

# 4,5,6-三取代嘧啶磺酰脲化合物的合成与除草活性

郭万成, 王美怡, 刘幸海, 李永红, 王素华, 李正名  
(南开大学元素有机化学国家重点实验室, 农药国家工程研究中心, 天津 300071)

**摘要** 合成了 19 个具有 4, 5, 6-三取代嘧啶磺酰脲化合物, 经过  $^1\text{H}$  NMR, MS 和元素分析确定了其结构。经油菜平皿法和盆栽试验测定了化合物的除草活性, 并讨论了活性规律。

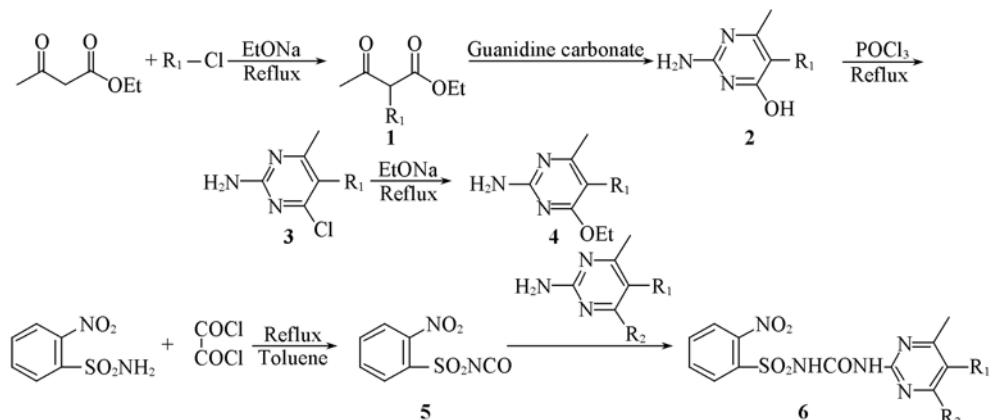
**关键词** 磺酰脲; 4,5,6-三取代嘧啶; 除草活性

**中图分类号** O626.41      **文献标识码** A      **文章编号** 0251-0790(2007)09-1666-05

1982 年, 第一个商品化的磺酰脲类除草剂——氯磺隆(Chlorsulfuron)问世。随后在全世界范围内大量的人力物力都投入到这一高效、低毒、高选择性和对环境友好的农药研究中来, 不断有新型磺酰脲类除草剂品种上市, 如 Nicosulfuron, Primisulfuron, Foramsulfuron<sup>[1~3]</sup>等。

本课题组已经合成了 700 多个新型磺酰脲类化合物, 并对其进行了室内生物活性测定, 从中筛选出具有自主知识产权的两个高活性的磺酰脲除草剂单嘧磺隆和单嘧磺酯<sup>[4,5]</sup>。Levitt<sup>[6]</sup>提出的构效规律认为, 在嘧啶杂环上必须具有两个取代基才具有很好的活性, 而这两个新化合物在嘧啶杂环上都只有单取代基, 同样具有很好的除草活性, 这是对 Levitt 构效规律的很好补充。

鉴于此, 为了更深入地研究其构效关系, 本文合成了 19 个在嘧啶环上具有 3 个取代基的磺酰脲类化合物, 并对其生物活性进行了研究。合成路线如 Scheme 1 所示。



$\text{R}_1 = n\text{-propyl, } n\text{-butyl, } n\text{-pentyl, } n\text{-heptyl, } n\text{-octyl, } \text{benzyl, } p\text{-methylbenyl, } o\text{-methylbenyl, }$   
 $o\text{-fluorobenzyl, } p\text{-methoxybenzyl, } m\text{-chlorobenzyl, } 2,4\text{-dichlorobenzyl; } \text{R}_2 = \text{Cl, OEt.}$

Scheme 1 Synthesis routes of the title compounds

## 1 实验部分

### 1.1 仪器与试剂

X-4 数字显示显微熔点测定仪(北京泰克仪器有限公司); Yanaco CHN CORDER MT-3 元素分析

收稿日期: 2007-02-11.

基金项目: 国家自然科学基金重点项目(批准号: 20432010)资助。

联系人简介: 李正名, 男, 教授, 博士生导师, 中国工程院院士, 主要从事有机化学和农药化学领域的研究。

E-mail: nkzml@nk.sina.net

仪; Bruker ACP-200MHz, Bruker Avance-300 MHz Varian Mercury Plus 400 MHz 核磁共振仪, DMSO-d<sub>6</sub> 溶剂, TMS 为内标。DABCO(1,4-二氮杂二环[2.2.2]辛烷)为美国 Aldrich 公司产品; 其余试剂均为市售分析纯或化学纯。

## 1.2 合 成

取代乙酰乙酸乙酯(**1**)按照文献[7]方法合成。

2-氨基-4-甲基-6-羟基-5-取代嘧啶(**2**)的合成: 在 30 mL 经干燥的乙醇中, 加入催化量的 TEBA 和 140 mmol 的甲醇钠, 分批加入 28 mmol 碳酸胍, 于室温搅拌 0.5 h 后, 加入 56 mmol 上述制得的取代乙酰乙酸乙酯, 加热回流 1~3 h, 停止反应, 冷却, 用浓盐酸中和, 得到化合物 **2**。

2-氨基-4-甲基-6-氯-5-取代嘧啶(**3**)参考本组内部资料合成。

2-氨基-4-甲基-6-乙氧基-5-取代嘧啶(**4**)按照文献[8]方法合成。

邻硝基苯磺酰脲(**6**)按照文献[9,10]方法合成。在 50 mL 圆底烧瓶中加入 15 mL 无水乙腈和 3.8 mmol 三取代嘧啶, 再加入化合物 **5** 的粗品 3.8 mmol, 室温过夜, 生成大量沉淀, 过滤, 并用少量乙腈洗涤, 干燥, 得目标产物 **6**。

## 1.3 除草活性测试

平皿法: 试验靶标为油菜(*Brassicanapus*), 通过黑暗条件下化合物对油菜胚根的生长抑制来检测化合物的除草活性。

盆栽法: 试验靶标为稗草(*Echinochloa Crussgalli*)、油菜(*Brassicanapus*)、马唐(*Digitaria sanguinalis Scop.*)和反枝苋(*Amaranthus retroflexus L.*), 以植株地上部鲜重抑制百分数来表示药效。

## 2 结果与讨论

化合物的物理化学常数列于表 1 和表 2。

Table 1 Physical data and elemental analysis of the title compounds

Compd.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	Yield(%)	m. p./°C	Elemental analysis(%, Calcd.)		
					C	H	N
<b>6a</b>	<i>n</i> -Propyl	Cl	51	176—178	43.31(43.53)	3.93(3.90)	16.73(16.92)
<b>6b</b>	<i>n</i> -Butyl	Cl	56	165—167	45.12(44.91)	4.23(4.24)	16.55(16.37)
<b>6c</b>	<i>n</i> -Pentyl	Cl	49	173—174	46.10(46.21)	4.55(4.56)	15.72(15.85)
<b>6d</b>	<i>n</i> -Heptyl	Cl	54	162—164	48.68(48.56)	5.35(5.15)	14.90(14.90)
<b>6e</b>	<i>n</i> -Octyl	Cl	75	167—168	49.30(49.63)	5.23(5.41)	14.61(14.47)
<b>6f</b>	Benzyl	Cl	59	193—195	49.26(49.41)	3.64(3.49)	14.89(15.16)
<b>6g</b>	<i>o</i> -Fluorobenzyl	Cl	59	179—181	47.47(47.56)	3.18(3.15)	14.88(14.59)
<b>6h</b>	<i>o</i> -Methylbenzyl	Cl	57	174—176	50.87(50.48)	3.62(3.81)	14.34(14.72)
<b>6i</b>	<i>p</i> -Methylbenzyl	Cl	63	208—209	50.61(50.48)	3.63(3.81)	15.22(14.72)
<b>6j</b>	2,4-Dichlorobenzyl	Cl	54	210—212	42.84(42.99)	2.76(2.66)	13.35(13.19)
<b>6k</b>	<i>n</i> -Butyl	EtO	74	168—170	49.26(49.42)	5.20(5.30)	16.17(16.01)
<b>6l</b>	<i>n</i> -Pentyl	EtO	68	161—162	50.31(50.54)	5.51(5.58)	15.27(15.51)
<b>6m</b>	<i>n</i> -Heptyl	EtO	63	153—154	52.61(52.60)	6.18(6.10)	14.57(14.60)
<b>6n</b>	<i>n</i> -Octyl	EtO	52	157—158	53.42(53.53)	6.19(6.33)	14.21(14.19)
<b>6o</b>	Benzyl	EtO	71	168—170	53.41(53.50)	4.41(4.49)	14.59(14.85)
<b>6p</b>	<i>m</i> -Chlorobenzyl	EtO	62	198—200	49.90(49.85)	4.09(3.98)	14.00(13.84)
<b>6q</b>	<i>o</i> -Fluorobenzyl	EtO	69	174—176	51.32(51.53)	4.34(4.12)	14.47(14.31)
<b>6r</b>	<i>p</i> -Methylbenzyl	EtO	84	181—182	54.16(54.42)	4.94(4.77)	14.56(14.42)
<b>6s</b>	<i>p</i> -Methoxybenzyl	EtO	74	175—177	52.49(52.69)	4.83(4.62)	13.96(13.96)
Contrast	H	EtO					

生物活性测定结果(表3和表4)初步表明, 5-位取代基的引入使部分具有4,5,6-三取代嘧啶磺酰脲化合物比只有4,6-二取代嘧啶磺酰脲化合物表现出了更好的除草活性。嘧啶环5-位取代基的变化对活性的影响较大, 当5-位取代基为取代苄基时的活性明显高于5-位为长链烷基的活性, 并且这些化合物的活性与嘧啶环6-位取代基也密切相关, 6-位为乙氧基时活性高于6-位为氯原子时的活性, 其中

以化合物 **6o~6s** 最为明显。总体来看，在嘧啶环其它取代基不变的情况下，5-位取代基的增加对除草活性影响较大，仅有部分可以保持活性。

**Table 2**  $^1\text{H}$  NMR and MS data of the title compounds

Compd.	MS( $[\text{M} - \text{H}]$ , $m/z$ )	$^1\text{H}$ NMR, $\delta$ (DMSO-d <sub>6</sub> )
<b>6a</b>	412	0.92(t, $J = 7.2$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.45(m, 2H, CH <sub>2</sub> ), 2.29(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.46(t, $J = 7.8$ Hz, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 7.83—7.90(m, 2H, Ar—H), 7.95(d, $J = 6.9$ Hz, 1H, Ar—H), 8.06(d, $J = 6.9$ Hz, 1H, Ar—H), 6.77(s, 2H, 2NH)
<b>6b</b>	426	0.91(t, $J = 6.9$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.37(m, 4H, 2CH <sub>2</sub> ), 2.29(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.49(s, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 7.82—7.90(m, 2H, Ar—H), 7.95(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H), 8.06(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H), 6.77(s, 2H, 2NH)
<b>6c</b>	440	0.88(t, $J = 6.3$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.31—1.51(m, 6H, 3CH <sub>2</sub> ), 2.56(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.67(t, $J = 7.8$ Hz, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 7.85(m, 2H, Ar—H), 8.07(m, 1H, Ar—H), 8.27(m, 1H, Ar—H), 10.92(s, 1H, NH), 12.96(s, 1H, NH)
<b>6d</b>	468	0.86(t, $J = 7.2$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.26—1.41(m, 10H, 5CH <sub>2</sub> ), 2.29(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.47(s, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 7.80—7.89(m, 2H, Ar—H), 7.95(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H), 8.06(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H), 6.77(s, 2H, 2NH)
<b>6e</b>	482	0.89(t, $J = 6.8$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.28—1.57(m, 12H, 6CH <sub>2</sub> ), 2.65(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.70(t, $J = 8.0$ Hz, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 7.80(m, 3H, Ar—H), 8.46(t, 1H, Ar—H), 13.10(s, 1H, NH)
<b>6f</b>	460	2.20(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 3.96(s, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 7.10(d, $J = 7.6$ Hz, 2H, Ar’—H), 7.19(t, $J = 6.8$ Hz, 1H, Ar’—H), 7.29(d, $J = 7.6$ Hz, 2H, Ar’—H), 7.83—7.89(m, 2H, Ar—H), 7.96(d, $J = 7.6$ Hz, 1H, Ar—H), 8.06(d, $J = 7.6$ Hz, 1H, Ar—H), 6.89(s, 2H, 2NH)
<b>6g</b>	478	2.21(s, 3H, Ar—CH <sub>3</sub> ), 3.94(s, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 6.93(m, 2H, Ar’—H), 7.11(m, 1H, Ar’—H), 7.26(m, 1H, Ar’—H), 7.80—7.90(m, 2H, Ar—H), 7.95(d, $J = 4.5$ Hz, 1H, Ar—H), 8.06(d, $J = 4.5$ Hz, 1H, Ar—H)
<b>6h</b>	474	2.14(s, 3H, Ar—CH <sub>3</sub> ), 2.35(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 3.85(s, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 7.04—7.13(m, 2H, Ar’—H), 7.21(m, 1H, Ar’—H), 7.34(m, 1H, Ar’—H), 7.81—7.89(m, 2H, Ar—H), 7.95(d, $J = 7.6$ Hz, 1H, Ar—H), 8.06(d, $J = 7.6$ Hz, 1H, Ar—H), 6.89(s, 2H, 2NH)
<b>6i</b>	474	2.17(s, 3H, Ar—CH <sub>3</sub> ), 2.22(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 3.87(s, 2H, Het—CH <sub>2</sub> ), 6.95(d, $J = 8.0$ Hz, 2H, Ar’—H), 7.06(d, $J = 8.0$ Hz, 2H, Ar’—H), 7.78—7.87(m, 2H, Ar—H), 7.93(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H), 8.03(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H), 6.85(s, 2H, 2NH)
<b>6j</b>	530	2.45(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 4.13(s, 2H, CH <sub>2</sub> ), 6.89(d, $J = 8.4$ Hz, 1H, Ar—H), 7.31(d, $J = 8.4$ Hz, 1H, Ar—H), 7.70(m, 1H, Ar—H), 7.99(m, 2H, Ar—H), 8.10(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H), 8.28(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H), 11.04(s, 1H, NH)
<b>6k</b>	436	0.93(t, $J = 6.8$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.38(t, $J = 6.8$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.33—1.45(m, 4H, 2CH <sub>2</sub> ), 2.49(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.51(t, $J = 8.2$ Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.36(q, $J = 6.8$ Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 7.76(t, 3H, Ar’—H), 8.46(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar—H)
<b>6l</b>	450	0.86(t, $J = 6.8$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.26—1.29(m, 4H, 2CH <sub>2</sub> ), 1.32(t, $J = 6.8$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.42(t, $J = 6.8$ Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 2.43(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.47(t, $J = 6.8$ Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.41(q, $J = 6.8$ Hz, 2H, OCH <sub>2</sub> ), 7.84—7.92(m, 3H, Ar—H), 8.18(t, 1H, Ar—H), 10.86(s, 1H, NH)
<b>6m</b>	478	0.89(t, $J = 6.9$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.29(m, 10H, 5CH <sub>2</sub> ), 1.39(t, $J = 6.9$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 2.49(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.51(t, $J = 7.5$ Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.38(t, $J = 6.9$ Hz, 2H, OCH <sub>2</sub> ), 7.21(s, 1H, NH), 7.77(m, 3H, Ar—H), 8.47(m, 1H, Ar—H), 14.03(s, 1H, NH)
<b>6n</b>	492	0.88(t, $J = 6.9$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 1.30(m, 12H, 6CH <sub>2</sub> ), 1.39(t, $J = 6.9$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 2.49(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 2.51(t, $J = 7.5$ Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.38(t, $J = 6.9$ Hz, 2H, OCH <sub>2</sub> ), 7.19(s, 1H, NH), 7.77(m, 3H, Ar—H), 8.47(m, 1H, Ar—H), 14.02(s, 1H, NH)
<b>6o</b>	470	1.28(t, $J = 6.8$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 2.43(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 3.89(s, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.40(q, $J = 6.8$ Hz, 2H, OCH <sub>2</sub> ), 7.18(t, 3H, Ar’—H), 7.28(t, 2H, Ar’—H), 7.91(d, 3H, Ar—H), 8.20(t, 1H, Ar—H), 10.89(s, 1H, NH)
<b>6p</b>	504	1.26(t, $J = 6.8$ Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 2.43(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 3.90(s, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.39(q, $J = 6.8$ Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 7.13(d, $J = 7.2$ Hz, 1H, Ar’—H), 7.29(m, 1H, Ar’—H), 7.87—7.95(m, 1H, Ar—H), 8.20(m, 1H, Ar—H)

Continued

Compd.	MS( [ M - H ] , m/z )	<sup>1</sup> H NMR, δ(DMSO-d <sub>6</sub> )
<b>6q</b>	488	1.34(t, J = 7.2 Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 2.51(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 3.92(s, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.36(q, J = 7.2 Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 6.98—7.07(m, 3H, Ar'—H), 7.17—7.22(m, 2H, Ar'—H), 7.76—7.79(m, 3H, Ar—H), 8.46(m, 1H, Ar—H)
<b>6r</b>	484	1.28(t, J = 6.8 Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 2.24(s, 3H, Ar'—CH <sub>3</sub> ), 2.41(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 3.83(s, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.39(q, J = 6.8 Hz, 2H, OCH <sub>2</sub> ), 7.04(d, J = 7.6 Hz, 2H, Ar'—H), 7.07(d, J = 7.6 Hz, 2H, Ar'—H), 7.86—7.95(m, 3H, Ar—H), 8.19(t, 1H, Ar—H), 10.86(s, 2H, 2NH)
<b>6s</b>	500	1.37(t, J = 6.4 Hz, 3H, CH <sub>3</sub> ), 2.50(s, 3H, Het—CH <sub>3</sub> ), 3.78(s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 3.84(s, 2H, CH <sub>2</sub> ), 4.38(q, J = 6.4 Hz, 2H, CH <sub>2</sub> ), 6.81(d, J = 8.4 Hz, 1H, Ar'—H), 7.06(d, J = 8.4 Hz, 1H, Ar'—H), 7.70(m, 1H, Ar—H), 7.75—7.79(m, 3H, Ar—H), 8.47(m, 1H, Ar—H)

**Table 3** Herbicidal activities of the compounds against rape root test( %, inhibition)

Compd.	100 μg/mL	10 μg/mL	1 μg/mL	Compd.	100 μg/mL	10 μg/mL	1 μg/mL
<b>6a</b>	72.6	69.3	51.9	<b>6k</b>	72.6	69.7	53.4
<b>6b</b>	81.4	58.5	14.0	<b>6l</b>	77.6	76.7	71.0
<b>6c</b>	87.9	49.5	20.4	<b>6m</b>	78.9	61.9	25.3
<b>6d</b>	49.0	17.1	0	<b>6n</b>	0	0	0
<b>6e</b>	70.9	56.0	20.2	<b>6o</b>	71.6	69.1	68.3
<b>6f</b>	88.5	71.8	38.5	<b>6p</b>	76.7	75.8	70.1
<b>6g</b>	87.7	73.9	56.8	<b>6q</b>	76.7	72.0	70.9
<b>6h</b>	94.9	56.2	17.5	<b>6r</b>	78.3	76.1	71.0
<b>6i</b>	65.0	57.0	10.1	<b>6s</b>	79.8	77.7	74.6
<b>6j</b>	80.8	70.1	66.6	Contrast	80.8	76.1	72.6

**Table 4** Inhibitory rate( % ) of the compounds against herbs at 1.5 kg/ha

Compd.	<i>Echinochloa Crusgalli</i>		<i>Brassicanapus</i>		<i>Digitaria sanguinalis</i>		<i>Scop.</i>		<i>Amaranthus retroflexus L.</i>	
	Soil	Foliage	Soil	Foliage	Soil	Foliage	Soil	Foliage	Soil	Foliage
<b>6a</b>	39.0	35.8	0	45.7	0	27.8	26.5	0	0	0
<b>6b</b>	44.4	59.6	0	55.4	3.7	26.3	46.9	11.7	0	0
<b>6c</b>	41.7	46.1	0	39.8	11.1	36.8	0	0	0	0
<b>6d</b>	38.1	31.6	0	13.1	0	20.3	2.0	0	0	0
<b>6e</b>	46.6	28.0	0	28.1	0	9.8	2.0	0	0	0
<b>6f</b>	37.2	49.7	0	46.5	0	18.8	34.7	31.5	0	0
<b>6g</b>	38.6	45.1	0	55.6	9.3	29.3	34.1	27.9	0	0
<b>6h</b>	46.2	30.6	0	47.1	0	0	18.4	12.3	0	0
<b>6i</b>	44.8	18.1	0	40.4	7.4	11.3	22.4	4.5	0	0
<b>6j</b>	46.2	25.4	0	45.3	5.6	23.3	0	44.3	0	0
<b>6k</b>	43.5	13.0	0	39.6	0	5.3	37.8	17.1	0	0
<b>6l</b>	39.0	21.8	0	45.7	1.9	27.8	6.1	41.7	0	0
<b>6m</b>	39.0	35.8	0	44.6	0	5.3	0	0	0	0
<b>6n</b>	45.3	12.4	0	36.8	13.0	24.8	14.3	4.5	0	0
<b>6o</b>	45.3	9.8	0	61.2	27.9	14.3	26.5	100.0	0	0
<b>6p</b>	46.2	36.3	50.8	86.3	22.2	33.8	70.1	100.0	0	0
<b>6q</b>	39.0	44.6	12.4	57.0	0	35.3	49.2	100.0	0	0
<b>6r</b>	38.6	29.5	66.1	80.8	1.9	29.3	67.3	100.0	0	0
<b>6s</b>	46.2	17.1	74.6	78.6	25.9	3.8	65.3	100.0	0	0
Contrast	83.4	86.5	74.6	96.0	68.3	60.9	100.0	100.0	0	0

## 参 考 文 献

- [ 1 ] Russell M. H., Saladini J. L., Lichtner F. . Pesticide Outlook[J], 2002, **8**: 166—173
- [ 2 ] LIU Chang-Ling(刘长令), LI Ji-De(李继德). Pesticides(农药)[J], 1999, **38**(8): 40—43
- [ 3 ] LIU Chang-Ling(刘长令). Fine and Speciality Chemicals(精细与专用化学品)[J], 2000, (6): 3—6
- [ 4 ] LI Zheng-Ming(李正名), JIA Guo-Feng(贾国峰), WANG Ling-Xiu(王玲秀), et al.. Composite for Preventing and Killing Weeds in the Corn Field, CN1080116A[P], 1994
- [ 5 ] LI Zheng-Ming(李正名), JIA Guo-Feng(贾国峰), WANG Ling-Xiu(王玲秀), et al.. Novel Sulfonylurea Herbicides, CN1106393

- [P], 1995
- [6] Levitt G. . Synthesis and Chemistry of Agrochemicals II , ACS Symposium Series No. 443 [C] , Washington , DC: American Chemical Society, 1991 : 16—31
- [7] LIU Chang-Ling(刘长令). The Design, Synthesis and Biological Activity of Novel Benzopyran-2-one and Thiazole Derivatives[D] , Tianjin: Collage of Chemistry, Nankai University, 2005
- [8] MA Ning(马宁). Study on Synthesis, Bioactivity and Structure-activity Relationship of New Sulfonylurea Compounds[D] , Tianjin: Collage of Chemistry, Nankai University, 2004
- [9] LI Peng-Fei(李鹏飞), MA Ning(马宁), WANG Bao-Lei(王宝雷), et al. . Chem. J. Chinese Universities(高等学校化学学报)[J] , 2005, 26(8) : 1459—1462
- [10] Levitt G. , Wilmington Del. Agricultural Sulfonamides, US 4394506[P] , 1983

## Synthesis and Herbicidal Activities of Novel 4,5,6-Trisubstituted Pyrimidine Sulfonylureas

GUO Wan-Cheng, WANG Mei-Yi, LIU Xing-Hai, LI Yong-Hong, WANG Su-Hua, LI Zheng-Ming\*

(State Key Laboratory of Elemento-Organic Chemistry, National Pesticide Engineering Research Center,  
Nankai University, Tianjin 300071, China)

**Abstract** In order to develop new herbicidal active compounds and study the structure-activity relationship, nineteen new sulfonylurea compounds were synthesized. Their structures were confirmed via <sup>1</sup>H NMR, MS and elemental analysis. The preliminary herbicidal activity of these new sulfonylurea compounds was determined with rape disc assay and pot bioassay experiments. The results show that most of the sulfonylureas consisting of 4,5,6-trisubstituted pyrimidines displayed a herbicidal activity at 1.5 kg/ha.

**Keywords** Sulfonylurea; 4,5,6-Trisubstituted pyrimidine; Herbicidal activity (Ed. : H, J, Z)

### 欢迎订阅《Chemical Research in Chinese Universities》

《Chemical Research in Chinese Universities》(《高等学校化学研究》, 英文版, 双月刊)是中华人民共和国教育部委托吉林大学主办的化学学科综合性学术刊物, 1984年创刊。本刊以研究论文、研究快报、研究简报和综合评述等栏目集中报道我国高等院校和中国科学院各研究所在化学学科及其交叉学科、新兴学科、边缘学科等领域所开展的基础研究、应用研究和重大开发研究所取得的最新成果。

本刊由中华人民共和国教育部从全国重点高等院校和中国科学院聘请 81 位学术造诣精深的化学家组成学术阵容强大的编委会, 由国内外著名的理论化学家唐敖庆教授任名誉主编, 著名的高分子化学家周其凤院士任主编。

本刊以“新、快、高”(即选题内容新, 文章发表速度快和学术水平及编辑出版质量高)为办刊特色, 刊载国家自然科学基金、攀登计划、“八六三”和“九七三”计划资助项目及其它科学基金资助项目成果文章达 90% 以上。从 1992 年起先后被美国科技信息研究所 (ISI) 的数据库和《SCI Expanded》、《SCI Search》、《Research Alert》、《Chemistry Citation Index》等检索刊物所收录, 从 1999 年起被《Current Contents/Physical, Chemical & Earth Science》收录, 据美国科技信息研究所期刊引证报告 (JCR) 公布的文献计量学数据, 本刊影响因子 2001 年为 0.223, 2002 年为 0.229, 2003 年为 0.370, 2004 年为 0.538, 2005 年为 0.411。刊文长期被《中国化学化工文摘》、美国《化学文摘》(C. A.)、美国《EI, Compendex》、俄罗斯《文摘杂志》(P. Z.) 和日本《科技文献速报》等中外著名检索刊物和文献数据库摘引和收录。

本刊 1992 年荣获国家教委直属高校优秀科技期刊奖, 1997 年荣获国家教委系统优秀科技期刊二等奖, 1999 年荣获国家教育部全国高等学校自然科学学报及教育部优秀科技期刊一等奖(等同于教育部科技进步一等奖), 2004 年荣获全国高校优秀科技期刊二等奖, 2006 年荣获首届中国高校精品科技期刊称号。《Chemical Research in Chinese Universities》于 2004 年由季刊扩为双月刊, 16 开本(A4), 每期 128 页, 采用微机排版, 激光照排, 80 g 胶版纸, 胶版印刷, 装帧质量高。国内定价 30 元/期(180 元/年), 国内外公开发行, 国际刊号 ISSN 1005-9040, 国内刊号 CN 22-1183/O6, 邮发代号 12-170。国内读者可在当地邮局订阅, 国外读者可通过中国国际图书贸易总公司(国外发行代号: 1533BM)订阅。补订者可与本刊编辑部联系。

2006 年开始与 Elsevier 公司合作出版发行网络版(<http://www.sciencedirect.com>)。

通讯地址: 长春市吉林大学前卫校区北区《高等学校化学学报》编辑部(邮政编码: 130021); 电话: 0431-88499216, 88499867, 88499870; 传真: 0431-88925344; E-mail: cjeu@jlu.edu.cn; <http://www.cjeu.jlu.edu.cn>