間攪拌した後、上記の 2-ヘンゾルノクロヘンチルビグアニド塩酸塩 (2 g) を加え室温で 30 分間攪拌した。次に α-フルオロ-α-メチルプロピオン酸メチル (1.62 g) を加え室温で 10 時間攪拌した後、水 50 ml を加え酢酸エチルエステルで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後酢酸エチルを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/1) に付し、2-アミノ-4-(2'-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロイソプロピル)-1,3,5-トリアゾン (1.65 g) を得た。

【0124】

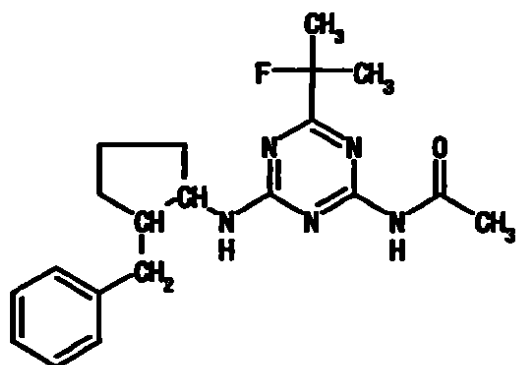
mp 50~55℃

【0125】

合成例 2

【0126】

【化21】



乾燥メタノール（5 ml）にナトリウム（0.1 g）を加え5分間攪拌した後、2-アミノ-4-(2'-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン（1 g）を加え50℃で1時間攪拌した。冷後、減圧下でメタノールを留去後、酢酸エチル（10 ml）を加え50℃で1時間攪拌した。冷後、水（30 ml）を加え酢酸エチルで抽出。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、酢酸エチルを減圧下留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン/酢酸エチル=3/2）に付し、2-アセチルアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン（0.57 g）を得た。

【0127】

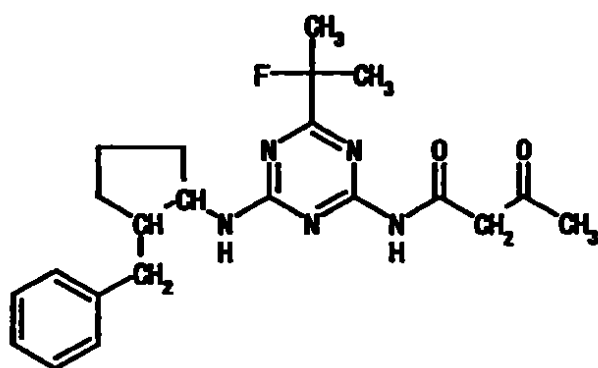
n_D^{20} 1.5512

【0128】

合成例3

【0129】

【化 2 2】



2-アミノ-4-(2'-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン(0.5g)及びアセチルメルトラム酸(0.28g)をヘンゼン(20ml)に溶解し、1時間加熱還流した。冷後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/2)に付し、2-アセトアセチルアミノ-4-(2'-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾン(0.55g)を得た。

【0130】

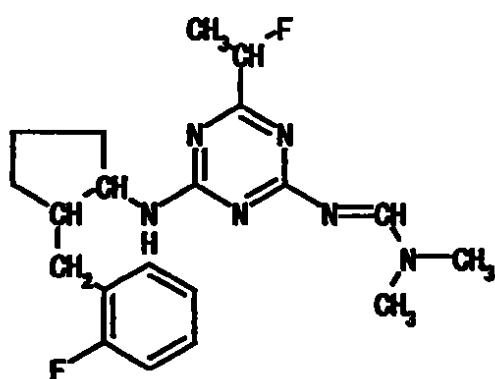
n_{20}^D 1.5433

【0131】

合成例 4

【0132】

【化 2 3】



2-アミノ-4-(2'-(2-(2-フルオロヘンゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(2-フルオロ-1-メチルプロピル)-1,3,5-トリアジン-4-イルアミノ)-6-(2-フルオロ-1-メチルプロピル)-1,3,5-トリアジン-4-イルアミノ-2-メチルプロパノ酸

) - 6 - (- フルオロイノプロピル) - 1 3 5 - トリアゾノ (0 3 g)

N N - ノメチルホルムアミトノメチルアセタール (0 3 2 g) および触媒量の p - トルエンスルホン酸 - 水和物をヘンゼン (20 ml) に溶解し 1 5 時間加熱還流した 冷後 減圧下溶媒を留去後 残渣をノリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒 ノクロロメタン メタノール = 90 5) に付し 2 - N N - ノメチルメチレノイミノ - 4 - (2 - (2 - フルオロヘノゾルノクロヘンチルアミノ) - 6 - (- フルオロイノプロピル) - 1 3 5 - トリアゾノ (0 3 4 g) を得た n_{20}^D 1 5 7 7 6

【0133】

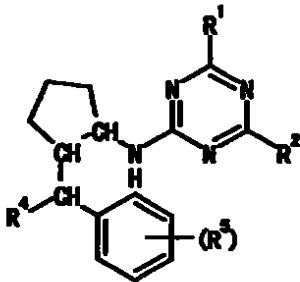
上記合成例 1 ~ 4 と同様にして得られる化合物を 合成例 1 ~ 4 で合成した化合物と共に 下記第 1 表に示す

【0134】

143
140

【表 1】

第 1 表



化合物 番号	R¹	R²	R⁴	(R⁵)	mp or n _D ²⁰
1	CH ₃	NH ₂	H	H	
2	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
3	C ₃ H _{7-n}	NH ₂	H	H	
4	C ₂ H _{7-iso}	NH ₂	H	H	
5	C ₄ H _{9-n}	NH ₂	H	H	
6	C ₄ H _{9-sec}	NH ₂	H	H	
7	C ₄ H _{9-iso}	NH ₂	H	H	
8	C ₄ H _{9-tert}	NH ₂	H	H	
9	C ₈ H _{11 n}	NH ₂	H	H	
10		NH ₂	H	H	
11		NH ₂	H	H	
12		NH ₂	H	H	
13		NH ₂	H	H	
14		NH ₂	H	H	
15	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
16	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
17	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
18	CHFCl	NH ₂	H	H	
19	CHFB _r	NH ₂	H	H	
20	CFCl ₂	NH ₂	H	H	

【 0 1 3 5 】

144
141

【表 2】

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁶) _n	mp or n _D ²⁰
21.	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
22.	CHF ₂	NH ₂	H	H	
23.	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
24.	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
25.	CF ₃	NH ₂	H	H	
26.	CCl ₃	NH ₂	H	H	
27.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	1 5557
28.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-F	1 5525
29.	CH ₃ CHF	N=CN(CH ₃) ₂	H	2-F	1 5776
30.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	1 5485
31.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
32.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	1 5420
33.	CH ₃ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
34.	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
35.	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
36.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	50~55°C
37.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-F	1.5469
38.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	1.5239
39.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
40.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-Cl	
41.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Cl	
42.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
43.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Br	
44.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Br	
45.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CH ₃	
46.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	1 5359
47.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
48.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-C ₂ H ₅	
49.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₂ H ₅	
50.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₃ H _{7-n}	

【 0 1 3 6 】

78
142

【表 3】

第 1 表 (続き)

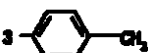
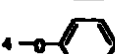
化合物		R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
51	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₈ H ₇ -180	
52	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₄ H ₉ -tert	
53	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CF ₃	
54	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CF ₃	
55	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CF ₃	
56	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
57	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
58	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
59	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OC ₂ H ₅	
60	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₂ H ₅	
61	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₈ H ₇ -180	
62	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCF ₃	
63	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCF ₃	
64	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCHF ₂	
65	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₂ CF ₃	
66	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
67	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₃	
68	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SC ₂ H ₅	
69	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-S(O)CH ₃	
70	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-S(O)CH ₃	
71	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SO ₂ CH ₃	
72	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SO ₂ CH ₃	
73	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCF ₃	
74	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCF ₃	
75	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₂ CF ₃	

【 0 1 3 7 】

446
43

【表 4】

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³) _n	mp or n _D ²⁰
76.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
77	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
78.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
79	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
80	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
81	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
82.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
83	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
84.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-NO ₂	
85	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CN	
86.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-F ₂	
87	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-F ₂	
88.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
89	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-Cl ₂	
90	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-Cl ₂	
91	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-Cl ₂	
92.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-(CH ₃) ₂	
93	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-(CH ₃) ₂	
94	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
95	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CF ₃) ₂	
96	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-(OCH ₃) ₂	
97	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,3,4-Cl ₃	
98	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4,6-(CH ₃) ₃	
99	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
100	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	1 5512

【 0 1 3 8 】

487
144

【表 5】

第 1 表 (続き)

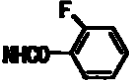
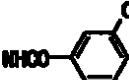
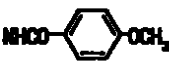
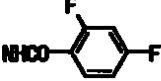
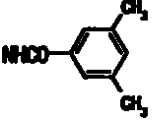
化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
101	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
102	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H _{7-n}	H	H	
103	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H _{7-iso}	H	H	
104	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H _{9-tert}	H	H	
105	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
106	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
107	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
108	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
109	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
110	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
111	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
112	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
113	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
114	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
115	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

【0 1 3 9】

148
145

【表 6】

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³) _n	mp or n _D ²⁰
116.	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
117	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
118	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
119	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
120	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
121	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	1 5433
122.	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
123	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
124	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
125	ClCH ₂ ClCH ₂	NH ₂	H	H	
126	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
127	CHF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
128.	CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
129	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
130	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	

【 0 1 4 0 】

249
146

【表 7】

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³) _n	mp or n _D ²⁰
131.	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
132		NH ₂	H	H	
133		NH ₂	H	H	
134		NH ₂	H	H	
135		NH ₂	H	H	
136		NH ₂	H	H	
137		NH ₂	H	H	
138		NH ₂	H	H	
139		NH ₂	H	H	
140		NH ₂	H	H	
141	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
142	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-F	
143	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
144	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
145	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	
146	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
147	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3-F	
148	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
149	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
150	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	

【 0 1 4 1 】

147

【表 8】

第 1 表 (続き)

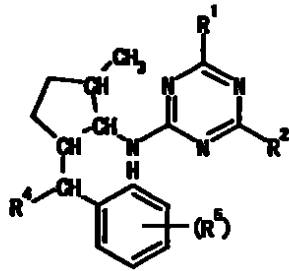
化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
151	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
152	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3-F	
153	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
154	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
155	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	
156	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
157	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
158	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
159	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
160	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
161	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
162	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
163	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
164	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
165	CF ₃	NH ₂	C ₈ H _{7-n}	H	
166	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₈ H _{7-n}	H	
167	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₈ H _{7-n}	H	

【 0 1 4 2 】

148

【表 9】

第 1 表 (続き)



化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
168	CF ₃	NH ₂	H	H	
169	CF ₃	NH ₂	H	2-F	
170	CF ₃	NH ₂	H	3-F	
171	CF ₃	NH ₂	H	4-F	
172	CF ₃	NH ₂	H	2-Cl	
173	CF ₃	NH ₂	H	3-Cl	
174	CF ₃	NH ₂	H	4-Cl	
175	CF ₃	NH ₂	H	3-Br	
176	CF ₃	NH ₂	H	3-CF ₃	
177	CF ₃	NH ₂	H	2-CH ₃	
178	CF ₃	NH ₂	H	3-CH ₃	
179	CF ₃	NH ₂	H	4-CH ₃	
180	CF ₃	NH ₂	H	2-OCH ₃	
181	CF ₃	NH ₂	H	3-OCH ₃	
182	CF ₃	NH ₂	H	4-OCH ₃	
183	CF ₃	NH ₂	H	3-SCH ₃	
184	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
185	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-F	
186	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
187	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
188	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-Cl	
189	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
190	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-Cl	

【 0 1 4 3 】

152
149

【表 1 0】

第1表 (続々)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³) _n	mp or n _D ²⁰
191	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-Br	
192.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CF ₃	
193	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-CH ₃	
194	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	
195	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-CH ₃	
196	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
197	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
198	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
199	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
200	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
201	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
202.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
203	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-F	
204.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	
205	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
206	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-Cl	
207	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Cl	
208.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
209	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Br	
210	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CF ₃	
211	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CH ₃	
212.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
213	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
214.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
215	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCH ₃	

【 0 1 4 4 】

150

【表 1 1】

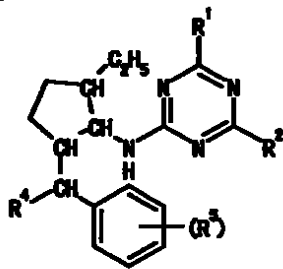
第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³) _n	mp or n _D ²⁰
216	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
217	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
218	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
219	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
220	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
221	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-F	
222	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
223	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3-F	
224	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
225	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3-F	
226	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
227	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
228	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
229	CF ₃	NH ₂	C ₆ H _{7-n}	H	
230	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₆ H _{7-n}	H	
231	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₆ H _{7-n}	H	

【 0 1 4 5 】

【表 1 2】

第 1 表 (続き)



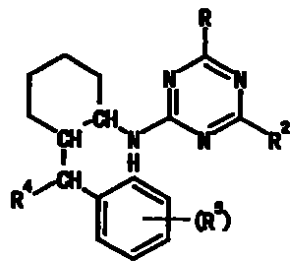
化合物		R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
番号						
232.	CF ₃	NH ₂	H	H		
233.	CF ₃	NH ₂	H	3-F		
234.	CF ₃	NH ₂	H	3-CH ₃		
235.	CF ₃	NH ₂	H	3,5-F ₂		
236.	CF ₃	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂		
237.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H		
238.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F		
239.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃		
240.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-F ₂		
241.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂		
242.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H		
243.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F		
244.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃		
245.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂		
246.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂		
247.	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H		
248.	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H		
249.	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H		
250.	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H		
251.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H		
252.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H		

【 0 1 4 6 】

152

【表 1 3】

第 1 表 (続き)



化合物		R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
253	CH ₃	NH ₂	H	H	
254	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
255	C ₃ H _{7-n}	NH ₂	H	H	
256	C ₃ H _{7-iso}	NH ₂	H	H	
257	C ₄ H _{9-n}	NH ₂	H	H	
258	C ₄ H _{9-sec}	NH ₂	H	H	
259	C ₄ H _{9-iso}	NH ₂	H	H	
260	C ₄ H _{9-tert}	NH ₂	H	H	
261	C ₃ H _{7-n}	NH ₂	H	H	
262		NH ₂	H	H	
263		NH ₂	H	H	
264		NH ₂	H	H	
265		NH ₂	H	H	
266		NH ₂	H	H	
267	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
268	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
269	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
270	CHFCl	NH ₂	H	H	

【 0 1 4 7 】

【表 1 4】

第 1 表 (続き)

化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
271	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
272.	CFCl ₂	NH ₂	H	H	
273	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
274	CHF ₂	NH ₂	H	H	
275	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
276	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
277	CF ₃	NH ₂	H	H	
278	CCl ₃	NH ₂	H	H	
279	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
280	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-F	
281	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	60~66°C
282	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
283.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	
284.	CH ₃ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
285	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
286.	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
287	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	1 5332
288.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-F	
289	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	72~80°C
290	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
291	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
292.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Cl	
293.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
294.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Br	
295	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Br	
296	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CH ₃	
297	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
298.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
299	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-C ₂ H ₅	
300	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₂ H ₅	

【 0 1 4 8】

154

【表 1 5】

第 1 表 (続々)

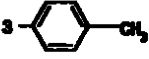
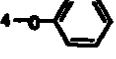
化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³) _n	mp or n _D ²⁰
301	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₃ H _{7-n}	
302	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₃ H _{7-iso}	
303	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₄ H _{9-tert}	
304	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CF ₃	
305	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CF ₃	
306	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CF ₃	
307	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
308	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
309	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
310	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OC ₂ H ₅	
311	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₂ H ₅	
312	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₃ H _{7-iso}	
313	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCF ₃	
314	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCF ₃	
315	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCHF ₂	
316	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₂ CF ₃	
317	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
318	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₃	
319	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SC ₂ H ₅	
320	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-S(O)CH ₃	
321	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-S(O)CH ₃	
322	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SO ₂ CH ₃	
323	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SO ₂ CH ₃	
324	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCF ₃	
325	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCF ₃	

【 0 1 4 9 】

155

【表 1 6】

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
326.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₂ CF ₃	
327	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
328.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4- 	
329	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
330	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
331	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
332	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
333	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-NO ₂	
334	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CN	
335	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-F ₂	
336.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-F ₂	
337	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
338.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-Cl ₂	
339	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-Cl ₂	
340	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-Cl ₂	
341	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-(CH ₃) ₂	
342	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-(CH ₃) ₂	
343	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
344.	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CF ₃) ₂	
345	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-(OCH ₃) ₂	

【0 1 5 0】

159
156

【表 1 7】

第 1 表 (続き)

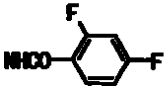
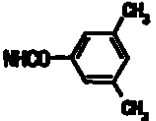
化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
346	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,3,4-Cl ₃	
347	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4,6-(CH ₃) ₃	
348	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
349	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	
350	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
351	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H _{7-n}	H	H	
352	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H _{7-iso}	H	H	
353	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H _{9-tart}	H	H	
354	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
355	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
356	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
357	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
358	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
359	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
360	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
361	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
362	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
363	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
364	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
365	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

【0 1 5 1】

760
157

【表 1 8】

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
366	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
367	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
368	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
369	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	
370	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
371	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
372	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
373	CH ₂ ClCH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
374	CH ₃ CF ₃	NH ₂	H	H	
375	CHF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
376	CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
377	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
378	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	
379	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
380	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-F	
381	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
382	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
383	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	
384	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
385	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3-F	

【 0 1 5 2 】

161
58

【表 1 9】

第 1 表 (続き)

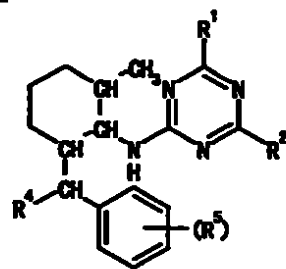
化合物		R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
386	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
387	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
388	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	
389	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
390	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3-F	
391	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
392	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
393	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	
394	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
395	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
396	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
397	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
398	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
399	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
400	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
401	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
402	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
403	CF ₃	NH ₂	C ₃ H _{7-n}	H	
404	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H _{7-n}	H	
405	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H _{7-n}	H	

【 0 1 5 3 】

159

【表 2 0】

第 1 表 (続き)



化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
406	CF ₃	NH ₂	H	H	
407	CF ₃	NH ₂	H	2-F	
408	CF ₃	NH ₂	H	3-F	
409	CF ₃	NH ₂	H	4-F	
410	CF ₃	NH ₂	H	2-Cl	
411	CF ₃	NH ₂	H	3-Cl	
412	CF ₃	NH ₂	H	4-Cl	
413	CF ₃	NH ₂	H	3-Br	
414	CF ₃	NH ₂	H	3-CF ₃	
415	CF ₃	NH ₂	H	2-CH ₃	
416	CF ₃	NH ₂	H	3-CH ₃	
417	CF ₃	NH ₂	H	4-CH ₃	
418	CF ₃	NH ₂	H	2-OCH ₃	
419	CF ₃	NH ₂	H	3-OCH ₃	
420	CF ₃	NH ₂	H	4-OCH ₃	
421	CF ₃	NH ₂	H	3-SCH ₃	
422	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
423	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-F	
424	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	
425	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
426	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-Cl	
427	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-Cl	
428	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-Cl	
429	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-Br	
430	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CF ₃	

【 0 1 5 4 】

163
160

【表 2 1】

第 1 表 (続き)

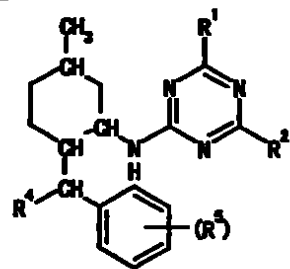
化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
431	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-CH ₃	
432	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	
433	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-CH ₃	
434	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
435	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
436	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
437	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
438	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
439	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
440	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
441	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-F	
442	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	
443	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
444	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-Cl	
445	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Cl	
446	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
447	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Br	
448	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CF ₃	
449	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CH ₃	
450	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
451	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
452	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
453	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
454	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
455	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
456	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
457	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
458	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
459	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
460	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
461	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
462	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
463	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

【 0 1 5 5 】

154
b1

【表 2 2】

第 1 表 (続表)



化合物 番号	R¹	R²	R⁴	(R⁵) _n	mp or n _D ²⁰
464.	CF ₃	NH ₂	H	H	
465	CF ₃	NH ₂	H	2-F	
466	CF ₃	NH ₂	H	3-F	
467	CF ₃	NH ₂	H	4-F	
468	CF ₃	NH ₂	H	2-Cl	
469	CF ₃	NH ₂	H	3-Cl	
470	CF ₃	NH ₂	H	4-Cl	
471	CF ₃	NH ₂	H	3-Br	
472	CF ₃	NH ₂	H	3-CF ₃	
473	CF ₃	NH ₂	H	2-CH ₃	
474	CF ₃	NH ₂	H	3-CH ₃	
475	CF ₃	NH ₂	H	4-CH ₃	
476.	CF ₃	NH ₂	H	2-OCH ₃	
477	CF ₃	NH ₂	H	3-OCH ₃	
478	CF ₃	NH ₂	H	4-OCH ₃	
479	CF ₃	NH ₂	H	3-SCH ₃	
480	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
481	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-F	
482.	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	
483	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
484	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-Cl	
485	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-Cl	
486	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-Cl	
487	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-Br	
488	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CF ₃	
489	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-CH ₃	
490	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	

【 0 1 5 6 】

765
162

【表 2 3】

第 1 表 (続き)

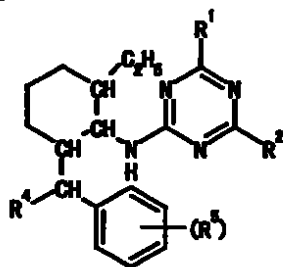
化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
491	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-CH ₃	
492	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
493	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
494	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
495	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
496	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
497	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
498	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
499	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-F	
500	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	
501	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
502	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-Cl	
503	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Cl	
504	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
505	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Br	
506	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CF ₃	
507	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CH ₃	
508	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
509	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
510	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
511	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
512	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
513	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
514	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
515	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
516	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
517	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
518	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
519	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
520	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
521	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

【 0 1 5 7 】

166
163

【表 2 4】

第 1 表 (続き)



化合物 番号	R¹	R²	R⁴	(R⁵) _n	mp or n _D ²⁰
522	CF ₃	NH ₂	H	H	
523	CF ₃	NH ₂	H	3-F	
524	CF ₃	NH ₂	H	3-CH ₃	
525	CF ₃	NH ₂	H	3,5-F ₂	
526	CF ₃	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
527	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
528	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	
529	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	
530	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
531	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
532	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
533	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	
534	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
535	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
536	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
537	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
538	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
539	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
540	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
541	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
542	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

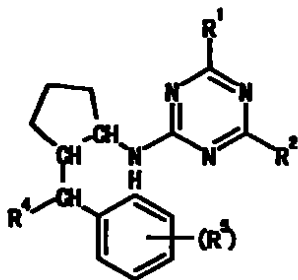
前記製法 (b) において 式 (IV) の化合物のかわりに ヨウ化メチル ヨウ化エチル又はヨウ化プロピルを用いて反応を行なうことにより得られる化合物を 下記第 2 表及び第 3 表に示す

167
164

【0158】

【表25】

第2表

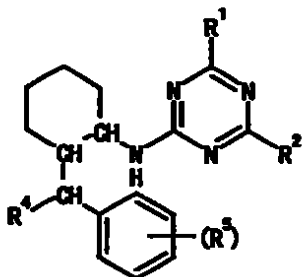


化合物 号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
543.	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
544.	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
545	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H _{7-n}	H	H	

【0159】

【表26】

第3表

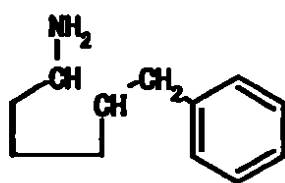


化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
546	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
547	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
548	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H _{7-n}	H	H	

合成例 5

【0160】

【化 24】



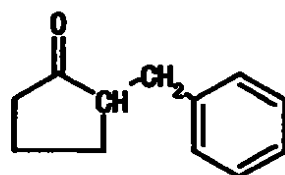
2-ヘンゾルノクロヘンタノン (11.51 g) とホルムアミト (44.41 ml) との混合物を 140~150℃ に加熱し、この温度を保ちながら蟻酸 (9.13 g) をゆっくり滴下した。滴下終了後、150℃ でさらに 2 時間加熱した。冷後、水を加え塩化メチレンで抽出した後、塩化メチレン層を水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。塩化メチレンを減圧下留去後、残さに濃塩酸 (36.85 ml) を加え、2 時間加熱還流した。冷後、水を加え水酸化ナトリウムでアルカリ性にした後、塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水で洗浄し、無水炭酸カリウムで乾燥させた後、減圧下塩化メチレンを留去し、残さを蒸留にて精製し、2-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ (5.18 g) を得た。 $n_{20}^D = 1.5371$

【0161】

合成例 6

【0162】

【化 25】



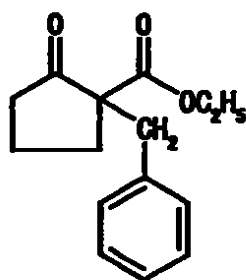
2-ヘンゾル-2-エトキノカルボニルノクロヘンタノン (23.17 g) に 48% 臭化水素酸 (50 ml) を加え、120℃ で 4 時間加熱還流した。冷後、氷 (100 g) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。ジエチルエーテル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ジエチルエーテルを減圧下留去後、残さを蒸留にて精製し、2-ヘンゾルノクロヘンタノン (11.51 g) を得た。 $n_{20}^D = 1.5288$

【0163】

合成例 7

【0164】

【化 26】



2-エトキシカルボニルノクロヘンタノン (13.37 g) の塩化メチレン (143 ml) 溶液にテトラブチルアンモニウム ハイトロゲンスルフェイト (29.1 g) ヘンゾルヨード (37.37 g) を加え ついて水酸化ナトリウム (6.86 g) の水 (143 ml) 溶液を加えた 混合物を室温下4時間攪拌した後 塩化メチレン層を分取し 水層を塩化メチレン (200 ml 3回) で抽出した 塩化メチレン層を合わせ 水 飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 飽和食塩水で洗浄し 無水硫酸ナトリウムで乾燥した 塩化メチレンを減圧下留去後残さをノリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒 ヘキサン 酢酸エチル=9:1) に付し 2-ヘンゾル-2-エトキシカルボニルノクロヘンタノン (16.8 g) を得た $n_D^{20}=1.5156$

【0165】

[生物試験例]

試験例 1 水田雑草に対する除草効果試験

活性化合物の調合剤の調製

担 体 アセトン 5 重量部

乳化剤 ヘンゾルオキノポリグリコールエーテル 1 重量部

活性物質の調合剤は 1 重量部の活性化合物と 上記の分量の担体および乳化剤とを混合することにより 乳剤として得られる その調合剤の所定薬量を水で希釈して試験に用いる

試験方法

温室内において 水田土壌を詰めた 500cm^2 ポットに 2 5葉期の(草丈 15cm)の水稻苗(品種 日本晴)を1ポット当り1株3本植えとした 次いで タイヌピエ タマガヤノリ ホタルイ コナギ 広葉雑草(アゼナ キカン グサ ミノハコハ ヒメミノハギ アブノメ等)の各種子を播種し 約 $2\sim 3\text{cm}$ 灌水した

【0166】

水稻移植5日後 前記調製法に従って調製した各活性化合物の調剤剤で水面処理した 処理後 3cm の灌水状態を保ち 散布3週間後に除草効果を調査した 除草効果の評価は 完全枯死を 100% とし 0% を除草効果なしとして行なった

【0167】

その結果 本発明の化合物 27 30 32および36の化合物は いずれも 薬量 0.25kg/ha で 水田雑草に対し十分な除草効果を示し 移植水稻に対し安全性を示した

【0168】

〔製剤例〕

製剤例1(粒剤)

本発明化合物No. 36(10部) ヘントナイト(モノモリロナイト)(30部) タルク(滑石)(58部)及びリグニンスルホン酸塩(2部)の混合物に 水(25部)を加え 良く捏化し 押し出し式造粒機により $10\sim 40\text{メノユ}$ の粒状とし $40\sim 50^\circ\text{C}$ で乾燥して粒剤とする

【0169】

製剤例2(粒剤)

$0.2\sim 2\text{mm}$ に粒度分布を有する粘土鉱物粒(95部)を回転混合機に入れ 回転下 液体希釈剤とともに本発明化合物No. 27(5部)を噴霧し均等に湿らせた後 $40\sim 50^\circ\text{C}$ で乾燥し粒剤とする

【0170】

製剤例3(乳剤)

本発明化合物No. 32(30部) キノレン(5部) ポリオキノエチレン

アルキルフェニルエーテル（8部）及びアルキルヘンゼンスルホン酸カルノウム（7部）を混合攪拌して乳剤とする

【0171】

製剤例4（水和剤）

本発明化合物No. 30（15部） ホワイトカーボン（含水無結晶酸化ケイ素微粉末）と粉末クレーとの混合物（15）（80部） アルキルヘンゼンスルホン酸ナトリウム（2部）及びアルキルナフタレンスルホン酸ナトリウムホルマリノ重合物（3部）を粉末混合し 水和剤とする

【0172】

製剤例5（水和顆粒）

本発明化合物No. 36（20部） リグニンスルホン酸ナトリウム（30部） ヘントナイト（15部）及び焼成ケイノウ土粉末（35部）を十分に混合し 水を加え 0.3mmのスクリーンで押し出し乾燥して 水和顆粒とする

【0173】

【発明の効果】

本発明の新規テトラノリノ誘導体は 上記生物試験例に示したように 除草剤として優れた性質を有している

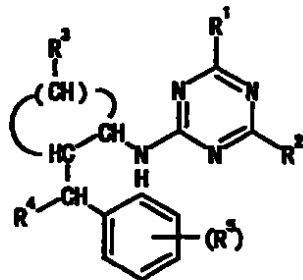
【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 除草剤の有効成分として優れた活性を示すトリアゾノ類を提供する

【解決手段】 式

【化 1】



式中

R¹はハロアルキル等を示し

R²はアミノ又はアルキルカルボニルアミノ等を示し

R³又はR⁴はそれぞれ独立に水素原子又はアルキルを示し

R⁵はハロゲン アルキル又はアルコキ等を示し

mは1～4の整数を示し

nは0～5の整数を示す

で表わされるトリアゾノ類

【選択図】 なし

認定・付加情報

特許出願の番号 平成11年 特許願 第255577号
受付番号 59900878776
書類名 特許願
担当官 第五担当上席 0094
作成日 平成11年 9月13日

<認定情報 付加情報>

【特許出願人】
【識別番号】 000232564
【住所又は居所】 東京都港区高輪4丁目10番8号
【氏名又は名称】 日本バイエルアグロケム株式会社
【代理人】 申請人
【識別番号】 100060782
【住所又は居所】 東京都港区赤坂1-9-15 日本自転車会館内
【氏名又は名称】 小田島 平吉
【選任した代理人】
【識別番号】 100074217
【住所又は居所】 東京都港区赤坂1-9-15 日本自転車会館内
小田島特許事務所
【氏名又は名称】 江角 洋治
【選任した代理人】
【識別番号】 100103311
【住所又は居所】 東京都港区赤坂1丁目9番15号 日本自転車会館
【氏名又は名称】 小田嶋 平吾

次頁無

171

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [000232564]

1 変更年月日 1993年 9月 8日
[変更理由] 住所変更
住 所 東京都港区高輪4丁目10番8号
氏 名 日本バイエルアグロケム株式会社

AZ 275

TRADUCCION Se traduce la caratula la descripción y las reivindicaciones anexas a una copia de la solicitud de patente Japonesa No Hei 11 255577 escrita en Japones Para el invento denominado nuevas 1 3 5 TRIAZINAS

-- --

**OFICINA DE PATENTES
GOBIERNO JAPONES**

Certifico que el anexo es una fiel copia de la siguiente solicitud como fue presentada en esta Oficina

Fecha de la solicitud	09 de Septiembre de 1999
Numero de solicitud	No Hei 11 255577
Solicitante	NIHON BAYER AGROCHEM K.K.
Fecha de certificacion	17 de Marzo de 2000

Director General

Firmado Ilegible T MOCHIZUKI
Oficina de Patentes

Certificado No 200 3016769

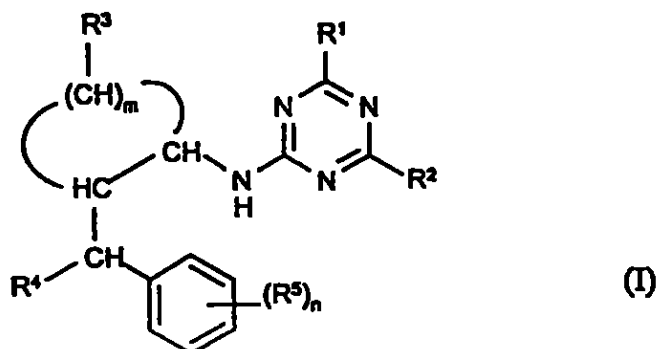
Cinta y Sello de Oblea

[Nombre del documento] Memoria descriptiva

[Título de la invención] 1 3 5 Triazinas herbicidas

[Reivindicaciones]

1 Triazinas representadas por la formula



en la que

R^1 representa alquilo de 1 a 5 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

74

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^5 representa halógeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 1-4

R^3 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un número entero de 2 o más

n representa un número entero de 0-5 y

R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

2 Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el que

R^1 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con flúor sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con flúor sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 5 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con flúor sustituido con

cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con cloro (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 3 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrogeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^5 representa fluoro cloro bromo metilo etilo n propilo isopropilo terc-butilo halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono) (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un numero entero de 2-4 en donde R^3 pueden ser identicos o diferentes

n representa un numero entero de 0-4 y

R^5 pueden ser identicos o diferentes en caso de que n represente un numero entero de 2 o mas

3 Un compuesto de acuerdo con la reivindicacion 1 en el que

R^1 representa metilo etilo n propilo isopropilo terc-butilo ciclopropilo clobutilo fluorometilo fluoroclorometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobromometilo trifluorometilo clorometilo triclorometilo bromometilo 1 fluoroetilo 2,2,2 trifluoroetilo 1,2,2,2 tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1 cloroetilo 1,2 dicloroetilo 1

bromoetilo perfluoropropilo 1 fluoro-1 metiletilo 1 cloro-1 metiletilo 1 bromo 1 metiletilo 1 (trifluorometil)-2,2,2 trifluoroetil bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con metilo

R^2 representa amino metilamino etilamino formilamino acetilamino etil carbonilamino ciclopropilcarbonilamino fluorometilcarbonilamino trifluorometil carbonilamino 1 fluoroetilcarbonilamino perfluoroetilcarbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con cloro o sustituido con metilo fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro sustituido con metilo o sustituido con metoxi acetoacetilamino o dimetilaminometilidenamino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un atomo de hidrogeno metilo o etilo

R^5 representa fluoro cloro metilo etilo trifluorometilo metoxi etoxi trifluorometoxi metiltio trifluorometiltio metilsulfinilo metilsulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo nitro o ciano

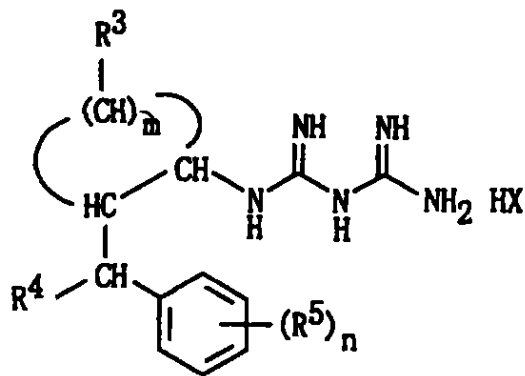
m representa un numero entero de 3-4 en donde R^3 pueden ser identicos o diferentes

n representa un numero entero de 0 3 y

R^5 pueden ser identicos o diferentes en caso de que n represente un numero entero de 2 o 3

4 Un producto quimico agricola que contiene como componente eficaz un compuesto de acuerdo con cualquiera de la reivindicaciones 1 3

5 Sales de biguanida representadas por la formula



en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se describen en la reivindicación 1 y

X representa un átomo de halógeno

DESCRIPCION DETALLADA DE LA INVENCION

Campo de aplicacion en las industrias

La presente invencion se refiere a nuevas 1,3,5 triazinas y a su aplicacion como herbicidas. La presente invencion se refiere ademas a procedimientos de preparacion de dichas triazinas herbicidas.

Tecnica anterior

Ya se sabe que ciertos tipos de triazinas muestran acciones como herbicidas (cfr WO 97/31904 WO 97/08156 WO 97/29095 etc.)

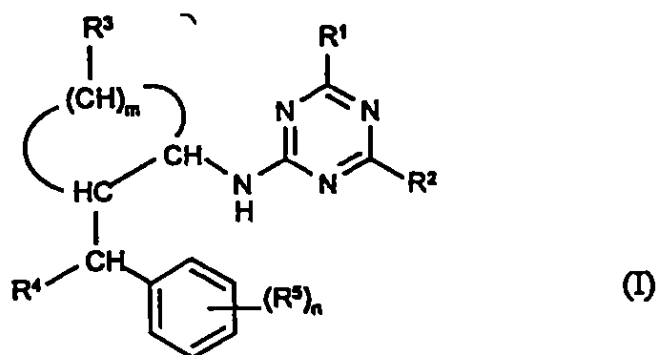
Problemas que va a solucionar la invencion

Sin embargo, los derivados de triazina convencionales no eran en general completamente satisfactorios en terminos de efectos y seguridad como herbicidas.

Medios para solucionar los problemas

Los presentes inventores realizaron una investigacion destinada a crear nuevos compuestos que tengan efectos superiores y seguridad superior como herbicidas.

Como resultado esta vez han encontrado nuevas 1,3,5 triazinas que tienen excelentes actividades biológicas representadas por la siguiente fórmula (I)



en la que

R^1 representa alquilo de 1 a 5 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^5 representa halógeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 1-4 y

R^3 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un número entero de 2 o más

n representa un número entero de 0-5 y

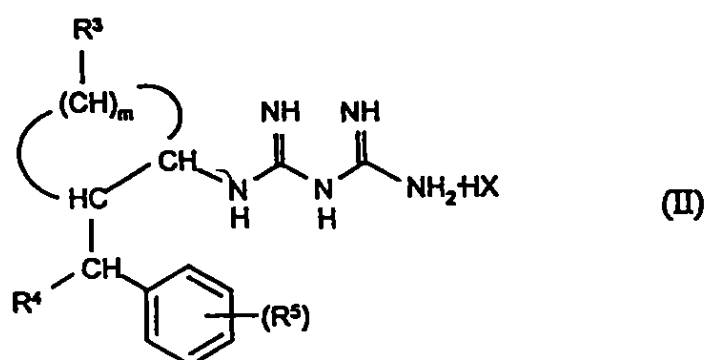
R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

Los compuestos de la fórmula (I) mencionada anteriormente de la presente invención pueden sintetizarse por ejemplo mediante cualquiera de los procedimientos de preparación (a) (e)

Procedimiento de preparación (a)

En caso de que R^2 represente amino

Un procedimiento para hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula



en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen la misma definicion que se menciona anteriormente

y

X representa halogeno preferiblemente cloro o bromo

con un ester de acido carboxilico representado por la formula



en la que

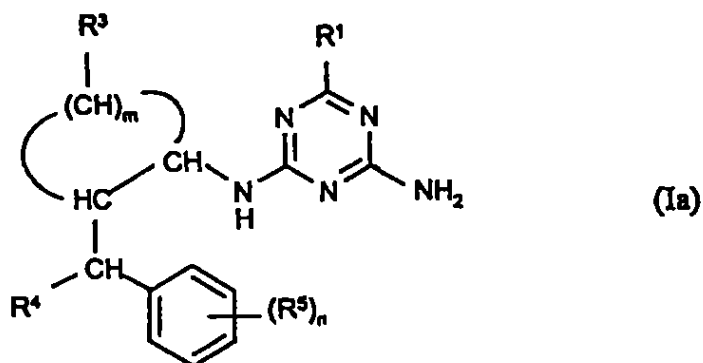
R^1 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente metilo o etilo

Procedimiento de preparacion (b)

En caso de que R^2 represente formilamino (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 atomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halogeno

Un procedimiento para hacer reaccionar un compuesto representado por la formula



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen la misma definición que se menciona anteriormente

con un ester de ácido carboxílico representado por la fórmula



en la que

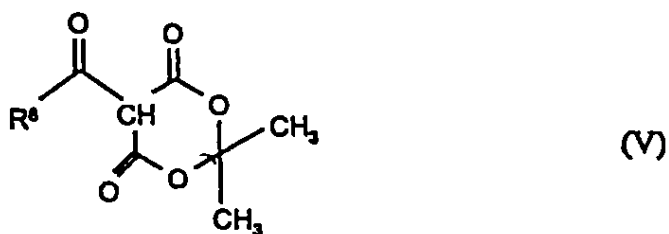
R^6 tiene la misma definición que se menciona anteriormente

R^7 representa un átomo de hidrógeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno

Procedimiento de preparación (c)

En caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 átomos de carbono) carbonilacetilamino

Un procedimiento para hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (Ia) mencionada anteriormente con un compuesto representado por la fórmula



en la que

R^6 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

Procedimiento de preparación (d)

En caso de que R^2 represente di(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

Un procedimiento para hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (Ia) mencionada anteriormente con un compuesto representado por la fórmula



en la que

R^6 tiene la misma definición que se menciona anteriormente

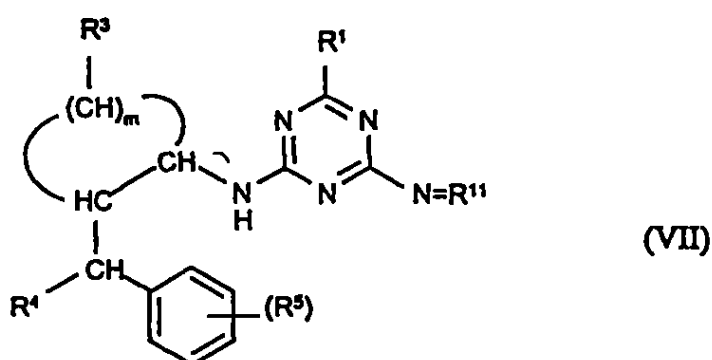
R^9 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 átomos de carbono y

R^{10} representa un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono preferiblemente un átomo de hidrógeno metilo o etilo

Procedimiento de preparación (e)

En caso de que R^2 represente (alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)amino

Un procedimiento para reducir un compuesto representado por la fórmula



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen la misma definición que se menciona anteriormente y

R^{11} representa alquilideno de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquilideno de 1 a 3 átomos de carbono

Las triazinas de la fórmula (I) proporcionadas por la presente invención muestran acciones herbicidas más fuertes en comparación con los compuestos descritos en las literaturas de la técnica anterior mencionadas previamente

En la presente memoria descriptiva

Halógeno representa flúor cloro bromo o yodo y preferiblemente representa flúor cloro o bromo

Alquilo puede ser de cadena lineal o cadena ramificada y puede representar por ejemplo alquilo de 1 a 4 átomos de carbono y pueden mencionarse específicamente metilo etilo n o iso propilo n iso sec o terc butilo etc

Como cicloalquilo pueden mencionarse por ejemplo ciclopropilo ciclobutilo ciclopentilo ciclohexilo etc

Haloalquilo es alquilo de cadena lineal o cadena ramificada sustituido con halógeno y pueden mencionarse por ejemplo alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con 1-9 flúor cloro y/o bromo específicamente fluorometilo fluoroclo

rometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobromometilo trifluorometilo clorometilo diclorometilo trichlorometilo bromometilo 1 fluoroetilo 2 fluoroetilo 2 2 2 trifluoroetilo 1 2 2 2 tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1 cloroetilo 1 2 dicloroetilo 1 bromoetilo perfluoropropilo 1 fluoro-1 metiletilo 1 cloro 1 metiletilo 1 bromo 1 metiletilo 1 (trifluorometil)-2 2 2 trifluoroetilo 2 cloro-1 1 2 trifluoroetilo 3 fluoropropilo 3 cloropropilo 2 2 3 3 3 pentafluoropropilo 1 2 2 3 3 3 hexafluoro propilo o perfluorobutilo etc

Alcoxí es alquil O del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo alcoxí de 1 a 4 átomos de carbono y pueden mencionarse específicamente metoxí etoxí n o iso-propoxí n iso sec o terc butoxí etc

Alquiltio es alquil S del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio y pueden mencionarse específicamente metiltio etiltio n o iso propiltio n iso sec- o terc-butiltio etc

Alquilsulfinilo es alquil SO del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo y pueden mencionarse específicamente metilsulfinilo etilsulfinilo n o iso-propilsulfinilo n iso sec o terc-butilsulfinilo etc

Alquilsulfonilo es alquil SO₂ del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo y pueden mencionarse específicamente metilsulfonilo etilsulfonilo n o iso propilsulfonilo n iso sec o terc butilsulfonilo etc

Alquilamino es alquil NH del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos

de carbono)amino y pueden mencionarse específicamente metilamino etilamino n o iso propilamino n iso sec- o terc-butilamino etc

Alquilcarbonilamino es alquil CONH del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo alquilcar bonilamino de 2 a 5 átomos de carbono en tota, y pueden mencionarse específi camente metilcarbonilamino etilcarbonilamino n o iso propilcarbonilamino n iso sec o terc-butilcarbonilamino etc

Cicloalquilcarbonilamino es cicloalquil CONH del que la parte de ci cloalquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo cicloalquilcarbonilamino de 4 a 7 átomos de carbono en total y pueden mencionarse específicamente ciclopropilcarbonilamino o ciclobutilcarbonilamino ciclopentilcarbonilamino ciclohexilcarbonilamino etc

Haloalquilcarbonilamino es haloalquil CONH del que la parte de haloal quilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejem plo haloalquilcarbonilamino de 2 a 5 átomos de carbono en total y pueden mencio narse específicamente fluorometilcarbonilamino difluorometilcarbonilamino difluo roclorometilcarbonilamino difluorobromometilcarbonilamino trifluorometilcarbo nilamino 1 fluoroetilcarbonilamino 2 fluorometilcarbonilamino 2 2 2 trifluoroetilcarbonilamino 1 2 2 2 tetrafluoroetilcarbonilamino perfluoroetilcarbo nilamino perfluoropropilcarbonilamino perfluorobutilcarbonilamino etc

En bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o susti tuido con alquilo y bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo la parte de halogeno tiene el mismo signifi cado que el halogeno mencionado anteriormente y la parte de alquilo tiene el mis mo significado que el alquilo mencionado anteriormente Como ejemplos específi cos de bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido

con alquilo" pueden mencionarse bencilo 2 (3 y 4) fluorobencilo o 2 (3 y 4) clorobencilo 2 (3 y 4) metilbencilo 2 3 (2 4- 2 5 2 6 3 4 3 5) difluorobencilo etc y como ejemplos específicos de bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse bencilcarbonilamino 2 3 o 4 fluorobencilcarbonilamino 2 3 o 4 clorobencilcarbonilamino 2 3 o 4 metilbencilcarbonilamino 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 difluorobencilcarbonilamino etc

En fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo la parte de halogeno tiene el mismo significado que el halogeno mencionado anteriormente y la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente. Como ejemplos específicos de fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse fenilo 2 3 o 4 fluorofenilo 2 3 o 4-clorofenilo 2 3 o 4 metilfenilo 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 difluorofenilo 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 diclorofenilo o 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 dimetilfenilo etc

En fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo la parte de halogeno tiene el mismo significado que el halogeno mencionado anteriormente y la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente. Como ejemplos específicos de fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse anilino 2 3 o 4 fluoroanilino 2 3 o 4 cloroanilino 2 3 o 4-metilanilino 2 3 o 4 metoxianilino 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 difluoroanilino 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 dicloroanilino 2 3 2 4 2 5 2 6- 3 4 o 3 5 dimetanilino etc

En alquilcarbonilacetilamino la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente y como ejemplos específicos de alquil

carbonilacetilamino pueden mencionarse acetoacetilamino propionilacetilamino butirilacetilamino isobutirilacetilamino valerilacetilamino isovalerilacetilamino pivaloilacetilamino etc

En "dialquilaminoalquilidenamino" la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente y la parte de alquilideno mencionada anteriormente puede ser de cadena lineal o cadena ramificada y puede representar por ejemplo alquilideno de 1 a 4 átomos de carbono. Como ejemplos de dialquilaminoalquilidenamino pueden mencionarse dimetilaminometilidenamino 1 (dimetilamino)etilidenamino 1 (dimetilamino)(n propiliden)amino 1 (dimetilamino)(n butiliden)amino 1 (dimetilamino)(iso butiliden)amino dietilaminometilidenamino di(n propil)aminometilidenamino di(n butil)aminometilidenamino (N metil N etilamino)metilidenamino (N metil N (n propil)amino)metilidenamino etc

Como el grupo preferible de compuestos de la presente invención, pueden mencionarse compuestos en los que en la fórmula (I)

R^1 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 5 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con

cloro (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 3 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^5 representa fluor cloro bromo metilo etilo n propilo isopropilo terc-butilo halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono) (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluor sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluor sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 2-4 en donde R^3 pueden ser idénticos o diferentes

n representa un número entero de 0-4 y

R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o mas

Y como el grupo mas preferible de compuestos pueden mencionarse compuestos en los que en la formula (I) mencionada anteriormente

R^1 representa metilo etilo n propilo isopropilo terc-butilo ciclopropilo ciclobutilo fluorometilo fluoroclorometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobromometilo trifluorometilo clorometilo triclorometilo bromometilo 1 fluoroetilo 2 2 2 trifluoroetilo 1 2 2 2 tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1 cloroetilo 1 2 dicloroetilo 1 bromoetilo perfluoropropilo 1 fluoro 1 metiletilo 1 cloro-1 metiletilo 1 bromo 1 metiletilo 1 (trifluorometil) 2 2 2 trifluoroetilo bencilo que puede estar opcional

mente sustituido con fluoro o sustituido con metilo o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con metilo

R^2 representa amino metilamino etilamino formilamino acetilamino etil carbonilamino ciclopropilcarbonilamino fluorometilcarbonilamino trifluorometil carbonilamino 1 fluoroetilcarbonilamino perfluoroetilcarbonilamino bencilcarbo nilamino que puede estar opcionalmente sustituido con cloro o sustituido con metilo fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro sustituido con metilo o sustituido con metoxi acetoacetilamino o dimetilaminometilidenamino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un atomo de hidrogeno metilo o etilo

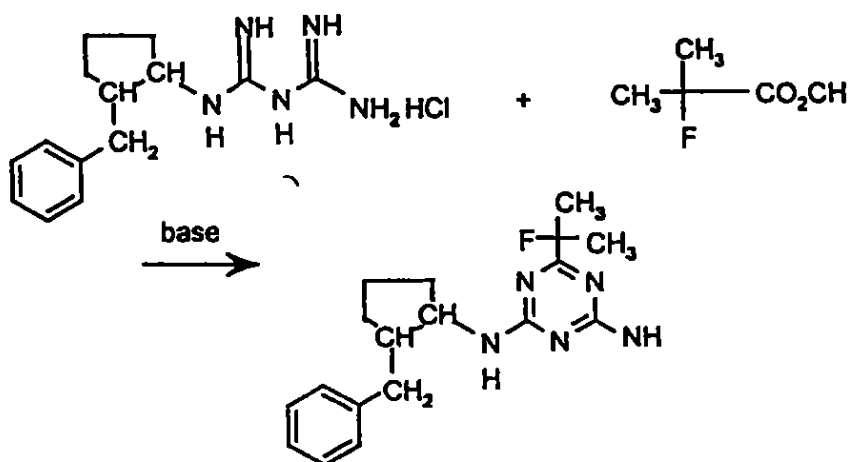
R^5 representa fluoro cloro metilo etilo trifluorometilo metoxi etoxi trifluorometoxi metiltio trifluorometiltio metilsulfinilo metilsulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo nitro o ciano

m representa un numero entero de 3 o 4 en donde R^3 pueden ser identicos o diferentes

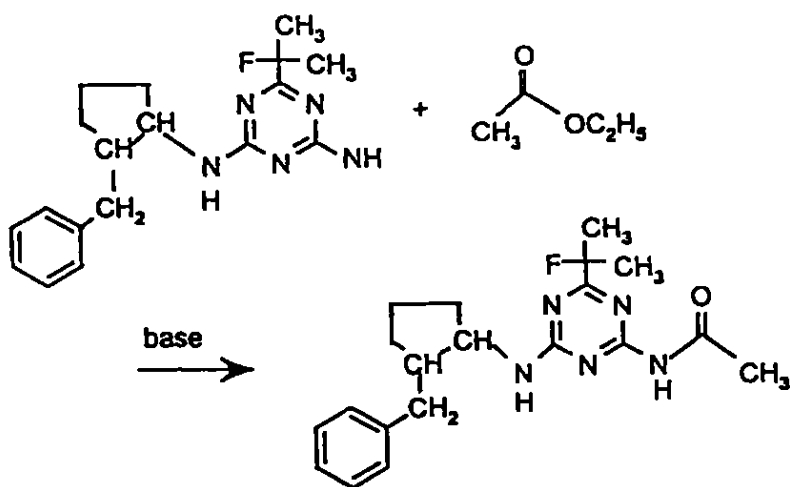
n representa un numero entero de 0 3 y

R^5 pueden ser identicos o diferentes en caso de que n represente un numero entero de 2 o 3

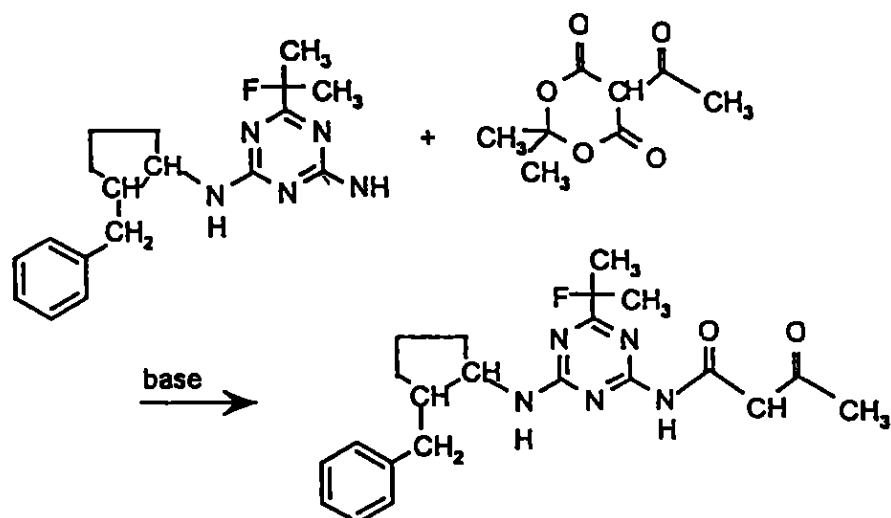
El procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocloreto de 2 bencilciclopentilbiguanida y α fluoro α metilpropionato de metilo como los materiales de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



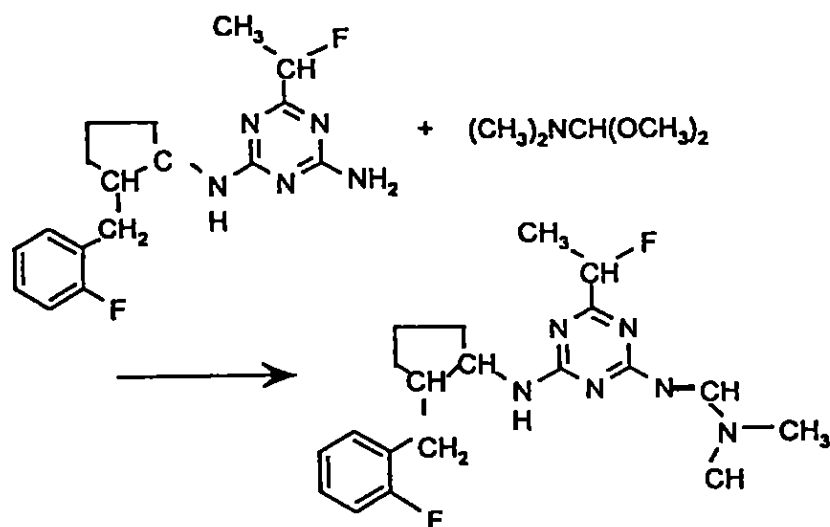
El procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen 2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina y acetato de etilo como los materiales de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



El procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocloreuro de 2 amino 4 (2 bencilciclopentilamino)-6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina y acetyl acido de Meldrum como los materiales de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion

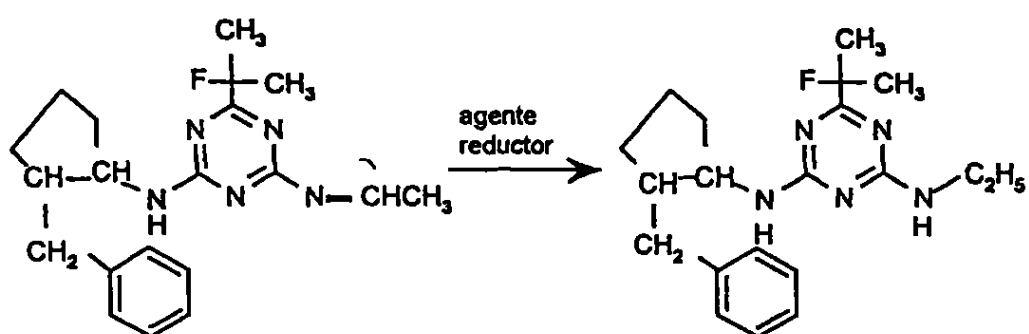


El procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocloreuro de 2 amino-4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina y dimetilacetal de N N dimetilformamida como los materiales de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion

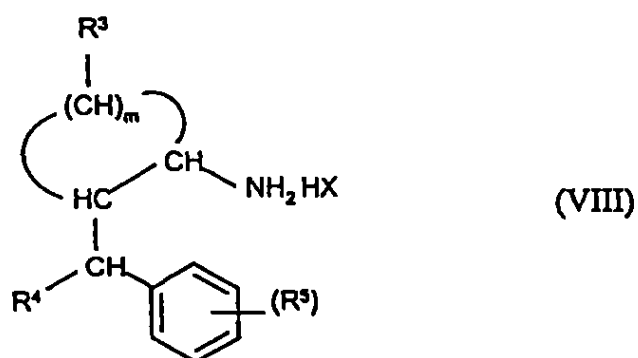


El procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se use 2 etilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina como el material de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion

192



Los compuestos de la formula (II) los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente son nuevos compuestos que no estan descritos en las literaturas hasta ahora y pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en las Solicitudes de Patente Japonesa Abiertas a Consulta por el Publico N° 246279/1989 264465/1988 222166/1988 N° 146876/1988 N° 51379/1988 haciendo reaccionar por ejemplo un compuesto de la formula



en la que

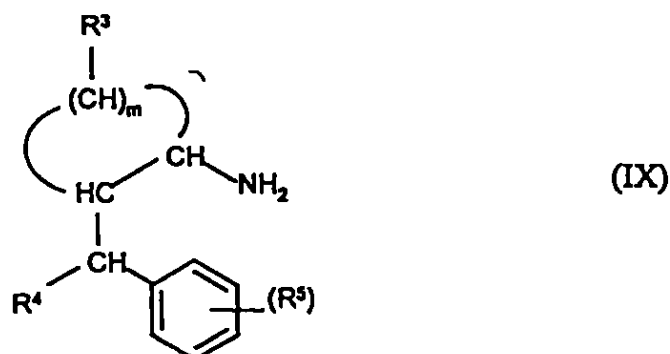
R^3 R^4 R^5 m y n tienen la misma definicion que se menciona anteriormente y

X representa halogeno

con cianoguanidina en un diluyente apropiado por ejemplo n decano

Los compuestos de la formula (VIII) mencionada anteriormente pueden prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la siguiente formula que

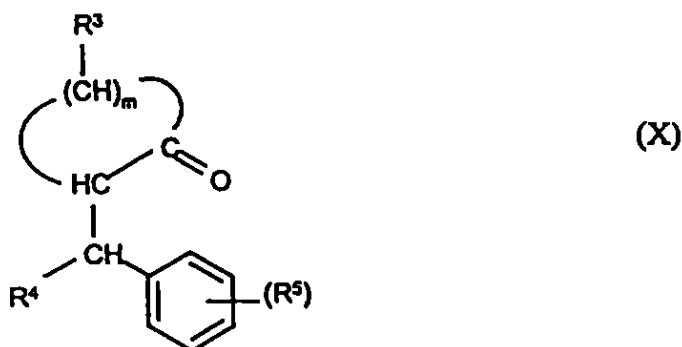
incluye parcialmente nuevos compuestos



en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen la misma definicion que se menciona anteriormente con un acido halohidrico apropiado por ejemplo acido clorhidrico

Los compuestos de la formula (IX) mencionada anteriormente una parte de los cuales son compuestos nuevos que no estaban descritos en las literaturas hasta ahora pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento descrito en, por ejemplo Organic Reaction Vol 5 p 301 (1962) John Wiley & Sons INC a saber mediante la reaccion de Leuckart de un compuesto representado por la formula

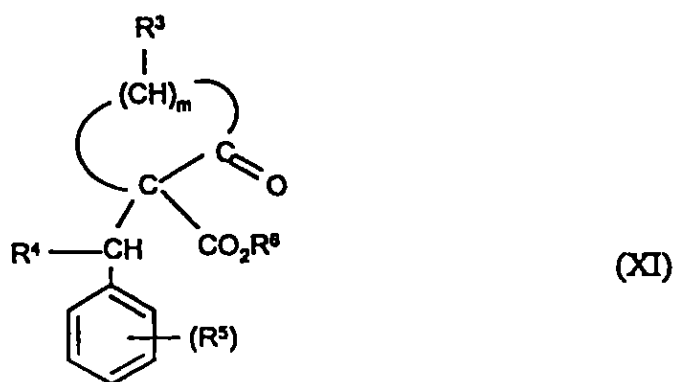


en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen la misma definicion que se menciona anteriormente usando formamida y acido formico

Los compuestos de la formula (X) mencionada anteriormente una parte de

los cuales son nuevos compuestos que no estaban descritos en las literaturas hasta ahora, pueden prepararse fácilmente mediante por ejemplo la descarboxilación comúnmente conocida de un β cetéster a saber a partir de un compuesto representado por la fórmula



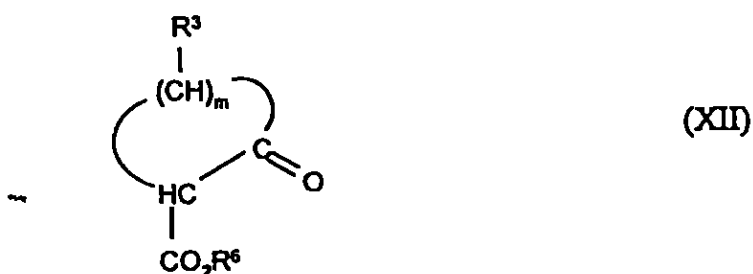
en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen la misma definición que se menciona anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

usando un ácido mineral apropiado por ejemplo ácido bromhídrico

Los compuestos de la fórmula (XI) mencionada anteriormente una parte de los cuales son nuevos compuestos que no están descritos en las literaturas hasta ahora pueden obtenerse fácilmente por ejemplo mediante el procedimiento descrito en SEIMITSU YUKI GOSEI (Precise organic syntheses) Nankodo p 160 1983 a saber haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula

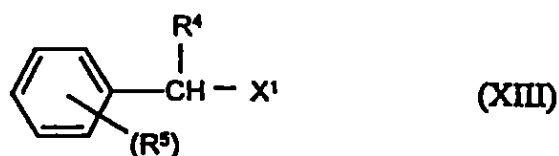


en la que

R^3 y m tienen la misma definición que se menciona anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

con un compuesto representado por la fórmula



en la que

R^4 , R^5 y n tienen la misma definición que se menciona anteriormente y

X^1 representa halógeno

usando un agente de condensación apropiado por ejemplo una solución acuosa de hidróxido sodio en un diluyente apropiado por ejemplo diclorometano en presencia de un catalizador de transferencia de fase por ejemplo hidrosulfato de tetrametilamonio

Los compuestos de la fórmula (XII) mencionados anteriormente una parte de los cuales son nuevos compuestos que no estaban descritos en las literaturas hasta ahora pueden prepararse fácilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en Organic Reaction Vol 15 p 1 (1967) John Wiley & Sons INC

Los compuestos de la fórmula (XIII) mencionada anteriormente son compuestos conocidos y pueden prepararse fácilmente de acuerdo con el procedimiento descrito en por ejemplo "SHIN JIKKEN KAGAKU KOZA (New experimental chemistry lectures) editado por Chemical Society of Japan, Vol 14(I) p 331 1962 publicado por Maruzen

Como ejemplos específicos de los compuestos de la fórmula (II) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparación (a) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

196 199

hidrocloruro de 2 bencilciclopentilbiguanida,
hidrocloruro de 2-(2 fluorobencil)ciclopentilbiguanida,
hidrocloruro de 2-(3 fluorobencil)ciclopentilbiguanida,
hidrocloruro de 2-(3 metilbencil)ciclopentilbiguanida,
hidrocloruro de 2 bencilciclohexilbiguanida
hidrocloruro de 2-(2 fluorobencil)ciclohexilbiguanida,
hidrocloruro de 2-(3 fluorobencil)ciclohexilbiguanida,
hidrocloruro de 2-(3 metilbencil)ciclohexilbiguanida, etc

Los compuestos de la formula (III) son compuestos conocidos y pueden usarse productos comerciales. Tambien pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito en EP A 850911

Como ejemplos especificos de los compuestos de la formula (III) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

fluoroacetato de etilo
fluorocloroacetato de etilo
fluorobromoacetato de etilo
difluorocloroacetato de etilo
dibromofluoroacetato de etilo
trifluoroacetato de etilo
pentafluoropropionato de metilo
 α fluoropropionato de etilo
 α fluoro- α metilpropionato de etilo
acetato de etilo
propionato de etilo

n butirato de etilo

isobutirato de etilo

ciclopropanocarboxilato de etilo

ciclopentanocarboxilato de etilo

ciclohexanocarboxilato de etilo etc

Los compuestos de la formula (Ia) usados como materiales de partida en los procedimientos de preparacion (b) (d) mencionados anteriormente son una parte de los compuestos de la formula (I) de la presente invencion y pueden prepararse facilmente mediante el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente

En el procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente los compuestos de la formula (IV) se basan en la definicion de R^6 mencionada anteriormente y R^7 representa un atomo de hidrogeno alquilo de 1 a 4 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 6 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 atomos de carbono) bencilo que puede estar sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilo que puede estar sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halogeno Preferiblemente se basan en la definicion preferible mencionada anteriormente de R^6 y R^7 representa alquilo de 1 a 3 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 atomos de carbono) bencilo que puede estar sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 atomos de carbono o fenilo que puede estar sustituido con alquilo de 1 a 3 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 3 atomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con cloro

Los compuestos de la formula (IV) son compuestos conocidos y pueden usarse productos comerciales O pueden sintetizarse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en EP A 850911

Como ejemplos especificos de los compuestos de la formula (Ia) usados como

198 201

los materiales de partida en los procedimientos de preparacion (b) (d) mencionados anteriormente que se incluyen en la formula (I) pueden mencionarse

2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina

2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4-(2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2 amino 4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (trifluorometil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina

2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina

2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (trifluorometil) 1 3 5 triazina

2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina

2 amino 4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6-(α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclohexilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina

2 amino 4 (2 (3 fluorobencil)ciclohexilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina

2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclohexilamino) 6 isopropil 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclohexilamino) 6 etil 1 3 5 triazina etc

Como ejemplos especificos de los compuestos de la formula (IV) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

acetato de etilo

propionato de etilo

n butirato de etilo

isobutirato de etilo

pivalato de etilo

ciclopropanocarboxilato de etilo

ciclopentanocarboxilato de etilo

ciclohexanocarboxilato de etilo

fenilacetato de etilo

benzoato de etilo

3 metilbenzoato de etilo

2 clorobenzoato de etilo

trifluoroacetato de etilo etc

Los compuestos de formula (V) materiales de partida en el procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente son compuestos conocidos y pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en Chem Pharm Bull (1987) 35(5) 1860 1870

Como ejemplos especificos de los compuestos de la formula (V) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

5 acetil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona

5 propionil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona

5 butiril 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona

5 isobutiril 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6-diona,

5 ciclopropilcarbonil 2 2 dimetil 1 3 dioxan 4 6 diona

5 ciclohexilcarbonil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona

5 (2 fluorobenzoil) 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona etc

Los compuestos de formula (VI) materiales de partida en el procedimiento de

preparacion (d) mencionado anteriormente son compuestos conocidos y pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Publico N° 277251/1996

Como ejemplos especificos de los compuestos de la fórmula (VI) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

- dimetilacetal de N N dimetilformamida,
- dimetilacetal de N N dietilformamida,
- dimetilacetal de N N dipropilformamida,
- dimetilacetal de N metil N etilformamida,
- dimetilacetal de N metil N propilformamida,
- dietilacetal de N N dimetilformamida
- dietilacetal de N N dietilformamida,
- dimetilacetal de N N dimetilacetamida
- dimetilacetal de N N dietilacetamida etc

Los compuestos de la formula (VII) los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente son compuestos nuevos que no estaban descritos en las literaturas hasta ahora y pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento descrito en por ejemplo la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Publico N° 51379/1988 por ejemplo haciendo reaccionar un compuesto de la formula (Ia) mencionada anteriormente con un aldehído alifático o una cetona alifática con el numero total de carbonos de 1 4 representados por la formula



Los compuestos de la formula (XIV) son compuestos conocidos y pueden usarse productos comerciales

Como ejemplos especificos de los compuestos de la formula (VII) usados

como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente pueden mencionarse los siguientes

- 2 metilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina
- 2 etilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino)-6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 propilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina
- 2 isopropilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 metilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 etilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 propilidenamino 4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 metilidenamino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
- 2 etilidenamino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
- 2 etilidenamino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina
- 2 etilidenamino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina
- 2 etilidenamino 4 (2 bencilciclohexilamino) 6 isopropil 1 3 5 triazina etc

Ademas de acuerdo con el procedimiento (b) mencionado anteriormente usando en lugar de compuestos de la formula (IV) un compuesto representado por la formula



en la que

- R¹² representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono y
- X¹ representa halogeno

tambien puede prepararse un compuesto que se prepara mediante el metodo de preparacion (e) mencionado anteriormente a saber un compuesto de la formula (I) de la presente invencion en la que R^2 representa (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)amino

La reaccion del procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse eteres por ejemplo eter etilico metil etil eter eter iso propilico eter butilico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) eter dimetilico de dietilenglicol (DGM) etc alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol butanol etilenglicol etc amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona 1 3 dimetil 2 imidazolidinona, triamida hexametilfosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina etc etc

El procedimiento de preparacion (a) puede efectuarse en presencia de un agente de condensacion Como un agente de condensacion utilizable en ese caso pueden mencionarse como bases inorganicas hidruros hidroxidos carbonatos bicarbonatos etc de metales alcalinos y metales alcalinoterreos por ejemplo hidruro sodico hidruro de litio hidrogenocarbonato sodico hidrogenocarbonato potasico carbonato sodico carbonato potasico hidroxido de litio hidroxido sodico hidroxido potasico hidroxido calcico etc amidas de metales alcalinos inorganicas por ejemplo amida de litio amida sodica amida potasica etc y como bases organicas alcohólicos aminas terciarias dialquilaminoanilinas y piridinas por ejemplo metoxido sodico etoxido sodico terc butoxido potasico trietilamina 1 1 4 4 tetrametiletildiamina (TMEDA) N N dimetilnilina N N dietilnilina piridina 4 dimetilaminopiridina (DMAP) 1 4 diazabicyclo[2 2 2]octano (DABCO) 1 8 diazabicyclo[5 4 0]undec-7 eno (DBU) etc

El procedimiento de preparacion (a) puede efectuarse en un intervalo sustancialmente amplio de temperatura. Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 a aproximadamente 100°C preferiblemente de aproximadamente 20 a aproximadamente 80°C. Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal. Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida.

Al efectuar el procedimiento de preparacion (a) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la formula (II) con 0.8 a 2.2 moles de un compuesto de la formula (III) en un diluyente por ejemplo metanol en presencia de 2 a 3 moles de metoxido sodico.

Ademas en el procedimiento de preparacion (a) la reaccion para producir el compuesto de la formula (II) a partir de un compuesto de la formula (IX) a traves de un compuesto de la formula (VIII) tambien puede efectuarse continuamente.

La reaccion del procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse agua, hidrocarburos alifaticos, aliciclicos y aromaticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano, hexano, ciclohexano, eter de petroleo, ligroina, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, diclorobenceno, etc. eteres por ejemplo eter etilico, metil etil eter, eter isopropilico, eter butilico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), eter dimetilico de dietilenglicol (DGM), etc. cetonas por ejemplo acetona, metil etil cetona (MEK), metil isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK), etc. nitrilos por ejemplo acetoniitrilo, propionitrilo, acrilonitrilo, etc. alcoholes por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol, etilenglicol, etc. esterres por ejemplo acetato de etilo, acetato de amilo, etc. amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida.

da (DMA) N metilpirrolidona, 1 3-dimetil 2 imidazolidinona, triamida hexametil fosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina, etc

El procedimiento de preparacion (b) puede efectuarse en presencia de una base Como una base utilizable en ese caso pueden mencionarse como bases inorganicas hidruros hidroxidos carbonatos bicarbonatos etc de metales alcalinos y metales alcalinoterreos por ejemplo hidruro sódico hidruro de litio hidrogenocarbonato sodico hidrogenocarbonato potasico carbonato sodico carbonato potasico hidroxido de litio hidroxido sodico hidroxido potasico hidroxido calcico etc amidas de metales alcalinos inorganicas por ejemplo amida de litio amida sodica amida potasica, etc y como bases organicas alcoholatos aminas terciarias dialquilaminoanilinas y piridinas por ejemplo trietilamina, 1 1 4 4 tetrametiletildiamina (TMEDA) N N dimetilanilina N N dietilanilina piridina 4 dimetilaminopiridina (DMAP) 1 4 diazabicyclo[2 2 2]octano (DABCO) 1 8 diazabicyclo[5 4 0]undec-7 eno (DBU) etc compuestos de organolitio por ejemplo metil litio n butil litio sec butil litio terc-butil litio fenil litio dimetil cobre litio diisopropilamida de litio ciclohexilisopropilamida de litio dicyclohexilamida de litio n butil litio DABCO n butil litio DBU n butil litio TMEDA, etc

El procedimiento de preparacion (b) puede efectuarse en un intervalo sustancialmente amplio de temperatura Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 aproximadamente 150°C preferiblemente de aproximadamente 40 aproximadamente 80 C Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (b) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un com

puesto de la formula (Ia) con 2 20 moles de un compuesto de la formula (IV) en presencia de 1 2 moles de metoxido sodico

La reaccion del procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifaticos aliciclicos y aromaticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohexano eter de petróleo ligroina benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1 2 dicloroetano clorobenceno diclorobenceno etc eteres por ejemplo eter etilico metil etil eter eter isopropilico eter butilico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) eter dimetilico de dietilenglicol (DGM) etc cetonas por ejemplo acetona metil etil cetona (MEK) metil isopropil cetona metil isobutil cetona (MIBK) etc nitrilos por ejemplo acetoni trilo propionitrilo acrilonitrilo etc alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol butanol etilenglicol etc esterres por ejemplo acetato de etilo acetato de amilo etc amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona 1 3 dimetil 2 imidazolidinona triamida hexametil fosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina, etc

El procedimiento de preparacion (c) puede efectuarse en un intervalo sustancialmente amplio de temperatura Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 20 aproximadamente 180°C preferiblemente aproximadamente 60-aproximadamente 120°C Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (c) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un com

puesto de la formula (Ia) con 1 2 moles de un compuesto de la formula (V) en un diluyente, por ejemplo benceno

La reaccion del procedimiento de preparaci3n (d) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifáticos aliciclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohexano eter de petroleo ligroina benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1 2 dicloroetano clorobenceno diclorobenceno etc eteres por ejemplo eter etilico metil etil eter eter isopropilico eter butilico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) eter dimetilico de dietilenglicol (DGM) etc cetonas por ejemplo acetona metil etil cetona (MEK) metil isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK) etc nitrilos por ejemplo acetoni trilo propionitrilo acrilonitrilo etc alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol butanol etilenglicol etc ester es por ejemplo acetato de etilo acetato de amilo etc amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona 1 3 dimetil 2 imidazolidinona triamida hexametil fosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina etc

El procedimiento de preparacion (d) puede efectuarse en presencia de un catalizador acido. Como ejemplos de catalizador acido utilizable en ese caso pueden mencionarse acidos minerales por ejemplo acido clorhídrico acido sulfurico acido nítrico acido bromhídrico hidrogenosulfito sodico etc acidos organicos por ejemplo acido formico acido acetico acido trifluoroacetico acido propionico acido metanosulfonico acido bencenosulfonico acido p toluenosulfonico etc hidroclo r os de amina organica por ejemplo hidrocloruro de piridina hidrocloruro de trieti lamina etc sulfonatos de amina, por ejemplo p toluenosulfonato de piridina, p

toluenosulfonato de trietilamina, etc

El procedimiento de preparacion (d) puede efectuarse en un intervalo sustancialmente amplio de temperatura. Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 20 aproximadamente 180°C preferiblemente aproximadamente 60 aproximadamente 120°C. Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal. Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida.

Al efectuar el procedimiento de preparacion (d) puede obtenerse el compuesto objetivo de la formula (I) por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la formula (Ia) con 2-4 moles de un compuesto de la formula (VI) en un diluyente por ejemplo benceno en presencia de una cantidad catalitica de acido p-toluenosulfonico.

La reaccion del procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse agua, hidrocarburos alifaticos, aliciclicos y aromaticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano, hexano, ciclohexano, eter de petroleo, ligroina, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, diclorobenceno, etc. eteres por ejemplo eter etilico, metil etil eter, eter isopropilico, eter butilico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), eter dimetilico de dietilenglicol (DGM), etc. cetonas por ejemplo acetona, metil etil cetona (MEK), metil isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK), etc. nitrilos por ejemplo acetoni-trilo, propionitrilo, acrilonitrilo, etc. alcoholes por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol, etilenglicol, etc. esterres por ejemplo acetato de etilo, acetato de amilo, etc. amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, triamida hexametil

fosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina, etc

El procedimiento de preparacion (e) puede efectuarse en presencia de un catalizador Como ejemplos de tales catalizadores utilizables en ese caso pueden mencionarse paladio al 10% carbono etc

El procedimiento de preparacion (e) puede efectuarse en un intervalo sustancialmente amplio de temperatura Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 aproximadamente 120°C preferiblemente aproximadamente 25 aproximadamente 80°C Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (e) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la formula (VII) con 1 2 moles de hidrogeno gaseoso en un diluyente por ejemplo metanol en presencia de una cantidad catalitica de paladio al 10% carbono

Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden usarse como herbicidas En la presente memoria descriptiva malas hierbas significa en el sentido mas amplio todas la plantas que crecen en lugares donde no se desean Los compuestos de la presente invencion actuan como herbicidas totales o selectivos dependiendo de la concentracion aplicada Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden usarse por ejemplo entre las malas hierbas y los cultivos siguientes

Malas hierbas dicotiledoneas de los generos Sinapis Lepidium Galium Stellaria, Chenopodium, Urtica Senecio Amaranthus Portulaca, Xanthium Ipomoea Polygonum Ambrosia Cirsium, Sonchus Solanum Rorippa Lamium Veronica, Datura Viola Galeopsis Papaver Centaurea Galinsoga Rotala Lindernia etc

Cultivos dicotiledoneos de los generos Gossypium Glycine Beta, Daucus Phaseolus Pisum, Solanum, Linum Ipomoea, Vicia, Nicotiana Lycopersicon, Arachis Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita, etc

Malas hierbas monocotiledóneas de los géneros Echinochloa, Setaria Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine Lolium, Bromus Avena Cyperus Sorghum, Agropyron, Monochoria Fimbristylis Sagittaria, Eleocharis Scirpus Paspalum, Ischaemum Agrostis Alopecurus Cynodon, etc

Cultivos monocotiledoneos de los géneros Oryza Zea, Triticum Hordeum, Avena Secale Sorghum Panicum Saccharum, Ananas Asparagus Allium etc

El uso de los compuestos de la presente invencion no esta restringido a las plantas mencionadas anteriormente sino que puede aplicarse a otras plantas de la misma manera Los compuestos activos de la presente invencion dependiendo de la concentracion aplicada pueden controlar no selectivamente malas hierbas y pueden usarse por ejemplo en terreno industrial vias de tren, caminos lugares con o sin plantaciones de arboles

Por otra parte los compuestos activos de la presente invencion pueden usarse para controlar malas hierbas en cultivos perennes y aplicarse en, por ejemplo deforestaciones plantaciones de arboles decorativos huertos de frutales vinedos arboledas de citricos huertos de nueces plantaciones de platanos plantaciones de cafe plantaciones de te plantaciones de caucho plantaciones de palma oleaginosa plantaciones de cacao plantaciones de bayas campos de lupulo etc y pueden aplicarse ademas para el control selectivo de malas hierbas en cultivos anuales

Los compuestos activos de la formula (I) de acuerdo con la presente invencion pueden elaborarse como las formulaciones normales en caso de uso Como tales formulaciones pueden mencionarse por ejemplo liquidos (concentrados emulsificables etc) polvos humectables emulsiones concentrados para suspensiones

polvos granulos dispersables en agua, tabletas granulos concentrados para suspensiones emulsiones microcapsulas en sustancias polimeras o formulaciones de gran tamano

Las formulaciones pueden prepararse de acuerdo con metodos conocidos de por si por ejemplo mezclando los compuestos activos con extendedores a saber diluyentes o portadores liquidos y/o solidos y opcionalmente con agentes tensioactivos a saber emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes formadores de espuma

Como diluyentes o portadores liquidos pueden mencionarse por ejemplo hidrocarburos aromaticos (por ejemplo xileno tolueno alquilnaftaleno etc) hidrocarburos aromaticos clorados o alifaticos clorados (por ejemplo clorobencenos cloruros de etileno cloruro de metileno etc) hidrocarburos alifaticos [por ejemplo ciclohexano etc o parafinas (por ejemplo fracciones de aceites minerales)] alcoholes (por ejemplo butanol glicol etc) y sus eteres esterres etc cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona metil isobutil cetona ciclohexanona, etc) disolventes fuertemente polares (por ejemplo dimetilformamida dimetilsulfoxido etc) o agua En el caso de usar agua como extendedor por ejemplo pueden usarse disolventes organicos como disolventes auxiliares

Como diluyentes o portadores solidos pueden mencionarse por ejemplo minerales naturales triturados (por ejemplo caolin arcilla talco yeso cuarzo atapulgita montmorillonita tierra diatomacea, etc) minerales sinteticos triturados (por ejemplo acido silicico altamente dispersado alumina silicatos etc) etc Como portadores solidos para granulos pueden mencionarse rocas machacadas y fraccionadas (por ejemplo calcita marmol piedra pomez sepiolita dolomita, etc) granulos sinteticos de harinas inorganicas y organicas particulas de materiales organicos (por ejemplo serrin cascara de coco mazorcas de maiz y pedunculos de tabaco etc) etc

213

211

Como emulsionantes y/o agentes formadores de espuma pueden mencionarse por ejemplo emulsionantes no iónicos y aniónicos [por ejemplo ésteres de ácidos grasos de polioxietileno éteres de alcoholes de ácidos grasos de polioxietileno (por ejemplo alquilaril poliglicol éteres, alquilsulfonatos alquilsulfatos arilsulfonatos etc)] o productos de la hidrólisis de la albumina, etc

Como dispersantes se incluyen, por ejemplo líquido residual de lignin sulfito metilcelulosa, etc

También pueden usarse adherentes en las formulaciones (polvos granulos formulaciones de gran tamaño emulsiones) Como dichos adherentes pueden mencionarse por ejemplo carboximetilcelulosa polímeros naturales y sintéticos (por ejemplo goma arábiga, poli(alcohol vinílico) poli(acetato de vinilo)) etc

También pueden usarse colorantes Como dichos colorantes pueden mencionarse pigmentos inorgánicos (por ejemplo óxido de hierro óxido de titanio y Azul de Prusia) y tintes orgánicos tales como tintes de alizarina tintes azoicos o tintes de ftalocianina metálica, y además nutrientes traza tales como sales de metales tales como hierro manganeso boro cobre cobalto molibdeno zinc etc

Dichas formulaciones pueden contener en un intervalo de generalmente 0.1 95% en peso preferiblemente 0.5 90% en peso de los componentes activos mencionados anteriormente

Los compuestos activos de la fórmula (I) de la presente invención pueden usarse como tales o en sus formas de formulación para controlar malas hierbas También pueden usarse como un agente mixto con herbicidas conocidos Tal agente mixto puede prepararse previamente como una forma de formulación final o puede prepararse mediante mezcla en tanque con ocasión de la aplicación Como una posible combinación como un agente mixto pueden mencionarse por ejemplo herbicidas del tipo de la sulfonilurea para uso en arrozales

Ademas los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion tambien pueden mezclarse con un asegurador y su aplicacion como un herbicida selectivo puede ampliarse mediante tal mezcladura Como un ejemplo del asegurador para ese proposito puede mencionarse 1 (α α dimetilbencil) 3 p tolilurea

Sorprendentemente algunos de los agentes mixtos de los compuestos de la presente invencion muestran efectos sinergicos

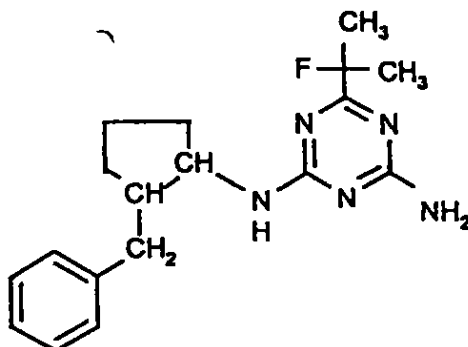
En el caso de usar los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden usarse directamente como tales o en las formas de formulacion mencionadas anteriormente o aplicarse en las formas de aplicacion preparadas mediante dilucion adicional Pueden aplicarse por medio de por ejemplo riego rociadura atomizacion, espolvoreo aplicacion de granulos etc

Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden aplicarse en cualesquiera fases antes y despues de la germinacion de las plantas Tambien pueden absorberse en el suelo antes de sembrar

La cantidad de aplicacion de los compuestos activos de la presente invencion no esta estrictamente restringida sino que puede variarse en un amplio intervalo de acuerdo con el efecto deseado el tipo de planta objetivo el lugar y el periodo de aplicacion etc En el caso del uso como herbicidas como la concentracion de aplicacion pueden mencionarse por ejemplo intervalos de aproximadamente 0 001 a aproximadamente 5 kg preferiblemente de aproximadamente 0 05 a aproximadamente 2 kg de los compuestos activos por hectarea

A continuacion las preparaciones y las aplicaciones de los compuestos de la presente invencion se describiran mas especificamente mediante los siguientes ejemplos Sin embargo la presente invencion no debe restringirse a ellos de ningun modo Partes son partes en peso a no ser que se especifique

EJEMPLOS

Ejemplo de Síntesis 1

Se anadio lentamente gota a gota 2 bencilciclopentilamina (3 g) a acido clorhidrico concentrado (3.6 ml) bajo enfriamiento con hielo. Despues de agitar como tal durante 30 minutos, se separo por destilacion agua bajo presion reducida para obtener hidrocioruro de 2 bencilciclopentilamina (3.1 g).

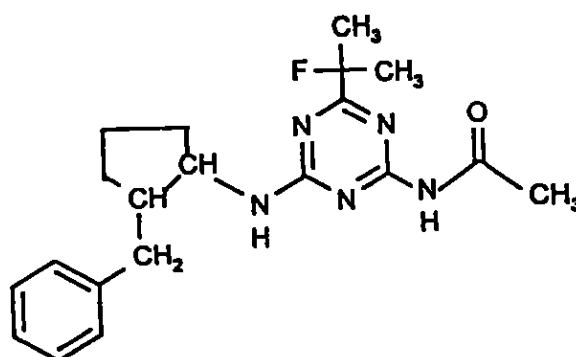
Se suspendieron el hidrocioruro de 2 bencilciclopentilamina mencionado anteriormente (3.1 g) y cianoguanidina (1.23 g) en n decano (30 ml) y se calentaron a 130 °C durante 4.5 horas. Despues del enfriamiento los cristales depositados se filtraron, se lavaron con n hexano y se secaron bajo presion reducida para obtener hidrocioruro de 2 bencilciclopentilbiguanida (3 g).

Despues de anadir sodio (0.31 g) en 12 ml de metanol seco y agitar durante 5 minutos, se anadio el hidrocioruro de 2 bencilciclopentilbiguanida mencionado anteriormente (2 g) y se agito a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuacion se anadio α -fluoro- α -metilpropionato de metilo (1.62 g) se agito a temperatura ambiente durante 10 horas. Despues de eso se anadieron 50 ml de agua y se extrajo con acetato de etilo. Despues de secar con sulfato sodico anhidro, el acetato de etilo se separo por destilacion bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente: hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 2-amino-4-(2-bencilciclopentilamino)-6-(α -fluoroisopropil)-1,3,5-triazina.

(1.65 g)

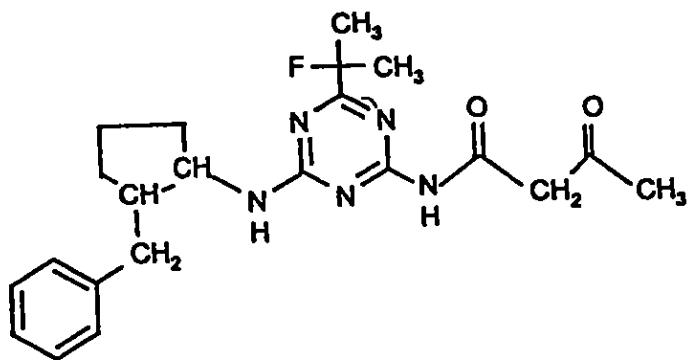
p f 50-55 °C

Ejemplo de Síntesis 2



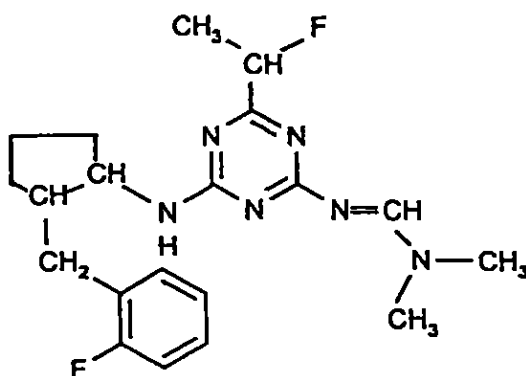
Después de añadir sodio (0.1 g) en metanol seco (5 ml) y agitar durante 5 minutos se añadió 2-amino-4-(2-benzilciclopentilamino)-6-(α -fluoroisopropil)-1,3,5-triazina (1 g) y se agitó a 50°C durante 1 hora. Después de enfriar el metanol se separó por destilación bajo presión reducida. A continuación, se añadió acetato de etilo (10 ml) y se agitó a 50°C durante 1 hora. Después de enfriar se añadió agua (30 ml) y se extrajo con acetato de etilo. Después de secar con sulfato sódico anhidro el acetato de etilo se separó por destilación bajo presión reducida y el residuo se trató mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo = 3/2) para obtener 2-acetilamino-4-(2-benzilciclopentilamino)-6-(α -fluoroisopropil)-1,3,5-triazina (0.57 g).

n_D^{20} 1.5512

Ejemplo de Sintesis 3

Se disolvieron 2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina (0 5 g) y acetil acido de Meldrum (0 28 g) en benceno (20 ml) y se sometieron a reflujo durante 1 hora mediante calentamiento. Despues de enfriar el disolvente se separo por destilacion bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente hexano acetato de etilo = 3 2) para obtener 2 acetoacetilamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina (0 55 g)

n_D^{20} 1 5433

Ejemplo de Sintesis 4

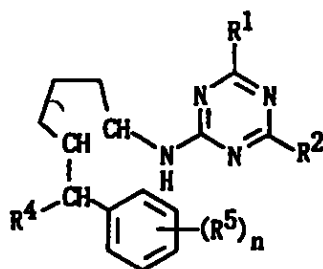
Se disolvieron 2 amino 4 (2 (2 fluorobencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina (0 3 g) dimetilacetal de N N dimetilformamida (0 32 g) y una cantidad catalitica de monohidrato de acido p toluenosulfonico en benceno

(20 ml) y se sometieron a reflujo durante 1 5 horas mediante calentamiento. Despues de enfriar el disolvente se separo por destilación bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente diclorometano metanol = 90 5) para obtener 2 N N dimetilmetilenimino 4 (2 (2 fluorobencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina (0 34 g) n_D^{20} 1 5776

Los compuestos obtenidos de la misma manera que en los Ejemplos de Sintesis 1-4 mencionados anteriormente se muestran en la Tabla 1 siguiente junto con compuestos sintetizados en los Ejemplos de Sintesis 1 4

217 219

Tabla 1



Comp

Nº	R¹	R²	R⁴	(R⁵)	pf o n ^D ₂₀
1	CH ₃	NH ₂	H	H	
2	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
3	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
4	C ₃ H ₇ iso	NH ₂	H	H	
5	C ₄ H ₉ n	NH ₂	H	H	
6	C ₄ H ₉ sec	NH ₂	H	H	
7	C ₄ H ₉ iso	NH ₂	H	H	
8	C ₄ H ₉ terc	NH ₂	H	H	
9	C ₆ H ₁₁ n	NH ₂	H	H	
10		NH ₂	H	H	
11		NH ₂	H	H	
12		NH ₂	H	H	
13		NH ₂	H	H	
14		NH ₂	H	H	
15	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
16	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
17	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
18	CHFCl	NH ₂	H	H	
19	CHFB _r	NH ₂	H	H	
20	CFCl ₂	NH ₂	H	H	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
21	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
22	CHF ₂	NH ₂	H	H	
23	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
24	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
25	CF ₃	NH ₂	H	H	
26	CCl ₃	NH ₂	H	H	
27	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	1 5557
28	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	1 5525
29	CH ₃ CHF	N=CN(CH ₃) ₂	H	2 F	1 5776
30	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3F	1 5485
31	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4F	
32	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	1 5420
33	CH ₂ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
34	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
35	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
36	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	50 55°C
37	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	1 5469
38	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	1 5239
39	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
40	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
41	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
42	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
43	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
44	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Br	
45	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
46	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	1 5359
47	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
48	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 C ₂ H ₅	
49	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₂ H ₅	
50	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ n	

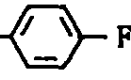
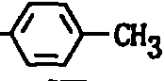
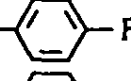
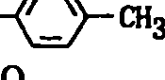
Tabla 1 (continuacion)

Comp

Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
51	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ 180	
52	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₄ H ₉ terc	
53	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
54	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
55	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CF ₃	
56	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
57	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
58	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
59	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OC ₂ H ₅	
60	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OC ₂ H ₅	
61	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OC ₃ H ₇ 180	
62	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCF ₃	
63	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCF ₃	
64	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCHF ₂	
65	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₂ CF ₃	
66	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
67	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCH ₃	
68	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SC ₂ H ₅	
69	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 S(O)CH ₃	
70	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 S(O)CH ₃	
71	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SO ₂ CH ₃	
72	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SO ₂ CH ₃	
73	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCF ₃	
74	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCF ₃	
75	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₂ CF ₃	

W-72

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
76	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
77	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4- 	
78	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
79	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
80	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
81	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
82	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
83	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
84	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 NO ₂	
85	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CN	
86	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4-F ₂	
87	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 F ₂	
88	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
89	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 Cl ₂	
90	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 Cl ₂	
91	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 Cl ₂	
92	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 (CH ₃) ₂	
93	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (CH ₃) ₂	
94	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
95	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CF ₃) ₂	
96	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (OCH ₃) ₂	
97	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 3 4 Cl ₃	
98	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 6 (CH ₃) ₃	
99	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
100	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	1 5512

23
221

Tabla 1 (continuacion)

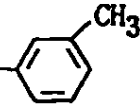
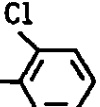
Comp					
Nº	R ¹	R ² ~	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
101	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
102	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ n	H	H	
103	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ iso	H	H	
104	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H ₉ terc	H	H	
105	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
106	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
107	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
108	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
109	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
110	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
111	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
112	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
113	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
114	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
115	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

Tabla 1 (continuacion)

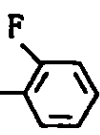
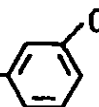
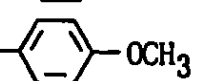
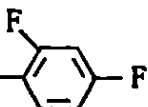
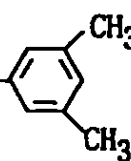
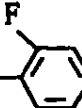
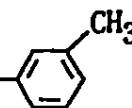
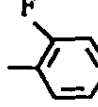
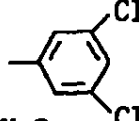
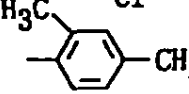
Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
116	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
117	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
118	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
119	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
120	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
121	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	1 5433
122	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
123	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
124	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
125	ClCH ₂ ClCH ₂	NH ₂	H	H	
126	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
127	CHF CF ₃	NH ₂	H	H	
128	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
129	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
130	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	

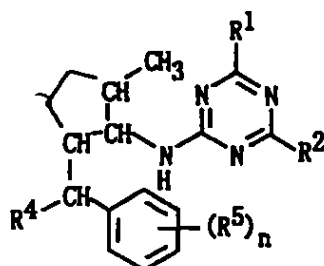
Tabla 1 (continuación)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pfo n _D ²⁰
131	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
132	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
133	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
134	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
135		NH ₂	H	H	
136		NH ₂	H	H	
137		NH ₂	H	H	
138		NH ₂	H	H	
139		NH ₂	H	H	
140		NH ₂	H	H	
141	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
142	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
143	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
144	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
145	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
146	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
147	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	
148	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
149	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
150	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	

726
224

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
151	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
152	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
153	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
154	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
155	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
156	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
157	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
158	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
159	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
160	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
161	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
162	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
163	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
164	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
165	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
166	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
167	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

Tabla 1 (continuacion)

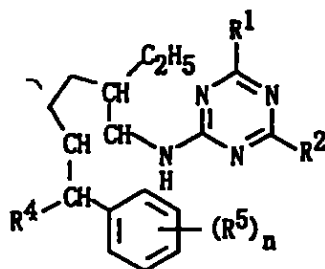
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
168	CF ₃	NH ₂	H	H	
169	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
170	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
171	CF ₃	NH ₂	H	4 F	
172	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
173	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
174	CF ₃	NH ₂	H	4-Cl	
175	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
176	CF ₃	NH ₂	H	3 CF ₃	
177	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
178	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
179	CF ₃	NH ₂	H	4-CH ₃	
180	CF ₃	NH ₂	H	2 OCH ₃	
181	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
182	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
183	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
184	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
185	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
186	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
187	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
188	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
189	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
190	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	

Tabla 1 (continuacion)

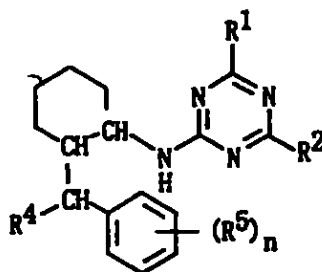
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	p f o n ^D ₂₀
191	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
192	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	
193	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
194	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
195	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 CH ₃	
196	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
197	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
198	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
199	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
200	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
201	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
202	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
203	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
204	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
205	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
206	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
207	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
208	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
209	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
210	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
211	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
212	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
213	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
214	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
215	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	

229
22Tabla 1 (continuacion)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
216	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
217	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
218	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
219	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
220	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
221	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
222	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
223	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	
224	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
225	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
226	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
227	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
228	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
229	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
230	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
231	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
232	CF ₃	NH ₂	H	H	
233	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
234	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
235	CF ₃	NH ₂	H	3 5 F ₂	
236	CF ₃	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
237	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
238	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
239	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
240	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
241	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
242	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
243	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
244	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
245	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
246	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
247	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
248	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
249	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
250	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
251	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
252	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pfo n ^D ₂₀
253	CH ₃	NH ₂	H	H	
254	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
255	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
256	C ₃ H ₇ -iso	NH ₂	H	H	
257	C ₄ H ₉ n	NH ₂	H	H	
258	C ₄ H ₉ sec	NH ₂	H	H	
259	C ₄ H ₉ iso	NH ₂	H	H	
260	C ₄ H ₉ terc	NH ₂	H	H	
261	C ₃ H ₇ -n	NH ₂	H	H	
262		NH ₂	H	H	
263		NH ₂	H	H	
264		NH ₂	H	H	
265		NH ₂	H	H	
266		NH ₂	H	H	
267	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
268	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
269	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
270	CHFCl	NH ₂	H	H	

232
230

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pfo n ^D ₂₀
271	CHFBr	NH ₂	H	H	
272	CFCl ₂	NH ₂	H	H	
273	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
274	CHF ₂	NH ₂	H	H	
275	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
276	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
277	CF ₃	NH ₂	H	H	
278	CCl ₃	NH ₂	H	H	
279	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
280	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
281	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	60 66°C
282	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
283	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
284	CH ₃ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
285	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
286	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
287	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	1 5332
288	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
289	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	72 80°C
290	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
291	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
292	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
293	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
294	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
295	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Br	
296	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
297	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
298	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
299	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 C ₂ H ₅	
300	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₂ H ₅	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
301	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ n	
302	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ -iso	
303	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₄ H ₉ terc	
304	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
305	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
306	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CF ₃	
307	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
308	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
309	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
310	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OC ₂ H ₅	
311	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₂ H ₅	
312	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ iso	
313	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCF ₃	
314	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCF ₃	
315	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCHF ₂	
316	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₂ CF ₃	
317	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
318	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₃	
319	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SC ₂ H ₅	
320	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 S(O)CH ₃	
321	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 S(O)CH ₃	
322	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SO ₂ CH ₃	
323	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SO ₂ CH ₃	
324	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCF ₃	
325	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCF ₃	

234
232
1**Tabla 1** (continuacion)

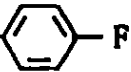
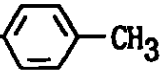
Comp					
N°	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
326	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCH ₂ CF ₃	
327	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
328	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4- 	
329	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-  -F	
330	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-  -CH ₃	
331	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
332	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
333	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-NO ₂	
334	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CN	
335	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 F ₂	
336	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 F ₂	
337	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
338	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 Cl ₂	
339	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 Cl ₂	
340	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 Cl ₂	
341	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 (CH ₃) ₂	
342	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4-(CH ₃) ₂	
343	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
344	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CF ₃) ₂	
345	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4-(OCH ₃) ₂	

Tabla 1 (continuación)

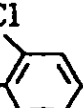
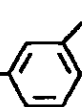
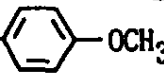
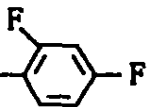
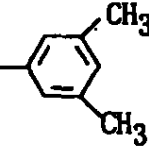
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
346	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 3 4 Cl ₃	
347	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 6 (CH ₃) ₃	
348	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
349	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	
350	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
351	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ n	H	H	
352	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ iso	H	H	
353	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H ₉ terc	H	H	
354	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
355	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
356	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
357	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
358	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
359	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
360	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
361	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
362	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
363	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
364	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
366	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
366	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
367	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
368	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
369	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	
370	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
371	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
372	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
373	CH ₂ ClCH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
374	CH ₃ CF ₃	NH ₂	H	H	
375	CHF CF ₃	NH ₂	H	H	
376	CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
377	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
378	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	
379	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
380	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
381	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
382	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
383	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
384	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
385	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	

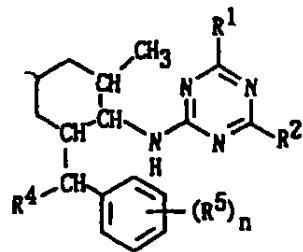
235 237

Tabla 1 (continuación)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	p f o n ^D ₂₀
386	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
387	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
388	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
389	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
390	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
391	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
392	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
393	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
394	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
395	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
396	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
397	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
398	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
399	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
400	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
401	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
402	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
403	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
404	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
405	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

236 ~~238~~

Tabla 1 (continuación)



Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
406	CF ₃	NH ₂	H	H	
407	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
408	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
409	CF ₃	NH ₂	H	4 F	
410	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
411	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
412	CF ₃	NH ₂	H	4 Cl	
413	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
414	CF ₃	NH ₂	H	3 CF ₃	
415	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
416	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
417	CF ₃	NH ₂	H	4 CH ₃	
418	CF ₃	NH ₂	H	2 OCH ₃	
419	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
420	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
421	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
422	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
423	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
424	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
425	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
426	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
427	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
428	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	
429	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
430	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	

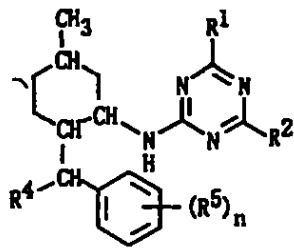
237 239

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
431	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
432	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
433	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 CH ₃	
434	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
435	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
436	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
437	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
438	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
439	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
440	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
441	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
442	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
443	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
444	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
445	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
446	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
447	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
448	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
449	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
450	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
451	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
452	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
453	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
454	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
455	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 SCH ₃	
456	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
457	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
458	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
459	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
460	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
461	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
462	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
463	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

238 240

Tabla 1 (continuacion)



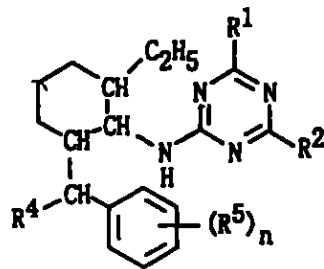
Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
464	CF ₃	NH ₂	H	H	
465	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
466	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
467	CF ₃	NH ₂	H	4 F	
468	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
469	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
470	CF ₃	NH ₂	H	4 Cl	
471	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
472	CF ₃	NH ₂)	H	3 CF ₃	
473	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
474	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
475	CF ₃	NH ₂	H	4 CH ₃	
476	CF ₃	NH ₂	H	2 OCH ₃	
477	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
478	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
479	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
480	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
481	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
482	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
483	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
484	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
485	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
486	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	
487	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
488	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	
489	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
490	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ² ~	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
491	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 CH ₃	
492	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
493	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
494	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
495	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
496	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
497	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
498	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
499	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
500	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
501	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
502	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
503	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
504	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
505	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
506	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
507	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
508	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
509	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
510	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
511	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
512	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
513	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
514	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
515	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
516	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
517	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
518	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
519	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
520	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
521	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

240

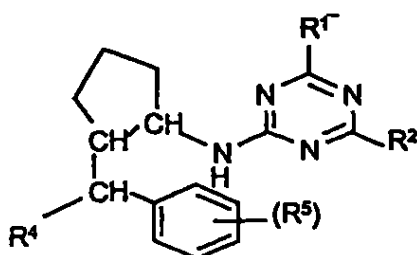
Tabla 1 (continuacion)



Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
522	CF ₃	NH ₂	H	H	
523	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
524	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
525	CF ₃	NH ₂	H	3 5 F ₂	
526	CF ₃	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
527	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
528	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
529	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
530	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
531	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
532	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
533	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
534	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
535	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
536	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
537	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
538	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
539	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
540	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
541	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
542	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

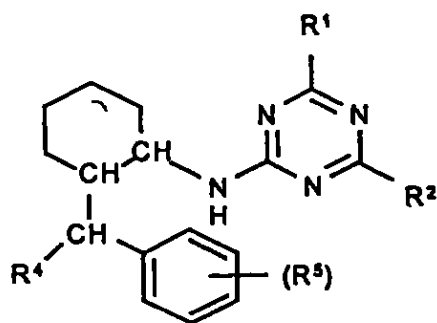
Los compuestos obtenidos efectuando la reaccion usando yoduro de metilo yoduro de etilo o yoduro de propilo en lugar de los compuestos de la fórmula (IV) en el procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente se muestran en las siguientes Tablas 2 y 3

Tabla 2



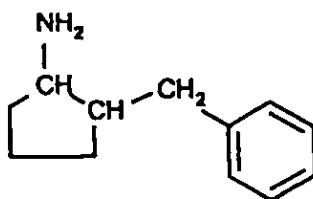
Comp

Nº	R¹	R²	R⁴	(R⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
543	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
544	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
545	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H ₇ n	H	H	

Tabla 3

Comp

Nº	R¹	R²	R⁴	(R³) _n	pf o n ^D ₂₀
546	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
547	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
548	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H ₇ n	H	H	

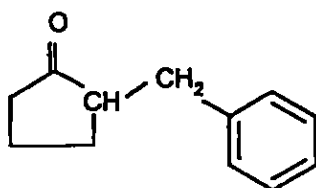
Ejemplo de Síntesis 5

Se calentó una mezcla de 2 bencilciclopentanona (11.51 g) y formamida (44.41 ml) a 140-150°C a lo que se añadió lentamente gota a gota, ácido fórmico (9.13 g) manteniendo la temperatura. Después de terminar la adición la mezcla se calentó a 150°C durante 2 horas más. Después de enfriar se añadió agua a la mezcla y se extrajo con cloruro de metileno. La capa de cloruro de metileno se lavó con agua y se secó con sulfato sódico anhidro. Después de que el cloruro de metileno se separara por destilación bajo presión reducida se añadió ácido clorhídrico concentrado (36.85 ml) al residuo y se sometió a reflujo durante 2 horas mediante calentamiento.

Después de enfriar se añadió agua, se alcalinizó con hidróxido sódico y se extrajo con cloruro de metileno. La capa de cloruro de metileno se lavó con agua y se secó con carbonato potásico anhidro. Después de que el cloruro de metileno se separara por destilación bajo presión reducida, el residuo se purificó mediante destilación para obtener 2 bencilciclopentilamina (5.18 g)

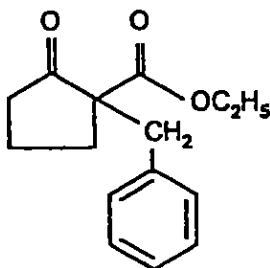
$$n_{20}^D = 1.5371$$

Ejemplo de Síntesis 6



Se añadió ácido bromhídrico al 48% (50 ml) a 2-bencil-2-etoxycarbonilciclopentanona (23.7 g) y se sometió a reflujo a 120°C durante 4 horas calentando. Después de enfriar se añadió hielo (100 g) a la mezcla y se extrajo con éter dietílico. Después de lavar la capa de éter dietílico con agua, una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico y una solución acuosa saturada de cloruro sódico se secó con sulfato sódico anhidro. Después de que el éter dietílico se separara por destilación bajo presión reducida, el residuo se purificó mediante destilación para obtener 2-bencilciclopentanona (11.51 g) $n_{20}^D = 1.5288$

Ejemplo de Síntesis 7



Se añadieron hidrosulfato de tetrabutilamonio (29.1 g) y yoduro de bencilo (37.37 g) a una solución de 2-etoxycarbonilciclopentanona (13.37 g) en cloruro

de metileno (143 ml) y a continuacion se a  adio una solucion de hidroxido sodico (6 86 g) en agua (143 ml) Despues de que la mezcla se agitara a temperatura ambiente durante 4 horas la capa de cloruro de metileno se separo y la capa acuosa se extrajo con cloruro de metileno (200 ml 3 veces) Las capas de cloruro de metileno se reunieron se lavaron con agua, solucion acuosa saturada de hidrogenocarbonato sodico y solucion acuosa saturada de cloruro sodico y se secaron con sulfato sodico anhidro Despues de que el cloruro de metileno se separara por destilacion bajo presion reducida, el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente hexano acetato de etilo = 9 1) para obtener 2 bencil 2 etoxycarbonilciclopentanona (16 8 g) $n_D^{20} = 1.5156$

Ejemplo de ensayo biologico

Ejemplo de Ensayo 1 Ensayo para el efecto herbicida contra malas hierbas de arrozales

Preparacion de una formulaci  n del compuesto activo

Portador Acetona 5 partes en peso

Emulsionante Benciloxipoliglicoleter 1 parte en peso

Se obtiene una formulacion de la sustancia activa como emulsion mezclando 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad mencionada anteriormente de portador y emulsionante Una cantidad prescrita de dicha formulacion se diluye con agua y se usa para el ensayo

Metodo de ensayo

En un invernadero se transplantaron 3 plantulas de arroz (cultivar Nihonbare) de la fase foliar 2 5 (15 cm de alto) a una maceta de 500 cm² llena con suelo de arrozal A continuacion se sembraron semillas de pata de gallina flor chica, junquillo monoconia y malas hierbas de hojas anchas (pimpinela falsa comun, Rotala indica elatinacea de tallo largo Ammannia multiflora Roxb Dopatrum juncum

Hammilt etc) y se vertio agua hasta una altura de aproximadamente 2 3 cm

Cinco dias despues del transplante del arroz, se aplico a la superficie del agua una solucion de cada compuesto activo preparado de acuerdo con el metodo de preparacion mencionado anteriormente El efecto herbicida se examino el dia después de 3 semanas de tratamiento periodo durante el cual se mantenía la altura del agua de 3 cm El efecto herbicida se valoro como 100% en el caso de la destruccion completa y como 0% en el caso de ausencia de efecto herbicida

Como resultado los compuestos de la presente invencion N° 27 30 32 y 36 mostraban en la cantidad quimica de 0 25 kg/ha un efecto herbicida suficiente contra mala hierbas de arrozales y mostraban seguridad para el arroz transplantado

Ejemplo de Formulacion 1 (Granulo)

Se anade agua (25 partes) a una mezcla del compuesto N° 36 de la presente invencion (10 partes) bentonita (montmorillonita) (30 partes) talco (58 partes) y sal de ligninsulfonato (2 partes) se amasa bien se convierte en granulos de malla 10-40 mediante una granuladora de extrusion y se seca a 40 50 C para obtener granulos

Ejemplo de Formulacion 2 (Granulo)

Se ponen en un mezclador giratorio particulas minerales de arcilla que tienen una distribucion del tamaño de las particulas de 0 2 2 mm (95 partes) Mientras se hace girar el compuesto N° 27 de la presente invencion (5 partes) se rocía junto con un diluyente liquido se humedece uniformemente y se seca a 40 50°C para obtener granulos

Ejemplo de Formulacion 3 (Concentrado emulsionable)

Se mezclan y se agitan para obtener una emulsion el compuesto N° 32 de la presente invencion (30 partes) xileno (5 partes) polioxietilenaalquil fenil eter (8 partes) y alquilbencenosulfonato calcico (7 partes)

248
246

Ejemplo de Formulacion 4 (Polvo humectable)

Se mezclan en forma de polvo y se convierten en un polvo humectable el compuesto N° 30 de la presente invencion (15 partes) una mezcla de carbono blanco (polvos finos de oxido de silicio amorfo hidratado) y arcilla en polvo (1 5) (80 partes) alquilbencenosulfonato sodico (2 partes) y polimero de alquilnaftalenosulfonato sodico formalina (3 partes)

Ejemplo de Formulacion 5 (Granulo dispersable en agua)

Se mezclan bien el compuesto N° 36 de la presente invencion (20 partes) ligninsulfonato sodico (30 partes) bentonita (15 partes) y polvo de tierra diatomacea calcinada (35 partes) se anade agua se extruyen con un tamiz de 0 3 mm y se secan para obtener granulos dispersables en agua

Efecto de la invencion

Como se muestra en el ejemplo de ensayo biologico mencionado anteriormente los nuevos derivados de tetrazolina de la presente invencion tienen excelentes propiedades como herbicida

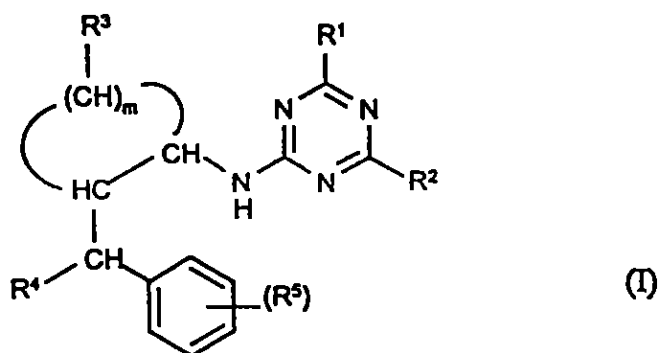
[Nombre del documento] Resumen

[Resumen]

[Materia] Proporcionar triazinas que muestran excelentes actividades como un componente eficaz de un herbicida

[Medios de solución]

Triazinas representadas por la fórmula



en la que

R^1 representa haloalquilo etc

R^2 representa amino o alquilcarbonilamino etc

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo

R^5 representa halógeno alquilo o alcoxi etc

m representa un número entero de 1-4

n representa un número entero de 0-5

248-250

日 本 国 特 許 庁
PATENT OFFICE
JAPANESE GOVERNMENT

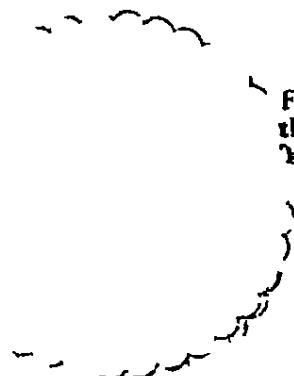
別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されて
いる事項と同一であることを証明する

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed
with this Office

出 願 年 月 日
Date of Application 2000年 3月 2日

出 願 番 号
Application Number 特願2000-057578

出 願 人
Applicant(s) 日本バイエルアグロケム株式会社



For legalization by the foreign consul in Japan,
this is to certify that the Seal affixed hereto
is genuine
okyo

MAY 15 2000 T. Mochizuki
Official

Ministry of Foreign Affairs
(Consular and Migration Policy Division)

2000年 4月14日

特許庁長官
Commissioner
Patent Office

近藤 隆彦



出証番号 出証特2000-3026536

CONSULADO DE COLOMBIA EN TOKIO JAPON

5/17/2000 Tokio J pón MAYO 17 2000
No 423

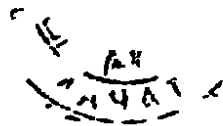
El suscrito Cónsul de Colombia CERTIFICA
que el Señor T MOCHIZUKI que autoriza el presente documento ejerce
legalmente en la fecha allí expresada las funciones de MINISTERIO
RELACIONES EXTERIORES DE JAPON y que la firma y sello que en el
documento aparecen como suyos son las que usa y acostumbra en sus
actos oficiales
El Cónsul no asume responsabilidad alguna por el contenido del
documento




Firma y Sello del Consul

Derechos US\$22

~~PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE~~



【 類名】 特許願

【整理番号】 200003001

【提出日】 平成12年 3月 2日

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 C07D251/18
A01N 43/64

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県小山市花垣町 2 - 8 - 2 4

【氏名】 渡辺 幸喜

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県下都賀郡国分寺町小金井 2 1 4 - 1 8

【氏名】 五島 敏男

【発明者】

【住所又は居所】 栃木県小山市城東 7 - 2 - 1

【氏名】 上野 知恵子

【発明者】

【住所又は居所】 トイノ連邦共和国デー ー 4 0 7 6 4 ランゲンフェルト
ゲーテノユトラノセ 3 8

【氏名】 マーク ウィルヘルム トレーヘス

【発明者】

【住所又は居所】 トイノ連邦共和国デー ー 4 0 7 8 9 モノハイム アム
ライノ エーカーヘーク 9

【氏名】 ディーター フォイヒト

【特許出願人】

【識別番号】 000232564

【氏名又は名称】 日本バイエルアグロケム株式会社

【代理人】

【識別番号】 100060782

【弁理士】

、

【氏名又は名称】 小田島 平吉

【選任した代理人】

【識別番号】 100074217

【弁理士】

【氏名又は名称】 江角 洋治

【選任した代理人】

【識別番号】 100103311

【弁理士】

【氏名又は名称】 小田嶋 平吾

【先の出願に基づく優先権主張】

【出願番号】 平成11年特許願第255577号

【出願日】 平成11年 9月 9日

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 019666

【納付金額】 21 000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 9809567

【ブルーフの要否】 要

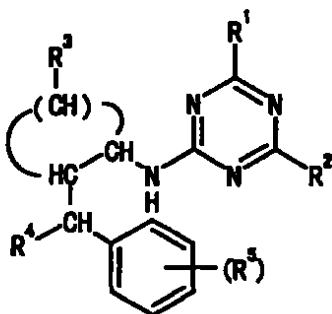
【書類名】 明細書

【発明の名称】 除草性 1, 3, 5-トリアゾノ類

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式

【化 1】



式中

R^1 は C_{1-5} アルキル C_{3-7} ノクロアルキル C_{1-4} ハロアルキル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノzol 又は場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 はアミノ C_{1-4} アルキルアミノ ホルミルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-6} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-4} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノzolカルボニルアミノ 場合により C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキノ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアセチルアミノ 又は $\text{ノ}(C_{1-4}\text{アルキル})$ アミノ- C_{1-4} アルキリデノアミノを示し

R^3 又は R^4 はそれぞれ独立に水素原子又は C_{1-4} アルキルを示し

R^5 はハロゲン C_{1-4} アルキル C_{1-4} ハロアルキル C_{1-4} アルコキノ C_{1-4} ハロアルコキノ C_{1-4} アルキルチオ C_{1-4} ハロアルキルチオ C_{1-4} アルキルスルフィニル C_{1-4} アルキルスルホニル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェニル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

mは1～4の整数を示し

mが2以上の整数を示す場合 R^3 は同一もしくは相異なってもよく

nは0～5の整数を示し そして

nが2以上の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なってもよい
て表わされるトリアゾノ類

【請求項2】 R^1 が C_{1-4} アルキル C_{3-5} ノクロアルキル C_{1-3} ハロアルキル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘノゾル 又は場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 がアミノ C_{1-3} アルキルアミノ ホルミルアミノ C_{1-3} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-5} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-3} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘノゾルカルボニルアミノ 場合により C_{1-3} アルキル置換

C_{1-3} アルコキノ置換 フルオル置換もしくはクロル置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ C_{1-3} アルキル-カルボニルアセチルアミノ 又はノ(C_{1-3} アルキル)アミノ- C_{1-3} アルキリデノアミノを示し

R^3 又は R^4 がそれぞれ独立に水素原子又は C_{1-3} アルキルを示し

R^5 がフルオル クロル ブロム メチル エチル n-プロピル iso-プロピル tert-ブチル C_{1-3} ハロアルキル C_{1-3} アルコキノ C_{1-3} ハロアルコキノ C_{1-3} アルキルチオ C_{1-3} ハロアルキルチオ C_{1-3} アルキルスルフィニル C_{1-3} アルキルスルホニル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェニル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

mが2～4の整数を示し このとき R^3 は同一もしくは相異なってもよく

nが0～4の整数を示し そして

nが2以上の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なってもよい

請求項1記載の化合物

【請求項3】 R^1 がメチル エチル n-プロピル isoo-プロピル tert-ブチル nクロプロピル nクロブチル フルオロメチル フルオロクロロメチル フルオロブロモメチル フルオロnクロロメチル フルオロnブロモメチル nフルオロメチル nフルオロクロロメチル nフルオロブロモメチル トリフルオロメチル クロロメチル トリクロロメチル ブロモメチル 1-フルオロエチル 2 2 2-トリフルオロエチル 1 2 2 2-テトラフルオロエチル パーフルオロエチル 1-クロロエチル 1 2-nクロロエチル 1-ブロモエチル パーフルオロプロピル 1-フルオロ-1-メチルエチル 1-クロロ-1-メチルエチル 1-ブロモ-1-メチルエチル 1-(トリフルオロメチル)-2 2 2-トリフルオロエチル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置換されていてもよいヘノール 又は場合によりフルオル置換 クロル置換もしくはメチル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 がアミノ メチルアミノ エチルアミノ ホルミルアミノ アセチルアミノ エチルカルボニルアミノ nクロプロピルカルボニルアミノ フルオロメチルカルボニルアミノ トリフルオロメチルカルボニルアミノ 1-フルオロエチルカルボニルアミノ パーフルオロエチルカルボニルアミノ 場合によりクロル置換もしくはメチル置換されていてもよいヘノールカルボニルアミノ 場合によりフルオル置換 クロル置換 メチル置換もしくはメトキノ置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ アセトアセチルアミノ 又はnメチルアミノメチリデンアミノを示し

R^3 又は R^4 がそれぞれ独立に水素原子 メチル又はエチルを示し

R^5 がフルオル クロル メチル エチル トリフルオロメチル メトキノ エトキノ トリフルオロメトキノ メチルチオ トリフルオロメチルチオ メチルスルフィニル メチルスルホニル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置換されていてもよいフェニル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置換されていてもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

mが3~4の整数を示し このとき R^3 は同一もしくは相異なってもよく

nが0~3の整数を示し そして

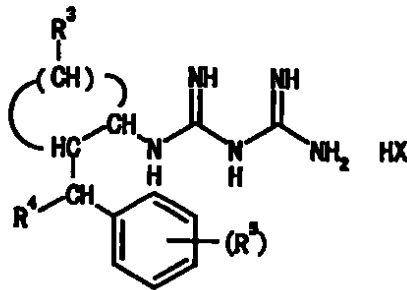
256
254

n が 2 又は 3 の整数を示す場合 R⁵ は同一もしくは相異なっているもよい
請求項 1 記載の化合物

【請求項 4】 請求項 1 ～ 3 のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有する農薬

【請求項 5】 式

【化 2】



式中

R³ R⁴ R⁵ m 及び n は請求項 1 に記載したと同義であり そして

X はハロゲン原子を示す

で表わされるビグアニト塩類

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は新規なトリアゾノ類及び除草剤としての利用に関する 本発明はさらに該除草性トリアゾノ類の製造方法に関する

【0002】

【従来の技術】

ある種のトリアゾノ類が除草剤としての作用を示すことはすでに知られている (WO 97/31904 WO 97/08156 WO 97/29095 等参照)

【0003】

【発明が解決しようとする課題】

しかし 既知のトリアゾノ誘導体は一般に除草剤としての効果並びに安全性の

点で十分に満足できるものではない

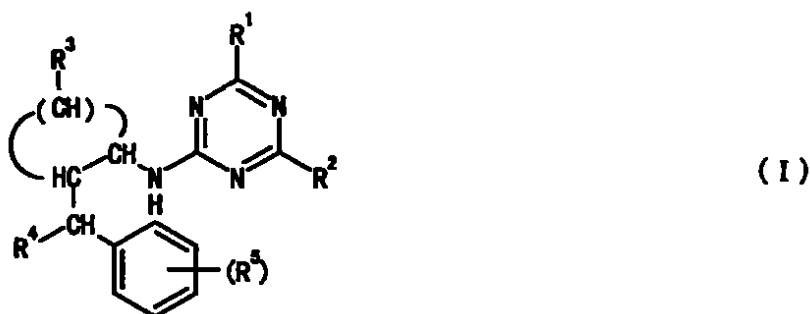
【0004】

【課題を解決するための手段】

本発明者等は 除草剤としてより高い効果を有し より高い安全性を有する新規化合物を創製すべく研究を行なった その結果 今回 優れた生物活性を持つ下記式 (I) で表される新規なトリアノン類が見出された

【0005】

【化3】



【0006】

式中

R^1 は C_{1-5} アルキル C_{3-7} ノクロアルキル C_{1-4} ハロアルキル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノzol 又は場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 はアミノ C_{1-4} アルキルアミノ ホルミルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-6} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-4} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノzolカルボニルアミノ 場合により C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキソ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアセチルアミノ 又は $\text{N}-(C_{1-4}\text{アルキル})$ アミノ- C_{1-4} アルキリデンアミノを示し

R^3 又は R^4 はそれぞれ独立に水素原子又は C_{1-4} アルキルを示し

R^5 はハロゲン C_{1-4} アルキル C_{1-4} ハロアルキル C_{1-4} アルコキノ C_{1-4}

288
256

$_4$ ハロアルコキノ C_{1-4} アルキルチオ C_{1-4} ハロアルキルチオ C_{1-4} アルキル
スルフィニル C_{1-4} アルキルスルホニル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4}
アルキル置換されていてもよいフェニル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4}
アルキル置換されていてもよいフェノキノ ニトロ又はノアノを示し

mは1～4の整数を示し

mが2以上の整数を示す場合 R^3 は同一もしくは相異なっているもよく

nは0～5の整数を示し そして

nが2以上の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なっているもよい

【0007】

本発明の上記式(I)の化合物は 例えば 下記製法(a)～(e)のいずれか
によって合成することができる

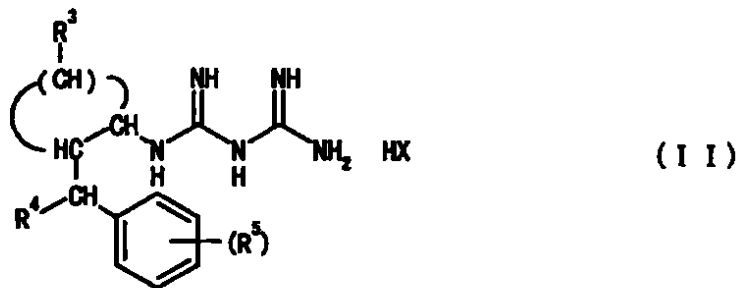
製法 (a)

R^2 がアミノを示す場合

式

【0008】

【化4】



【0009】

式中

R^3 R^4 R^5 ■及びnは前記と同義であり そして

Xはハロゲン 好ましくはクロル又はブロムを示す

て表される化合物を式



式中

R^1 は前記と同義であり

R^6 は C_{1-4} アルキル 好ましくはメチル又はエチルを示す
て表されるカルボン酸エステルと反応させる方法

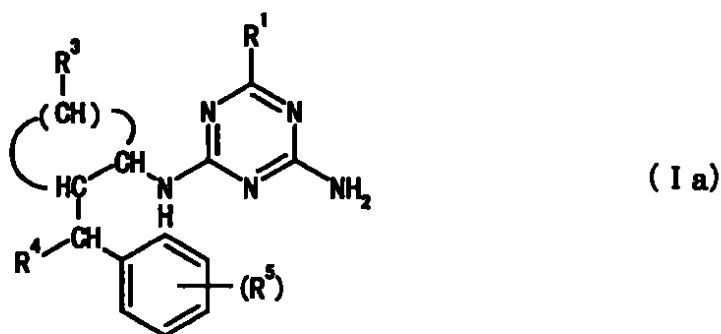
製法 (b)

R^2 がホルミルアミノ C_{1-4} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-6} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-4} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノゾルカルボニルアミノ又は場合により C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキノ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノを示す場合

式

【0010】

【化5】



【0011】

式中 R^1 R^3 R^4 R^5 及び n は前記と同義である
て表される化合物を式



式中

R^6 は前記と同義であり

R^7 は水素原子 C_{1-4} アルキル C_{3-6} ノクロアルキル C_{1-4} ハロアルキル 場合によりハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノゾル又は場合により C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキノ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルを示す

て表されるカルボン酸エステルと反応させる方法

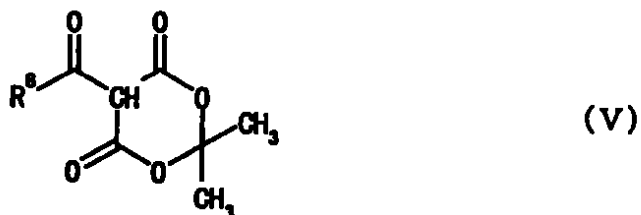
360
258

製法 (c)

R^2 が C_{1-4} アルキル-カルボニルアセチルアミノを示す場合
上記式 (I a) の化合物を式

【0012】

【化6】



【0013】

式中 R^8 は C_{1-4} アルキル 好ましくは C_{1-3} アルキルを示す
て表される化合物と反応させる方法

製法 (d)

R^2 が $\text{ノ}(C_{1-4}\text{アルキル})-C_{1-4}\text{アルキリデノアミノ}$ を示す場合
上記式 (I a) の化合物を式

【0014】

【化7】



【0015】

式中

R^6 は前記と同義であり

R^9 は C_{1-4} アルキル 好ましくは C_{1-3} アルキルを示し

R^{10} は水素原子又は C_{1-3} アルキル 好ましくは水素原子 メチル又はエチルを
示す

て表される化合物と反応させる方法

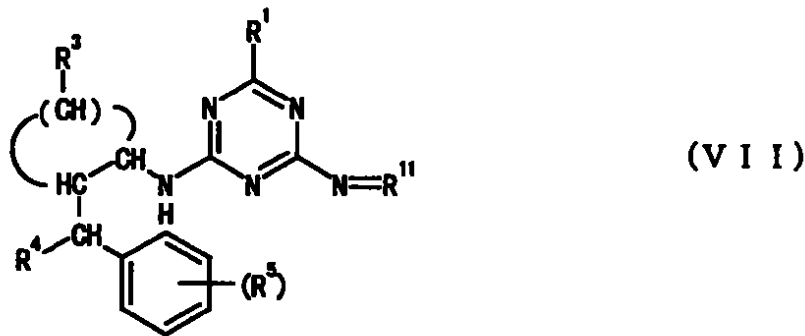
製法 (e)

R^2 が C_{1-4} アルキルアミノを示す場合

式

【0016】

【化8】



【0017】

式中

R^1 R^3 R^4 R^5 m 及び n は前記と同義であり そして

R^{11} は C_{1-4} アルキリデン 好ましくは C_{1-3} アルキリデンを示す
て表される化合物を還元反応に付す方法

【0018】

本発明により提供される式(I)のトリアゾノ類は 前述した先行技術文献に
記載の化合物に比較して 強力な除草作用を示す

【0019】

本明細書において

「ハロゲン」はフルオル クロル ブロム又はヨートを示し 好ましくはフルオ
ル クロル ブロムである

【0020】

「アルキル」は直鎖状又は分岐鎖状であることができ 例えば C_{1-4} のアル
キルを示すことができ 具体的には メチル エチル n -もしくは iso -ブ
ロピル n - iso - sec -もしくは $tert$ -ブチル等を例示すること
ができる

【0021】

「 n クロアルキル」としては 例えば n クロプロピル n クロブチル n ク
ロヘンチル n クロヘキシル等が挙げられる

【0022】

「ハロアルキル」はハロゲン置換された直鎖状又は分岐鎖状のアルキルであり
 例えば 1～9個のフルオル クロル及び／又はブロムにより置換されたC₁₋₄のアルキルを例示することができ 具体的には フルオロメチル フルオロクロロメチル フルオロブロモメチル フルオロジクロロメチル フルオロジブロモメチル ノフルオロメチル ノフルオロクロロメチル ノフルオロブロモメチル トリフルオロメチル クロロメチル ジクロロメチル トリクロロメチル ブロモメチル 1-フルオロエチル 2-フルオロエチル 2,2,2-トリフルオロエチル 1,2,2,2-テトラフルオロエチル パーフルオロエチル 1-クロロエチル 1,2-ジクロロエチル 1-ブロモエチル パーフルオロプロピル 1-フルオロ-1-メチルエチル 1-クロロ-1-メチルエチル 1-ブロモ-1-メチルエチル 1-(トリフルオロメチル)-2,2,2-トリフルオロエチル 2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチル 3-フルオロプロピル 3-クロロプロピル 2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル 1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピル パーフルオロブチル等が挙げられる

【0023】

「アルコキン」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-O-であり
 例えば C₁₋₄のアルコキンを示すことができ 具体的には メトキン エトキン n-もしくはiso-プロポキン n- iso- sec-もしくはtert-ブトキン等を例示することができる

【0024】

「アルキルチオ」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-S-であり
 例えば C₁₋₄のアルキルチオを示すことができ 具体的には メチルチオ エチルチオ n-もしくはiso-プロピルチオ n- iso- sec-もしくはtert-ブチルチオ等を例示することができる

【0025】

「アルキルスルフィニル」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-S-O-であり 例えば C₁₋₄のアルキルスルフィニルを示すことができ 具体的

には メチルスルフィニル エチルスルフィニル n-もしくはiso-プロピルスルフィニル n- iso- sec-もしくはtert-ブチルスルフィニル等を例示することができる

【0026】

「アルキルスルホニル」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-SO₂-であり 例えば C₁₋₄のアルキルスルホニルを示すことができ 具体的には メチルスルホニル エチルスルホニル n-もしくはiso-プロピルスルホニル n- iso- sec-もしくはtert-ブチルスルホニル等を例示することができる

【0027】

「アルキルアミノ」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-NH-であり 例えば C₁₋₄のアルキルアミノを示すことができ 具体的には メチルアミノ エチルアミノ n-もしくはiso-プロピルアミノ n- iso- sec-もしくはtert-ブチルアミノ等を例示することができる

【0028】

「アルキル-カルボニルアミノ」はアルキル部分が上記の意味を有するアルキル-CONH-であり 例えば 合計でC₂₋₅のアルキル-カルボニルアミノを示すことができ 具体的には メチルカルボニルアミノ エチルカルボニルアミノ n-もしくはiso-プロピルカルボニルアミノ n- iso- sec-もしくはtert-ブチルカルボニルアミノ等を例示することができる

【0029】

「ノクロアルキル-カルボニルアミノ」はノクロアルキル部分が上記の意味を有するノクロアルキル-CONH-であり 例えば 合計でC₄₋₇のノクロアルキル-カルボニルアミノを示すことができ 具体的には ノクロプロピルカルボニルアミノ ノクロブチルカルボニルアミノ ノクロヘンチルカルボニルアミノ ノクロヘキシルカルボニルアミノ等を例示することができる

【0030】

「ハロアルキル-カルボニルアミノ」はハロアルキル部分が上記の意味を有するハロアルキル-CONH-であり 例えば 合計でC₂₋₅のハロアルキル-カル

269- 62

ボニルアミノを示すことができ 具体的には フルオロメチルカルボニルアミノ
 ノフルオロメチルカルボニルアミノ ノフルオロクロロメチルカルボニルアミ
 ノ ノフルオロブロモメチルカルボニルアミノ トリフルオロメチルカルボニル
 アミノ 1-フルオロエチルカルボニルアミノ 2-フルオロメチルカルボニル
 アミノ 2 2 2-トリフルオロエチルカルボニルアミノ 1 2 2 2-
 テトラフルオロエチルカルボニルアミノ パーフルオロエチルカルボニルアミノ
 パーフルオロプロピルカルボニルアミノ パーフルオロブチルカルボニルアミ
 ノ等を例示できる

【0031】

「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいヘノzol」
 及び「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいヘノzol
 カルボニルアミノ」におけるハロゲン部分は上記の「ハロゲン」と同様の意味を
 有し また アルキル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有する しかし
 て 「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいヘノzol」
 の具体例としては ヘノzol 2-(3-及び4-)フルオロヘノzol 2-
 (3-及び4-)クロロヘノzol 2-(3-及び4-)メチルヘノzol 2
 3-(2 4- 2 5- 2 6- 3 4- 3 5-)ノフルオロヘノzol
 等を例示することができ また 「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル
 置換されていてもよいヘノzolカルボニルアミノ」の具体例としては ヘノzol
 カルボニルアミノ 2- 3-もしくは4-フルオロヘノzolカルボニルアミノ
 2- 3-もしくは4-クロロヘノzolカルボニルアミノ 2- 3-もしくは
 4-メチルヘノzolカルボニルアミノ 2 3- 2 4- 2 5- 2
 6- 3 4-もしくは3 5-ノフルオロヘノzolカルボニルアミノ等を例示
 することができる

【0032】

「場合によりハロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいフェニル」
 におけるハロゲン部分は上記の「ハロゲン」と同様の意味を有し また アルキ
 ル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有する しかして 「場合によりハ
 ロゲン置換もしくはアルキル置換されていてもよいフェニル」の具体例としては

フェニル 2- 3-もしくは4-フルオロフェニル 2- 3-もしくは4-クロロフェニル 2- 3-もしくは4-メチルフェニル 2 3- 2 4- 2 5- 2 6- 3 4-もしくは3 5-ノフルオロフェニル 2 3- 2 4- 2 5- 2 6- 3 4-もしくは3 5-ノクロロフェニル 2 3- 2 4- 2 5- 2 6- 3 4-もしくは3 5-ノメチルフェニル等を例示することができる

【0033】

「場合によりアルキル置換 アルコキソ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ」において アルキル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有し アルコキソ部分は上記の「アルコキソ」と同様の意味を有し また ハロゲン部分は上記の「ハロゲン」と同様の意味を有する しかし 「場合によりアルキル置換 アルコキソ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ」の具体例としては フェニルカルボニルアミノ 2- 3-もしくは4-フルオロフェニルカルボニルアミノ 2- 3-もしくは4-クロロフェニルカルボニルアミノ 2- 3-もしくは4-メチルフェニルカルボニルアミノ 2- 3-もしくは4-メトキシフェニルカルボニルアミノ 2 3- 2 4- 2 5- 2 6- 3 4-もしくは3 5-ノフルオロフェニルカルボニルアミノ 2 3- 2 4- 2 5- 2 6- 3 4-もしくは3 5-ノクロロフェニルカルボニルアミノ 2 3- 2 4- 2 5- 2 6- 3 4-もしくは3 5-ノメチルフェニルカルボニルアミノ等を例示することができる

「アルキルカルボニルアセチルアミノ」におけるアルキル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有し 「アルキルカルボニルアセチルアミノ」の具体例としては アセトアセチルアミノ プロピオニルアセチルアミノ ブチリルアセチルアミノ イノブチリルアセチルアミノ バレリルアセチルアミノ イノバレリルアセチルアミノ ピバロイルアセチルアミノ等を例示することができる

【0034】

「ノアルキルアミノアルキリデンアミノ」のアルキル部分は上記の「アルキル」と同様の意味を有し また 上記のアルキリデン部分は直鎖状又は分岐鎖状で

あることがき 例えば C_{1-4} のアルキリデンを示すことができる しかして

「ジアルキルアミノアルキリデンアミノ」の例としては ノメチルアミノメチリデンアミノ 1-(ノメチルアミノ)エチリデンアミノ 1-(ノメチルアミノ)(n-プロピリデン)アミノ 1-(ノメチルアミノ)(n-ブチリデン)アミノ 1-(ノメチルアミノ)(iso-ブチリデン)アミノ ジエチルアミノメチリデンアミノ ノ(n-プロピル)アミノメチリデンアミノ ノ(n-ブチル)アミノメチリデンアミノ (N-メチル-N-エチルアミノ)メチリデンアミノ (N-メチル-N-(n-プロピル)アミノ)メチリデンアミノ等を挙げるができる

【0035】

本発明の好適な群の化合物としては 式(I)において

R^1 が C_{1-4} アルキル C_{3-5} ノクロアルキル C_{1-3} ハロアルキル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘノノル 又は場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 がアミノ C_{1-3} アルキルアミノ ホルミルアミノ C_{1-3} アルキル-カルボニルアミノ C_{3-5} ノクロアルキル-カルボニルアミノ C_{1-3} ハロアルキル-カルボニルアミノ 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘノノルカルボニルアミノ 場合により C_{1-3} アルキル置換

C_{1-3} アルコキノ置換 フルオル置換もしくはクロル置換されていてもよいフェニルカルボニルアミノ C_{1-3} アルキル-カルボニルアセチルアミノ 又はノ(C_{1-3} アルキル)アミノ- C_{1-3} アルキリデンアミノを示し

R^3 又は R^4 がそれぞれ独立に水素原子又は C_{1-3} アルキルを示し

R^5 がフルオル クロル ブロム メチル エチル n-プロピル iso-プロピル tert-ブチル C_{1-3} ハロアルキル C_{1-3} アルコキノ C_{1-3} ハロアルコキノ C_{1-3} アルキルチオ C_{1-3} ハロアルキルチオ C_{1-3} アルキルスルフィニル C_{1-3} アルキルスルホニル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェニル 場合によりフルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいフェノキノ ニト

ロ又はノアノを示し

mが2～4の整数を示し このとき R^3 は同一もしくは相異なっているもよく

nが0～4の整数を示し そして

nが2以上の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なっているもよい
化合物が挙げられる

【0036】

そして 更に好ましい群の化合物としては 前記式(I)の化合物において
 R^1 がメチル エチル n-プロピル iso-プロピル tert-ブチル
nクロプロピル nクロブチル フルオロメチル フルオロクロロメチル フ
ルオロブロモメチル フルオロnクロロメチル フルオロnブロモメチル nフ
ルオロメチル nフルオロクロロメチル nフルオロブロモメチル トリフルオ
ロメチル クロロメチル トリクロロメチル ブロモメチル 1-フルオロエチ
ル 2, 2, 2-トリフルオロエチル 1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル
パーフルオロエチル 1-クロロエチル 1, 2-nクロロエチル 1-プロ
モエチル パーフルオロプロピル 1-フルオロ-1-メチルエチル 1-クロ
ロ-1-メチルエチル 1-ブromo-1-メチルエチル 1-(トリフルオロメ
チル)-2, 2, 2-トリフルオロエチル 場合によりフルオル置換もしくはメ
チル置換されていてもよいヘノール 又は場合によりフルオル置換 クロル置換
もしくはメチル置換されていてもよいフェニルを示し

R^2 がアミノ メチルアミノ エチルアミノ ホルミルアミノ アセチルアミ
ノ エチルカルボニルアミノ nクロプロピルカルボニルアミノ フルオロメチ
ルカルボニルアミノ トリフルオロメチルカルボニルアミノ 1-フルオロエチ
ルカルボニルアミノ パーフルオロエチルカルボニルアミノ 場合によりクロル
置換もしくはメチル置換されていてもよいヘノールカルボニルアミノ 場合によ
りフルオル置換 クロル置換 メチル置換もしくはメトキノ置換されていてもよ
いフェニルカルボニルアミノ アセトアセチルアミノ 又はnメチルアミノメチ
リデンアミノを示し

R^3 又は R^4 がそれぞれ独立に水素原子 メチル又はエチルを示し

268
266

R^5 がフルオル クロル メチル エチル トリフルオロメチル メトキン
エトキン トリフルオロメトキン メチルチオ トリフルオロメチルチオ メチ
ルスルフィニル メチルスルホニル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置
換されていてもよいフェニル 場合によりフルオル置換もしくはメチル置換され
ていてもよいフェノキン ニトロ又はノアノを示し

m が3～4の整数を示し このとき R^3 は同一もしくは相異なっているもよく

n が0～3の整数を示し そして

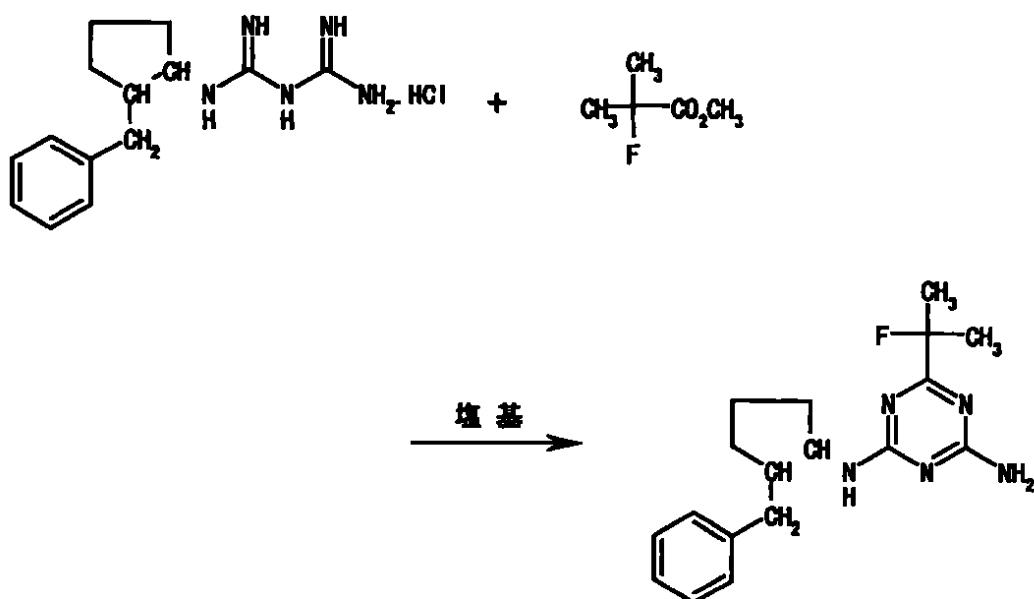
n が2又は3の整数を示す場合 R^5 は同一もしくは相異なっているもよい
化合物が挙げられる

【0037】

前記製法 (a) は 原料として 例えば 2-ヘノノルノクロヘンチルビグア
ニト塩酸塩と α -フルオロ- α -メチルプロピオン酸メチルとを用いる場合 下
記の反応式で表される

【0038】

【化9】



【0039】

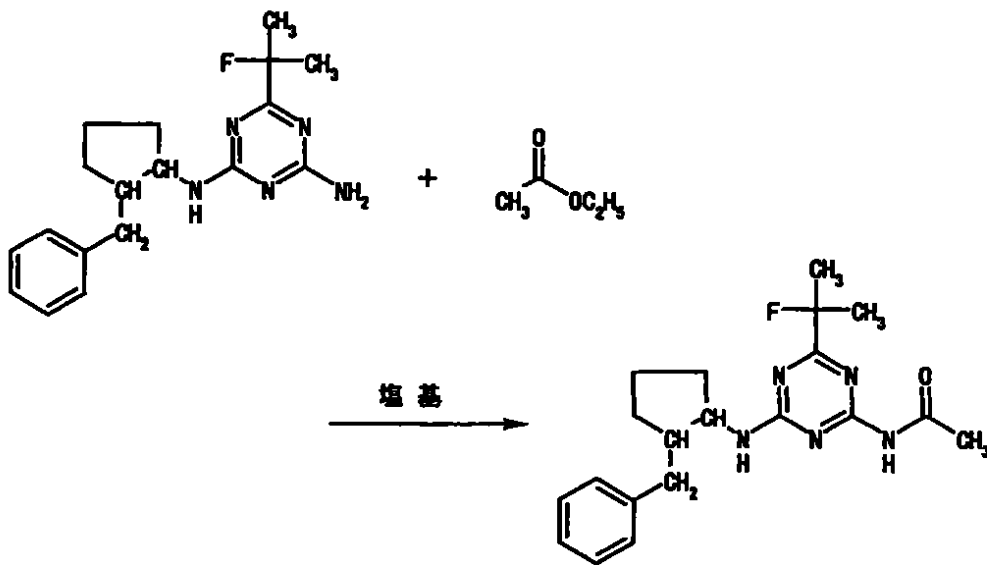
前記製法 (b) は 原料として 例えば 2-アミノ-4-(2-ヘノノル
ノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-ト

749
28

リアノンと酢酸エチルエステルとを用いる場合 下記の反応式で表される

【0040】

【化10】

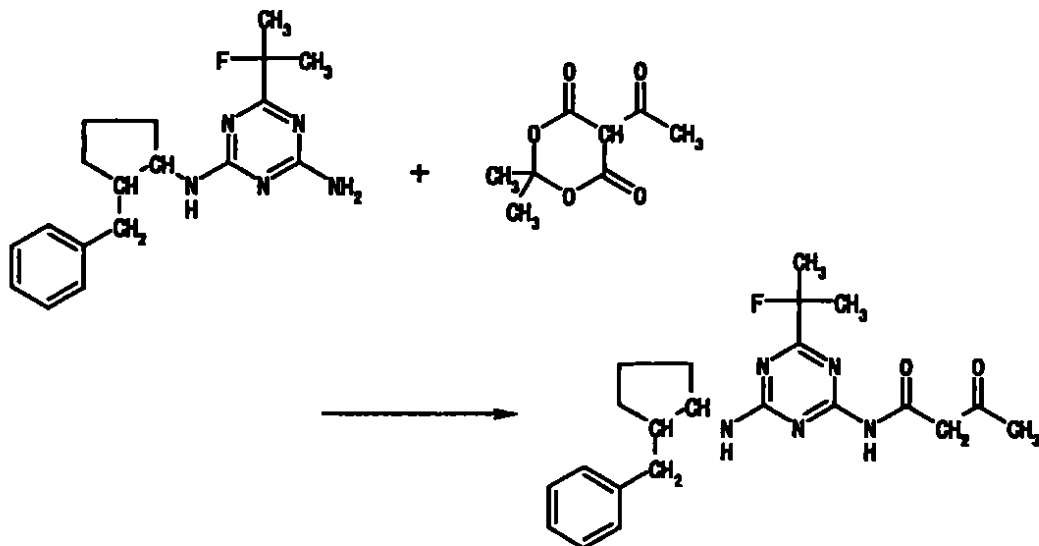


【0041】

前記製法 (c) は 原料として 例えば 2-アミノ-4-(2-ヘンゾル
ンクロヘンチルアミノ)-6-(α-フルオロイノプロピル)-1 3 5-ト
リアノンとアセチルメルトラム酸とを用いる場合 下記の反応式で表される

【0042】

【化11】



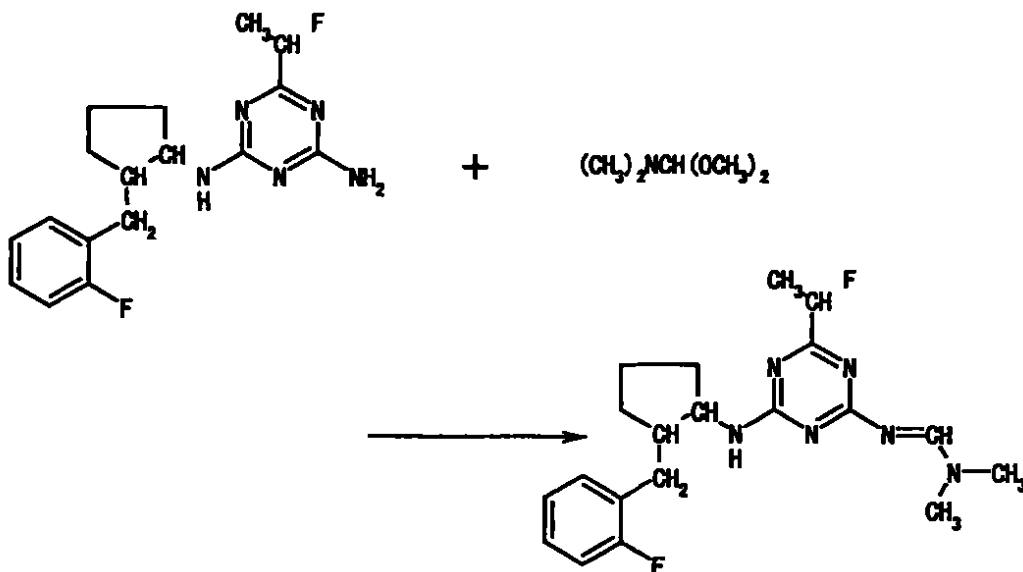
【0043】

70
208

前記製法 (d) は 原料として 例えば 2-アミノ-4-(2-(2-フルオロヘンゾル)クロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾノとN,N-ジメチルホルムアミトジメチルアセタールとを用いる場合 下記の反応式で表される

【0044】

【化12】

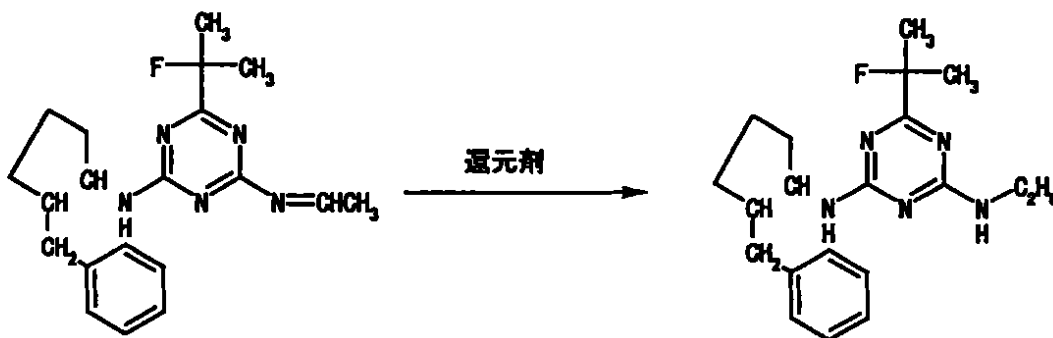


【0045】

前記製法 (e) は 原料として 例えば 2-エチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾノを用いる場合 下記の反応式で表される

【0046】

【化13】

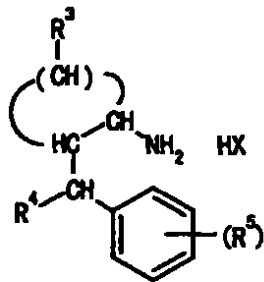


【0047】

上記製法 (a) において 原料である式 (I I) の化合物は 従来の文献に未記載の新規化合物であり 例えば 特開平 1-246279 号公報 特開昭 63-264465 号公報 特開昭 63-222166 号公報 特開昭 63-146876 号公報 特開昭 63-51379 号公報等に記載されている方法 例えば

【0048】

【化 14】



(VIII)

【0049】

式中

R^3 R^4 R^5 n 及び n は前記と同義であり

X はハロゲンを示す

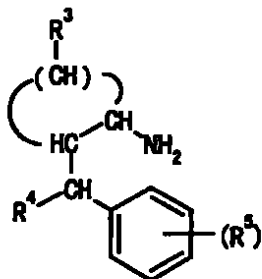
て表される化合物をノアノグアニンと 適当な希釈剤 例えば n -デカン中で反応させることにより製造することができる

【0050】

上記式 (VIII) の化合物は 一部新規化合物を包含する下記式

【0051】

【化 15】



(IX)

【0052】

式中 R^3 R^4 R^5 n 及び n は前記と同義である

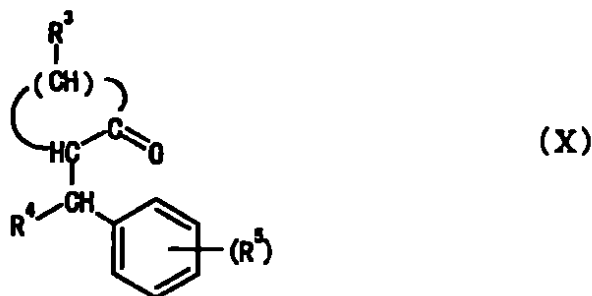
で表される化合物を適当なハロゲン化水素酸 例えば 塩酸と反応させることにより製造することができる

【0053】

上記式 (IX) の化合物は その一部は従来 of 文献に未記載の新規化合物であるが 例えば Organic Reaction Vol 5 p 301 (1962) John Wiley & Sons INC に記載されている方法 すなわち 式

【0054】

【化16】



【0055】

式中 R^3 R^4 R^5 m及びnは前記と同義である

で表される化合物を ホルムアミトと蟻酸を用いた Leuckart 反応に付すことにより製造することができる

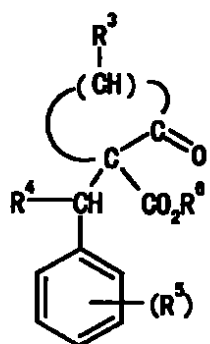
【0056】

上記式 (X) の化合物は その一部は従来 of 文献に未記載の新規化合物であるが 例えば 一般的に知られている β -ケトエステルの脱カルボキソ反応 すなわち 式

【0057】

273
21

【化 17】



(X I)

【0058】

式中

R^3 R^4 R^5 m 及び n は前記と同義であり

R^6 は C_{1-4} アルキルを示す

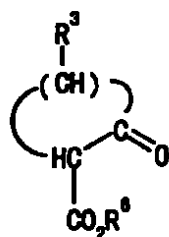
て表される化合物から 適当な鉱酸 例えば 臭化水素酸を用い 容易に製造することができる

【0059】

上記式 (X I) の化合物は その一部は従来 of 文献に未記載の新規化合物であるが 例えば 「精密有機合成」 南江堂 160頁 1983年に記載の方法すなわち 式

【0060】

【化 18】



(X I I)

【0061】

式中

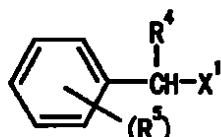
R^3 及び m は前記と同義であり

R^6 は C_{1-4} アルキルを示す

て表される化合物を 式

【0062】

【化19】



(XIII)

【0063】

式中

 R^4 R^5 及び n は前記と同義であり X^1 はハロゲンを示す

て表わされる化合物と 適当な縮合剤 例えば 水酸化ナトリウム水溶液を用い
 相間移動触媒 例えば テトラブチルアンモニウム ヒドロゲンスルフェイト
 の存在下において 適当な希釈剤 例えば ノクロロメタン中で反応させること
 により容易に得ることができる

【0064】

上記式 (XII) の化合物は その一部は従来の文献に未記載の新規化合物で
 あるが 例えば Organic Reaction Vol 15 p 1(1967) John Wiley & Sons
 INC に記載されている方法により容易に製造することができる

【0065】

上記式 (XIII) の化合物は既知の化合物であり 例えば 「新実験化学講
 座」 日本化学会編 第14巻 (I) 331頁 1962年 丸善発行に記載されて
 いる方法により容易に製造することができる

【0066】

上記製法 (a) において原料として用いられる式 (II) の化合物の代表例と
 しては下記のを例示することができる

【0067】

2-ヘンゾルノクロヘンチルピグアニト塩酸塩

2-(2-フルオロヘンゾル)ノクロヘンチルピグアニト塩酸塩

2-(3-フルオロヘンゾル)ノクロヘンチルピグアニト塩酸塩

2- (3-メチルヘノール) ノクロヘノチルピグアニト塩酸塩

2-ヘノールノクロヘキシルピグアニト塩酸塩

2- (2-フルオロヘノール) ノクロヘキシルピグアニト塩酸塩

2- (3-フルオロヘノール) ノクロヘキシルピグアニト塩酸塩

2- (3-メチルヘノール) ノクロヘキシルピグアニト塩酸塩等

【0068】

式 (I I I) の化合物は 既知の化合物であり 市販品を用いてもよく 又は
EP-A-850911に記載されている方法で容易に製造することもできる

【0069】

上記製法 (a) において原料として用いられる式 (I I I) の化合物の代表例
としては下記のを例示することができる

【0070】

フルオロ酢酸エチルエステル

フルオロクロロ酢酸エチルエステル

フルオロブロモ酢酸エチルエステル

ジフルオロクロロ酢酸エチルエステル

ジブロモフルオロ酢酸エチルエステル

トリフルオロ酢酸エチルエステル

ヘンタフルオロプロピオン酸メチルエステル

α -フルオロプロピオン酸エチルエステル

α -フルオロ- α -メチルプロピオン酸エチルエステル

酢酸エチルエステル

プロピオン酸エチルエステル

n-酪酸エチルエステル

イノ酪酸エチルエステル

ノクロプロパンカルボン酸エチルエステル

ノクロヘンタンカルボン酸エチルエステル

ノクロヘキサノカルボン酸エチルエステル等

【0071】

上記製法 (b) ~ (d) において 原料である式 (Ia) の化合物は 本発明の式 (I) の化合物の一部であり 上記製法 (a) により容易に製造することがてきる

【0072】

上記製法 (b) において 式 (IV) の化合物は 前記 R^6 の定義に基づいたものを意味し R^7 は水素原子 C_{1-4} アルキル C_{3-6} ノクロアルキル C_{1-4} ハロアルキル ハロゲン置換もしくは C_{1-4} アルキル置換されていてもよいヘノゾル

又は C_{1-4} アルキル置換 C_{1-4} アルコキノ置換もしくはハロゲン置換されていてもよいフェニルを示す 好ましくは 前記 R^6 の好ましい定義に基づいたものを意味し R^7 は水素原子 C_{1-3} アルキル C_{3-5} ノクロアルキル C_{1-3} ハロアルキル フルオル置換 クロル置換もしくは C_{1-3} アルキル置換されていてもよいヘノゾル 又は C_{1-3} アルキル置換 C_{1-3} アルコキノ置換もしくはフルオル置換もしくはクロル置換されていてもよいフェニルを示す

【0073】

式 (IV) の化合物は既知の化合物であり 市販品を用いてもよく 又は 例えば EP-A-850911 に記載の方法で容易に合成することもできる

【0074】

上記製法 (b) ~ (d) において原料として用いられる式 (Ia) の化合物の代表例としては式 (I) に包含される下記のを例示することができる

【0075】

2-アミノ-4-(2-ヘノゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾノ

2-アミノ-4-(2-ヘノゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾノ

2-アミノ-4-(2-(2-フルオロヘノゾル)ノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾノ

2-アミノ-4-(2-(2-フルオロヘノゾル)ノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾノ

2-アミノ-4-(2-(2-フルオロヘノゾル)ノクロヘンチルアミノ)

- 6 - (トリフルオロメチル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - フルオロヘノゾル) ノクロヘンチルアミノ)
- 6 - (α - フルオロイノプロピル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - フルオロヘノゾル) ノクロヘンチルアミノ)
- 6 - (α - フルオロエチル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - フルオロヘノゾル) ノクロヘンチルアミノ)
- 6 - (トリフルオロメチル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - メチルヘノゾル) ノクロヘンチルアミノ) -
- 6 - (α - フルオロイノプロピル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - メチルヘノゾル) ノクロヘンチルアミノ) -
- 6 - (α - フルオロエチル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - メチルヘノゾル) ノクロヘンチルアミノ) -
- 6 - (α - フルオロイノプロピル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - ヘノゾルノクロヘキノルアミノ) - 6 - (α - フル
オロイノプロピル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - ヘノゾルノクロヘキノルアミノ) - 6 - (α - フル
オロエチル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - フルオロヘノゾル) ノクロヘキノルアミノ)
- 6 - (α - フルオロイノプロピル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - フルオロヘノゾル) ノクロヘキノルアミノ)
- 6 - (α - フルオロエチル) - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - メチルヘノゾル) ノクロヘキノルアミノ) -
- 6 - イノプロピル - 1 3 5 - トリアゾノ
- 2 - アミノ - 4 - (2 - (3 - メチルヘノゾル) ノクロヘキノルアミノ) -
- 6 - エチル - 1 3 5 - トリアゾノ等

【0076】

上記製法 (b) において原料として用いられる式 (IV) の化合物の代表例と
しては下記のを例示することができる

【0077】

278 96

酢酸エチルエステル

プロピオノ酸エチルエステル

n-酪酸エチルエステル

イノ酪酸エチルエステル

ピバリノ酸エチルエステル

ノクロプロパンカルボノ酸エチルエステル

ノクロヘンタンカルボノ酸エチルエステル

ノクロヘキサノカルボノ酸エチルエステル

フェニル酢酸エチルエステル

安息香酸エチルエステル

3-メチル安息香酸エチルエステル

2-クロロ安息香酸エチルエステル

トリフルオロ酢酸エチルエステル等

【0078】

上記製法 (c) において 原料である式 (V) の化合物は 既知の化合物であり 例えば Chem Pharm Bull (1987) 35 (5) 1860-1870に記載の方法により容易に製造することができる

【0079】

上記製法 (c) において原料として用いられる式 (V) の化合物の代表例としては下記のを例示することができる

【0080】

5-アセチル-2 2-メチル-1 3-ノオキサノ-4 6-ノオン

5-プロピオニル-2 2-メチル-1 3-ノオキサノ-4 6-ノオン

5-ブチリル-2 2-メチル-1 3-ノオキサノ-4 6-ノオン

5-イノブチリル-2 2-メチル-1 3-ノオキサノ-4 6-ノオン

5-ノクロプロピルカルボニル-2 2-メチル-1 3-ノオキサノ-4

6-ノオン

329
197

5-ノクロヘキシルカルボニル-2 2-ノメチル-1 3-ノオキサノ-4
6-ノオン
5-(2-フルオロヘノノイル)-2 2-ノメチル-1 3-ノオキサノ-
4 6-ノオン等

【0081】

上記製法(d)において 原料である式(VI)の化合物は 既知の化合物で
あり 例えば 特開平8-277251号公報に記載の方法により容易に製造す
ることができる

【0082】

上記製法(d)において原料として用いられる式(VI)の化合物の代表例と
しては下記のを例示することができる

【0083】

N N-ノメチルホルムアミトノメチルアセタール
N N-ノエチルホルムアミトノメチルアセタール
N N-ノプロピルホルムアミトノメチルアセタール
N-メチル-N-エチルホルムアミトノメチルアセタール
N-メチル-N-プロピルホルムアミトノメチルアセタール
N N-ノメチルホルムアミトノエチルアセタール
N N-ノエチルホルムアミトノエチルアセタール
N N-ノメチルアセトアミトノメチルアセタール
N N-ノエチルアセトアミトノメチルアセタール等

【0084】

上記製法(e)において 原料である式(VII)の化合物は 従来の文献に
未記載の新規化合物であり 例えば 特開昭63-51379号公報に記載され
る方法 例えば 前記式(Ia)の化合物を式



で表わされる総炭素数がC₁₋₄の脂肪族アルデヒドもしくは脂肪族ケトンと反応
させることにより製造することができる

【0085】

式 (XIV) の化合物は既知の化合物であり 市販されているものを用いることができる

【0086】

上記製法 (e) において原料として用いられる式 (VII) の化合物の代表例としては下記のを例示することができる

【0087】

- 2-メチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-エチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-プロピリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-イノプロピリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-メチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-エチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-プロピリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-メチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘキシルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-エチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘキシルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-エチリデンアミノ-4-(2-(3-フルオロヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-エチリデンアミノ-4-(2-(3-メチルヘンゾル)ンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾ
- 2-エチリデンアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-

イノプロビル-1 3 5-トリアゾノ等

【0088】

なお 上記製法 (b) に従い 式 (IV) の化合物のかわりに 式



式中

R^{12} は C_{1-4} アルキルを示し

X^1 はハロゲンを示す

で表わされる化合物を用いることによっても 上記製法 (e) により製造される化合物 すなわち R^2 が C_{1-4} アルキルアミノを示す本発明の式 (I) の化合物を製造することができる

【0089】

上記製法 (a) の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用される希釈剤の例としては エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル イノプロビルエーテル ブチルエーテル ジオキサノ ノメトキン エタノ (DME) テトラヒドロフラン (THF) ジエチレングリコールジメチルエーテル (DGM) 等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イノプロパノール ブタノール エチレングリコール等 酸アミト類 例えば ジメチルホルムアミト (DMF) ジメチルアセトアミト (DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン ヘキサメチルフォスフォリノクトリアミト (HMPA) 等 スルホノ スルホキント類 例えば ノメチルスルホキント (DMSO) スルホラノ等 塩基 例えば ピリジン等を挙げることができる

【0090】

製法 (a) は酸結合剤の存在下で行うことができ その際に使用しうる酸結合剤としては 無機塩基として アルカリ金属およびアルカリ土類金属の水素化物 水酸化物 炭酸塩 重炭酸塩等 例えば 水素化ナトリウム 水素化リチウム 炭酸水素ナトリウム 炭酸水素カリウム 炭酸ナトリウム 炭酸カリウム 水酸化リチウム 水酸化ナトリウム 水酸化カリウム 水酸化カルシウム等 無機アルカリ金属アミト類 例えば リチウムアミト ナトリウムアミト カリウムアミト等 また 有機塩基として アルコラート 第3級アミノ類 ジアルキル

アミノアニリン類及びピリゾン類 例えば ナトリウムメトキサイト ナトリウムエトキサイト カリウムtert-ブトキサイト トリエチルアミン 1,1,4,4-テトラメチルエチレンジアミン(TMEDA) N,N-ジメチルアニリン N,N-ジエチルアニリン ピリゾン 4-ジメチルアミノピリゾン(DMAP) 1,4-ジアザビシクロ[2,2,2]オクタン(DABCO) 1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]ウンデカ-7-エン(DBU)等が挙げられる

【0091】

製法(a)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般には約0～約100℃ 好ましくは約20～約80℃の間の温度が適当である また 該反応は常圧下で行うことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧下で操作することもできる

【0092】

製法(a)を実施するにあたっては 例えば 式(II)の化合物1モルに対し 希釈剤例えばメタノール中で 0.8～2.2モル量の式(III)の化合物を 2～3モル量のナトリウムメトキサイト存在下で反応させることによって 式(I)の目的化合物を得ることができる

【0093】

なお 製法(a)において 式(IX)の化合物から式(VIII)の化合物を経由し式(II)の化合物を製造する反応は連続して行なうこともできる

【0094】

上記製法(b)の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用される希釈剤の例としては 水 脂肪族 脂環族および芳香族炭化水素類(場合によっては塩素化されてもよい) 例えば ヘンタン ヘキサン ノクロヘキサン 石油エーテル リグロイン ヘンゼン トルエン キノレン ノクロロメタン クロロホルム 四塩化炭素 1,2-ジクロロエタン クロルヘンゼン ジクロロヘンゼン等 エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル イノプロピルエーテル ブチルエーテル ジオキサン ノメトキノエタン(DME) テトラヒドロフラン(THF) ノエチレングリコールジメチルエーテル(DGM)等 ケトン類 例えば アセトン メチルエチルケトン(MEK) メチル-イノプロピル

ケトン メチルイソブチルケトン(MIBK)等 ニトリル類 例えば アセトニトリル プロピオニトリル アクリロニトリル等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イソプロパノール ブタノール エチレングリコール等 エステル類 例えば 酢酸エチル 酢酸アミル等 酸アミト類 例えば ノメチルホルムアミト(DMF) ノメチルアセトアミト(DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ノメチル-2-イミダゾリジノン ヘキサメチルフォスフォリノクトリアミト(HMPA)等
スルホン スルホキント類 例えば ノメチルスルホキント(DMSO) スルホラノン等 塩基 例えば ピリジン等を挙げることができる

【0095】

製法(b)は塩基の存在下で行うことができ その際に使用する塩基としては 無機塩基として アルカリ金属およびアルカリ土類金属の水素化物 水酸化物 炭酸塩 重炭酸塩等 例えば 水素化ナトリウム 水素化リチウム 炭酸水素ナトリウム 炭酸水素カリウム 炭酸ナトリウム 炭酸カリウム 水酸化リチウム 水酸化ナトリウム 水酸化カリウム 水酸化カルシウム等 無機アルカリ金属アミト類 例えば リチウムアミト ナトリウムアミト カリウムアミト等
また 有機塩基として アルコラート 第3級アミノ類 ジアルキルアミノアニリン類及びピリジン類 例えば トリエチルアミン 1,1,4,4-テトラメチルエチレンジアミン(TMEDA) N,N-ジメチルアニリン N,N-ジエチルアニリン ピリジン 4-ジメチルアミノピリジン(DMAP) 1,4-ジアザビシクロ[2,2,2]オクタノ(DABCO)及び1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]ウンデカ-7-エン(DBU)等 有機リチウム化合物 例えば メチルリチウム n-ブチルリチウム sec-ブチルリチウム tert-ブチルリチウム フェニルリチウム ノメチルカノパーリチウム リチウムジイソプロピルアミト リチウムシクロヘキシルイソプロピルアミト リチウムシクロヘキシルアミト n-ブチルリチウム DABCO n-ブチルリチウム DBU n-ブチルリチウム TMEDA等を挙げることができる

【0096】

製法(b)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般には約0～約150℃ 好ましくは約40～約80℃の間の温度が適当である
また 該反応は常圧下で行うことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧

下で操作することもできる

【0097】

製法 (b) を実施するにあたっては 例えば 式 (Ia) の化合物 1 モルに対し 2 ~ 20 モル量の式 (IV) の化合物を 1 ~ 2 モル量のナトリウムメトキサイト存在下で反応させることによって式 (I) の目的化合物を得ることができる

【0098】

上記製法 (c) の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用される希釈剤の例としては 水 脂肪族 脂環族および芳香族炭化水素類 (場合によっては塩素化されてもよい) 例えば ヘンタン ヘキサン ノクロヘキサン 石油エーテル リグロイン ヘンゼン トルエン キノレン ノクロロメタン クロロホルム 四塩化炭素 1,2-ノクロロエタン クロルヘンゼン ノクロロヘンゼン等 エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル イノプロピルエーテル ブチルエーテル ノオキサン ノメトキノエタン (DME) テトラヒドロフラン (THF) ノエチレングリコールノメチルエーテル (DGM) 等 ケトン類 例えば アセトン メチルエチルケトン (MEK) メチル-イノプロピルケトン メチルイノブチルケトン (MIBK) 等 ニトリル類 例えば アセトニトリル プロピオニトリル アクリロニトリル等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イノプロパノール ブタノール エチレングリコール等 エステル類 例えば 酢酸エチル 酢酸アミル等 酸アミト類 例えば ノメチルホルムアミト (DMF) ノメチルアセトアミト (DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ノメチル-2-イミダゾリノンノノ ヘキサメチルフォスフォリノクトリアミト (HMPA) 等 スルホノ スルホキント類 例えば ノメチルスルホキント (DMSO) スルホラン等 塩基 例えば ピリジン等を挙げることができる

【0099】

製法 (c) は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般には約 20 ~ 約 180℃ 好ましくは約 60 ~ 約 120℃ の間の温度が適当である また 該反応は常圧下で行うことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧下で操作することもできる

【0100】

製法(c)を実施するにあたっては 例えば 希釈剤例えばヘンゼン中で 式(Ia)の化合物1モルに対し 1~2モル量の式(V)の化合物を反応させることによって式(I)の目的化合物を得ることができる

【0101】

上記製法(d)の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用される希釈剤の例としては 水 脂肪族 脂環族および芳香族炭化水素類(場合によっては塩素化されてもよい) 例えば ヘンタン ヘキサン ノクロヘキサン 石油エーテル リグロイン ヘンゼン トルエン キノレン ノクロロメタン クロロホルム 四塩化炭素 1,2-ノクロロエタン クロルヘンゼン ノクロロヘンゼン等 エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル イノプロピルエーテル ブチルエーテル ノオキサン ノメトキノエタン(DME) テトラヒドロフラン(THF) ノエチレングリコールノメチルエーテル(DGM)等 ケトン類 例えば アセトン メチルエチルケトン(MEK) メチル-イノプロピルケトン メチルイノブチルケトン(MIBK)等 ニトリル類 例えば アセトニトリル プロピオニトリル アクリロニトリル等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イノプロパノール ブタノール エチレングリコール等 エステル類 例えば 酢酸エチル 酢酸アミル等 酸アミト類 例えば ノメチルホルムアミト(DMF) ノメチルアセトアミト(DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ノメチル-2-イミダノリノノン ヘキサメチルフォスフォリノクトリアミト(HMPA)等 スルホン スルホキント類 例えば ノメチルスルホキント(DMSO) スルホラン等 塩基 例えば ピリノンを挙げることをできる

【0102】

製法(d)は酸触媒の存在下で行うことができ その際に使用する酸触媒の例としては 鉱酸類 例えば 塩酸 硫酸 硝酸 臭化水素酸 亜硫酸水素ナトリウム等 有機酸類 例えば 蟻酸 酢酸 トリフルオロ酢酸 プロピオン酸 メタノルスルホン酸 ヘンゼンスルホン酸 p-トルエンスルホン酸等 有機アミノ塩酸塩 例えば ピリノン塩酸塩 トリエチルアミノ塩酸塩等 アミノスルホン酸塩 例えば ピリノンp-トルエンスルホン酸塩 トリエチルアミノp-トル

エンスルホノ酸塩等を挙げることができる

【0103】

製法(d)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般には約20～約180℃ 好ましくは約60～約120℃の間の温度が適当である また 該反応は常圧下で行つことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧下で操作することもできる

【0104】

製法(d)を実施するにあたっては 例えば 希釈剤例えばヘンゼン中で 式(Ia)の化合物1モルに対し 2モル～4モル量の式(VI)の化合物を 触媒量のp-トルエンスルホノ酸存在下で反応させることによって式(I)の目的化合物を得ることができ

【0105】

上記製法(e)の反応は適当な希釈剤中で実施することができ その際に使用される希釈剤の例としては 水 脂肪族 脂環族および芳香族炭化水素類(場合によっては塩素化されてもよい) 例えば ヘンタン ヘキサン ノクロヘキサン 石油エーテル リグロイン ヘンゼン トルエン キノレン ジクロロメタン クロロホルム 四塩化炭素 1,2-ジクロロエタン クロルヘンゼン ジクロロヘンゼン等 エーテル類 例えば エチルエーテル メチルエチルエーテル イノプロピルエーテル ブチルエーテル ジオキサン ジメトキノエタン(DME) テトラヒドロフラン(THF) ノエチレングリコールジメチルエーテル(DGM)等 ケトン類 例えば アセトン メチルエチルケトン(MEK) メチル-イノプロピルケトン メチルイノブチルケトン(MIBK)等 ニトリル類 例えば アセトニトリル プロピオニトリル アクリロニトリル等 アルコール類 例えば メタノール エタノール イノプロパノール ブタノール エチレングリコール等 エステル類 例えば 酢酸エチル 酢酸アミル等 酸アミト類 例えば ジメチルホルムアミト(DMF) ジメチルアセトアミト(DMA) N-メチルピロリトン 1,3-ジメチル-2-イミダゾリノンノン ヘキサメチルフォスフォリノクトリアミト(HMPA)等 スルホノ スルホキント類 例えば ノメチルスルホキント(DMSO) スルホラノ等 塩基 例えば ピリジン等をあげることができる

287
105

【0106】

製法(e)は触媒の存在下で行うことができ その際に使用しうる触媒の例としては 10%パラジウム-炭素等を挙げることができる

【0107】

製法(e)は実質的に広い温度範囲内において実施することができるが 一般には約0~約120℃ 好ましくは約25~約80℃の間の温度が適当である
また 該反応は常圧下で行うことが望ましいが 場合によっては加圧または減圧下で操作することもできる

【0108】

製法(e)を実施するにあたっては 例えば 希釈剤例えばメタノール中で式(VII)の化合物1モルに対し 1~2モル量の水素ガスを 触媒量の10%パラジウム-炭素存在下で反応させることによって式(I)の目的化合物を得ることができる

【0109】

本発明の式(I)の活性化合物は除草剤として使用することができる 本明細書において「雑草」は 広義に 望ましくない場所に生育するすべての植物を意味する 本発明の化合物は 使用濃度によって非選択性または選択性除草剤として作用する 本発明の式(I)の活性化合物は 例えば下記の雑草と栽培植物との間で使用することができる

【0110】

双子葉雑草の属 カラノ(Sinapis) マメグソバイナズナ(Lepidium) ヤエムグラ キヌタノウ(Galium) ハコヘ(Stellaria) アカザ アリタノウ(Chenopodium) イラクサ(Urtica) ハンゴンノウ ノボロギク キオン(Senecio) ヒユ ハゲイトウ(Amaranthus) スヘリヒユ マノバボタン(Portulaca) オナモミ(Xanthium) アサガオ(Ipomoea) ミチヤナギ(Polygonum) ブタクサ(Ambrosia) ノアザミ フジョアザミ(Cirsium) ノゲン(Sonchus) ナス ノヤガイモ イヌホオズキ(Solanum) イヌガラシ(Rorippa) オトリコノウ(Lamium) クワガタノウ イヌノフグリ(Veronica) チョウセンアサガオ(Datura) スミレ パンジー(Viola) チンマオトロ(Galeopsis) ケン(Papaver) ヤグルマギ

ク (Centaurea) ハキダメギク (Galinsoga) キカノグサ (Rotala) アゼナ (Lindernia) 等

【0111】

双子葉栽培植物の属 ワタ (Gossypium) ダイズ (Glycine) フダンノウ サ
トウダイコン (Beta) ニンジン (Daucus) インゲンマメ アオイマダ (Phaseo-
lus) エントウ (Pisum) ナス ジャガイモ (Solanum) アマ (Linum) サノマ
イモ アサガオ (Ipomoea) ノラマメ ナンテンハギ (Vicia) タバコ (Nicoti-
ana) トマト (Lycopersicon) ナンキンマメ (Arachis) アブラナ ハクサイ
カブラ キャベツ (Brassica) アキノノゲシ (Lactuca) キュウリ メロン
(Cucumis) カボチャ (Cucurbita) 等

【0112】

単子葉雑草の属 ヒエ (Echinochloa) エノコロ アワ (Setaria) キビ (Pa-
nicum) メヒンバ (Digitaria) アワガエリ チモシー (Phleum) イチゴノナ
ギ スズメノカタビラ (Poa) ウノノケグサ トボノガラ (Festuca) オヒンバ
ノコクビエ (Eleusine) トクムギ (Lolium) キノネガヤ イヌムギ (Bromus)
) カラスムギ オートムギ (エノバク) (Avena) カヤノリグサ パピルス ノ
チトウイ ハマスゲ (Cyperus) モロコシ (Sorghum) カモノグサ (Agropyron)
コナギ (Monochoria) テンノキ (Fimbristylis) オモダカ クワイ (Sagitta-
ria) ハリイ クログワイ (Eleocharis) ホタルイ ウキヤグラ フトイ (Sci-
rpus) スズメノヒエ (Paspalum) カモノハシ (Ischaemum) ヌカボ (Agrostis)
) スズメノテノボウ (Alopecurus) ギョウギンバ (Cynodon) 等

【0113】

単子葉栽培植物の属 イネ (Oryza) トウモロコシ ホノブコーン (Zea) コ
ムギ (Triticum) オオムギ (Hordeum) カラスムギ オートムギ (エノバク) (Av-
ena) ライムギ (Secale) モロコシ (Sorghum) キビ (Panicum) サトウキビ
ワセオバナ (Saccharum) パイナップル (Ananas) アスパラガス (Asparagus)
) ネギ ニラ (Allium) 等

【0114】

本発明の化合物の使用は 上記の植物に限定されることなく 他の植物に対

289
187

しても同様に適用され得る また 使用濃度によって 本発明の活性化合物は 雑草を非選択的に防除することができ 例えば 工場等の産業用地 鉄道軌道 道路 植林地 非植林地等において使用することができる

【0115】

更に 本発明の活性化合物は 多年性植物栽培において 雑草防除のために使用することができる 例えば 植林 観賞用植林 果樹園 ブドウ園 カンキノ果樹園 ナノノ果樹園 バナナ栽培場 コーヒー栽培場 茶栽培場 ゴム栽培場 ギネアアブラヤシ栽培場 ココア栽培場 小果樹園 ホノブ栽培地等に適用することができる また 一年性植物栽培において 選択的雑草防除のためにも適用することができる

【0116】

本発明の式(I)の活性化合物は使用に際して通常の製剤形態にすることができる 所てかかる形態としては 例えば 液剤(乳剤等) 水和剤 エマルジョン 懸濁剤 粉剤 水和顆粒剤 錠剤 粒剤 懸濁エマルジョン濃厚物 重合体物質中のマイクロカプセル ノンボ剤等を挙げることができる

【0117】

これらの製剤は それ自体既知の方法で製造することができる 例えば 活性化合物を 展開剤 即ち 液体及び/又は固体の希釈剤又は担体 場合によっては界面活性剤 即ち 乳化剤及び/又は分散剤及び/又は泡沫形成剤を用いて混合することによって調製することができる

【0118】

液体の希釈剤又は担体としては 例えば 芳香族炭化水素類(例えば キノレン トルエン アルキルナフタレン等) クロル化芳香族又はクロル化脂肪族炭化水素類(例えば クロロベンゼン類 塩化エチレン類 塩化メチレン等) 脂肪族炭化水素類[例えば ノクロヘキサノ等 パラフィン類(例えば 鉱油留分等)] アルコール類(例えば ブタノール グリコール等)並びにそれらのエーテル エステル等 ケトン類(例えば アセトン メチルエチルケトン メチルイノブチルケトン又はノクロヘキサノ等) 強極性溶媒(例えば ジメチルホルムアミト ジメチルスルホキント等) 水等を挙げることができる 展開剤と

して水を用いる場合には 例えば 有機溶媒を補助溶媒として使用することができる

【0119】

固体の希釈剤又は担体としては 例えば 粉碎天然鉱物（例えば カオリノクレー タルク チョーク 石英 アタパルガイト モノモリロナイト又は珪藻土等） 粉碎合成鉱物（例えば 高分散ケイ酸 アルミナ ケイ酸塩等）などを挙げることができる 粒剤のための固体担体としては 粉碎且つ分別された岩石（例えば 方解石 大理石 軽石 海泡石 白雲石等） 無機及び有機物粉の合成粒 そして有機物質（例えば おがくず ココヤシの実のから とつもろこしの穂軸そしてタバコの茎等）の細粒体などを挙げることができる

【0120】

乳化剤及び／又は泡沫剤としては 非イオン及び陰イオン乳化剤〔例えば ポリオキソエチレン脂肪酸エステル ポリオキソエチレン脂肪酸アルコールエーテル（例えば アルキルアリールポリグリコールエーテル アルキルスルホン酸塩 アルキル硫酸塩 アリールスルホン酸塩等）〕 アルブミン加水分解生成物などを挙げることができる

【0121】

分散剤としては 例えば リグニンサルファイト廃液 メチルセルロースなどが包含される

【0122】

固着剤も製剤（粉剤 粒剤 ジャンボ剤 乳剤）に使用することができ 該固着剤としては 例えば カルボキソメチルセルロース 天然及び合成ポリマー（例えば アラビアゴム ポリビニルアルコールそしてポリビニルアセテート等）などを挙げることができる

【0123】

着色剤を使用することでもでき 該着色剤としては 無機顔料（例えば 酸化鉄 酸化チタンそしてブルノアンブルー） アリザリン染料 アノ染料又は金属フタロニアン染料のよつな有機染料 更に 鉄 マンガン ボロ 銅 コバルト モリブデン 亜鉛等の金属の塩のような微量元素を挙げることができる

【0124】

該製剤は 一般には 前記活性成分を0.1～95重量% 好ましくは0.5～90重量%の範囲内で含有することができる

【0125】

本発明の式(I)の活性化合物は それ自体で又はそれらの製剤形態で 雑草防除のために使用することができ また 公知の除草剤との混合剤としても使用することができる そのような混合剤は予め最終的な製剤形態に調製されていてもよく 或いは使用に際してタンクミックスすることもある 混合剤としての可能な組み合わせとしては 例えば スルホニルウレア系の水田用除草剤を例示することができる

【0126】

また 本発明の式(I)の活性化合物は 薬害軽減剤との混合も可能であり この混合により 選択性除草剤としての適用をより広げることができる そのための薬害軽減剤としては 例えば 1-(α - α -ジメチルヘノゾル)-3-p-トリルウレアを例示することができる

【0127】

驚くべきことに 本発明の化合物のいくつかの混合剤はまた相乗効果を現わす

【0128】

本発明の式(I)の活性化合物を使用する場合 そのまま直接使用するか あるいは前記製剤の形態で使用するか 又は更に希釈して調製された使用形態で施用することができ 例えば 液剤散布(watering) 噴霧(spraying atomising) 散粉又は散粒等の方法で施用することができる

【0129】

本発明の式(I)の活性化合物は 植物の発芽前及び発芽後のいずれの段階においても施用することができる また それらは播種前に土壌中に取り込ませることもできる

【0130】

本発明の活性化合物の施用量は 厳密に制限されるものではなく 望むべき効

【0136】

乾燥メタノール 12 ml にナトリウム (0.31 g) を加え 5 分間攪拌した後
 上記の 2-ヘンゾルノクロヘンチルピグアニト塩酸塩 (2 g) を加え室温で 3
 0 分間攪拌した。次に α -フルオロ- α -メチルプロピオン酸メチル (1.6
 2 g) を加え室温で 10 時間攪拌した後、水 50 ml を加え酢酸エチルエステ
 ルで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後酢酸エチルを減圧下留去し、残
 渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/1
) に付し、2-アミノ-4-(2-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フル
 オロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾノ (1.65 g) を得た。

【0137】

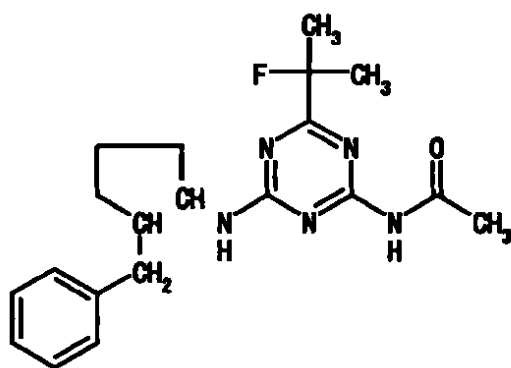
mp 50~55℃

【0138】

合成例 2

【0139】

【化 21】



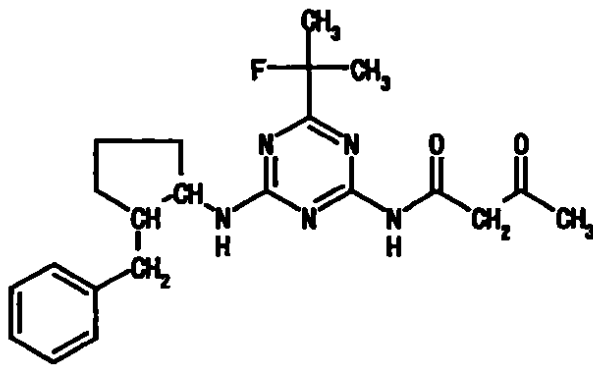
【0140】

乾燥メタノール (5 ml) にナトリウム (0.1 g) を加え 5 分間攪拌した後
 2-アミノ-4-(2-ヘンゾルノクロヘンチルアミノ)-6-(α -フル
 オロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾノ (1 g) を加え 50℃ で 1 時間攪
 拌した。冷後、減圧下でメタノールを留去後、酢酸エチル (10 ml) を加え 5
 0℃ で 1 時間攪拌した。冷後、水 (30 ml) を加え酢酸エチルで抽出。無水硫
 酸ナトリウムで乾燥後、酢酸エチルを減圧下留去した。残渣をシリカゲルカラム

$$n^D_{20} \quad 1 \quad 5 \quad 5 \quad 1 \quad 2$$

合成例 3

【化 2 2】



2-アミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾノ(0.5g)及びアセチルメルトラム酸(0.28g)をヘンゼン(20ml)に溶解し、1時間加熱還流した。冷後、減圧下溶媒を留去し、残渣をノリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサノ-酢酸エチル=3:2)に付し、2-アセトアセチルアミノ-4-(2-ヘンゾルンクロヘンチルアミノ)-6-(α -フルオロイノプロピル)-1,3,5-トリアゾノ(0.55g)を得た。

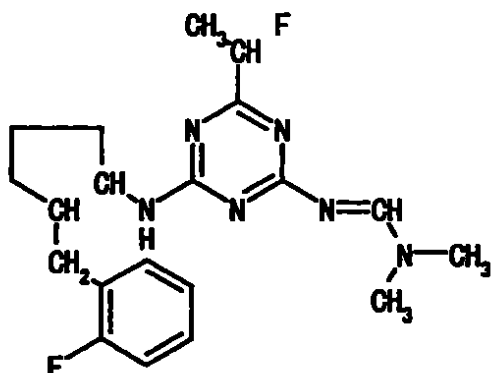
$$n^D_{20} \quad 1 \quad 5 \quad 4 \quad 3 \quad 3$$

合成例 4

出証特 2000-3026536

295
293

【化 23】



【0147】

2-アミノ-4-(2-(2-フルオロフェノール)シクロヘンチルアミノ)-6-(1-フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾノ(0.3g) N-N-ジメチルホルムアミトジメチルアセタール(0.32g) および触媒量の p-トルエンスルホン酸一水和物をヘンゼン(20ml)に溶解し 1.5時間加熱還流した 冷後 減圧下溶媒を留去後 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒 シクロロメタン/メタノール=90/5)に付し 2-N-N-ジメチルメチレノイミノ-4-(2-(2-フルオロフェノール)シクロヘンチルアミノ)-6-(1-フルオロエチル)-1,3,5-トリアゾノ(0.34g)を得た n_{20}^D 1.5776

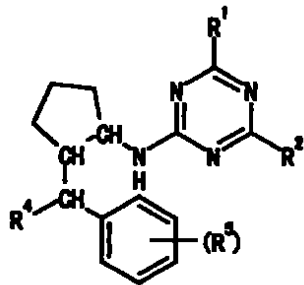
【0148】

上記合成例1~4と同様にして得られる化合物を 合成例1~4で合成した化合物と共に 下記第1表に示す

【0149】

【表 1】

第 1 表



化合物					
番号	R¹	R²	R³	(R⁴)	mp or n _D ²⁰
1	CH ₃	NH ₂	H	H	
2	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
3	C ₃ H _{7-n}	NH ₂	H	H	
4	C ₃ H _{7-iso}	NH ₂	H	H	
5	C ₄ H _{9-n}	NH ₂	H	H	
6	C ₄ H _{9-sec}	NH ₂	H	H	
7	C ₄ H _{9-iso}	NH ₂	H	H	
8	C ₄ H _{9-tert}	NH ₂	H	H	
9	C ₈ H _{11-n}	NH ₂	H	H	
10		NH ₂	H	H	
11		NH ₂	H	H	
12		NH ₂	H	H	
13		NH ₂	H	H	
14		NH ₂	H	H	
15	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
16	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
17	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
18	CHFCl	NH ₂	H	H	
19	CHFBBr	NH ₂	H	H	
20	CFCl ₂	NH ₂	H	H	

【 0 1 5 0 】

297
25

【表 2】

第 1 表 (続々)

化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³) _n	mp or n _D ²⁰
21	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
22	CHF ₃	NH ₂	H	H	
23	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
24	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
25	CF ₃	NH ₂	H	H	
26	CCl ₃	NH ₂	H	H	
27	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	1 5557
28	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-F	1 5525
29	CH ₃ CHF	N=CHN(CH) ₂	H	2-F	1 5776
30	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	1 5485
31	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
32	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	1 5420
33	CH ₃ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
34	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
35	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
36	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	50~55 C
37	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	1 5469
38	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	1 5239
39	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
40	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-Cl	
41	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Cl	
42	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
43	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Br	
44	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Br	
45	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CH ₃	
46	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	1 5359
47	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
48	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-C ₂ H ₅	
49	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₂ H ₅	
50	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₂ H _{5-n}	

【 0 1 5 1 】

296 298

【表 3】

第 1 表 (続き)

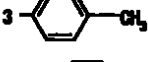
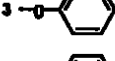
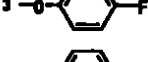
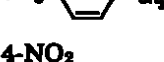
化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³)	mp or n _D ²⁰
51	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₃ H ₇ -180	
52	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₄ H ₉ -tert	
53	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CF ₃	
54	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CF ₃	
55	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CF ₃	
56	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
57	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
58	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
59	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OC ₂ H ₅	
60	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₂ H ₅	
61	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₃ H ₇ -180	
62	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCF ₃	
63	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCF ₃	
64	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCHF ₂	
65	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₂ CF ₃	
66	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
67	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₃	
68	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SC ₂ H ₅	
69	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 S(O)CH ₃	
70	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 S(O)CH ₃	
71	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SO ₂ CH ₃	
72	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SO ₂ CH ₃	
73	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCF ₃	
74	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCF ₃	
75	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₂ CF ₃	

【 0 1 5 2 】

297 299

【表 4】

第 1 表 (続 き)

化合物		R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
76	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
77	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
78	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
79	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
80	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
81	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
82	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
83	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H		
84	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-NO ₂	
85	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CN	
86	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-F ₂	
87	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-F ₂	
88	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
89	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-Cl ₂	
90	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-Cl ₂	
91	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-Cl ₂	
92	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-(CH ₃) ₂	
93	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-(CH ₃) ₂	
94	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
95	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CF ₃) ₂	
96	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-(OCH ₃) ₂	
97	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,3,4-Cl ₃	
98	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4,6-(CH ₃) ₃	
99	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
100	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	1 5512

【 0 1 5 3 】

298 300

【表 5】

第 1 表 (続き)

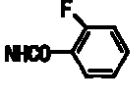
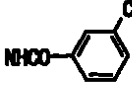
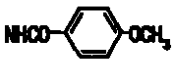
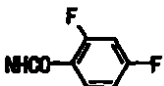
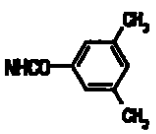
化合物		R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
101	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
102	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H _{7-n}	H	H	
103	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H _{7 iso}	H	H	
104	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H _{9-tert}	H	H	
105	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
106	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
107	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
108	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
109	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
110	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
111	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
112	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
113	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
114	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
115	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

【 0 1 5 4 】

299 301

【表 6】

第 1 表 (続 き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
116	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
117	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
118	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
119	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
120	(CH ₃) ₂ CF		H	H	
121	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	1 5433
122	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
123	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
124	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
125	ClCH ₂ ClCH ₂	NH ₂	H	H	
126	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
127	CHF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
128	CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
129	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
130	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	

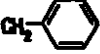
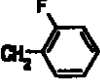
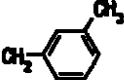
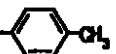
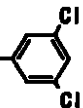
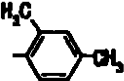
【 0 1 5 5 】

302

300

【表 7】

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
131	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
132		NH ₂	H	H	
133		NH ₂	H	H	
134		NH ₂	H	H	
135		NH ₂	H	H	
136		NH ₂	H	H	
137		NH ₂	H	H	
138		NH ₂	H	H	
139		NH ₂	H	H	
140		NH ₂	H	H	
141	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
142	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-F	
143	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
144	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
145	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	
146	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
147	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3-F	
148	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
149	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
150	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	

【 0 1 5 6 】

301

203

【表 8】

第 1 表 (続 き)

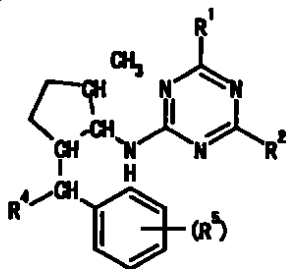
化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
151	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
152	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3-F	
153	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
154	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
155	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
156	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
157	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
158	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
159	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
160	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
161	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
162	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
163	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
164	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
165	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇	n H	
166	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇	n H	
167	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇	n H	

【 0 1 5 7 】

302 304

【表 9】

第 1 表 (続き)



化合物					
番号	R¹	R²	R⁴	(R⁵)	mp or n _D ²⁰
168	CF ₃	NH ₂	H	H	
169	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
170	CF ₃	NH ₂	H	3-F	
171	CF ₃	NH ₂	H	4-F	
172	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
173	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
174	CF ₃	NH ₂	H	4-Cl	
175	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
176	CF ₃	NH ₂	H	3-CF ₃	
177	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
178	CF ₃	NH ₂	H	3-CH ₃	
179	CF ₃	NH ₂	H	4-CH ₃	
180	CF ₃	NH ₂	H	2-OCH ₃	
181	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
182	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
183	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
184	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
185	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
186	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
187	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
188	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
189	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
190	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-Cl	

【 0 1 5 8 】

303 305

【表 1 0】

第 1 表 (続き)

化合物		R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
191	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
192	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CF ₃	
193	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
194	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
195	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-CH ₃	
196	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
197	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
198	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
199	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
200	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
201	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
202	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
203	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-F	
204	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
205	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
206	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
207	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Cl	
208	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
209	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Br	
210	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
211	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
212	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
213	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
214	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
215	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCH ₃	

【 0 1 5 9 】

304 306

【表 1 1】

第 1 表 (続き)

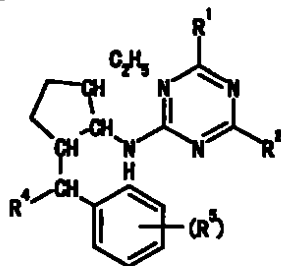
化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
216	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
217	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
218	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
219	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
220	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
221	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-F	
222	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
223	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3-F	
224	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
225	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3-F	
226	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
227	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
228	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
229	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₇	n-H	
230	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₇	n-H	
231	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₇	n-H	

【 0 1 6 0 】

305 307

【表 1 2】

第 1 表 (続 き)



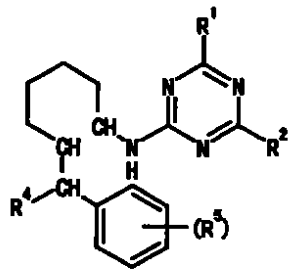
化合物 番号	R¹	R²	R⁴	(R⁵) _n	mp or n _D ²⁰
232	CF ₃	NH ₂	H	H	
233	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
234	CF ₃	NH ₂	H	3-CH ₃	
235	CF ₃	NH ₂	H	3,5 F ₂	
236	CF ₃	NH ₂	H	3,5 (CH ₃) ₂	
237	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
238	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	
239	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	
240	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5 F ₂	
241	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5 (CH ₃) ₂	
242	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
243	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
244	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
245	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5 F ₂	
246	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5 (CH ₃) ₂	
247	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
248	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
249	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
250	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
251	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
252	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

【 0 1 6 1 】

306 308

【表 1 3】

第 1 表 (続き)



化合物 番号	R¹	R²	R⁴	(R⁵)	mp or n _D ²⁰
253	CH ₃	NH ₂	H	H	
254	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
255	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
256	C ₃ H ₇ iso	NH ₂	H	H	
257	C ₄ H ₉ -n	NH ₂	H	H	
258	C ₄ H ₉ -sec	NH ₂	H	H	
259	C ₄ H ₉ -iso	NH ₂	H	H	
260	C ₄ H ₉ tert	NH ₂	H	H	
261	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
262		NH ₂	H	H	
263		NH ₂	H	H	
264		NH ₂	H	H	
265		NH ₂	H	H	
266		NH ₂	H	H	
267	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
268	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
269	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
270	CHFCl	NH ₂	H	H	

【 0 1 6 2 】

307 309

【表 1 4】

第 1 表 (続き)

化合物		R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
271	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
272	CFCl ₂	NH ₂	H	H	
273	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
274	CHF ₂	NH ₂	H	H	
275	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
276	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
277	CF ₃	NH ₂	H	H	
278	CCl ₃	NH ₂	H	H	
279	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
280	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
281	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	60~66°C
282	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
283	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	
284	CH ₂ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
285	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
286	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
287	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	1 5332
288	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
289	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	72~80°C
290	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-F	
291	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
292	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Cl	
293	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
294	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-Br	
295	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Br	
296	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CH ₃	
297	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
298	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
299	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 C ₂ H ₅	
300	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₂ H ₅	

【 0 1 6 3 】

308 316

【表 1 5】

第 1 表 (続き)

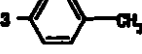
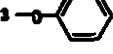
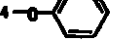
化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
301	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₃ H ₇ n	
302	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ 180	
303	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-C ₄ H ₉ -tert	
304	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
305	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
306	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CF ₃	
307	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
308	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
309	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
310	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OC ₂ H ₅	
311	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₂ H ₅	
312	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OC ₃ H ₇ 180	
313	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCF ₃	
314	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCF ₃	
315	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCHF ₂	
316	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₂ CF ₃	
317	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
318	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₃	
319	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SC ₂ H ₅	
320	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 S(O)CH ₃	
321	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-S(O)CH ₃	
322	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SO ₂ CH ₃	
323	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SO ₂ CH ₃	
324	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCF ₃	
325	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCF ₃	

【 0 1 6 4 】

309 21

【表 1 6】

第 1 表 (続 き)

化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³)	mp or n _D ²⁰
326	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SCH ₂ CF ₃	
327	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
328	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4- 	
329	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
330	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
331	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
332	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
333	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-NO ₂	
334	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CN	
335	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-F ₂	
336	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-F ₂	
337	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
338	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-Cl ₂	
339	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-Cl ₂	
340	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-Cl ₂	
341	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2,4-(CH ₃) ₂	
342	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-(CH ₃) ₂	
343	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
344	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CF ₃) ₂	
345	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,4-(OCH ₃) ₂	

【 0 1 6 5 】

3/2

3/10

【表 1 7】

第 1 表 (続き)

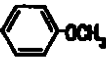
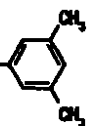
化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
346	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 3 4 Cl ₃	
347	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 6-(CH ₃) ₃	
348	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
349	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	
350	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
351	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H _{7-n}	H	H	
352	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H _{7 iso}	H	H	
353	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H _{9 tert}	H	H	
354	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
355	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
356	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
357	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
358	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
359	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
360	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
361	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
362	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
363	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
364	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
365	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

【 0 1 6 6 】

311 313

【表 1 8】

第 1 表 (続き)

化合物		R ³	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
366	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
367	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
368	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
369	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	
370	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
371	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
372	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
373	CH ₂ ClCH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
374	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
375	CHFCH ₂ F	NH ₂	H	H	
376	CF ₂ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
377	CF ₂ CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
378	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	
379	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
380	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-F	
381	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
382	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3,5-F ₂	
383	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂	
384	CH ₂ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
385	CH ₂ CHF	NH ₂	CH ₃	3-F	

【 0 1 6 7 】

3/2 34

【表 1 9】

第 1 表 (続き)

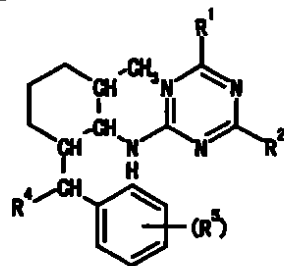
化合物		R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
番号	R ¹				
386	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
387	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
388	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
389	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
390	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
391	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3-CH ₃	
392	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
393	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
394	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
395	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
396	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
397	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
398	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-F	
399	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3-CH ₃	
400	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
401	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
402	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
403	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇	n H	
404	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇	n H	
405	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇	-n H	

【 0 1 6 8 】

3/3 3/8

【表 2 0】

第 1 表 (続 き)



化合物					
番号	R¹	R²	R⁴	(R⁵)	mp or n _D ²⁰
406	CF ₃	NH ₂	H	H	
407	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
408	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
409	CF ₃	NH ₂	H	4-F	
410	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
411	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
412	CF ₃	NH ₂	H	4-Cl	
413	CF ₃	NH ₂	H	3-Br	
414	CF ₃	NH ₂	H	3 CF ₃	
415	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
416	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
417	CF ₃	NH ₂	H	4 CH ₃	
418	CF ₃	NH ₂	H	2-OCH ₃	
419	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
420	CF ₃	NH ₂	H	4-OCH ₃	
421	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
422	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
423	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
424	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	
425	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-F	
426	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
427	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
428	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-Cl	
429	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
430	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	

【 0 1 6 9】

【表 2 1】

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
431	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
432	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	
433	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-CH ₃	
434	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
435	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
436	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
437	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
438	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5-F ₂	
439	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
440	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
441	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
442	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	
443	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
444	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
445	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
446	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
447	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
448	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
449	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
450	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
451	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
452	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
453	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
454	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
455	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-SCH ₃	
456	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5-F ₂	
457	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
458	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
459	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
460	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
461	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
462	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
463	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

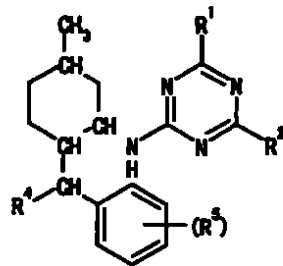
【 0 1 7 0 】

37

35

【表 2 2】

第 1 表 (続き)



化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
464	CF ₃	NH ₂	H	H	
465	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
466	CF ₃	NH ₂	H	3-F	
467	CF ₃	NH ₂	H	4-F	
468	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
469	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
470	CF ₃	NH ₂	H	4-Cl	
471	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
472	CF ₃	NH ₂	H	3 CF ₃	
473	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
474	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
475	CF ₃	NH ₂	H	4-CH ₃	
476	CF ₃	NH ₂	H	2-OCH ₃	
477	CF ₃	NH ₂	H	3-OCH ₃	
478	CF ₃	NH ₂	H	4-OCH ₃	
479	CF ₃	NH ₂	H	3-SCH ₃	
480	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
481	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
482	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
483	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
484	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
485	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
486	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-Cl	
487	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-Br	
488	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	
489	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
490	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	

【 0 1 7 1 】

316 375

【表 2 3】

第 1 表 (続 き)

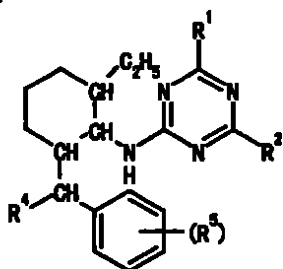
化合物					
番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n _D ²⁰
491	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-CH ₃	
492	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
493	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
494	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
495	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
496	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
497	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
498	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
499	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
500	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
501	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
502	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-Cl	
503	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
504	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-Cl	
505	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
506	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
507	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
508	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
509	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CH ₃	
510	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-OCH ₃	
511	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-OCH ₃	
512	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-OCH ₃	
513	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
514	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5-F ₂	
515	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5-(CH ₃) ₂	
516	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
517	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
518	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
519	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
520	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
521	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

【 0 1 7 2 】

317 219

【表 24】

第 1 表 (続き)



化合物					
番号	R¹	R²	R⁴	(R⁵)	mp or n _D ²⁰
522	CF ₃	NH ₂	H	H	
523	CF ₃	NH ₂	H	3-F	
524	CF ₃	NH ₂	H	3-CH ₃	
525	CF ₃	NH ₂	H	3,5-F ₂	
526	CF ₃	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
527	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
528	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-F	
529	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3-CH ₃	
530	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
531	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
532	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
533	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-F	
534	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-CH ₃	
535	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-F ₂	
536	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3,5-(CH ₃) ₂	
537	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
538	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
539	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
540	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
541	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
542	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

【0173】

前記製法 (b) において 式 (IV) の化合物のかわりに ヨウ化メチル ヨウ化エチル又はヨウ化プロピルを用いて反応を行なうことにより得られる化合物

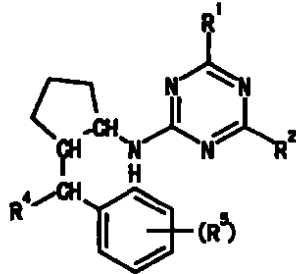
318 320

を 下記第 2 表及び第 3 表に示す

【0174】

【表 2 5】

第 2 表

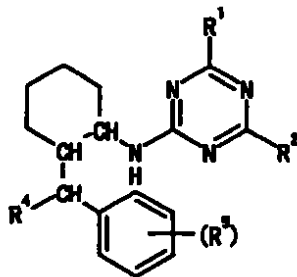


化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	mp or n ₂₀
543	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
544	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
545	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H ₇ n	H	H	

【0175】

【表 2 6】

第 3 表



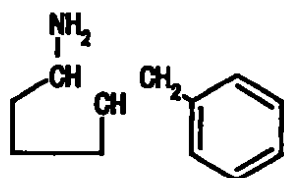
化合物 番号	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	mp or n ₂₀
546	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
547	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
548	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H ₇ n	H	H	

【0176】

合成例 5

【0177】

【化24】



【0178】

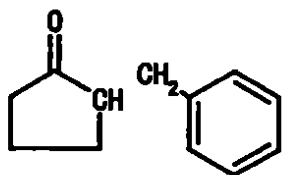
2-ヘンゾルンクロヘンタノン (11.51 g) とホルムアミト (44.41 ml) との混合物を 140～150℃ に加熱し、この温度を保ちながら蟻酸 (9.13 g) をゆっくり滴下した。滴下終了後、150℃ でさらに 2 時間加熱した。冷後、水を加え塩化メチレンで抽出した後、塩化メチレン層を水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。塩化メチレンを減圧下留去後残さに濃塩酸 (36.85 ml) を加え、2 時間加熱還流した。冷後、水を加え水酸化ナトリウムでアルカリ性にした後、塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水で洗浄し、無水炭酸カリウムで乾燥させた後、減圧下塩化メチレンを留去し、残さを蒸留にて精製し、2-ヘンゾルンクロヘンチルアミン (5.18 g) を得た。 $n_D^{20} = 1.5371$

【0179】

合成例 6

【0180】

【化25】



【0181】

2-ヘンゾル-2-エトキンカルボニルンクロヘンタノン (23.17 g) に 48% 臭化水素酸 (50 ml) を加え、120℃ で 4 時間加熱還流した。冷後、水 (100 g) を加えジエチルエーテルで抽出した。ジエチルエーテル層を水

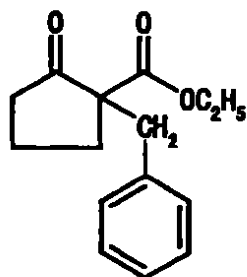
飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 飽和食塩水で洗浄後 無水硫酸ナトリウムで乾燥した ノエチルエーテルを減圧下留去後残さを蒸留にて精製し 2-ヘノールノクロヘンタノン (11 51 g) を得た $n_{20}^D = 1.5288$

【0182】

合成例 7

【0183】

【化 26】



【0184】

2-エトキノカルボニルノクロヘンタノン (13 37 g) の塩化メチレン (143 ml) 溶液にテトラブチルアンモニウム ハイトロゲノスルフェイト (29 1 g) ヘノールヨードait (37 37 g) を加え ついて水酸化ナトリウム (6 86 g) の水 (143 ml) 溶液を加えた 混合物を室温下4時間攪拌した後 塩化メチレン層を分取し 水層を塩化メチレン (200 ml 3回) で抽出した 塩化メチレン層を合わせ 水 飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 飽和食塩水で洗浄し 無水硫酸ナトリウムで乾燥した 塩化メチレンを減圧下留去後残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒 ヘキサン 酢酸エチル=9 1) に付し 2-ヘノール-2-エトキノカルボニルノクロヘンタノン (16 8 g) を得た $n_{20}^D = 1.5156$

【0185】

[生物試験例]

試験例 1 水田雑草に対する除草効果試験

活性化合物の調合剤の調製

担 体 アセトン 5 重量部

乳化剤 ヘノールオキノポリグリコールエーテル 1 重量部

活性物質の調合剤は 1 重量部の活性化合物と 上記の分量の担体および乳化剤とを混合することにより 乳剤として得られる その調合剤の所定薬量を水で希釈して試験に用いる

試験方法

温室内において 水田土壌を詰めた 500cm^2 ポットに 2 5 葉期の (草丈 15cm) の水稻苗 (品種 日本晴) を 1 ポット当り 1 株 3 本植えた 次いで タイヌビエ タマガヤノリ ホタルイ コナギ 広葉雑草 (アゼナ キカノグサ ミノハコハ ヒメミノハギ アブノメ等) の各種子を播種し 約 $2\sim 3\text{cm}$ 灌水した

【0186】

水稻移植 5 日後 前記調製法に従って調製した各活性化合物の調合剤で水面処理した 処理後 3cm の灌水状態を保ち 散布 3 週間後に除草効果を調査した 除草効果の評価は 完全枯死を 100% とし 0% を除草効果なしとして行なった

【0187】

その結果 本発明の化合物 27 30 32 および 36 の化合物は いずれも薬量 0.25kg/ha で 水田雑草に対し十分な除草効果を示し 移植水稻に対し安全性を示した

【0188】

〔製剤例〕

製剤例 1 (粒剤)

本発明化合物 No. 36 (10 部) ヘントナイト (モノモリロナイト) (30 部) タルク (滑石) (58 部) 及びリグニンスルホン酸塩 (2 部) の混合物に 水 (25 部) を加え 良く捏化し 押し出し式造粒機により $10\sim 40\text{メシユ}$ の粒状とし $40\sim 50^\circ\text{C}$ で乾燥して粒剤とする

【0189】

製剤例 2 (粒剤)

$0.2\sim 2\text{mm}$ に粒度分布を有する粘土鉱物粒 (95 部) を回転混合機に入れ 回転下 液体希釈剤とともに本発明化合物 No. 27 (5 部) を噴霧し均等に

322 324

湿らせた後 40～50℃で乾燥し粒剤とする

【0190】

製剤例3（乳剤）

本発明化合物No 32（30部） キノレン（5部） ポリオキノエチレン
アルキルフェニルエーテル（8部）及びアルキルヘンゼンスルホン酸カルノウム
（7部）を混合攪拌して乳剤とする

【0191】

製剤例4（水和剤）

本発明化合物No 30（15部） ホワイトカーボン（含水無結晶酸化ケイ
素微粉末）と粉末クレーとの混合物（1 5）（80部） アルキルヘンゼンス
ルホン酸ナトリウム（2部）及びアルキルナフタレンスルホン酸ナトリウムホル
マリノ重合物（3部）を粉末混合し 水和剤とする

【0192】

製剤例5（水和顆粒）

本発明化合物No 36（20部） リグニンスルホン酸ナトリウム（30部
） ヘントナイト（15部）及び焼成ケイノウ土粉末（35部）を十分に混合し
水を加え 0 3 mmのスクリーンで押し出し乾燥して 水和顆粒とする

【0193】

【発明の効果】

本発明の新規1 3 5 ートリアゾノ類テトラノリノ誘導体は 上記生物
試験例に示したよつに 除草剤として優れた性質を有している

323 32

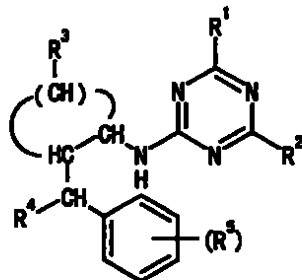
【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 除草剤の有効成分として優れた活性を示すトリアゾノ類を提供する

【解決手段】 式

【化 1】



式中

R¹はハロアルキル等を示し

R²はアミノ又はアルキルカルボニルアミノ等を示し

R³又はR⁴はそれぞれ独立に水素原子又はアルキルを示し

R⁵はハロゲン アルキル又はアルコキ等を示し

mは1～4の整数を示し

nは0～5の整数を示す

で表わされるトリアゾノ類

【選択図】 なし

認定 付加情報

特許出願の番号 特願2000-057578
受付番号 50000249187
書類名 特許願
担当官 第五担当上席 0094
作成日 平成12年 3月 7日

<認定情報 付加情報>

【特許出願人】
【識別番号】 000232564
【住所又は居所】 東京都港区高輪4丁目10番8号
【氏名又は名称】 日本バイエルアグロケム株式会社
【代理人】 申請人
【識別番号】 100060782
【住所又は居所】 東京都港区赤坂1-9-15 日本自転車会館内
【氏名又は名称】 小田島 平吉
【選任した代理人】
【識別番号】 100074217
【住所又は居所】 東京都港区赤坂1-9-15 日本自転車会館内
小田島特許事務所
【氏名又は名称】 江角 洋治
【選任した代理人】
【識別番号】 100103311
【住所又は居所】 東京都港区赤坂1丁目9番15号 日本自転車会館
【氏名又は名称】 小田嶋 平吾

322
325

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号	[000232564]
1 変更年月日	1993年 9月 8日
[変更理由]	住所変更
住 所	東京都港区高輪4丁目10番8号
氏 名	日本バイエルアグロケム株式会社

326-322

TRADUCCION Se traduce la caratula la descripcion y las reivindicaciones anexas a una copia de la solicitud de patente Japonesa No 2000 057578 escrita en Japones Para el invento denominado nuevas 1 3 5 TRIAZINAS

**OFICINA DE PATENTES
GOBIERNO JAPONES**

Certifico que el anexo es una fiel copia de la siguiente solicitud como fue presentada en esta Oficina

Fecha de la solicitud	02 de Marzo de 2000
Numero de solicitud	No 2000 057578
Solicitante	NIHON BAYER AGROCHEM K.K.
Fecha de certificacion	14 de Abril de 2000

Director General

Firmado Ilegible T MOCHIZUKI
Oficina de Patentes

Certificado No 200 3026536

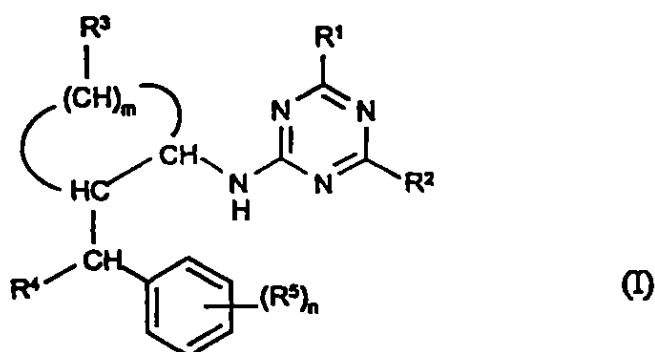
Cinta y Sello de Oblea

NUEVAS 1,3,5 TRIAZINAS

La presente invención se refiere a nuevas 1,3,5 triazinas a procedimientos para su preparación y a su uso como herbicidas

Ya se sabe que ciertos tipos de triazinas muestran acciones como herbicidas (cfr WO 97/31904 WO 97/08156 WO 97/29095 etc)

Se han encontrado ahora nuevas 1,3,5 triazinas de la fórmula (I)



en la que

R^1 representa alquilo de 1 a 5 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)

no)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^5 representa halógeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitró o ciano

m representa un número entero de 1-4 y

R^3 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un número entero de 2 o más

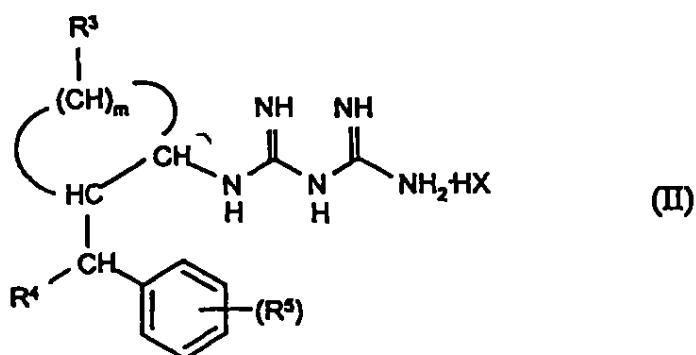
n representa un número entero de 0-5 y

R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, pueden obtenerse mediante un procedimiento en el que

a) en caso de que R^2 represente amino

compuestos de la fórmula (II)



en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

X representa halogeno preferiblemente cloro o bromo

se hacen reaccionar con compuestos de la formula (III)



en la que

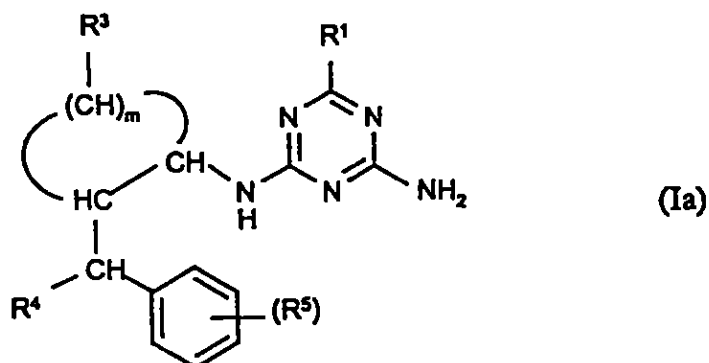
R^1 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente metilo o etilo

en presencia de disolventes inertes y si es apropiado en presencia de un agente que se une a los acidos o

- b) en caso de que R^2 represente formilamino (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 atomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 atomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halogeno

compuestos de la formula (Ia)



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente

se hacen reaccionar con compuestos de la formula (IV)



en la que

R^6 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente

R^7 representa un átomo de hidrogeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halogeno

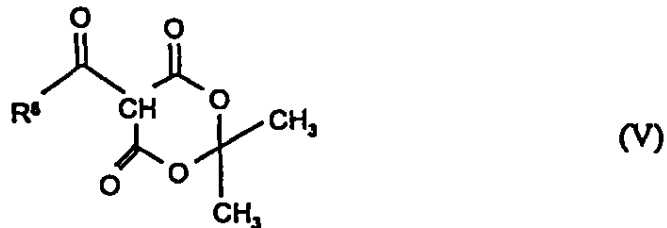
en presencia de disolventes inertes y si es apropiado en presencia de un agente que se une a los ácidos

o

c) en caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 átomos de carbono

no)carbonilacetilamino

los compuestos de la formula (Ia) se hacen reaccionar con compuestos de la formula (V)



en la que

R^8 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 atomos de carbono

en presencia de disolventes inertes

o

d) en caso de que R^2 represente di(alquilo de 1 a 4 atomos de carbono)(alquiliden de 1 a 4 atomos de carbono)amino

los compuestos de la formula (Ia)

se hacen reaccionar con compuestos de la formula (VI)



en la que

R^6 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente

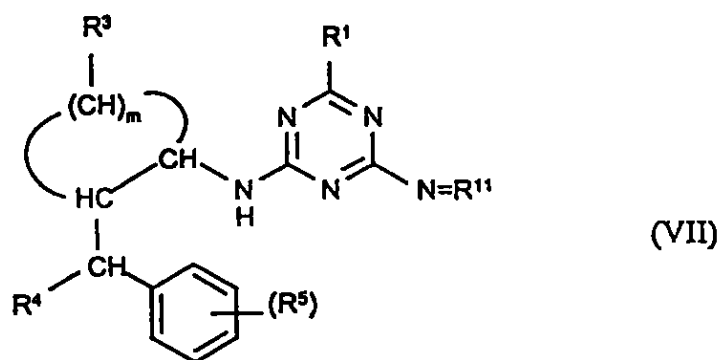
R^9 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 atomos de carbono y

R^{10} representa un atomo de hidrogeno o alquilo de 1 a 3 atomos de carbono preferiblemente un atomo de hidrogeno metilo o etilo

en presencia de disolventes inertes y si es apropiado en presencia de un catalizador
acido

o

e) en caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)amino
compuestos de la formula (VII)



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

R^{11} representa alquilideno de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente alquilideno de 1 a 3 atomos de carbono

se reducen en presencia de disolventes inertes y en presencia de catalizador

Las triazinas de la formula (I) de acuerdo con la presente invencion muestran acciones herbicidas mas fuertes en comparacion con los compuestos descritos en las literaturas de la tecnica anterior mencionadas previamente

En las formulas

Halogeno representa fluoro cloro bromo o yodo y preferiblemente representa fluoro cloro o bromo

Alquilo puede ser de cadena lineal o cadena ramificada y puede representar por ejemplo alquilo de 1 a 4 atomos de carbono y pueden mencionarse especifi

camente metilo etilo n o iso propilo n iso sec- o terc butilo etc

Como cicloalquilo pueden mencionarse por ejemplo ciclopropilo ciclo butilo ciclopentilo ciclohexilo etc

Haloalquilo es alquilo de cadena lineal o cadena ramificada sustituido con halogeno y pueden mencionarse por ejemplo alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con 1 9 fluoro cloro y/o bromo especificamente fluorometilo fluoroclorometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobromometilo trifluorometilo clorometilo diclorometilo triclorometilo bromometilo 1 fluoroetilo 2 fluoroetilo 2 2 2 trifluoroetilo 1 2 2 2 tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1 cloroetilo 1 2 dicloroetilo 1 bromoetilo perfluoropropilo 1 fluoro 1 metiletilo 1 cloro 1 metiletilo 1 bromo 1 metiletilo 1 (trifluorometil) 2 2 2 trifluoroetilo 2 cloro-1 1 2 trifluoroetilo 3 fluoropropilo 3 cloropropilo 2 2 3 3 3 pentafluoropropilo 1 2 2 3 3 3 hexafluoro propilo o perfluorobutilo etc

Alcoxí es alquil O del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo alcoxí de 1 a 4 atomos de carbono y pueden mencionarse especificamente metoxí etoxí n o iso propoxí n iso sec o terc-butoxí etc

Alquiltio es alquil S del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)tio y pueden mencionarse especificamente metiltio etiltio n o iso propiltio n iso sec o terc-butiltio etc

Alquilsulfinilo es alquil SO del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)sulfinilo y pueden mencionarse especificamente metilsulfinilo etilsulfinilo n o iso-propilsulfinilo n iso sec o terc butilsulfinilo etc

Alquilsulfonilo es alquil SO_2 del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo y pueden mencionarse específicamente metilsulfonilo etilsulfonilo n o iso propilsulfonilo n iso sec- o terc butilsulfonilo etc

Alquilamino es alquil NH del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino y pueden mencionarse específicamente metilamino etilamino n o iso propilamino n iso sec o terc butilamino etc

Alquilcarbonilamino es alquil CONH del que la parte de alquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo alquilcarbonilamino de 2 a 5 átomos de carbono en total, y pueden mencionarse específicamente metilcarbonilamino etilcarbonilamino n o iso propilcarbonilamino n iso sec- o terc-butilcarbonilamino etc

Cicloalquilcarbonilamino es cicloalquil CONH del que la parte de cicloalquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo cicloalquilcarbonilamino de 4 a 7 átomos de carbono en total y pueden mencionarse específicamente ciclopropilcarbonilamino o ciclobutilcarbonilamino ciclopentilcarbonilamino ciclohexilcarbonilamino etc

Haloalquilcarbonilamino es haloalquil CONH del que la parte de haloalquilo tiene el significado mencionado anteriormente y puede representar por ejemplo haloalquilcarbonilamino de 2 a 5 átomos de carbono en total y pueden mencionarse específicamente fluorometilcarbonilamino difluorometilcarbonilamino difluoroclorometilcarbonilamino difluorobromometilcarbonilamino trifluorometilcarbonilamino 1 fluoroetilcarbonilamino 2 fluorometilcarbonilamino 2 2 2 trifluoroetilcarbonilamino 1 2 2 2 tetrafluoroetilcarbonilamino perfluoroetilcarbonilamino perfluoropropilcarbonilamino perfluorobutilcarbonilamino etc

En 'bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo y bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo la parte de halogeno tiene el mismo significado que el halogeno mencionado anteriormente y la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente. Como ejemplos específicos de 'bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse bencilo 2 (3 y 4) fluorobencilo o 2 (3 y 4) clorobencilo 2 (3 y 4) metilbencilo 2 3 (2 4 2 5 2 6 3 4 3 5) difluorobencilo etc y como ejemplos específicos de 'bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse bencilcarbonilamino 2 3 o 4 fluorobencilcarbonilamino 2 3 o 4 clorobencilcarbonilamino 2 3 o 4 metilbencilcarbonilamino 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 difluorobencilcarbonilamino etc

En 'fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo la parte de halogeno tiene el mismo significado que el halogeno mencionado anteriormente y la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente. Como ejemplos específicos de 'fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo pueden mencionarse fenilo 2 3 o 4 fluorofenilo 2 3 o 4 clorofenilo 2 3 o 4 metilfenilo 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 difluorofenilo 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 diclorofenilo o 2 3 2 4 2 5 2 6 3 4 o 3 5 dimetilfenilo etc

En 'fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo sustituido con alcoxi o sustituido con halogeno la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente la parte de alcoxi tiene el mismo significado que el alcoxi mencionado anteriormente y la parte de halogeno tiene el mismo significado que el halogeno mencionado anteriormente

Como ejemplos específicos de 'fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo sustituido con alcoxi o sustituido con halogeno pueden mencionarse fenilcarbonilamino 2³ o 4 fluorofenilcarbonilamino 2³ o 4 clorofenilcarbonilamino 2³ o 4 metilfenilcarbonilamino 2³ o 4 metoxi fenilcarbonilamino 2³ 2⁴ 2⁵ 2⁶ 3⁴ o 3⁵ difluorofenilcarbonilamino 2³ 2⁴ 2⁵ 2⁶ 3⁴ o 3⁵ diclorofenilcarbonilamino 2³ 2⁴ 2⁵ 2⁶ 3⁴ o 3⁵ dimetilfenilcarbonilamino etc

En alquilcarbonilacetilamino la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente y como ejemplos específicos de alquil carbonilacetilamino pueden mencionarse acetoacetilamino propionilacetilamino butirilacetilamino isobutirilacetilamino valerilacetilamino isovalerilacetilamino pivaloilacetilamino etc

En "dialquilaminoalquilidenamino la parte de alquilo tiene el mismo significado que el alquilo mencionado anteriormente y la parte de alquilideno mencionada anteriormente puede ser de cadena lineal o cadena ramificada y puede representar por ejemplo alquilideno de 1 a 4 átomos de carbono Como ejemplos de dialquilaminoalquilidenamino pueden mencionarse dimetilaminometilidenamino 1 (dimetilamino)etilidenamino 1 (dimetilamino)(n propiliden)amino 1 (dimetilamino)(n butiliden)amino 1 (dimetilamino)(iso butiliden)amino dietilaminometilidenamino di(n propil)aminometilidenamino di(n butil)aminometilidenamino (N metil N etilamino)metilidenamino (N metil N (n propil)amino)metilidenamino etc

Como el grupo preferible de compuestos de la presente invención pueden mencionarse compuestos en los que en la fórmula (I)

R¹ representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de

1 a 3 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 5 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con cloro (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 3 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^5 representa fluor cloro bromo metilo etilo n propilo isopropilo terc butilo halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono) (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono nitró o ciano

m representa un número entero de 2 a 4 en donde R^3 pueden ser idénticos o diferentes

n representa un número entero de 0-4 y

R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

Y como el grupo mas preferible de compuestos pueden mencionarse compuestos en los que en la formula (I) mencionada anteriormente

R¹ representa metilo etilo n propilo isopropilo terc butilo ciclopropilo ciclo butilo fluorometilo fluoroclorometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobromometilo trifluorometilo clorometilo triclorometilo bromometilo 1 fluoroetilo 2 2 2 trifluoroetilo 1 2 2 2 tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1 cloroetilo 1 2 dicloroetilo 1 bromoetilo perfluoropropilo 1 fluoro 1 metiletilo 1 cloro 1 metiletilo 1 bromo 1 metiletilo 1 (trifluorometil) 2 2 2 trifluoroetilo bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con metilo

R² representa amino metilamino etilamino formilamino acetilamino etilcarbonilamino ciclopropilcarbonilamino fluorometilcarbonilamino trifluorometilcarbonilamino 1 fluoroetilcarbonilamino perfluoroetilcarbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con cloro o sustituido con metilo fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro sustituido con metilo o sustituido con metoxi acetoacetilamino o dimetilaminometilidenamino

R³ o R⁴ representan cada uno independientemente un atomo de hidrogeno metilo o etilo

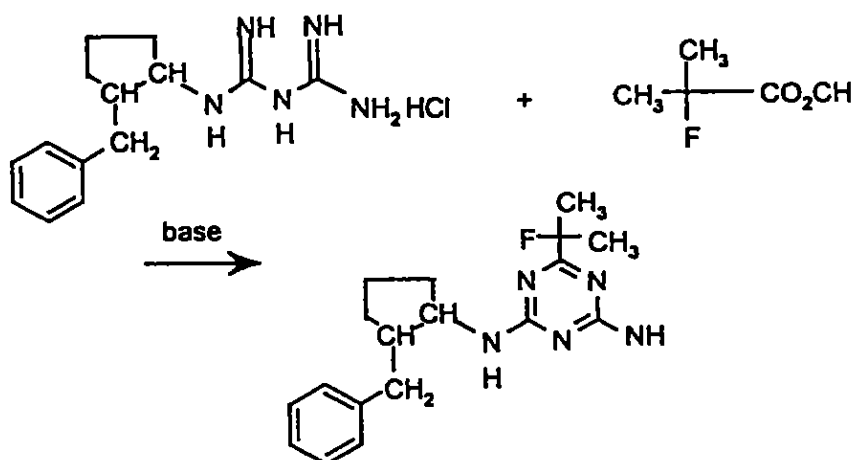
R⁵ representa fluoro cloro metilo etilo trifluorometilo metoxi etoxi trifluorometoxi metiltio trifluorometiltio metilsulfinilo metilsulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo nitro o ciano

m representa un numero entero de 3 o 4 en donde R^3 pueden ser identicos o diferentes

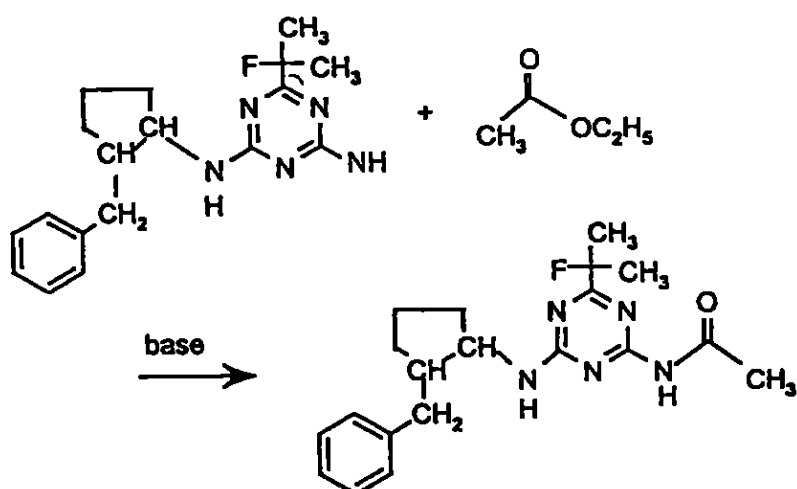
n representa un numero entero de 0-3 y

R^5 pueden ser identicos o diferentes en caso de que n represente un numero entero de 2 ó 3

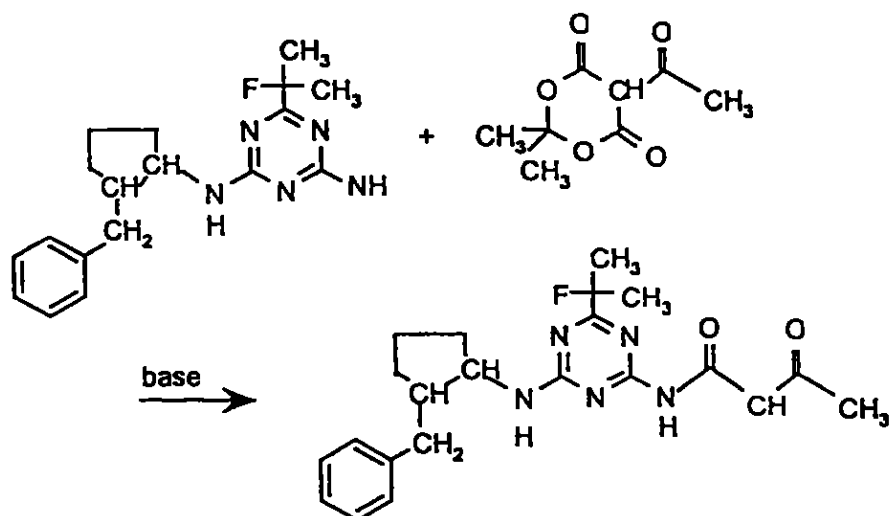
El procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocioruro de 2 bencilciclopentilbiguanida y α fluoro- α metilpropionato de metilo como los materiales de partida, puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



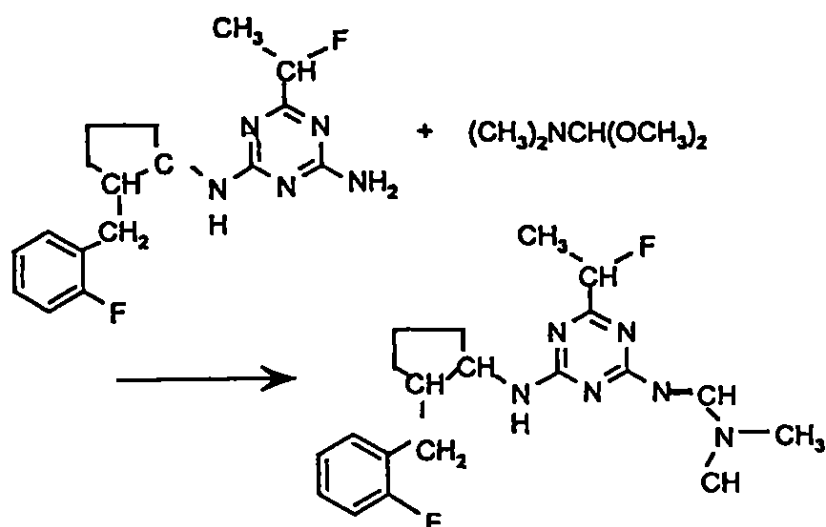
El procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen 2 amino 4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoro isopropil) 1 3 5 triazina y acetato de etilo como los materiales de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



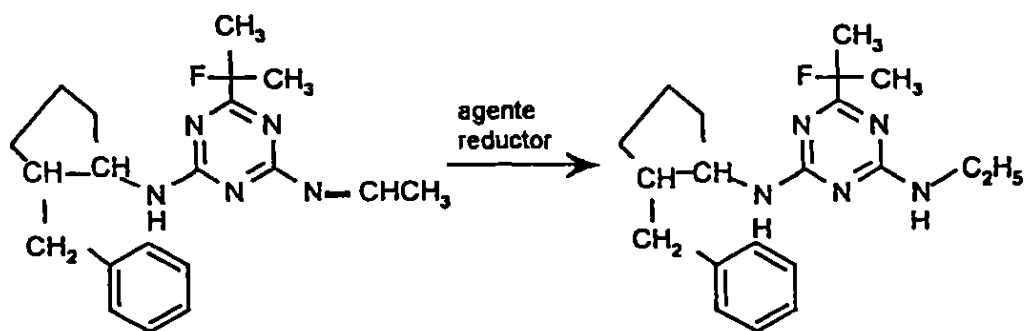
El procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocloreto de 2 amino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina y acetil acido de Meldrum como los materiales de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



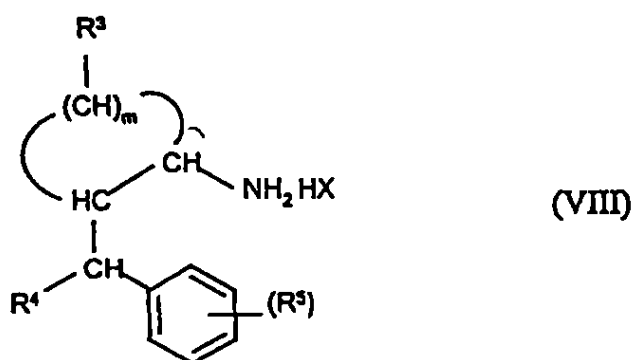
El procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se usen hidrocloreto de 2 amino-4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina y dimetilacetal de N N dimetilformamida como los materiales de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



El procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente en caso por ejemplo de que se use 2 etilidenamino 4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina como el material de partida puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reaccion



Los compuestos de la formula (II) los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente son nuevos compuestos que no estan descritos en las literaturas conocidas y pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en las Solicitudes de Patente Japonesa Abiertas a Consulta por el Publico N° 246279/1989 264465/1988 222166/1988 N° 146876/1988 N° 51379/1988 haciendo reaccionar por ejemplo un compuesto de la formula (VIII)



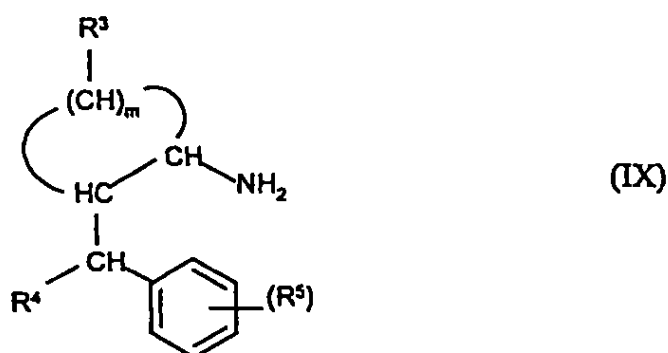
en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

X representa halogeno

con cianoguanidina en un diluyente apropiado por ejemplo *n*-decano

Los compuestos de la formula (VIII) mencionada anteriormente pueden prepararse haciendo reaccionar compuestos de la formula (IX)



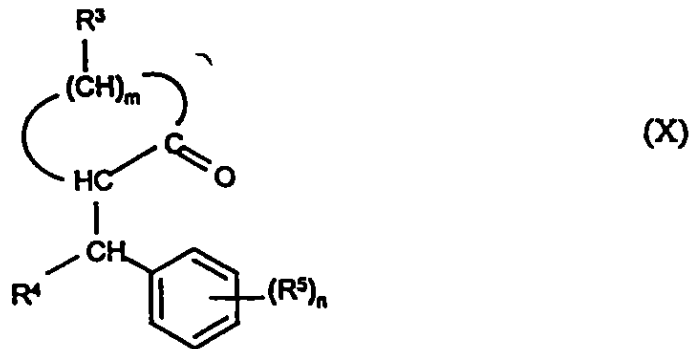
en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente

con un acido halohidrico apropiado tal como acido clorhidrico

Los compuestos de la formula (IX) mencionada anteriormente una parte de los cuales es nueva y no esta descrita en las literaturas conocidas pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento a saber la reaccion de Leuckart descrito en por ejemplo *Organic Reaction*, Vol 5 p 301 (1962) John Wiley & Sons INC hacien

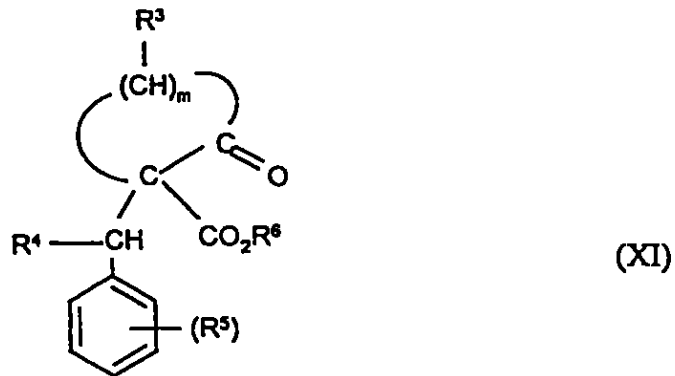
do reaccionar compuestos de la formula (X)



en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente con formamida y acido formico

Los compuestos de la formula (X) mencionada anteriormente una parte de los cuales es nueva y no esta descrita en las literaturas conocidas pueden prepararse facilmente haciendo reaccionar por ejemplo en la descarboxilacion comunmente bien conocida de β cetoesteres a saber compuestos representados por la formula (XI)



en la que

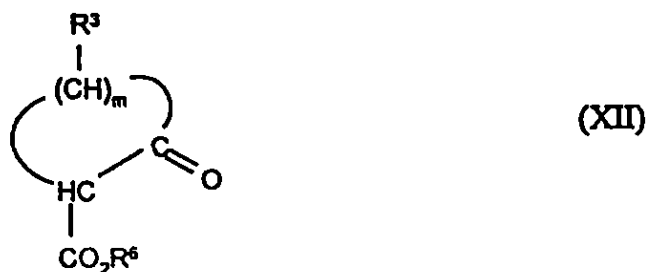
R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono

con un acido mineral apropiado por ejemplo acido bromhidrico

344 2/16

Los compuestos de la formula (XI) mencionada anteriormente una parte de los cuales es nueva y no esta descrita en las literaturas conocidas pueden obtenerse facilmente por ejemplo mediante el procedimiento descrito en SEIMITSU YUKI GOSEI (Precise organic syntheses) Nankodo p 160 1983 a saber haciendo reaccionar compuestos de la formula (XII)

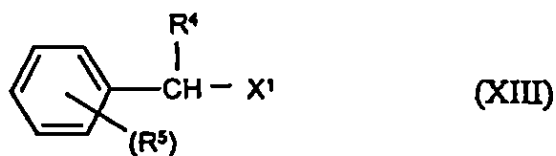


en la que

R^3 y m tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

R^6 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono

con compuestos de la formula



en la que

R^4 R^5 y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

X^1 representa halogeno

usando un agente que se une a los acidos apropiado por ejemplo una solucion acuosa de hidroxido sodico en un diluyente apropiado por ejemplo diclorometano en presencia de un catalizador de transferencia de fase por ejemplo hidrogenosulfato de tetrametilamonio

Los compuestos de la formula (XII) mencionados anteriormente una parte de

los cuales es nueva y no esta descrita en las literaturas conocidas pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en Organic Reaction, Vol 15 p 1 (1967) John Wiley & Sons INC

Los compuestos de la formula (XIII) mencionada anteriormente son compuestos conocidos y pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito en, por ejemplo SHIN JIKKEN KAGAKU KOZA (New experimental chemistry lectures) editado por Chemical Society of Japan Vol 14(I) p 331 1962 publicado por Maruzen

Los compuestos de la formula (II) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente pueden mencionarse como sigue

hidrocloruro de 2 bencilciclopentilbiguanida,
hidrocloruro de 2-(2 fluorobencil)ciclopentilbiguanida
hidrocloruro de 2 (3 fluorobencil)ciclopentilbiguanida,
hidrocloruro de 2-(3 metilbencil)ciclopentilbiguanida
hidrocloruro de 2 bencilciclohexilbiguanida
hidrocloruro de 2 (2 fluorobencil)ciclohexilbiguanida
hidrocloruro de 2-(3 fluorobencil)ciclohexilbiguanida y
hidrocloruro de 2 (3 metilbencil)ciclohexilbiguanida

Los compuestos de la formula (III) son compuestos conocidos y pueden obtenerse comercialmente Tambien pueden prepararse fácilmente de acuerdo con el procedimiento descrito en EP A 850911

Los compuestos de la formula (III) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente pueden mencionarse como sigue

fluoroacetato de etilo

346 5/8

fluorocloroacetato de etilo
fluorobromoacetato de etilo
difluorocloroacetato de etilo
dibromofluoroacetato de etilo
trifluoroacetato de etilo
pentafluoropropionato de metilo
 α fluoropropionato de etilo
 α fluoro- α metilpropionato de etilo
acetato de etilo
propionato de etilo
n butirato de etilo
isobutirato de etilo
ciclopropanocarboxilato de etilo
ciclopentanocarboxilato de etilo
ciclohexanocarboxilato de etilo etc

Los compuestos de la formula (Ia) usados como los materiales de partida en los procedimientos de preparacion (b) (d) mencionados anteriormente son una parte de los compuestos de la formula (I) de la presente invencion y pueden prepararse facilmente mediante el procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente

En el procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente los compuestos de la formula (IV) se basan en la definicion de R^6 mencionada anteriormente y R^7 representa un atomo de hidrogeno alquilo de 1 a 4 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 6 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 atomos de carbono) bencilo que puede estar sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilo que puede estar sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de

carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halogeno. Preferiblemente se basan en la definicion preferible mencionada anteriormente de R^6 y R^7 representa alquilo de 1 a 3 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 atomos de carbono) bencilo que puede estar sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 atomos de carbono o fenilo que puede estar sustituido con alquilo de 1 a 3 atomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 3 atomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con cloro.

Los compuestos de la formula (IV) son compuestos conocidos y pueden usarse los comerciales. O pueden sintetizarse fácilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en EP A 850911.

Los compuestos de la formula (Ia) usados como los materiales de partida en los procedimientos de preparacion (b) (d) mencionados anteriormente que se incluyen en la formula (I) pueden mencionarse como sigue:

2-amino-4-(2-bencilciclopentilamino)-6-(α -fluoroisopropil)-1,3,5-triazina

2-amino-4-(2-bencilciclopentilamino)-6-(α -fluoroetil)-1,3,5-triazina,

2-amino-4-(2-(2-fluorobencil)ciclopentilamino)-6-(α -fluoroisopropil)-1,3,5-triazina,

2-amino-4-(2-(2-fluorobencil)ciclopentilamino)-6-(α -fluoroetil)-1,3,5-triazina,

2-amino-4-(2-(2-fluorobencil)ciclopentilamino)-6-(trifluorometil)-1,3,5-triazina

2-amino-4-(2-(3-fluorobencil)ciclopentilamino)-6-(α -fluoroisopropil)-1,3,5-triazina

2-amino-4-(2-(3-fluorobencil)ciclopentilamino)-6-(α -fluoroetil)-1,3,5-triazina

2-amino-4-(2-(3-fluorobencil)ciclopentilamino)-6-(trifluorometil)-1,3,5-triazina

2-amino-4-(2-(3-metilbencil)ciclopentilamino)-6-(α -fluoroisopropil)-1,3,5-triazina

2-amino-4-(2-(3-metilbencil)ciclopentilamino)-6-(α -fluoroetil)-1,3,5-triazina,

2 amino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 amino 4 (2 bencilciclohexilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclohexilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,

2 amino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclohexilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,

2 amino 4 (2 (3 metilbencil)ciclohexilamino) 6 isopropil 1 3 5 triazina,

2 amino 4 (2 (3 metilbencil)ciclohexilamino) 6 etil 1 3 5 triazina, etc

Los compuestos de la formula (IV) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente pueden mencionarse como sigue

acetato de etilo

propionato de etilo

n butirato de etilo

isobutirato de etilo

pivalato de etilo

ciclopropanocarboxilato de etilo

ciclopentanocarboxilato de etilo

ciclohexanocarboxilato de etilo

fenilacetato de etilo

benzoato de etilo

3 metilbenzoato de etilo

2 clorobenzoato de etilo y

trifluoroacetato de etilo

Los compuestos de formula (V) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente son compuestos cono

cidos y pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en Chem Pharm Bull (1987) 35(5) 1860 1870

Los compuestos de la formula (V) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente pueden mencionarse como sigue

- 5 acetil 2 2 dimetil 1 3 dioxan 4 6 diona,
- 5 propionil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona,
- 5 butiril 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona,
- 5 isobutiril 2 2 dimetil 1 3 dioxan 4 6 diona
- 5 ciclopropilcarbonil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona
- 5 ciclohexilcarbonil 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona,
- 5 (2 fluorobenzoil) 2 2 dimetil 1 3 dioxan-4 6 diona etc

Los compuestos de formula (VI) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente son compuestos conocidos y pueden prepararse facilmente de acuerdo con el procedimiento descrito por ejemplo en la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Publico N° 277251/1996

Los compuestos de la formula (VI) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente pueden mencionarse como sigue

- dimetilacetal de N N dimetilformamida
- dimetilacetal de N N dietilformamida
- dimetilacetal de N N dipropilformamida
- dimetilacetal de N metil N etilformamida
- dimetilacetal de N metil N propilformamida
- dietilacetal de N N dimetilformamida,

diethylacetal de N N diethylformamida,
 dimethylacetal de N N dimethylacetamida,
 dimethylacetal de N N diethylacetamida, etc

Los compuestos de la formula (VII) usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente son nuevos y no se describen en las literaturas conocidas y pueden prepararse de acuerdo con el procedimiento descrito en por ejemplo la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Publico Nº 51379/1988 por ejemplo haciendo reaccionar los compuestos de la formula (Ia) mencionada anteriormente con aldehidos alifaticos o cetonas alifaticas con de 1 a 4 atomos de carbono en total en los grupos alifáticos de la formula (XIV)



en la que R^{11} significa el grupo alifatico restante que forma los aldehidos/cetonas alifaticos

Los compuestos de la formula (XIV) son compuestos conocidos y pueden obtenerse comercialmente

Los compuestos de la formula (VII) usados como materiales de partida en el procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente pueden mencionarse como sigue

2 metilidenamino 4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina

2 etilidenamino 4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina

2 propilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina

2 isopropilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina

2 metilidenamino-4-(2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
 2 etilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino)-6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
 2 propilidenamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
 2 metilidenamino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
 2-etilidenamino-4-(2 bencilciclohexilamino)-6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina,
 2 etilidenamino-4 (2 (3 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina,
 2 etilidenamino-4 (2 (3 metilbencil)ciclopentilamino) 6 (α fluoroetil) 1 3 5 triazina
 2 etilidenamino-4 (2 bencilciclohexilamino) 6-isopropil 1 3 5 triazina, etc

Ademas de acuerdo con el procedimiento (b) mencionado anteriormente en lugar de compuestos de la formula (IV) usando compuestos de la formula (XV)



en la que

R^{12} representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono y

X^1 representa halogeno

a saber tambien pueden prepararse los compuestos de la formula (I) de la presente invencion en la que R^2 representa (alquil de 1 a 4 atomos de carbono)amino como una alternativa del procedimiento (e)

La reaccion del procedimiento de preparacion (a) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse eteres por ejemplo eter etilico metil etil eter eter iso propilico eter butilico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) eter dimetilico de dietilenglicol (DGM) etc alcoholes por ejemplo metanol etanol iso propanol butanol etilenglicol etc amidas de acido por ejemplo dimetilformamida

(DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona, 1 3 dimetil 2 imidazolidinona, triamida hexametilfosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina, etc

El procedimiento de preparacion (a) puede efectuarse en presencia de un agente que se une a los acidos Como agentes que se unen a los acidos utilizables en ese caso pueden mencionarse como bases inorganicas hidruros hidroxidos carbonatos bicarbonatos etc de metales alcalinos y metales alcalinoterreos por ejemplo hidruro sodico hidruro de litio hidrogenocarbonato sodico hidrogenocarbonato potasico carbonato sodico carbonato potasico hidroxido de litio hidroxido sodico hidroxido potasico hidroxido calcico etc amidas de metales alcalinos inorganicas por ejemplo amida de litio amida sodica, amida potasica etc y como bases organicas alcoholatos aminas terciarias dialquilaminoanilinas y piridinas por ejemplo metoxido sodico etoxido sodico terc-butoxido potasico trietilamina 1 1 4 4 tetrametiletildiamina (TMEDA) N N dimetilnilina, N N dietilnilina piridina 4 dimetilaminopiridina (DMAP) 1 4-diazabicyclo[2 2 2]octano (DABCO) 1 8 diazabicyclo[5 4 0]undec 7 eno (DBU) etc

El procedimiento de preparacion (a) puede efectuarse en un intervalo sustancialmente amplio de temperatura Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 a aproximadamente 100°C preferiblemente de aproximadamente 20 a aproximadamente 80°C Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (a) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la formula (II) con 0 8 2 2 moles de un compuesto de la formula (III) en un

diluyente por ejemplo metanol en presencia de 2 3 moles de metóxido sodico

Ademas en el procedimiento de preparación (a) la reaccion para producir el compuesto de la formula (II) a partir de un compuesto de la formula (IX) a través de un compuesto de la formula (VIII) tambien puede efectuarse continuamente

La reaccion del procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifáticos alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohexano eter de petroleo ligroina benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1 2 dicloroetano clorobenceno diclorobenceno etc eteres por ejemplo eter etilico metil etil eter eter isopropilico eter butilico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) eter dimetilico de dietilenglicol (DGM) etc cetonas por ejemplo acetona metil etil cetona (MEK) metil isopropil cetona metil isobutil cetona (MIBK) etc nitrilos por ejemplo acetonitrilo propionitrilo acrilonitrilo alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol butanol etilenglicol etc esterres por ejemplo acetato de etilo acetato de amilo etc amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona 1 3 dimetil 2 imidazolidinona triamida hexametilfosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina etc

El procedimiento de preparacion (b) puede efectuarse en presencia de un agente que se une a los acidos Como agentes que se unen a los acidos utilizables en ese caso pueden mencionarse como bases inorganicas hidruros hidroxidos carbonatos etc bicarbonatos de metales alcalinos y metales alcalinoterreos por ejemplo hidruro sodico hidruro de litio hidrogenocarbonato sodico hidrogenocarbonato potasico carbonato sodico carbonato potasico hidroxido de litio hidroxido sodico

hidroxido potasico hidroxido calcico etc amidas de metales alcalinos inorgánicas, por ejemplo amida de litio amida sodica, amida potasica etc y como bases orgánicas alcoholatos aminas terciarias dialquilaminoanilinas y piridinas por ejemplo trietilamina, 1,1,4,4-tetrametiletilendiamina (TMEDA), N,N-dimetilanilina, N,N-di-etilanilina, piridina, 4-dimetilaminopiridina (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU) etc compuestos de organo litio por ejemplo metil litio n-butil litio sec-butil litio terc-butil litio fenil litio dimetil cobre-litio diisopropilamida de litio ciclohexilisopropilamida de litio diciclohexilamida de litio n-butil litio DABCO n-butil litio DBU n-butil litio TMEDA, etc

El procedimiento de preparacion (b) puede efectuarse en un intervalo sustancialmente amplio de temperatura. Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 a aproximadamente 150°C preferiblemente de aproximadamente 40 a aproximadamente 80°C. Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal. Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida.

Al efectuar el procedimiento de preparacion (b) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la formula (Ia) con 2-20 moles de un compuesto de la formula (IV) en presencia de 1-2 moles de metoxido sodico.

La reaccion del procedimiento de preparacion (c) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifáticos alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohexano eter de petroleo ligroina benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1,2-dicloroetano clorobenceno diclorobenceno etc eteres

por ejemplo éter etílico metil etil éter éter isopropílico éter butílico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) éter dimetílico de dietilenglicol (DGM) etc cetonas por ejemplo acetona, metil etil cetona (MEK) metil isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK) etc nitrilos por ejemplo acetoni trilo propionitrilo acrilonitrilo etc alcoholes por ejemplo metanol etanol isopro panol butanol etilenglicol etc esterés por ejemplo acetato de etilo acetato de amilo etc amidas de ácido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona, 1 3 dimetil 2 imidazolidinona triamida hexametil fosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina etc

El procedimiento de preparacion (c) puede efectuarse en un intervalo sustan cialmente amplio de temperatura Temperaturas adecuadas estan en el intervalo ge neralmente de aproximadamente 20 aproximadamente 180°C preferiblemente apro ximadamente 60 aproximadamente 120°C Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presion elevada o bajo presion reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (c) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un com puesto de la formula (Ia) con 1 2 moles de un compuesto de la formula (V) en un diluyente por ejemplo benceno

La reaccion del procedimiento de preparacion (d) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifáticos aliciclicos y aromaticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohe xano éter de petroleo ligroina, benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1 2 dicloroetano clorobenceno diclorobenceno etc eteres

por ejemplo éter etílico metil etil eter eter isopropílico eter butílico dioxano di metoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) eter dimetílico de dietilenglicol (DGM) etc cetonas por ejemplo acetona, metil etil cetona (MEK) metil isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK) etc nitrilos por ejemplo acetoni trilo propionitrilo acrilonitrilo tetc alcoholes por ejemplo metanol etanol iso propanol butanol etilenglicol etc esterés por ejemplo acetato de etilo acetato de amilo etc amidas de ácido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetami da (DMA) N metilpirrolidona 1 3 dimetil 2 imidazolidinona triamida hexametil fosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina etc

El procedimiento de preparacion (d) puede efectuarse en presencia de un ca talizador ácido Como ejemplos de catalizador ácido utilizable en ese caso pueden mencionarse ácidos minerales por ejemplo ácido clorhídrico ácido sulfúrico ácido nítrico ácido bromhídrico hidrogenosulfito sodico etc ácidos orgánicos por ejem plo ácido fórmico ácido acético ácido trifluoroacético ácido propiónico ácido metanosulfónico ácido bencenosulfónico ácido p toluenosulfónico etc hidroclo ru ros de amina orgánica, por ejemplo hidrocloruro de piridina hidrocloruro de trieti lamina etc sulfonatos de amina, por ejemplo p toluenosulfonato de piridina p toluenosulfonato de trietilamina, etc

El procedimiento de preparacion (d) puede efectuarse en un intervalo sustan cialmente amplio de temperatura Temperaturas adecuadas están en el intervalo ge neralmente de aproximadamente 20 aproximadamente 180°C preferiblemente apro ximadamente 60-aproximadamente 120°C Dicha reacción se efectúa deseablemente bajo presión normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presión elevada o bajo presión reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (d) puede obtenerse el com

259
31

puesto objetivo de la formula (I) por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la formula (Ia) con 2-4 moles de un compuesto de la formula (VI) en un diluyente por ejemplo benceno en presencia de una cantidad catalitica de acido p toluenosulfonico

La reaccion del procedimiento de preparacion (e) mencionado anteriormente puede efectuarse en un diluyente apropiado Como ejemplos de diluyente usado en ese caso pueden mencionarse agua hidrocarburos alifaticos aliciclicos y aromaticos (que opcionalmente pueden estar clorados) por ejemplo pentano hexano ciclohexano eter de petroleo ligroina, benceno tolueno xileno diclorometano cloroformo tetracloruro de carbono 1 2 dicloroetano clorobenceno diclorobenceno etc eteres por ejemplo eter etilico metil etil eter eter isopropilico eter butilico dioxano dimetoxietano (DME) tetrahidrofurano (THF) eter dimetilico de dietilenglicol (DGM) etc cetonas por ejemplo acetona, metil etil cetona (MEK) metil isopropil cetona metil isobutil cetona (MIBK) etc nitrilos por ejemplo acetoni trilo propionitrilo acrilonitrilo etc alcoholes por ejemplo metanol etanol isopropanol butanol etilenglicol etc esterres por ejemplo acetato de etilo acetato de amilo etc amidas de acido por ejemplo dimetilformamida (DMF) dimetilacetamida (DMA) N metilpirrolidona 1 3 dimetil 2 imidazolidinona, triamida hexametil fosforica (HMPA) etc sulfonas y sulfoxidos por ejemplo dimetilsulfoxido (DMSO) sulfolano etc bases por ejemplo piridina etc

El procedimiento de preparacion (e) puede efectuarse en presencia de un catalizador Como ejemplos de tales catalizadores utilizables en ese caso pueden mencionarse paladio al 10% carbono etc

El procedimiento de preparacion (e) puede efectuarse en un intervalo sustancialmente amplio de temperatura Temperaturas adecuadas estan en el intervalo generalmente de aproximadamente 0 aproximadamente 120°C preferiblemente apro

ximadamente 25 aproximadamente 80°C Dicha reaccion se efectua deseablemente bajo presion normal Opcionalmente sin embargo es posible efectuarla bajo presión elevada o bajo presion reducida

Al efectuar el procedimiento de preparacion (e) el compuesto objetivo de la formula (I) puede obtenerse por ejemplo haciendo reaccionar 1 mol de un compuesto de la formula (VII) con 1 2 moles de hidrogeno gaseoso en un diluyente, por ejemplo metanol en presencia de una cantidad catalitica de paladio al 10% carbono

Los compuestos activos de la formula (I) de acuerdo con la presente invencion pueden usarse como herbicidas En la presente memoria descriptiva malas hierbas significa, en el sentido mas amplio todas la plantas que crecen en lugares donde no se desean Los compuestos de la presente invencion actuan como herbicidas totales o selectivos dependiendo de la concentracion aplicada Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden usarse por ejemplo entre las malas hierbas y los cultivos siguientes

Malas hierbas dicotiledoneas de los generos Sinapis Lepidium, Galium Stellaria, Chenopodium, Urtica Senecio Amaranthus Portulaca, Xanthium Ipomoea, Polygonum Ambrosia, Cirsium, Sonchus Solanum Rorippa, Lamium, Veronica, Datura, Viola, Galeopsis Papaver Centaurea Galinsoga Rotala, Lindernia, etc

Cultivos dicotiledoneos de los generos Gossypium Glycine Beta Daucus Phaseolus Pisum, Solanum Linum Ipomoea, Vicia Nicotiana Lycopersicon Arachis Brassica Lactuca Cucumis Cucurbita, etc

Malas hierbas monocotiledoneas de los generos Echinochloa Setaria, Panicum Digitaria Phleum Poa Festuca Eleusine Lolium Bromus Avena Cyperus Sorghum, Agropyron Monochoria, Fimbristylis Sagittaria, Eleocharis Scirpus Paspalum Ischaemum Agrostis Alopecurus Cynodon etc

Cultivos monocotiledoneos de los generos Oryza Zea, Triticum Hordeum,

Avena, Secale Sorghum, Panicum Saccharum, Ananas, Asparagus Allium, etc

El uso de los compuestos, de acuerdo con la presente invencion, no esta restringido a las plantas mencionadas anteriormente sino que puede aplicarse a otras plantas de la misma manera. Los compuestos activos de la presente invencion, dependiendo de la concentracion aplicada pueden controlar no selectivamente malas hierbas y pueden usarse por ejemplo en terreno industrial vias de tren, caminos lugares con o sin plantaciones de arboles

Por otra parte los compuestos activos de acuerdo con la presente invencion, pueden usarse para controlar malas hierbas en cultivos perennes y aplicarse en, por ejemplo deforestaciones plantaciones de arboles decorativos huertos de frutales vinedos arboledas de citricos huertos de nueces plantaciones de platanos plantaciones de cafe plantaciones de te plantaciones de caucho plantaciones de palma oleaginosa plantaciones de cacao plantaciones de bayas campos de lupulo etc y pueden aplicarse ademas para el control selectivo de malas hierbas en cultivos anuales

Los compuestos activos de la formula (I) de acuerdo con la presente invencion, pueden elaborarse como las formulaciones normales en caso de uso. Como tales formulaciones pueden mencionarse por ejemplo liquidos (concentrados emulsificables etc) polvos humectables emulsiones concentrados para suspensiones polvos granulos dispersables en agua tabletas granulos concentrados para suspensiones emulsiones microcapsulas en sustancias polimeras o formulaciones de gran tamaño

Las formulaciones pueden prepararse de acuerdo con metodos conocidos por ejemplo mezclando los compuestos activos con extendedores a saber diluyentes o portadores liquidos y/o solidos y opcionalmente con agentes tensioactivos a saber emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes formadores de espuma

Como diluyentes o portadores líquidos pueden mencionarse por ejemplo hidrocarburos aromáticos (por ejemplo xileno tolueno alquilnaftaleno etc) hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados (por ejemplo clorobencenos cloruros de etileno cloruro de metileno etc) hidrocarburos alifáticos [por ejemplo ciclohexano etc o parafinas (por ejemplo fracciones de aceites minerales)] alcoholes (por ejemplo butanol glicol etc) y sus éteres ésteres etc cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona metil isobutil cetona, ciclohexanona, etc) disolventes fuertemente polares (por ejemplo dimetilformamida dimetilsulfoxido etc) o agua. En el caso de usar agua como extendedor por ejemplo pueden usarse disolventes orgánicos como disolventes auxiliares.

Como diluyentes o portadores sólidos pueden mencionarse por ejemplo minerales naturales triturados (por ejemplo caolín arcilla talco yeso cuarzo atapulgita montmorillonita tierra diatomacea etc) minerales sintéticos triturados (por ejemplo ácido silícico altamente dispersado alumina, silicatos etc) etc. Como portadores sólidos para granulos pueden mencionarse rocas machacadas y fraccionadas (por ejemplo calcita mármol piedra pómez, sepiolita dolomita, etc) granulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas partículas de materiales orgánicos (por ejemplo serrín cáscaras de coco mazorcas de maíz y pedunculos de tabaco etc) etc.

Como emulsionantes y/o agentes formadores de espuma pueden mencionarse por ejemplo emulsionantes no iónicos y aniónicos [por ejemplo ésteres de ácidos grasos de polioxietileno éteres de alcoholes de ácidos grasos de polioxietileno (por ejemplo alquilaril poliglicol éteres alquilsulfonatos alquilsulfatos arilsulfonatos etc)] o productos de la hidrólisis de la albumina etc.

Como dispersantes se incluyen por ejemplo líquido residual de lignín sulfito metilcelulosa etc.

Tambien pueden usarse adherentes en las formulaciones (polvos granulos formulaciones de gran tamaño emulsiones) Como dichos adherentes pueden mencionarse por ejemplo carboximetilcelulosa, polimeros naturales y sinteticos (por ejemplo goma arabiga, poli(alcohol vinilico) poli(acetato de vinilo)) etc

También pueden usarse colorantes Como dichos colorantes pueden mencionarse pigmentos inorganicos (por ejemplo oxido de hierro oxido de titanio y Azul de Prusia) y tintes organicos tales como tintes de alizarina tintes azoicos o tintes de ftalocianina metalica, y ademas nutrientes traza tales como sales de metales tales como hierro manganeso boro cobre cobalto molibdeno zinc etc

Dichas formulaciones pueden contener en un intervalo de generalmente 0 a 95% en peso preferiblemente 0.5 a 90% en peso de los componentes activos mencionados anteriormente

Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden usarse como tales o en sus formas de formulacion para controlar malas hierbas Tambien pueden usarse como un agente mixto con herbicidas conocidos Tal agente mixto puede prepararse previamente como una forma de formulacion final o puede prepararse mediante mezcladura en tanque con ocasion de la aplicacion Como una posible combinacion como un agente mixto pueden mencionarse por ejemplo herbicidas del tipo de la sulfonilurea para uso en arrozales

Ademas los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion tambien pueden mezclarse con un asegurador y su aplicacion como un herbicida selectivo puede ampliarse mediante tal mezcladura Como un ejemplo del asegurador para ese proposito puede mencionarse 1 (α α dimetilbencil) 3 p tolilurea

Sorprendentemente algunos de los agentes mixtos de los compuestos de la presente invencion muestran efectos sinergicos

En el caso de usar los compuestos activos de la formula (I) de la presente in

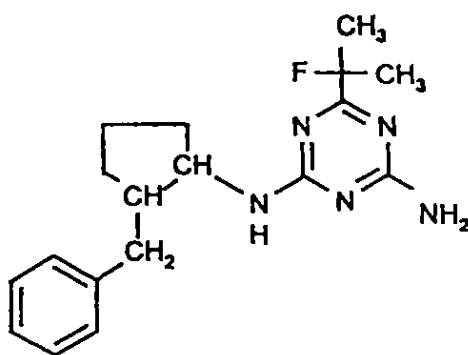
vencion, pueden usarse directamente como tales o en las formas de formulacion mencionadas anteriormente o aplicarse en las formas de aplicacion preparadas mediante dilucion adicional Pueden aplicarse por medio de por ejemplo riego rocia dura, atomizacion, espolvoreo aplicacion de granulos etc

Los compuestos activos de la formula (I) de la presente invencion pueden aplicarse en cualesquiera fases antes y despues de la germinacion de las plantas Tambien pueden absorberse en el suelo antes de sembrar

La cantidad de aplicacion de los compuestos activos de la presente invencion no esta estrictamente restringida sino que puede variarse en un amplio intervalo de acuerdo con el efecto deseado el tipo de planta objetivo el lugar y el periodo de aplicacion, etc En el caso del uso como herbicidas como la concentracion de aplicacion pueden mencionarse por ejemplo intervalos de aproximadamente 0 001 a aproximadamente 5 kg, preferiblemente de aproximadamente 0 05 a aproximadamente 2 kg de los compuestos activos por hectarea

A continuacion, las preparaciones y las aplicaciones de los compuestos de la presente invencion se describiran mas especificamente mediante los siguientes ejemplos Sin embargo la presente invencion no debe restringirse a ellos de ningun modo 'Partes son partes en peso a no ser que se especifique

Ejemplo de Sintesis 1



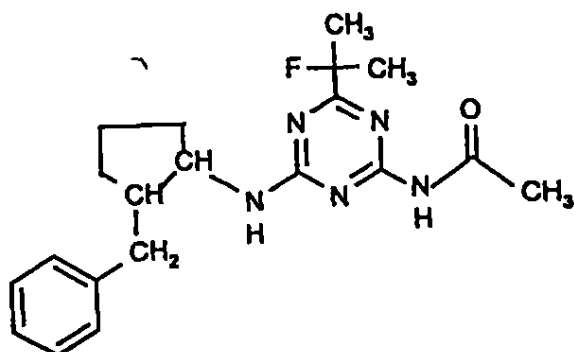
Se añadio lentamente gota a gota 2 bencilciclopentilamina (3 g) a acido

clorhídrico concentrado (3.6 ml) bajo enfriamiento con hielo. Después de agitar como tal durante 30 minutos, se separó por destilación agua bajo presión reducida para obtener hidrocloruro de 2-bencilciclopentilamina (3.1 g).

Se suspendieron el hidrocloruro de 2-bencilciclopentilamina mencionado anteriormente (3.1 g) y cianoguanidina (1.23 g) en *n*-decano (30 ml) y se calentaron a 130°C durante 4.5 horas. Después del enfriamiento, los cristales depositados se filtraron, se lavaron con *n*-hexano y se secaron bajo presión reducida para obtener hidrocloruro de 2-bencilciclopentilbiguanida (3 g).

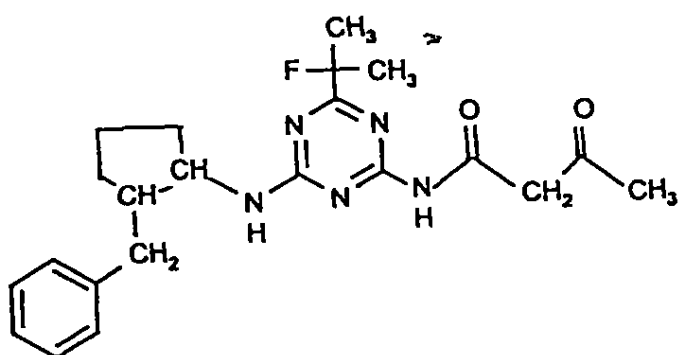
Después de añadir sodio (0.31 g) en 12 ml de metanol seco y agitar durante 5 minutos, se añadió el hidrocloruro de 2-bencilciclopentilbiguanida mencionado anteriormente (2 g) y se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuación, se añadió α -fluoro- α -metilpropionato de metilo (1.62 g) y se agitó a temperatura ambiente durante 10 horas. Después de eso, se añadieron 50 ml de agua y se extrajo con acetato de etilo. Después de secar con sulfato sódico anhidro, el acetato de etilo se separó por destilación bajo presión reducida y el residuo se trató mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 2-amino-4-(2-bencilciclopentilamino)-6-(α -fluoroisopropil)-1,3,5-triazina (1.65 g).

p.f. 50-55°C

364
360Ejemplo de Sintesis 2

Despues de anadir sodio (0.1 g) en metanol seco (5 ml) y agitar durante 5 minutos se añadio 2-amino-4-(2-benzilciclopentilamino)-6-(α-fluoroisopropil)-1,3,5-triazina (1 g) y se agito a 50°C durante 1 hora. Despues de enfriar el metanol se separo por destilacion bajo presion reducida. A continuacion, se añadio acetato de etilo (10 ml) y se agito a 50°C durante 1 hora. Despues de enfriar se anadio agua (30 ml) y se extrajo con acetato de etilo. Despues de secar con sulfato sodico anhidro el acetato de etilo se separo por destilacion bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de sílice (eluyente hexano-acetato de etilo = 3/2) para obtener 2-acetilamino-4-(2-benzilciclopentilamino)-6-(α-fluoroisopropil)-1,3,5-triazina (0.57 g).

n_D^{20} 1.5512

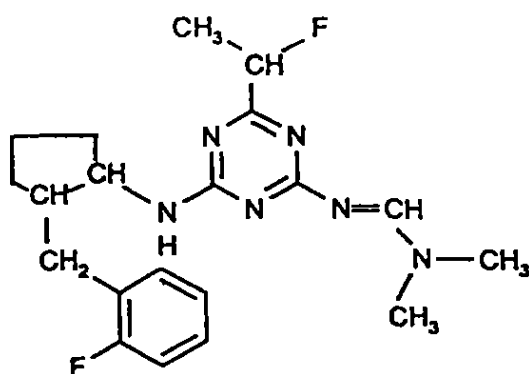
Ejemplo de Sintesis 3

Se disolvieron 2-amino-4-(2-benzilciclopentilamino)-6-(α-fluoroisopropil)-1,3,5-triazina

1 3 5 triazina (0 5 g) y acetil acido de Meldrum (0 28 g) en benceno (20 ml) y se sometieron a reflujo durante 1 hora mediante calentamiento Después de enfriar el disolvente se separo por destilación bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente hexano acetato de etilo = 3 2) para obtener 2 acetoacetilamino-4 (2 bencilciclopentilamino) 6-(α fluoroisopropil) 1 3 5 triazina (0 55 g)

n_D^{20} 1 5433

Ejemplo de Sintesis 4

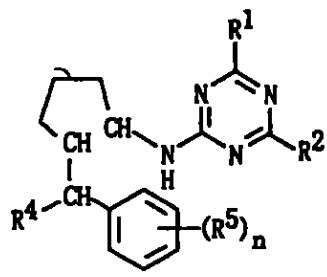


Se disolvieron 2 amino 4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (1 fluoroetil) 1 3 5 triazina (0 3 g) dimetilacetal de N N dimetilformamida (0 32 g) y una cantidad catalitica de monohidrato de acido p toluenosulfonico en benceno (20 ml) y se sometieron a reflujo durante 1 5 horas mediante calentamiento Despues de enfriar el disolvente se separo por destilacion bajo presion reducida y el residuo se trato mediante cromatografia en columna de gel de silice (eluyente diclorometano metanol = 90 5) para obtener 2 N N dimetilmetilenimino 4 (2 (2 fluorobencil)ciclopentilamino) 6 (1 fluoroetil) 1 3 5 triazina (0 34 g) n_D^{20} 1 5776

Los compuestos que pueden obtenerse de la misma manera que en los Ejemplos de Sintesis 1-4 mencionados anteriormente se muestran en la Tabla 1 siguiente junto con compuestos sintetizados en los Ejemplos de Sintesis 1-4

366 368

Tabla 1



Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
1	CH ₃	NH ₂	H	H	
2	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
3	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
4	C ₃ H ₇ iso	NH ₂	H	H	
5	C ₄ H ₉ n	NH ₂	H	H	
6	C ₄ H ₉ sec	NH ₂	H	H	
7	C ₄ H ₉ iso	NH ₂	H	H	
8	C ₄ H ₉ terc	NH ₂	H	H	
9	C ₈ H ₁₁ n	NH ₂	H	H	
10		NH ₂	H	H	
11		NH ₂	H	H	
12		NH ₂	H	H	
13		NH ₂	H	H	
14		NH ₂	H	H	
15	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
16	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
17	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
18	CHFCl	NH ₂	H	H	
19	CHFBBr	NH ₂	H	H	
20	CFCl ₂	NH ₂	H	H	

Tabla 1 (continuacion)

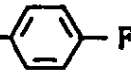
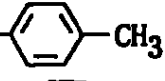
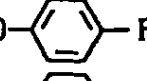
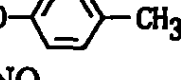
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
21	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
22	CHF ₂	NH ₂	H	H	
23	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
24	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
25	CF ₃	NH ₂	H	H	
26	CCl ₃	NH ₂	H	H	
27	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	1 5557
28	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	1 5525
29	CH ₃ CHF	N=CN(CH ₃) ₂	H	2 F	1 5776
30	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3F	1 5485
31	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4F	
32	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	1 5420
33	CH ₂ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
34	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
35	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
36	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	50 55°C
37	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	1 5469
38	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	1 5239
39	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
40	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
41	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
42	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
43	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
44	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Br	
45	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
46	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	1 5359
47	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
48	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 C ₂ H ₅	
49	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₂ H ₅	
50	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ n	

308 370

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
51	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ iso	
52	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₄ H ₉ terc	
53	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
54	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
55	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CF ₃	
56	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
57	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
58	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
59	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OC ₂ H ₅	
60	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OC ₂ H ₅	
61	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OC ₃ H ₇ iso	
62	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCF ₃	
63	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCF ₃	
64	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCHF ₂	
65	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₂ CF ₃	
66	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
67	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCH ₃	
68	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SC ₂ H ₅	
69	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 S(O)CH ₃	
70	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 S(O)CH ₃	
71	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SO ₂ CH ₃	
72	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SO ₂ CH ₃	
73	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCF ₃	
74	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCF ₃	
75	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₂ CF ₃	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
76	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
77	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4- 	
78	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
79	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
80	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
81	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
82	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
83	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
84	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 NO ₂	
85	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CN	
86	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4-F ₂	
87	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4-F ₂	
88	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
89	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 Cl ₂	
90	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 Cl ₂	
91	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 Cl ₂	
92	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 (CH ₃) ₂	
93	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (CH ₃) ₂	
94	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
95	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CF ₃) ₂	
96	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4-(OCH ₃) ₂	
97	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 3 4 Cl ₃	
98	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 6-(CH ₃) ₃	
99	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
100	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	1 5512

370 372

Tabla 1 (continuación)

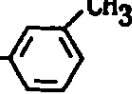
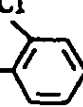
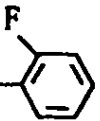
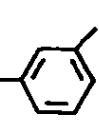
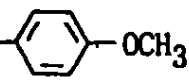
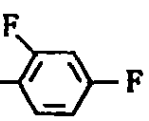
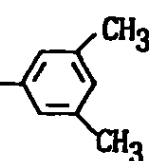
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
101	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
102	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ n	H	H	
103	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ -iso	H	H	
104	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H ₉ -terc	H	H	
105	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
106	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
107	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
108	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
109	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
110	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
111	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
112	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
113	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
114	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
115	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
116	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
117	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
118	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
119	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
120	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
121	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	1 5433
122	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
123	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
124	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
125	ClCH ₂ ClCH ₂	NH ₂	H	H	
126	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
127	CHFClCF ₃	NH ₂	H	H	
128	CH ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
129	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
130	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	

374
372

Tabla 1 (continuacion)

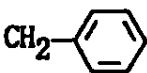
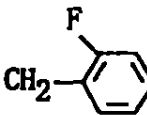
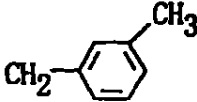
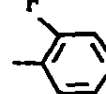
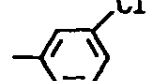
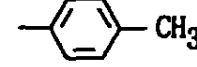
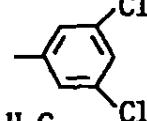
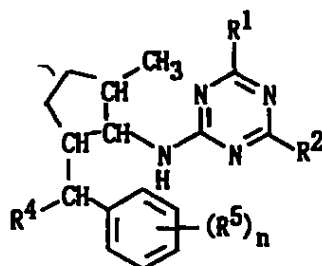
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pfo n ^D ₂₀
131	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
132	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
133	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
134	CH ₂ - 	NH ₂	H	H	
135		NH ₂	H	H	
136		NH ₂	H	H	
137		NH ₂	H	H	
138		NH ₂	H	H	
139		NH ₂	H	H	
140		NH ₂	H	H	
141	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
142	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
143	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
144	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
145	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
146	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
147	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	
148	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
149	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
150	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
151	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
152	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
153	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
154	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
155	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
156	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
157	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
158	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
159	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
160	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
161	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
162	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
163	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
164	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
165	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
166	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
167	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

Tabla 1 (continuación)

Comp

Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pfo n ^D ₂₀
168	CF ₃	NH ₂	H	H	
169	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
170	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
171	CF ₃	NH ₂	H	4 F	
172	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
173	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
174	CF ₃	NH ₂	H	4 Cl	
175	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
176	CF ₃	NH ₂	H	3 CF ₃	
177	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
178	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
179	CF ₃	NH ₂	H	4 CH ₃	
180	CF ₃	NH ₂	H	2 OCH ₃	
181	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
182	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
183	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
184	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
185	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
186	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
187	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
188	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
189	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
190	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	

377

375

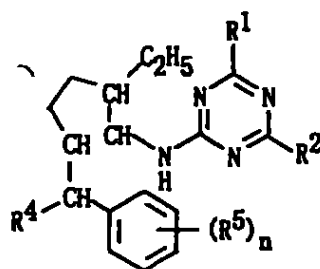
Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ³)	pf o n ^D ₂₀
191	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
192	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	
193	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
194	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
195	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 CH ₃	
196	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
197	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
198	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
199	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
200	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
201	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
202	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
203	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
204	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
205	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
206	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
207	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
208	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
209	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
210	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
211	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
212	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
213	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
214	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
215	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	

378
376Tabla 1 (continuacion)

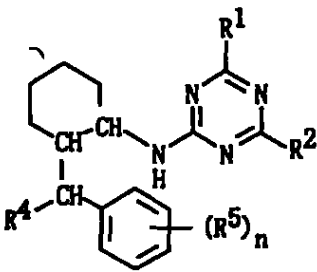
Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
216	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
217	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
218	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
219	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
220	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
221	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
222	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
223	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	
224	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
225	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
226	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
227	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
228	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
229	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
230	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
231	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

37A

Tabla 1 (continuación)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
232	CF ₃	NH ₂	H	H	
233	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
234	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
235	CF ₃	NH ₂	H	3 5 F ₂	
236	CF ₃	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
237	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
238	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
239	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
240	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
241	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
242	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
243	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
244	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
245	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
246	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
247	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
248	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
249	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
250	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
251	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
252	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

Tabla 1 (continuacion)



Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
253	CH ₃	NH ₂	H	H	
254	C ₂ H ₅	NH ₂	H	H	
255	C ₃ H ₇ n	NH ₂	H	H	
256	C ₃ H ₇ iso	NH ₂	H	H	
257	C ₄ H ₉ n	NH ₂	H	H	
258	C ₄ H ₉ sec	NH ₂	H	H	
259	C ₄ H ₉ iso	NH ₂	H	H	
260	C ₄ H ₉ terc	NH ₂	H	H	
261	C ₅ H ₇ n	NH ₂	H	H	
262		NH ₂	H	H	
263		NH ₂	H	H	
264		NH ₂	H	H	
265		NH ₂	H	H	
266		NH ₂	H	H	
267	CH ₂ F	NH ₂	H	H	
268	CH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
269	CH ₂ Br	NH ₂	H	H	
270	CHFCI	NH ₂	H	H	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
271	CHFB _r	NH ₂	H	H	
272	CFCl ₂	NH ₂	H	H	
273	CFBr ₂	NH ₂	H	H	
274	CHF ₂	NH ₂	H	H	
275	CF ₂ Cl	NH ₂	H	H	
276	CF ₂ Br	NH ₂	H	H	
277	CF ₃	NH ₂	H	H	
278	CCl ₃	NH ₂	H	H	
279	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
280	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
281	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	60 66°C
282	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
283	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
284	CH ₂ CH ₂ F	NH ₂	H	H	
285	CH ₃ CHCl	NH ₂	H	H	
286	CH ₃ CHBr	NH ₂	H	H	
287	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	1 5332
288	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
289	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	72 80°C
290	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
291	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
292	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
293	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
294	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
295	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Br	
296	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
297	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
298	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
299	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 C ₂ H ₅	
300	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₂ H ₅	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
301	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ n	
302	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ -iso	
303	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₄ H ₉ terc	
304	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
305	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CF ₃	
306	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CF ₃	
307	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
308	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
309	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
310	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OC ₂ H ₅	
311	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OC ₂ H ₅	
312	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 C ₃ H ₇ iso	
313	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCF ₃	
314	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCF ₃	
315	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCHF ₂	
316	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₂ CF ₃	
317	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
318	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCH ₃	
319	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SC ₂ H ₅	
320	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 S(O)CH ₃	
321	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 S(O)CH ₃	
322	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SO ₂ CH ₃	
323	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-SO ₂ CH ₃	
324	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCF ₃	
325	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCF ₃	

Tabla 1 (continuacion)

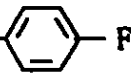
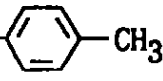
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
326	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 SCH ₂ CF ₃	
327	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3- 	
328	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4- 	
329	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-  -F	
330	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-  -CH ₃	
331	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3-O- 	
332	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-O- 	
333	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 NO ₂	
334	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4-CN	
335	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 F ₂	
336	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 F ₂	
337	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
338	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 Cl ₂	
339	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 Cl ₂	
340	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 Cl ₂	
341	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 (CH ₃) ₂	
342	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (CH ₃) ₂	
343	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
344	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CF ₃) ₂	
345	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 4 (OCH ₃) ₂	

Tabla 1 (continuación)

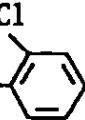
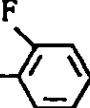
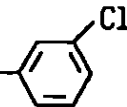
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
346	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 3 4 Cl ₃	
347	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 4 6 (CH ₃) ₃	
348	(CH ₃) ₂ CF	NHCHO	H	H	
349	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₃	H	H	
350	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₂ H ₅	H	H	
351	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ n	H	H	
352	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₃ H ₇ iso	H	H	
353	(CH ₃) ₂ CF	NHCOC ₄ H ₉ terc	H	H	
354	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
355	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
356	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
357	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ F	H	H	
358	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₃	H	H	
359	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCHFCH ₃	H	H	
360	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCF ₂ CF ₃	H	H	
361	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
362	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ - 	H	H	
363	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
364	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
366	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	

Tabla 1 (continuación)

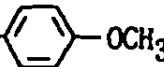
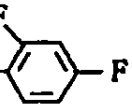
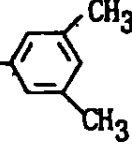
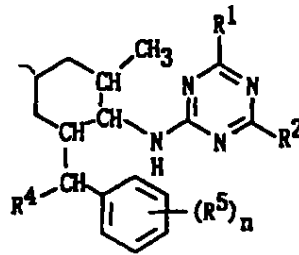
Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
366	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
367	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
368	(CH ₃) ₂ CF	NHCO- 	H	H	
369	(CH ₃) ₂ CF	NHCOCH ₂ COCH ₃	H	H	
370	(CH ₃) ₂ CF	N=CHN(CH ₃) ₂	H	H	
371	(CH ₃) ₂ CCl	NH ₂	H	H	
372	(CH ₃) ₂ CBr	NH ₂	H	H	
373	CH ₂ ClCH ₂ Cl	NH ₂	H	H	
374	CH ₃ CF ₃	NH ₂	H	H	
375	CHFCH ₃	NH ₂	H	H	
376	CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
377	CF ₂ CF ₂ CF ₃	NH ₂	H	H	
378	(CF ₃) ₂ CH	NH ₂	H	H	
379	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
380	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 F	
381	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
382	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
383	CF ₃	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
384	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
385	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 F	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
386	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
387	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
388	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
389	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
390	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 F	
391	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 CH ₃	
392	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 F ₂	
393	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	3 5 (CH ₃) ₂	
394	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
395	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
396	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
397	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
398	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
399	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
400	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
401	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 F	
402	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	3 CH ₃	
403	CF ₃	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
404	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	
405	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₃ H ₇ n	H	

Tabla 1 (continuación)

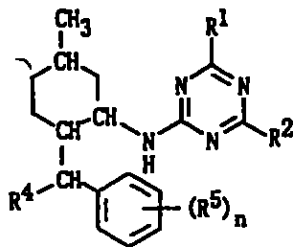


Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
406	CF ₃	NH ₂	H	H	
407	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
408	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
409	CF ₃	NH ₂	H	4 F	
410	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
411	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
412	CF ₃	NH ₂	H	4 Cl	
413	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
414	CF ₃	NH ₂	H	3 CF ₃	
415	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
416	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
417	CF ₃	NH ₂	H	4 CH ₃	
418	CF ₃	NH ₂	H	2 OCH ₃	
419	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
420	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
421	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
422	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
423	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
424	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
425	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
426	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
427	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
428	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	
429	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
430	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	

Tabla 1 (continuación)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
431	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
432	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
433	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 CH ₃	
434	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
435	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
436	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
437	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
438	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
439	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
440	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
441	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
442	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
443	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
444	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
445	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
446	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
447	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
448	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
449	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2-CH ₃	
450	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
451	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
452	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
453	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
454	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
455	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 SCH ₃	
456	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
457	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
458	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
459	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
460	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
461	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
462	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
463	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

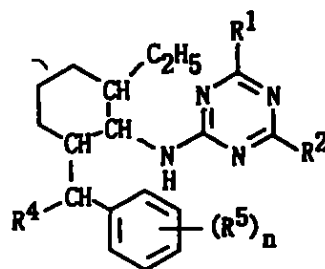
Tabla 1 (continuación)



Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
464	CF ₃	NH ₂	H	H	
465	CF ₃	NH ₂	H	2 F	
466	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
467	CF ₃	NH ₂	H	4 F	
468	CF ₃	NH ₂	H	2 Cl	
469	CF ₃	NH ₂	H	3 Cl	
470	CF ₃	NH ₂	H	4 Cl	
471	CF ₃	NH ₂	H	3 Br	
472	CF ₃	NH ₂)	H	3 CF ₃	
473	CF ₃	NH ₂	H	2 CH ₃	
474	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
475	CF ₃	NH ₂	H	4 CH ₃	
476	CF ₃	NH ₂	H	2 OCH ₃	
477	CF ₃	NH ₂	H	3 OCH ₃	
478	CF ₃	NH ₂	H	4 OCH ₃	
479	CF ₃	NH ₂	H	3 SCH ₃	
480	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
481	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 F	
482	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
483	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 F	
484	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 Cl	
485	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Cl	
486	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 Cl	
487	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 Br	
488	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CF ₃	
489	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 CH ₃	
490	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	

Tabla 1 (continuacion)

Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
491	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 CH ₃	
492	CH ₃ CHF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
493	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
494	CH ₃ CHF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
495	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
496	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
497	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
498	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
499	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 F	
500	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
501	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 F	
502	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 Cl	
503	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Cl	
504	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 Cl	
505	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 Br	
506	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CF ₃	
507	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 CH ₃	
508	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
509	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 CH ₃	
510	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	2 OCH ₃	
511	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 OCH ₃	
512	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	4 OCH ₃	
513	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 SCH ₃	
514	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
515	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
516	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
517	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
518	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
519	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
520	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
521	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

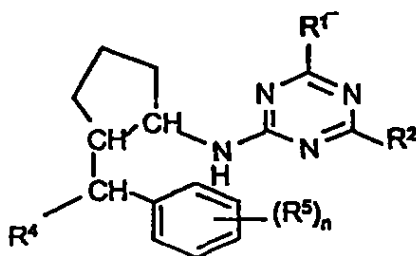
Tabla 1 (continuacion)

Comp					
N	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵)	pf o n ^D ₂₀
522	CF ₃	NH ₂	H	H	
523	CF ₃	NH ₂	H	3 F	
524	CF ₃	NH ₂	H	3 CH ₃	
525	CF ₃	NH ₂	H	3 5 F ₂	
526	CF ₃	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
527	CH ₃ CHF	NH ₂	H	H	
528	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 F	
529	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 CH ₃	
530	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
531	CH ₃ CHF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
532	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	H	
533	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 F	
534	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 CH ₃	
535	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 F ₂	
536	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	H	3 5 (CH ₃) ₂	
537	CF ₃	NH ₂	CH ₃	H	
538	CF ₃	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
539	CH ₃ CHF	NH ₂	CH ₃	H	
540	CH ₃ CHF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	
541	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	CH ₃	H	
542	(CH ₃) ₂ CF	NH ₂	C ₂ H ₅	H	

390

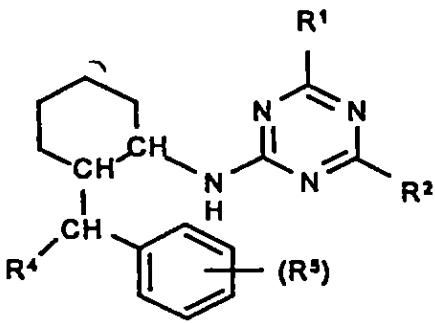
Los compuestos obtenidos efectuando la reaccion usando yoduro de metilo yoduro de etilo o yoduro de propilo en lugar de los compuestos de la fórmula (IV) en el procedimiento de preparacion (b) mencionado anteriormente se muestran en las siguientes Tablas 2 y 3

Tabla 2



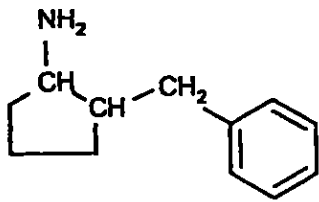
Comp					
Nº	R ¹	R ²	R ⁴	(R ⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
543	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
544	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
545	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H ₇ n	H	H	

Tabla 3



Comp					
Nº	R¹	R²	R⁴	(R⁵) _n	pf o n ^D ₂₀
546	(CH ₃) ₂ CF	NHCH ₃	H	H	
547	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₂ H ₅	H	H	
548	(CH ₃) ₂ CF	NHC ₃ H ₇ n	H	H	

Ejemplo de Sintesis 5

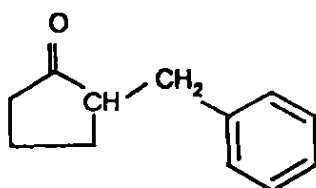


Se calentó una mezcla de 2 bencilciclopentanona (11 51 g) y formamida (44 41 ml) a 140 150°C a lo que se añadió lentamente gota a gota, ácido fórmico (9 13 g) manteniendo la temperatura. Después de terminar la adición la mezcla se calentó a 150°C durante 2 horas más. Después de enfriar se añadió agua a la mezcla y se extrajo con cloruro de metileno. La capa de cloruro de metileno se lavó con agua y se secó con sulfato sódico anhidro. Después de que el cloruro de metileno se separara por destilación bajo presión reducida se añadió ácido clorhídrico concentrado (36 85 ml) al residuo y se sometió a reflujo durante 2 horas mediante calentamiento.

Despues de enfriar se añadio agua, se alcalinizo con hidróxido sodico y se extrajo con cloruro de metileno. La capa de cloruro de metileno se lavo con agua y se secó con carbonato potasico anhidro. Despues de que el cloruro de metileno se separara por destilacion bajo presion reducida el residuo se purifico mediante destilacion para obtener 2 bencilciclopentilamina (5.18 g)

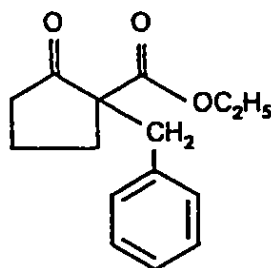
$$n_D^{20} = 1.5371$$

Ejemplo de Sintesis 6



Se anadio acido bromhidrico al 48% (50 ml) a 2 bencil 2 etoxycarbonilciclopentanona (23.7 g) y se sometio a reflujo a 120°C durante 4 horas calentando. Despues de enfriar se anadio hielo (100 g) a la mezcla y se extrajo con eter dietilico. Despues de lavar la capa de eter dietilico con agua, una solucion acuosa saturada de hidrogenocarbonato sodico y una solucion acuosa saturada de cloruro sodico se seco con sulfato sodico anhidro. Despues de que el eter dietilico se separara por destilacion bajo presion reducida, el residuo se purifico mediante destilacion para obtener 2 bencilciclopentanona (11.51 g) $n_D^{20} = 1.5288$

Ejemplo de Sintesis 7



Se anadieron hidrogenosulfato de tetrabutilamonio (29.1 g) y yoduro de bencilo (37.37 g) a una solucion de 2 etoxycarbonilciclopentanona (13.37 g) en cloruro

de metileno (143 ml) y a continuación se añadió una solución de hidróxido sódico (6.86 g) en agua (143 ml). Después de que la mezcla se agitará a temperatura ambiente durante 4 horas, la capa de cloruro de metileno se separó y la capa acuosa se extrajo con cloruro de metileno (200 ml 3 veces). Las capas de cloruro de metileno se reunieron, se lavaron con agua, solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico y solución acuosa saturada de cloruro sódico y se secaron con sulfato sódico anhidro. Después de que el cloruro de metileno se separara por destilación bajo presión reducida, el residuo se trató mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente hexano/acetato de etilo = 9/1) para obtener 2-bencil-2-etoxycarbonilciclopentanona (16.8 g) $n_{D_{20}} = 1.5156$.

Ejemplo de Ensayo 1 Ensayo para el efecto herbicida contra malas hierbas de arrozales

Preparación de una formulación del compuesto activo

Portador Acetona 5 partes en peso

Emulsionante Benciloxipoliglicoleter 1 parte en peso

Se obtiene una formulación de la sustancia activa como emulsión mezclando 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad mencionada anteriormente de portador y emulsionante. Una cantidad prescrita de dicha formulación se diluye con agua y se usa para el ensayo.

Método de ensayo

En un invernadero se transplantaron 3 plantulas de arroz (cultivar Nihonbare) de la fase foliar 2.5 (15 cm de alto) a una maceta de 500 cm² llena con suelo de arrozal. A continuación se sembraron semillas de pata de gallina, flor chica, junquillo, monocoria y malas hierbas de hojas anchas (pimpinela falsa común, *Rotala indica*, elatinacea de tallo largo, *Ammannia multiflora* Roxb, *Dopatrium junceum* Hamilt. etc.) y se vertió agua hasta una altura de aproximadamente 2-3 cm.

Cinco días después del trasplante del arroz, se aplicó a la superficie del agua una solución de cada compuesto activo preparado de acuerdo con el método de preparación mencionado anteriormente. El efecto herbicida se examinó el día después de 3 semanas de tratamiento, período durante el cual se mantenía la altura del agua de 3 cm. El efecto herbicida se valoró como 100% en el caso de la destrucción completa y como 0% en el caso de ausencia de efecto herbicida.

Como resultado, los compuestos de la presente invención N° 27, 30, 32 y 36 mostraban en la cantidad química de 0,25 kg/ha un efecto herbicida suficiente contra malas hierbas de arrozales y mostraban seguridad para el arroz transplantado.

Ejemplo de Formulación 1 (Granulo)

Se añade agua (25 partes) a una mezcla del compuesto N° 36 de la presente invención (10 partes), bentonita (montmorillonita) (30 partes), talco (58 partes) y sal de ligninsulfonato (2 partes). Se amasa bien, se convierte en granulos de malla 10-40 mediante una granuladora de extrusión y se seca a 40-50°C para obtener granulos.

Ejemplo de Formulación 2 (Granulo)

Se ponen en un mezclador giratorio partículas minerales de arcilla que tienen una distribución del tamaño de las partículas de 0,2-2 mm (95 partes). Mientras se hace girar el compuesto N° 27 de la presente invención (5 partes) se rocía junto con un diluyente líquido, se humedece uniformemente y se seca a 40-50°C para obtener granulos.

Ejemplo de Formulación 3 (Concentrado emulsionable)

Se mezclan y se agitan para obtener una emulsión el compuesto N° 32 de la presente invención (30 partes), xileno (5 partes), polioxietilénalquil fenil éter (8 partes) y alquilbencenosulfonato cálcico (7 partes).

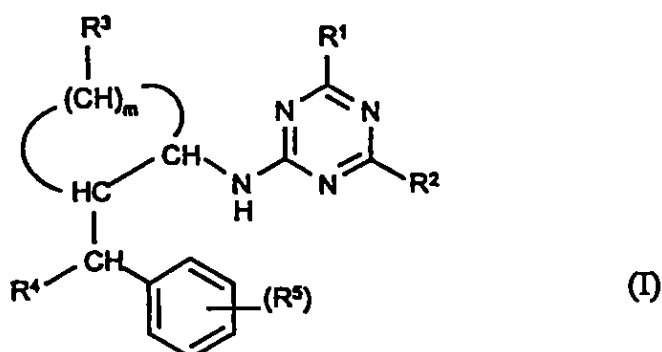
Ejemplo de Formulación 4 (Polvo humectable)

Se mezclan en forma de polvo y se convierten en un polvo humectable el

compuesto N° 30 de la presente invencion (15 partes) una mezcla de carbono blanco (polvos finos de oxido de silicio amorfo hidratado) y arcilla en polvo (1 5) (80 partes) alquilbencenosulfonato sodico (2 partes) y polimero de alquilnaftalenosulfonato sodico-formalina (3 partes)

Ejemplo de Formulacion 5 (Granulo dispersable en agua)

Se mezclan bien el compuesto N° 36 de la presente invencion (20 partes) ligninsulfonato sodico (30 partes) bentonita (15 partes) y polvo de tierra diatomácea calcinada (35 partes) se anade agua se extruyen con un tamiz de 0 3 mm y se secan para obtener granulos dispersables en agua

REIVINDICACIONES**1 Triazinas de la formula**

en la que

R^1 representa alquilo de 1 a 5 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

397 397

R^5 representa halogeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 1 a 4

R^3 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un número entero de 2 o más

n representa un número entero de 0 a 5 y

R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

2 Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el que

R^1 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 5 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono susti

tuido con alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono sustituido con fluoro o sustituido con cloro (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)amino(alquilidén de 1 a 3 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono

R^5 representa fluoro cloro bromo metilo etilo n propilo isopropilo terc butilo halo(alquilo de 1 a 3 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 3 átomos de carbono) (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 3 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 3 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con alquilo de 1 a 3 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 2-4 en donde R^3 pueden ser idénticos o diferentes

n representa un número entero de 0-4 y

R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

3 Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el que

R^1 representa metilo etilo n propilo isopropilo terc-butilo ciclopropilo clobutilo fluorometilo fluoroclorometilo fluorobromometilo fluorodiclorometilo fluorodibromometilo difluorometilo difluoroclorometilo difluorobromometilo trifluorometilo clorometilo triclorometilo bromometilo 1 fluoroetilo 2,2,2 trifluoroetilo 1,2,2,2 tetrafluoroetilo perfluoroetilo 1 cloroetilo 1,2 dicloroetilo 1 bromoetilo perfluoropropilo 1 fluoro-1 metiletilo 1 cloro-1 metiletilo 1 bromo 1 metiletilo 1 (trifluorometil) 2,2,2 trifluoroetilo bencilo que puede estar opcional

399 401

mente sustituido con fluoro o sustituido con metilo o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro o sustituido con metilo

R^2 representa amino metilamino etilamino formilamino acetilamino etil carbonilamino ciclopropilcarbonilamino fluorometilcarbonilamino trifluorometil carbonilamino 1 fluoroetilcarbonilamino perfluoroetilcarbonilamino bencilcarbo nilamino que puede estar opcionalmente sustituido con cloro o sustituido con metilo fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro sustituido con cloro sustituido con metilo o sustituido con metoxi acetoacetilamino o dimetilaminometilidenamino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un atomo de hidrogeno metilo o etilo

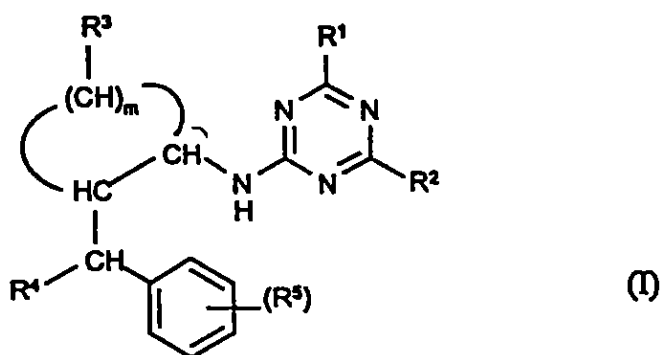
R^5 representa fluoro cloro metilo etilo trifluorometilo metoxi etoxi trifluorometoxi metiltio trifluorometiltio metilsulfinilo metilsulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con fluoro o sustituido con metilo nitro o ciano

m representa un numero entero de 3-4 en donde R^3 pueden ser identicos o diferentes

n representa un numero entero de 0 3 y

R^5 pueden ser identicos o diferentes en caso de que n represente un numero entero de 2 o 3

4 Un procedimiento para la preparacion de los compuestos de la formula (I)



en la que

R^1 representa alquilo de 1 a 5 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^5 representa halógeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono)

~~403~~

401

401

401

401

401

401



401

401



en la que

R^1 tiene la misma definición que se menciona anteriormente

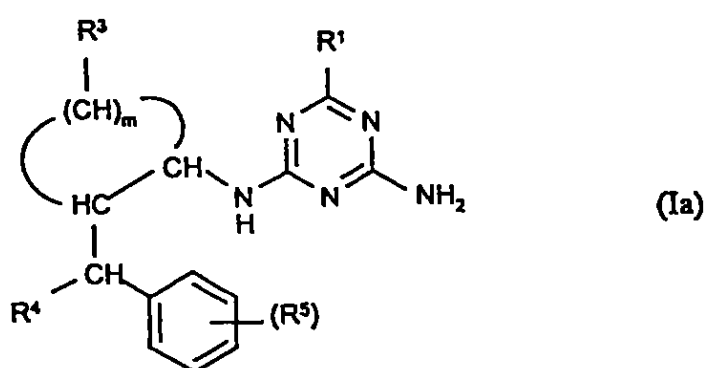
R^6 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente metilo o etilo

en presencia de disolventes inertes y si es apropiado en presencia de un agente que se une a los ácidos

o

b) en caso de que R^2 represente formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno

compuestos de la fórmula (Ia)



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan ante

riormente

se hacen reaccionar con compuestos de la formula (IV)



en la que

R^6 tiene la misma definicion que se menciona anteriormente

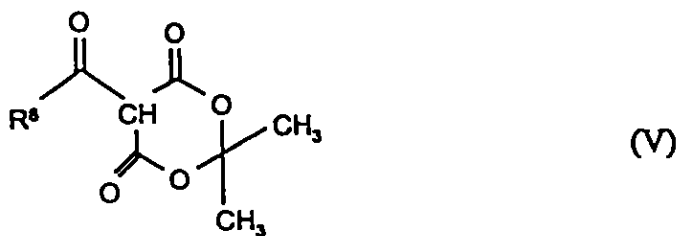
R^7 representa un atomo de hidrogeno alquilo de 1 a 4 atomos de carbono cicloalquilo de 3 a 6 atomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 atomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 atomos de carbono sustituido con alcoxí de 1 a 4 atomos de carbono o sustituido con halogeno

en presencia de disolventes inertes y si es apropiado en presencia de un agente que se une a los acidos

o

c) en caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 atomos de carbono) carbonilacetilamino

los compuestos de la formula (Ia) se hacen reaccionar con compuestos de la formula (V)



en la que

R^8 representa alquilo de 1 a 4 atomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 atomos de carbono

en presencia de disolventes inertes

o

d) en caso de que R^2 represente di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)(alquiliden de 1 a 4 átomos de carbono)amino

los compuestos de la fórmula (Ia)

se hacen reaccionar con compuestos de la fórmula (VI)



en la que

R^6 tiene la misma definición que se menciona anteriormente

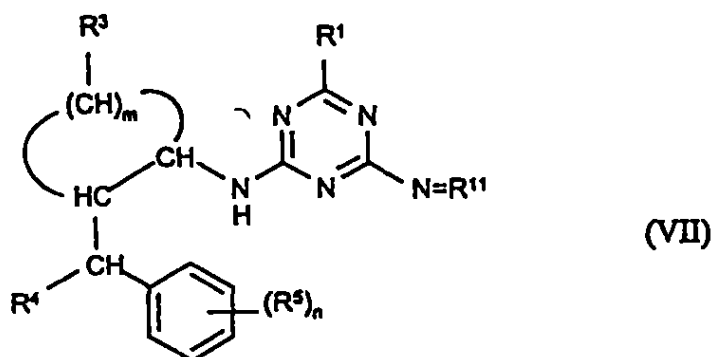
R^9 representa alquilo de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquilo de 1 a 3 átomos de carbono y

R^{10} representa un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono preferiblemente un átomo de hidrógeno metilo o etilo

en presencia de disolventes inertes y si es apropiado en presencia de un catalizador ácido

o

e) en caso de que R^2 represente (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino compuestos de la fórmula (VII)



en la que

R^1 R^3 R^4 R^5 m y n tienen las mismas definiciones que se mencionan anteriormente y

R^{11} representa alquilideno de 1 a 4 átomos de carbono preferiblemente alquilideno de 1 a 3 átomos de carbono

se reducen en presencia de disolventes inertes y en presencia de catalizador

5 Composición herbicida, caracterizada porque contiene al menos un derivado de 1,3,5 triazina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1

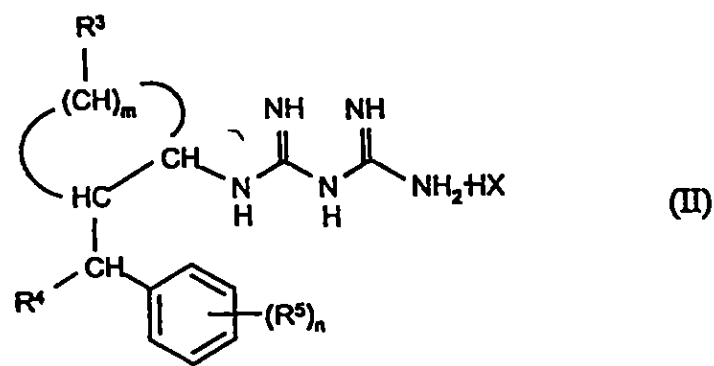
6 Procedimiento para combatir malas hierbas caracterizado porque se dejan actuar derivados de 1,3,5 triazina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 sobre malas hierbas y/o su hábitat

7 Uso de derivados de 1,3,5 triazina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 para combatir malas hierbas

8 Procedimiento para la preparación de composiciones herbicidas caracterizado porque se mezclan derivados de 1,3,5 triazina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 con extendedores y/o agentes tensioactivos

9 Sales de biguanida representadas por la fórmula

406 403

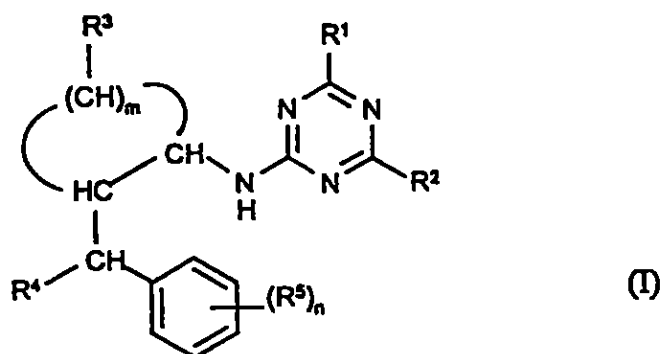


en la que

R^3 R^4 R^5 m y n tiene las mismas definiciones que se describen en la reivindicacion 1 y
 X representa un atomo de halogeno

RESUMEN

Nuevas triazinas representadas por la fórmula



en la que

R^1 representa alquilo de 1 a 5 átomos de carbono cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) bencilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

R^2 representa amino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino formilamino (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino (cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono)carbonilamino halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilamino bencilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenilcarbonilamino que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido con alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o sustituido con halógeno (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilacetilamino o di(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)amino(alquilideno de 1 a 4 átomos de carbono)amino

R^3 o R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

408 410

R^5 representa halogeno alquilo de 1 a 4 átomos de carbono halo(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono) alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono halo(alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono) (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio halo(alquil de 1 a 4 átomos de carbono)tio (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfinilo (alquil de 1 a 4 átomos de carbono)sulfonilo fenilo que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono fenoxi que puede estar opcionalmente sustituido con halogeno o sustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono nitro o ciano

m representa un número entero de 1 a 4

R^3 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que m represente un número entero de 2 o más

n representa un número entero de 0 a 5 y

R^5 pueden ser idénticos o diferentes en caso de que n represente un número entero de 2 o más

y su uso como herbicidas

		FORMATO DE DIGITALIZACION RELACION DE ANEXOS		 Royal Technologies S.A. Desarrollamos Soluciones Digitales
Expediente No		00067211	No de Folios	
Item		No de unidades		
1	CD			
2	DVD			
3	REVISTA			
4	LIBRO			
5	PERIODICO			
6	DISQUETES			
7	SOBRE DE MANILA	1		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA			
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO			
10	OTROS			
Observaciones Arte final				



410

412

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

NIT 800176089 2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO		Folios 412
Radicacion	63067211 00000000	
Fecha (AMD)	2000-09-06 18 56 43	
Tramite	002 PATENTES D	1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia	2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES	

RECIBO OFICIAL DE CAJA 47 617
FECHA JULIO 31 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

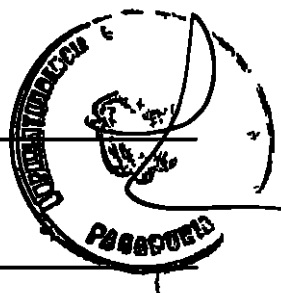
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No PAGO	Jr PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050 00110 6	2879230	24 955 500 00

***** C O N C E P T O *****

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005 01 01	SOLICITUDES	
		1 TRAMITES DE SOL DE PATENTE DE IN	608 000 00
		TOTAL	\$ 608 000 00

SON SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No

Colo 08733-861-005-8

Carrera 13 No 27 00 Pisos 5 y 10
Conmutador 334 12 21
Fax 281 31 25
Santa Fe de Bogota D C Colombia

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCION []

MODELO DE UTILIDAD []

- Nombre e identificación del Solicitante / []
- Nombre e identificación del Inventor / []
- Título o nombre de la Invención / []
- Descripción 2 []
- Reivindicaciones 398 []
- Resumen 409 []
- Comprobante de Pago 412 []
- Poder cuando proceda - []
- Copia de la primera solicitud de patente si reivindica prioridad señalándola expresamente []
- Firma del solicitante o apoderado | []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Nombre e identificación del peticionario []
- Nombre e identificación del inventor o diseñador []
- Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse []
- Representación gráfica []
- Comprobante de pago []
- Poder cuando proceda []
- Firma del solicitante o apoderado []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Firma Responsable

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación 00067211 00000000 Folios 412
 Fecha (AMD) 2000-09-06 18:56:43
 Fecha 2000-09-06 18:56:43
 Trámite 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
 Dependencia 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Carrera 13 No 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador 334 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail info@sc.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. Colombia

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PRIMER EXAMEN DE FORMA

EXPEDIENTE 00-67211

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención

SI ☒ NO ☐ NO APLICABLE ☐ Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344 art 14-a)

SI ☒ NO ☐ NO APLICABLE ☐ Acreditó en forma correcta la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art 14-c de la Decisión 344 literal g) del art 4 del Decreto 117/94)

SI ☒ NO ☐ NO APLICABLE ☐ Presentó en forma correcta el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de Enero del 2000)

SI ☒ NO ☐ EXTEMPORANEAMENTE ☐ Reivindicó prioridad dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de Paris

SI ☒ NO ☐ NO APLICABLE ☐ Presentó copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad al momento de radicar la solicitud nacional

SI ☒ NO ☐ NO APLICABLE ☐ Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art 4 D-3 Convenio de Paris Concepto 5 de enero de 1999 SIC)

SI ☒ NO ☐ CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS

OBSERVACIONES

En consecuencia se conceptua que esta solicitud

SI ☒ NO ☐ Se ajusta a los aspectos FORMALES indicados en la Decisión 344 y por tanto

SI ☒ NO ☐ Se recomienda PUBLICAR el extracto correspondiente

Bogotá D C 7 de septiembre del 2000

EXAMINADOR JURIDICO

202022

1º EXAMEN DE FORMA

Radicación No 00-67211

Concepto Técnico No 1519

Clasificación Internacional de Patentes A01N 43/707

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención

- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8 Art.13-a)
- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13 a)
- SI ☒ NO ☐ Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e)
- SI ☒ NO ☐ Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13 b)
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c)
- SI ☐ NO ☐ Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto 117 del 94)
- SI ☒ NO ☐ Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980)
- SI ☒ NO ☐ Contiene una o más reivindicaciones en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d)
- SI ☒ NO ☐ Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto 117 /94
- SI ☒ NO ☐ Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto 117 /94
- SI ☒ NO ☐ Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P 104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto 117 /94)
- SI ☒ NO ☐ Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P 105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto 117 /94)
- SI ☒ NO ☐ CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS

OBSERVACIONES Y OTROS SI ☐ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

Bogotá, D C Sep 19/2000

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202026

Expediente 00-67211

Auto 3559

LA JEFE DE DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TENIENDO EN CUENTA

PRIMERO Que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 13 y 14 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena y los artículos 3 y 4 del Decreto 117 de 1994

SEGUNDO Que el solicitante hizo manifestación expresa pidiendo que la solicitud sea publicada a los dieciocho (18) meses contados a partir de la fecha de presentación de la solicitud esto es el día 06 de marzo del año 2002

DISPONE

ARTICULO PRIMERO Reconocer personería al doctor Emilio Ferrero como apoderado del solicitante en los términos y para los efectos del poder conferido

ARTICULO SEGUNDO Enviar el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial conforme lo establece el artículo 23 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena teniendo en cuenta la oportunidad señalada

CUMPLASE

Dado Bogotá D C a los 11 JUL, 2007

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

Bogotá D C Dic 2002 el extracto de esta solicitud fue publicado en el N 516 (de fecha 30-05-02) de la Gaceta de la Propiedad Industrial El término habil señalado por la ley expiro el 29-08-02 y SI NO X se presentaron observaciones por parte de terceros