

[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int. Cl<sup>6</sup>

C07D231/20

C07D401/12 A01N 43/56

# [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 97194093.2

[43]公开日 1999年5月12日

[11]公开号 CN 1216535A

[22]申请日 97.4.25 [21]申请号 97194093.2

[30]优先权

[32]96.4.26 [33]JP [31]130879/96

[32]96.8.9 [33]JP [31]227767/96

[86]国际申请 PCT/JP97/01457 97.4.25

[87]国际公布 WO97/41106 英 97.11.6

[85]进入国家阶段日期 98.10.26

[71]申请人 石原产业株式会社

地址 日本大阪市

[72]发明人 村井重夫 菊川弘司 中山仁志

佐野真喜子

矶贝章彦

[74]专利代理机构 上海专利商标事务所

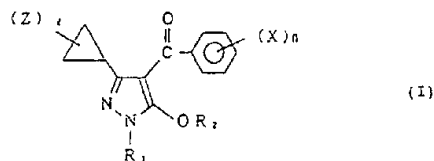
代理人 林蕴和

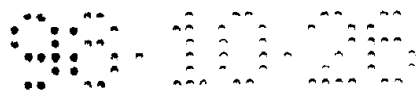
权利要求书 9 页 说明书 94 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 吡唑化合物及其制备方法以及含该化合物的除草剂

[57]摘要

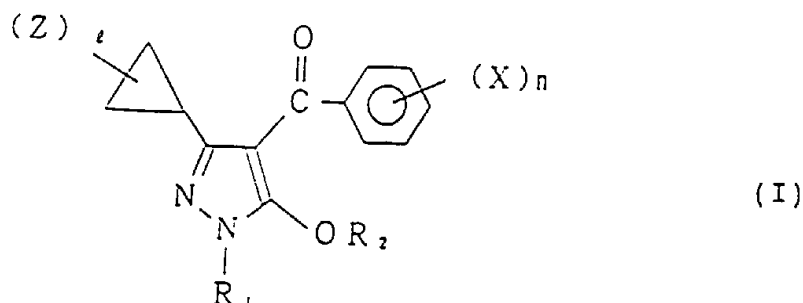
一种式(I)的吡唑化合物或其盐,其中R<sub>1</sub>是烷基, R<sub>2</sub>是氢原子、甲基、-A-R<sub>3</sub>、可被取代的苯基、可被取代的吡啶基、或被苯基取代的烯丙基,A是-SO<sub>2</sub>-、-CO-、-CH(R<sub>6</sub>)-或-CH(R<sub>7</sub>)CO-,R<sub>3</sub>是可被取代的烷基、可被取代的烯基、可被取代的炔基、可被取代的烷氧基、氰基、二烷基氨基或可被取代的苯基,R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>各自是氢原子或烷基,X是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>8</sub>)R<sub>9</sub>、-N(R<sub>10</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>、-CH<sub>2</sub>S(O)<sub>q</sub>R<sub>12</sub>或-OSO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>,R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>和R<sub>13</sub>各自是烷基,Z是烷基,1是0-5的整数,n是1-5的整数,q是0-2的整数,只要当1至少为2时,有多个Z可以相同或不同,而当n至少为2时,有多个X可以相同或不同。





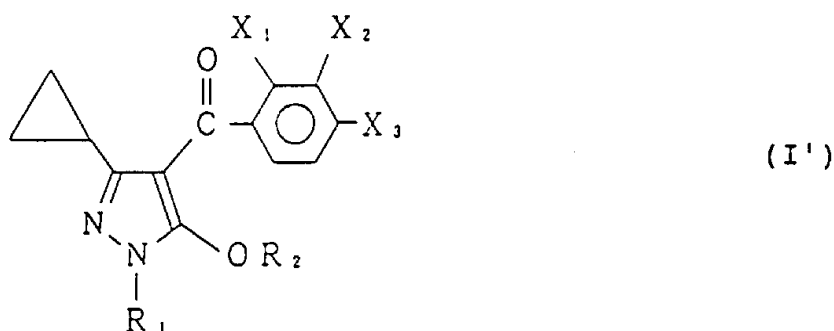
# 权 利 要 求 书

1.一种式(I)的吡唑化合物或其盐:



- 5 其中  $R_1$  是烷基,  $R_2$  是氢原子、甲基、 $-A-R_3$ 、可被取代的苯基、可被取代的吡啶基、或被苯基取代的烯丙基,  $A$  是 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CH}(R_6)-$ 或 $-\text{CH}(R_7)\text{CO}-$ ,  $R_3$  是可被取代的烷基、可被取代的烯基、可被取代的炔基、可被取代的烷氧基、氰基、二烷基氨基或可被取代的苯基,  $R_6$  和  $R_7$  各自是氢原子或烷基,  $X$  是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-\text{SO}_2\text{N}(R_8)R_9$ 、 $-\text{N}(R_{10})\text{SO}_2R_{11}$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_qR_{12}$  或 $-\text{OSO}_2R_{13}$ ,  $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自是烷基,  $Z$  是烷基,  $l$  是 0-5 的整数,  $n$  是 1-5 的整数,  $q$  是 0-2 的整数, 只要当  $l$  至少为 2 时, 多个  $Z$  可以相同或不同, 而当  $n$  至少为 2 时, 多个  $X$  可以相同或不同。

2.如权利要求 1 所述的吡唑化合物或其盐, 其特征还在于由式(I')表示式(I):



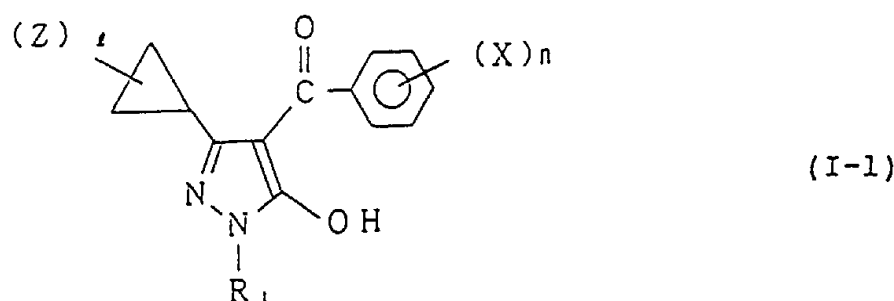
- 15 其中  $R_1$  是烷基,  $R_2$  是氢原子、或 $-A-R_3$ ,  $A$  是 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CH}_2-$ 或 $-\text{CH}_2\text{CO}-$ ,  $R_3$  是可被取代的烷基、可被取代的烯基、可被取代的炔基、氰基或可被取代的苯基,  $X^1$ 、 $X^2$  和  $X^3$  各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、 $-\text{SO}_2\text{N}(R_8)R_9$ 、 $-\text{N}(R_{10})\text{SO}_2R_{11}$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_qR_{12}$  或 $-\text{OSO}_2R_{13}$ ,  $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自是烷基,  $q$  是 0-2 的整数。
- 20



3.如权利要求2所述的吡唑化合物或其盐,其特征还在于A是-SO<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-或-CH<sub>2</sub>CO-, X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>和X<sup>3</sup>各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基或硝基。

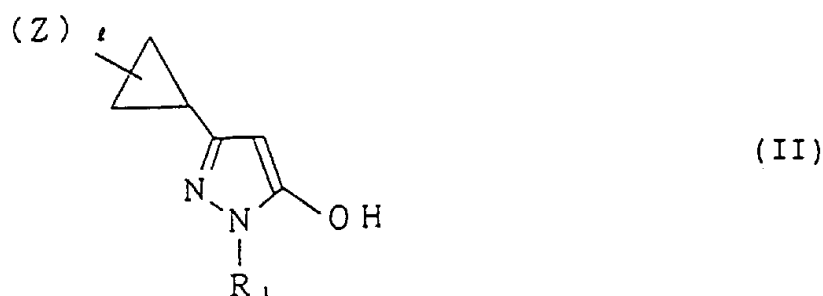
4.如权利要求3所述的吡唑化合物或其盐,其特征还在于X<sup>1</sup>是烷基硫代基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基, X<sup>2</sup>和X<sup>3</sup>各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基或硝基。

5.一种制备式(I-1)的吡唑化合物或其盐的方法,该方法包括使式(II)的化合物与式(III)的化合物反应获得式(IV)的化合物,和使式(IV)的化合物进行重排反应,式(I-1)的化合物如下,



10

式(I-1)中, R<sub>1</sub>是烷基、Z是烷基、l是0-5的整数,只要当l至少为2时,多个Z可相同或不同, X是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>8</sub>)R<sub>9</sub>、-N(R<sub>10</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>、-CH<sub>2</sub>S(O)<sub>q</sub>R<sub>12</sub>或-OSO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>, R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>和R<sub>13</sub>各自是烷基, q是  
15 0-2的整数, n是1-5的整数,只要当n至少是2时,多个X可相同或不同,式(II)的化合物如下,

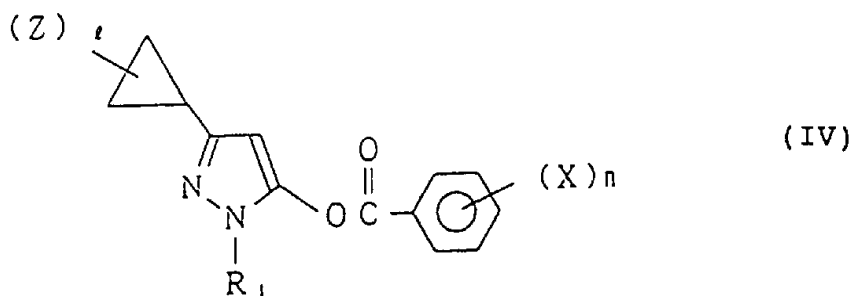


式(II)中, R<sub>1</sub>、Z和l按上述定义,式(III)化合物如下:



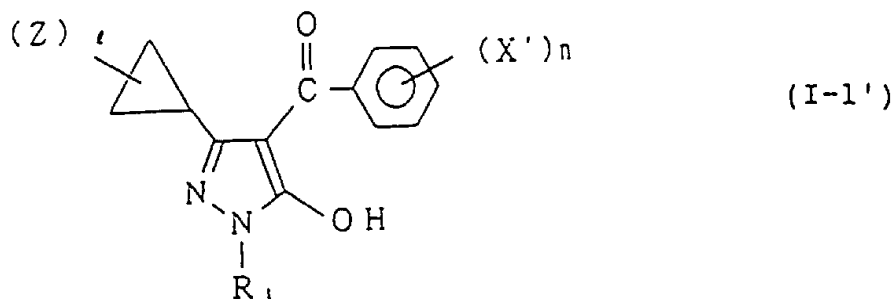


式(III)中, X和n按上述定义, Y是卤原子, 式(IV)化合物如下,

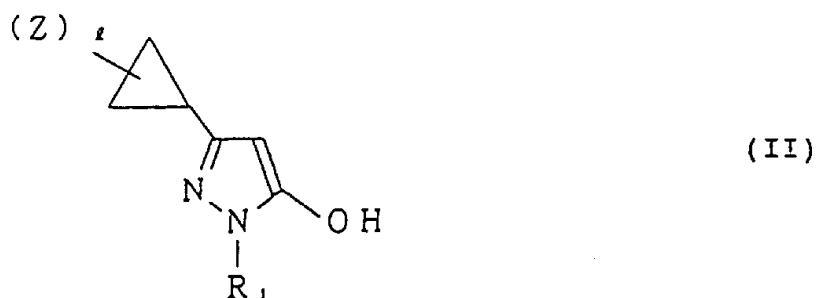


式(IV)中, R<sub>1</sub>、X、Z、l和n按上述定义.

6.一种制备式(I-1')吡唑化合物或其盐的方法, 该方法包括使式(II)的化合物与  
5 式(V)的化合物和四氯化碳反应, 随后进行水解反应, 式(I-1')的化合物如下,



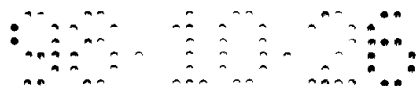
式(I-1')中, R<sub>1</sub>是烷基、Z是烷基、l是0-5的整数, 只要当l至少为2时,  
多个Z可相同或不同, X'是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫  
代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基, n是1-5的整数, 只要当n至少是2时, 多  
10 个X'可相同或不同, 式(II)的化合物如下,



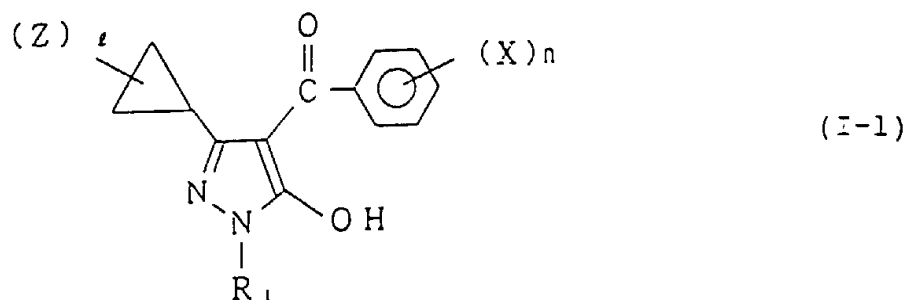
式(II)中, R<sub>1</sub>、Z和l按上述定义, 式(V)化合物如下:



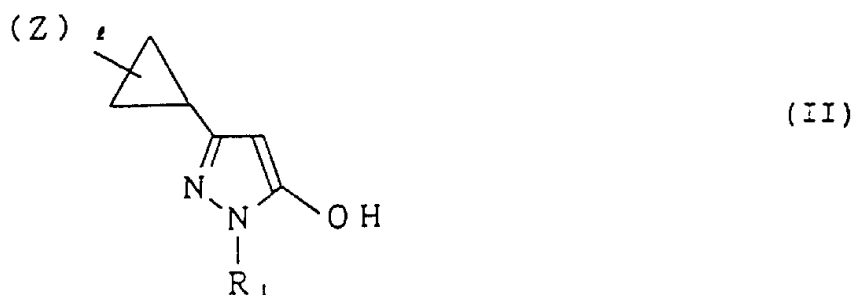
式(V)中, X'和n按上述定义.



7.一种制备式(I-1)的吡唑化合物或其盐的方法, 该方法包括使式(II)的化合物与式(VI)的化合物反应, 式(I-1)的化合物如下,

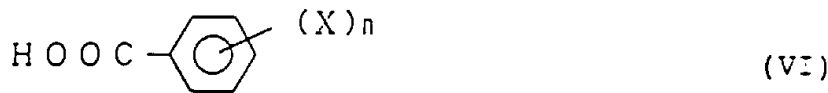


式(I-1)中,  $R_1$  是烷基、 $Z$  是烷基、 $l$  是 0-5 的整数, 只要当  $l$  至少为 2 时, 多个  $Z$  可相同或不同,  $X$  是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_8)\text{R}_9$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{10})\text{SO}_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_q\text{R}_{12}$  或  $-\text{OSO}_2\text{R}_{13}$ ,  $\text{R}_8$ 、 $\text{R}_9$ 、 $\text{R}_{10}$ 、 $\text{R}_{11}$ 、 $\text{R}_{12}$  和  $\text{R}_{13}$  各自是烷基,  $q$  是 0-2 的整数,  $n$  是 1-5 的整数, 只要当  $n$  至少是 2 时, 多个  $X$  可相同或不同, 式(II)的化合物如下,



10

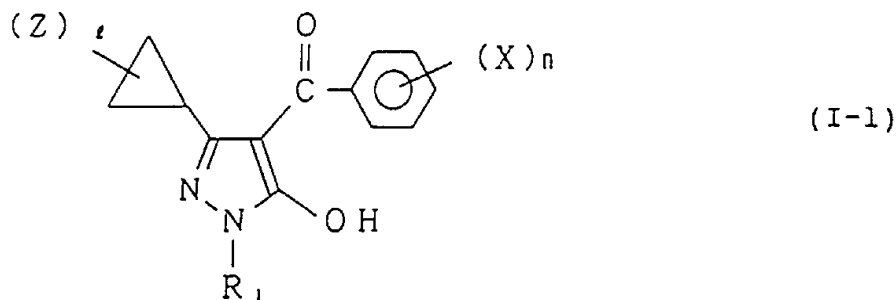
式(II)中,  $R_1$ 、 $Z$  和  $l$  按上述定义, 式(VI)化合物如下,



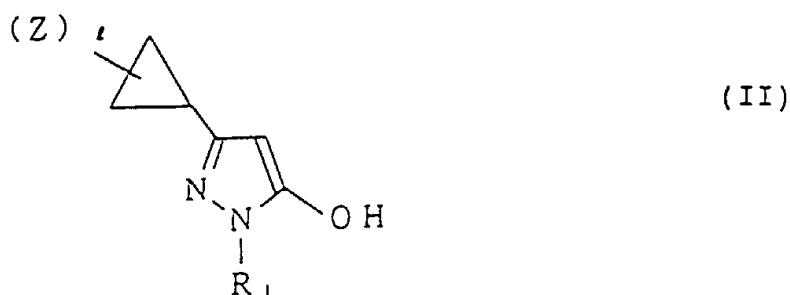
式(VI)中,  $X$  和  $n$  按上述定义。

8.一种制备式(I-1)的吡唑化合物或其盐的方法, 该方法包括使式(II)的化合物与式(X)的化合物和一氧化碳反应, 式(I-1)的化合物如下,

15



式(I-1)中， $R_1$ 是烷基、 $Z$ 是烷基、 $l$ 是0-5的整数，只要当 $l$ 至少为2时，多个 $Z$ 可相同或不同， $X$ 是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-SO_2N(R_8)R_9$ 、 $-N(R_{10})SO_2R_{11}$ 、 $-CH_2S(O)qR_{12}$ 或 $-OSO_2R_{13}$ ， $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 和 $R_{13}$ 各自是烷基， $q$ 是0-2的整数， $n$ 是1-5的整数，只要当 $n$ 至少是2时，多个 $X$ 可相同或不同，式(II)的化合物如下，



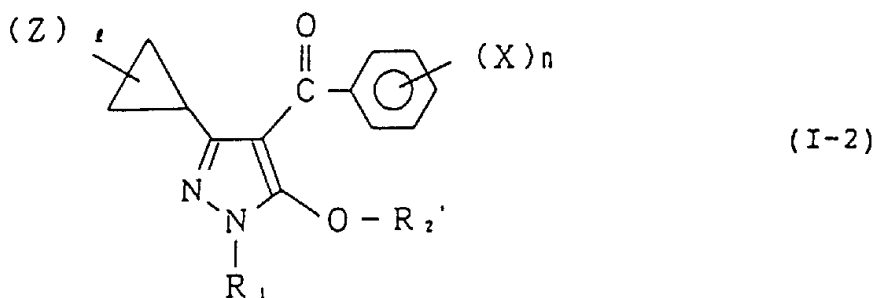
式(II)中， $R_1$ 、 $Z$ 和 $l$ 按上述定义，式(X)化合物如下，



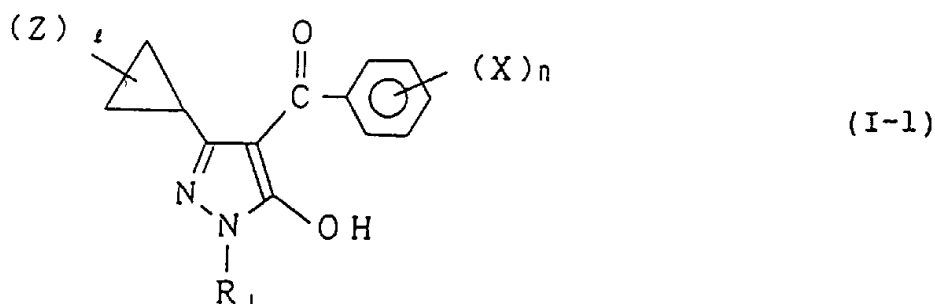
10

式(X)中， $X$ 和 $n$ 按上述定义， $T$ 是氯原子、溴原子或碘原子。

9.一种制备式(I-2)的吡唑化合物或其盐的方法，该方法包括使式(I-1)的化合物与式(VII)的化合物反应，式(I-2)的化合物如下，



式(I-2)中,  $R_1$  是烷基、 $R_2'$  是甲基、 $-A-R_3$ 、可被取代的苯基, 可被取代的吡啶基, 或被苯基取代的烯丙基,  $A$  是  $-SO_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-CH(R_6)-$  或  $-CH(R_7)CO-$ ,  $R_3$  是可被取代的烷基、可被取代的烯基、可被取代的炔基、可被取代的烷氧基、氰基、二烷基氨基或可被取代的苯基,  $R_6$  和  $R_7$  各自是氢原子或烷基,  $Z$  是烷基,  $l$  是 0-5 的整数, 只要当  $l$  至少是 2 时, 多个  $Z$  可相同或不同,  $X$  是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-SO_2N(R_8)R_9$ 、 $-N(R_{10})SO_2R_{11}$ 、 $-CH_2S(O)_qR_{12}$  或  $-OSO_2R_{13}$ ,  $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自是烷基,  $n$  是 1-5 的整数, 只要当  $n$  至少是 2 时, 多个  $X$  可相同或不同,  $q$  是 0-2 的整数, 式(I-1)的化合物如下,



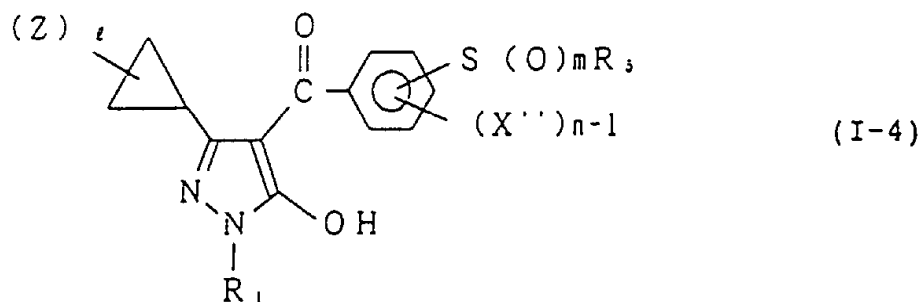
10

式(I-1)中,  $R_1$ 、 $X$ 、 $Z$ 、 $n$  和  $l$  按上述定义, 式(VII)的化合物如下,



式(VII)中,  $R_2'$  按上述定义,  $Y$  是卤原子。

10. 一种制备式(I-4)的吡唑化合物或其盐的方法, 该方法包括氧化式(VI-1)的化合物, 获得式(VI-2)的化合物, 和使式(VI-2)的化合物进行重排反应, 式(I-4)的化合物如下,

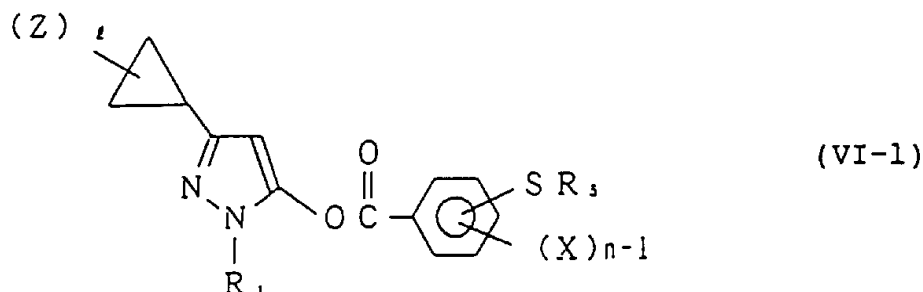


式(I-4)中,  $R_1$  和  $R_5$  各自是烷基,  $Z$  是烷基,  $l$  是 0-5 的整数, 只要当  $l$  至少是 2 时, 多个  $Z$  可相同或不同,  $X''$  是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-SO_2N(R_8)R_9$ 、 $-N(R_{10})SO_2R_{11}$ 、

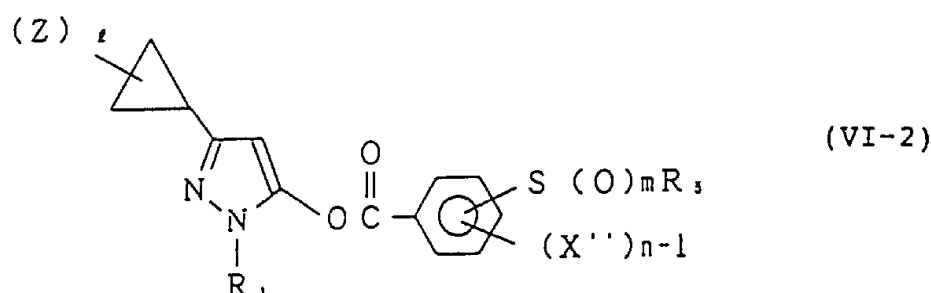
20



$-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_q\text{R}_{12}$  或  $-\text{OSO}_2\text{R}_{13}$ ,  $\text{R}_8$ 、 $\text{R}_9$ 、 $\text{R}_{10}$ 、 $\text{R}_{11}$ 、 $\text{R}_{12}$  和  $\text{R}_{13}$  各自是烷基,  $q'$  是 1 或 2,  $m$  是 1 或 2,  $n$  是 1-5 的整数, 只要当  $n$  至少是 3 时, 多个  $\text{X}''$  可相同或不同, 式(VI-1)的化合物如下,



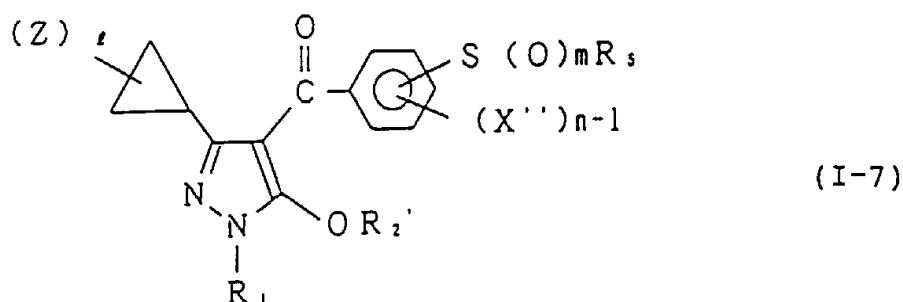
5 式(VI-1)中,  $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_5$ 、 $\text{Z}$ 、 $l$  和  $n$  按上述定义,  $\text{X}$  是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_8)\text{R}_9$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{10})\text{SO}_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_q\text{R}_{12}$  或  $-\text{OSO}_2\text{R}_{13}$ ,  $\text{R}_8$ 、 $\text{R}_9$ 、 $\text{R}_{10}$ 、 $\text{R}_{11}$ 、 $\text{R}_{12}$  和  $\text{R}_{13}$  各自是烷基, 只要当  $n$  至少是 3 时, 多个  $\text{X}''$  可相同或不同, 式(VI-2)的化合物如下,



10

式(VI-2)中,  $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_5$ 、 $\text{Z}$ 、 $\text{X}''$ 、 $l$ 、 $m$  和  $n$  按上述定义。

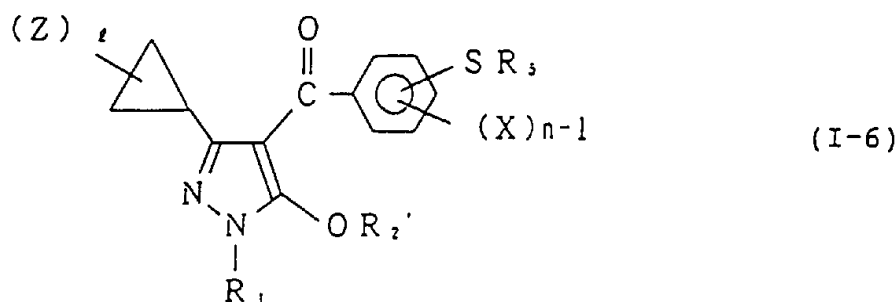
11. 一种制备式(I-7)的吡唑化合物或其盐的方法, 该方法包括氧化式(I-6)的化合物, 其中式(I-7)的化合物如下,



15 式(I-7)中,  $\text{R}_1$  和  $\text{R}_5$  各自是烷基,  $\text{R}_2'$  是甲基、 $-\text{A}-\text{R}_3$ 、可被取代的苯基、可被取代的吡啶基或被苯基取代的烯丙基,  $\text{A}$  是  $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CH}(\text{R}_6)-$ 、或



-CH(R<sub>7</sub>)CO-, R<sub>3</sub>是可被取代的烷基、可被取代的烯基、可被取代的炔基、可被取代的烷氧基、氰基、二烷基氨基或可被取代的苯基, R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>各自是氢原子或烷基, Z是烷基, l是0-5的整数, 只要当l至少是2时, 多个Z可相同或不同, m是1或2, X''是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>8</sub>)R<sub>9</sub>、-N(R<sub>10</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>、-CH<sub>2</sub>S(O)q'R<sub>12</sub>或-OSO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>, R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>和R<sub>13</sub>各自是烷基, q'是1或2, n是1-5的整数, 只要当n至少是3时, 多个X''可相同或不同, 式(I-6)的化合物如下,



式(I-6)中, R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>'、R<sub>5</sub>、Z、l和n按上述定义, X是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>8</sub>)R<sub>9</sub>、-N(R<sub>10</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>、-CH<sub>2</sub>S(O)qR<sub>12</sub>或-OSO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>, R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>和R<sub>13</sub>各自是烷基, q是0-2的整数, 只要当n至少是3时, 多个X可相同或不同。

12.一种除草剂, 它含有权利要求1所述的吡啶化合物或其盐作为活性组分。

15 13.一种控制有害杂草的方法, 该方法包括施用有效量如权利要求1所述的吡啶化合物或其盐。

14.一种控制有害杂草的方法, 该方法包括在高地施用有效量如权利要求1所述的吡啶化合物或其盐。

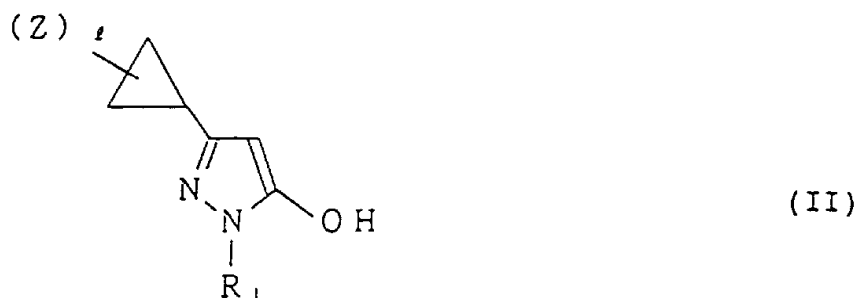
20 15.一种控制有害杂草的方法, 该方法包括在玉米田施用有效量如权利要求1所述的吡啶化合物或其盐。

16.一种控制有害杂草的方法, 该方法包括在小麦田施用有效量如权利要求1所述的吡啶化合物或其盐。

17.一种控制有害杂草的方法, 该方法包括在稻田施用有效量如权利要求1所述的吡啶化合物或其盐。

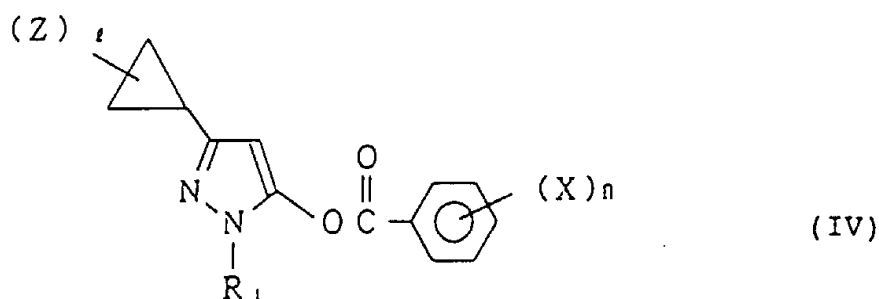
25 18.一种混合的除草剂组合物, 该组合物包括至少一种选自如权利要求1所述的吡啶化合物或其盐的物质和至少一种选自其它除草剂的活性组分。

19.一种式(II)的化合物:



其中， $R_1$  是烷基， $Z$  是烷基， $l$  是 0-5 的整数，只要当  $l$  至少是 2 时，多个  $Z$  可相同或不同。

20. 一种式(IV)的化合物:



5

其中， $R_1$  是烷基， $X$  是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_8)\text{R}_9$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{10})\text{SO}_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_q\text{R}_{12}$  或  $-\text{OSO}_2\text{R}_{13}$ ， $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自是烷基， $Z$  是烷基， $l$  是 0-5 的整数， $n$  是 1-5 的整数， $q$  是 0-2 的整数，只要当  $l$  至少是 2 时，多个  $Z$  可相同或不同，且当  $n$  至少是 2 时，多个  $X$  可相同或不同。

10



# 说明书

## 吡唑化合物及其制备方法 以及含该化合物的除草剂

5

### 技术领域

本发明涉及可用作除草剂活性组分的新颖的吡唑化合物。

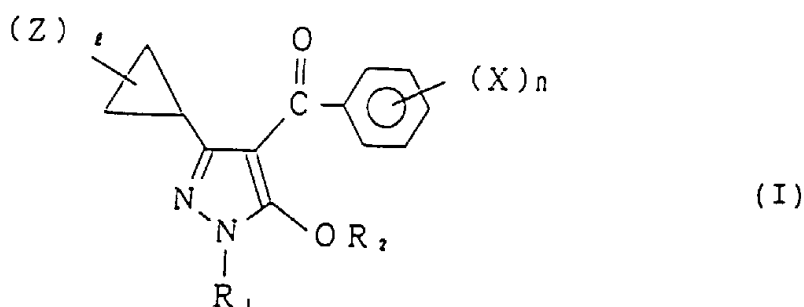
### 技术背景

10 UK 2002375A 和 EP 282944A 公开了在吡唑环 3 位有各种取代基的吡唑衍生物。但是，本发明的吡唑化合物因为在吡唑环 3 位有一个环烷基取代基而明显不同于这样的衍生物。

EP 638555A 还公开了在吡唑环 3 位和 4 位有各种取代基的吡唑乙醇酸酰胺衍生物。但是本发明的吡唑化合物由于在吡唑环 4 位有苄基取代基而明显不同于这  
15 样的衍生物。

### 本发明的描述

本发明人对吡唑化合物进行了各种研究，以找出优秀的除草剂，并因此完成了本发明。即本发明提供了式(I)的新颖吡唑化合物或其盐：



20

其中  $R_1$  是烷基， $R_2$  是氢原子、甲基、 $-A-R_3$ 、可被取代的苯基、可被取代的吡啶基、或可被苯基取代的烯丙基， $A$  是 $-SO_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-CH(R_6)-$ 或 $-CH(R_7)CO-$ ， $R_3$  是可被取代的烷基、可被取代的烯基、可被取代的炔基、可被取代的烷氧基、氰基、二烷基氨基或可被取代的苯基， $R_6$  和  $R_7$  各自是氢原子或烷基， $X$  是氢原子、  
25 卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-SO_2N(R_8)R_9$ 、 $-N(R_{10})SO_2R_{11}$ 、 $-CH_2S(O)_qR_{12}$  或 $-OSO_2R_{13}$ ，



$R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自是烷基， $Z$  是烷基， $l$  是 0-5 的整数， $q$  是 0-2 的整数，只要当  $l$  至少为 2 时，各个  $Z$  可以相同或不同，而当  $n$  至少为 2 时，各个  $X$  可以相同或不同；所述化合物的制备方法；以及含所述化合物的除草剂；对制备所述化合物有用的新颖中间体化合物。

5 现参照优选的实施方案详细描述本发明。

对  $R_1$  和  $R_3$  的烷基或烷基部分可以是  $C_{1-10}$ ，优选  $C_{1-5}$  的直链或支链的烷基，对  $R_6$  和  $R_7$  的烷基可以是  $C_{1-2}$  的烷基。对  $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$ 、 $X$  和  $Z$  的烷基或烷基部分可以是  $C_{1-4}$  的直链或支链的烷基。这些烷基或烷基部分的具体例子包括甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、叔丁基、戊基、辛基和癸基。

10 对  $R_3$  的烯基可以是  $C_{2-10}$  的直链或支链的烯基，如乙烯基、烯丙基、丁间二烯基或异丙烯基。对  $R_3$  的炔基可以是  $C_{2-10}$  的直链或支链的炔基，如乙炔基、丙炔基或 2-戊烯-4-炔基。

对可被取代的苯基或吡啶基的取代基、对  $R_2$  的取代基可以是卤素、 $C_{1-4}$  的卤代烷基或硝基。取代基数可以是 1 或更多，当该数字至少为 2 时，这样的取代基  
15 可以相同或不同。

对可被取代的烷基、可被取代的链烯基、可被取代的炔基、或可被取代的烷氧基的取代基、对  $R_3$  的取代基可以是卤素、 $C_{1-4}$  烷氧基、 $C_{1-6}$  烷氧基羰基或氰基。取代基数为 1 或更多，如果至少为 2，这样的取代基可以相同或不同。

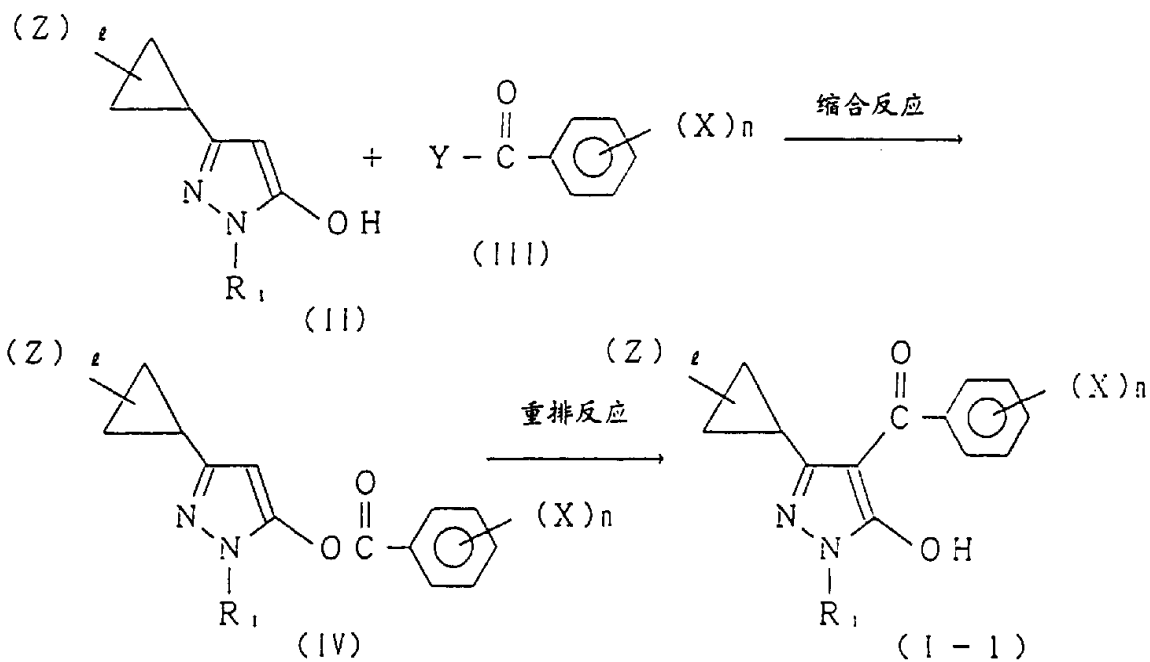
对可被取代的苯基、对  $R_3$  的取代基可以是卤素、 $C_{1-4}$  的烷基、 $C_{1-4}$  的卤代烷基、 $C_{1-4}$  烷氧基- $C_{1-4}$  烷基、 $C_{1-4}$  烷氧基、硝基或氰基。取代基的数量可以是 1 或  
20 更多，如果至少为 2，这样的取代基可以相同或不同。

对  $X$  的卤原子和在  $R_2$ 、 $R_3$  和  $X$  中所含的作为取代基的卤原子可以是氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。作为取代基的卤原子的数可以是 1 或更多，如果至少  
为 2，各个卤原子可以相同或不同。

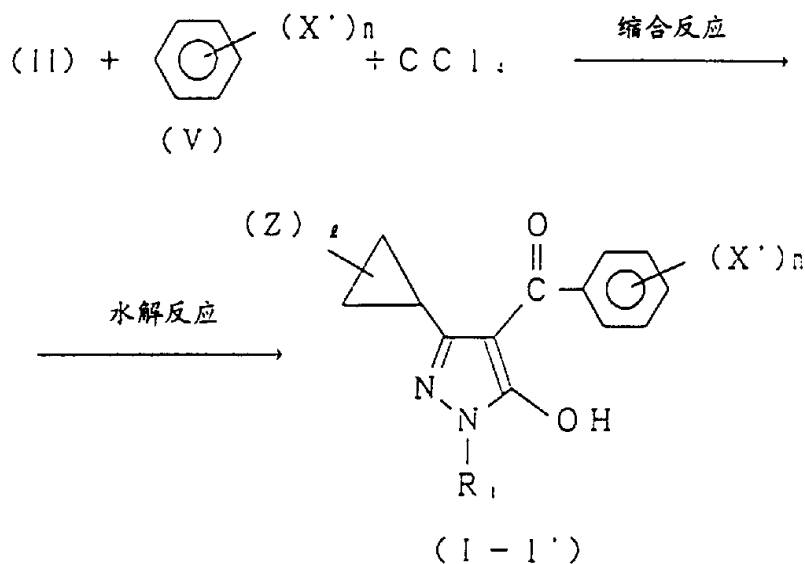
25 在式(I)的吡唑化合物中，其中  $R_2$  是氢原子的化合物能够形成盐。该盐可以是任何盐，只要它是农业可接受的，例如它可以是碱金属盐(如钠盐或钾盐)，碱土金属盐(如镁盐或钙盐)，或铵盐(如二甲胺盐或三乙胺盐)。

式(I)的吡唑化合物或其盐(后面提到的本发明的化合物)可根据下列反应(A)-(E)制备，并由常规的方法制备其盐。

(A) 当  $R_2$  是氢原子时:

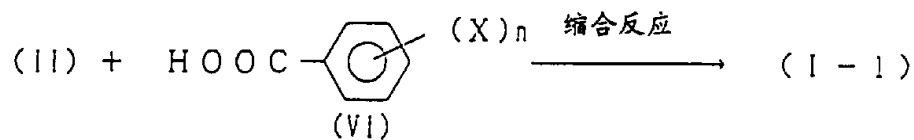


(B) 当  $R_2$  是氢原子时:



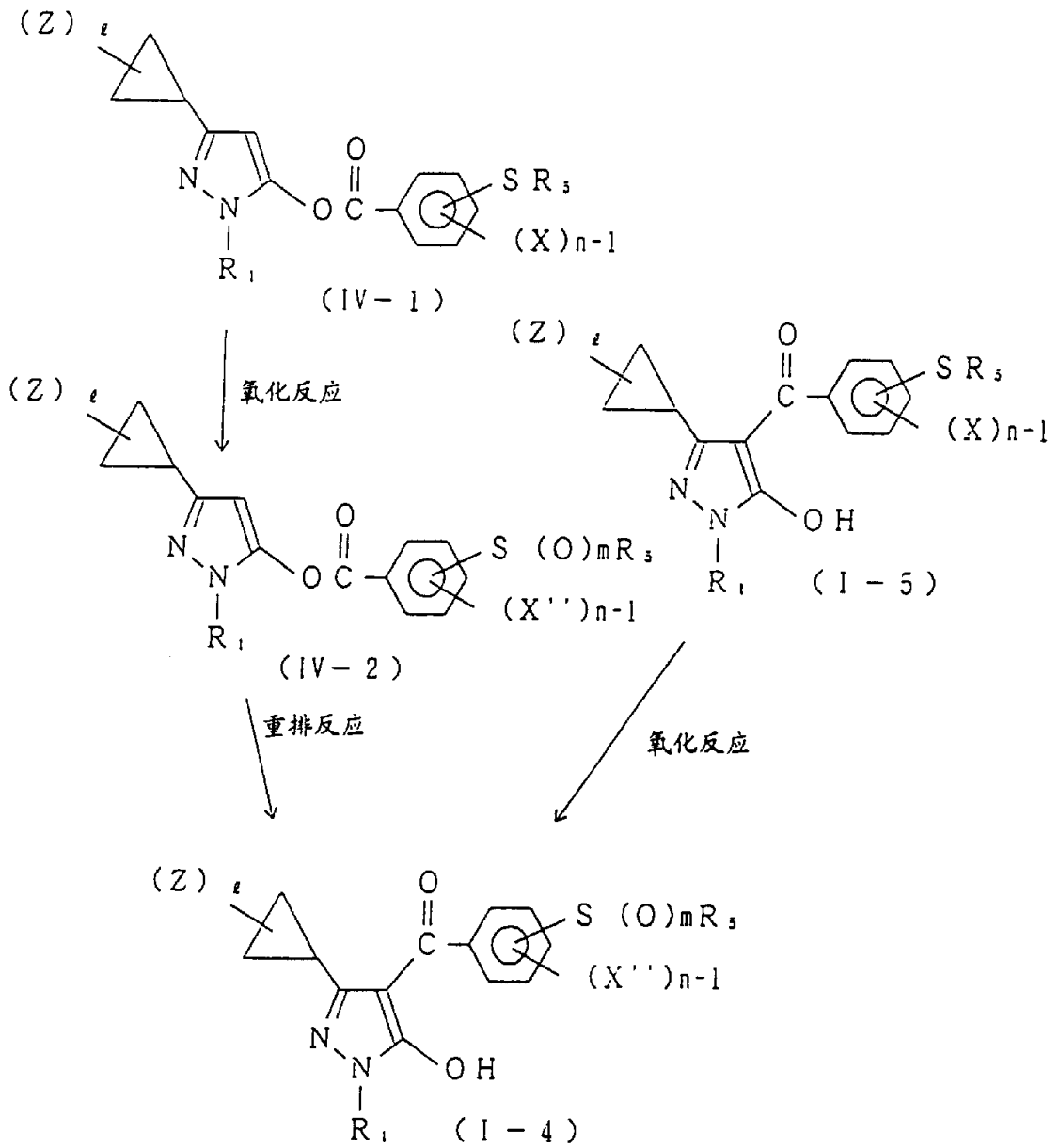
5

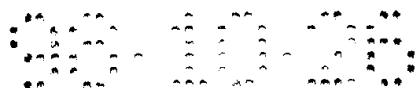
(C) 当  $R_2$  是氢原子时:



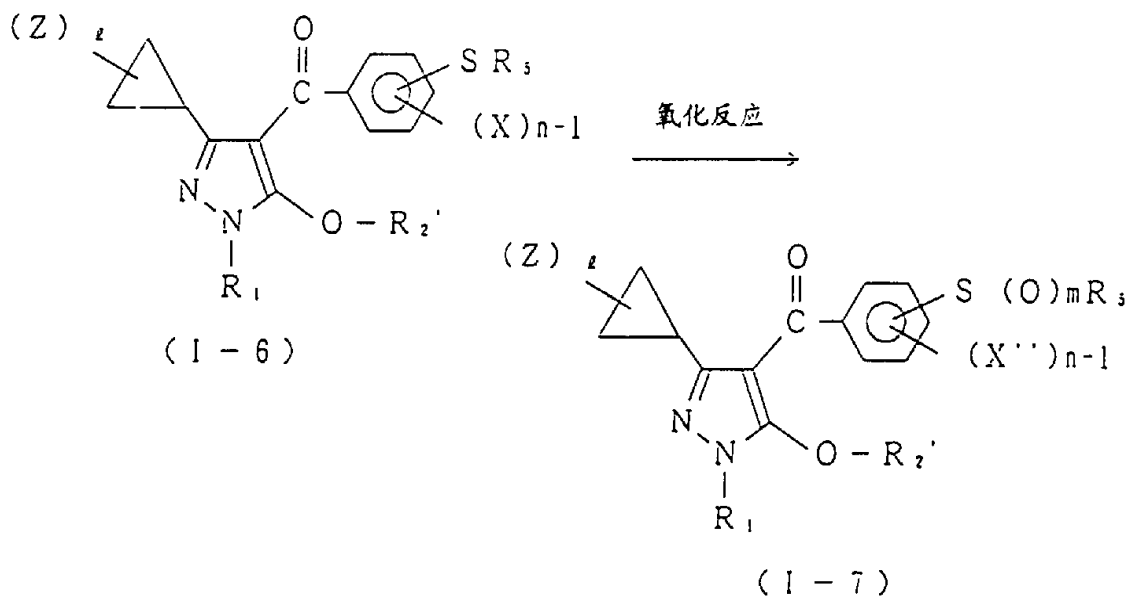


(F) 当  $R_2$  是氢原子,  $(X)_n$  含有至少一个烷基亚磺酰基或烷基磺酰基时:





(G)当  $R_2$  是除氢原子外的其它原子,  $(X)_n$  含有至少一个烷基亚磺酰基或烷基磺酰基时:



现在描述上述的反应(A)。反应(A)中,  $R_1$ 、 $X$ 、 $Z$ 、 $l$ 和 $n$ 按上述的定义,

5  $Y$  是卤原子。

如果必要,可以在碱存在下进行反应(A)中的缩合反应。作为碱,可以从碳酸盐(如碳酸钾和碳酸钠);碳酸氢盐(如碳酸氢钾和碳酸氢钠);金属氢化物(氢化钾和氢化钠);胺类(如单甲胺、二甲胺和三乙胺);和吡啶类(如吡啶和4-二甲基氨基吡啶)适当地选择一个或多个使用。

10 如果必要,还可以在溶剂存在下进行反应(A)中的缩合反应。作为这样的溶剂,可使用任何溶剂,只要该溶剂对该反应惰性,可以从芳烃(如苯、甲苯、二甲苯和氯苯);脂环烃或脂肪烃(如四氯化碳、二氯甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷和环己烷);醚类(如二噁烷、四氢呋喃和二乙醚);酯类(乙酸甲酯、乙酸乙酯);极性的质子惰性的溶剂(如二甲基亚砷、四氢噻吩砷、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶和六甲基磷酰三胺);腈类(如乙腈、丙腈和丙烯腈);酮类(丙酮和甲基乙基酮);和水中适当地选择一个或多个使用。

如果必要,还可以在相转移催化剂存在下进行反应(A)中的缩合反应。作为这样的相转移催化剂,可以从氯化苄基三乙铵、溴化苄基三乙铵、氯化四乙铵和溴化四乙铵中适当地选择一个或多个使用。

20 反应(A)中的缩合反应温度一般为  $0-250\text{ }^{\circ}\text{C}$ , 优选  $15-150\text{ }^{\circ}\text{C}$ , 反应时间一般为  $0.1-48$  小时, 优选  $0.1-24$  小时。



可通过反应(A)中的缩合反应制备的式(IV)的化合物是一种新颖的中间化合物，可用于制备本发明的化合物。

反应(A)的重排反应包括以下两个步骤：(1)重排反应步骤和(2)pH 调节步骤。一般在碱存在下进行重排步骤。作为这样的碱，可从碳酸盐(如碳酸钾和碳酸钠)和氢氧化钙中适当选择一种或多种使用。碱用量一般为每摩尔式(IV)的化合物使用 0.5-5 摩尔的碱。

如果必要，还可以在溶剂存在下进行重排反应的重排反应步骤。作为这样的溶剂，可使用任何溶剂，只要该溶剂对该反应为惰性，可从芳烃(如苯、甲苯、二甲苯和氯苯)；醚类(如二噁烷、四氢呋喃和二乙醚)；极性质子惰性溶剂(二甲基亚砷、四氢噻吩砷、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶和六甲基磷酰三胺)适当选择一种或多种使用。

优选在共沸脱水条件下进行反应(A)中的重排反应的重排反应步骤，能有效进行重排反应。这是本发明的优选实施方案之一。通过重排反应步骤，产生式(I)化合物的盐，用于制备这样的盐的方法也是本发明的实施方案之一。使该重排反应步骤获得的上述式(I)的化合物的盐，或含该盐的反应混合物与上述式(VII)的化合物在反应(D)(下面进行描述)的反应条件下反应，还可以制得上述式(I-2)的化合物。这也是本发明的实施方案之一。

重排反应步骤的反应温度一般为 50-250 °C，优选 50-150 °C，反应时间一般为 0.1-48 小时，优选 0.5-24 小时。

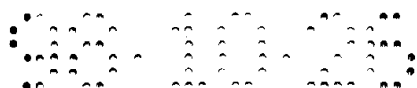
反应(A)的重排反应中的 pH 调节步骤是一在酸性物质和水存在下将 pH 值调节到最大为 7 的反应。作为这样的酸性物质，可从无机酸(如盐酸和硫酸)和有机酸(乙酸)中适当地选择一个或多个使用。

如果必要，可在溶剂存在下进行反应(A)的重排反应中的 pH 调节步骤。作为这样的溶剂，可使用任何溶剂，只要该溶剂对该反应惰性。例如，可从前面步骤的重排反应步骤中描述的那些溶剂中选择一种或多种使用。

根据常规的方法，在分离由前面的重排反应步骤获得的反应产物后可以进行反应(A)的重排反应中的 pH 调节步骤，或用在重排反应步骤获得的反应混合物在同一个锅内进行上述的 pH 调节步骤。当以一锅法进行时，可在前面重排反应步骤获得的反应混合物中加入酸性物质和水并使它们反应来进行。

pH 调节反应步骤的反应温度一般在 0-100 °C，优选 0-60 °C。

现在描述上述反应(B)。反应(B)中， $R_1$ 、Z、l、n 和(II)按上面的定义， $X'$  是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基或烷



基磺酰基、只要当  $n$  至少为 2 时，各个  $X'$  可以相同或不同。

反应(B)中的缩合反应一般在路易斯酸存在下进行。作为路易斯酸，可从如干的氯化铝和干的溴化铝中适当选择一个或多个使用。

5 如果必要，反应(B)中的缩合反应还可在溶剂存在下进行。作为这样的溶剂，可使用任何溶剂，只要该溶剂对该反应为惰性，可从卤代脂族烃，如四氯化碳、二氯甲烷、氯仿、二氯甲烷和二氯乙烷中适当选择一种或多种使用。

反应(B)中的缩合反应的反应温度一般为  $0-80\text{ }^{\circ}\text{C}$ ，反应时间一般为  $0.1-24$  小时，优选  $0.1-10$  小时。

10 反应(B)中的水解反应一般在酸性物质存在下进行。作为这样的酸性物质，可从无机酸，如盐酸和硫酸中适当选择一种或多种使用。

如果必要，反应(B)中的水解反应可以在溶剂存在下进行。作为这样的溶剂，可使用任何溶剂，只要该溶剂对该反应为惰性，可从对前面的缩合反应所述中列举的那些溶剂中适当选择一种或多种使用。

15 根据常规的方法，在分离由前面的缩合反应获得的反应产物后可以进行反应(B)中的水解反应，或用在缩合反应获得的反应混合物在一锅内进行上述的水解反应。当以一锅法进行的情况下，如果必要，可在前面缩合反应获得的反应混合物中采用后处理，如除去路易斯酸，然后加入酸性物质和水来进行反应。

反应(B)中的水解反应的反应温度一般为  $20-100\text{ }^{\circ}\text{C}$ ，反应时间一般为  $0.1-24$  小时，优选  $0.1-10$  小时。

20 现在描述上述反应(C)。反应(C)中， $X$ 、 $n$ 、(II)和(I-1)按上面的定义。

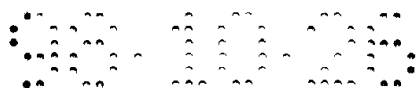
反应(C)中缩合反应一般在缩合剂和溶剂存在下进行。例如  $N,N'$ -二环己基碳化二亚胺可作为缩合剂，任何溶剂，只要它对该缩合反应为惰性都可作为这样的溶剂，可从醇类，如叔丁醇和叔戊醇中适当选择一个或多个使用。

25 如果必要，反应(C)中的缩合反应还可以在碱存在下进行。可从碳酸盐，如碳酸钾和碳酸钠中适当选择一个或多个用作这样的碱。

反应(C)中的缩合反应的反应温度一般为  $50-100\text{ }^{\circ}\text{C}$ ，反应时间一般为  $0.1-24$  小时，优选  $0.5-20$  小时。

现在描述上述反应(D)。反应(D)中， $X$ 、 $n$ 、(II)和(I-1)按上面的定义， $T$  是氯原子、溴原子或碘原子。

30 反应(D)一般在碱和金属催化剂存在下进行。作为碱，可从碱金属(如钠和钾)；烷基醇碱金属(alkali metal alkolates)(如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾)；碳酸盐(如碳酸钾和碳酸钠)；碳酸氢盐(碳酸氢钾和碳酸氢钠)；金属氢氧化物(如氢氧化钾和氢



氧化钠); 金属氢化物(如氢化钾和氢化钠); 胺类(如单甲胺、二甲胺和三乙胺); 吡啶类(吡啶、4-二甲基氨基吡啶); 和 N,N-二甲基苯胺中适当选择一种或多种作为这样的碱。过渡金属, 如钨、铑、钌或铂可作为金属催化剂。不具体限制用于与金属催化剂的金属配位的配位体, 但优选有机磷化合物, 如三苯膦或三正丁

5 膦。

如果必要, 可以在溶剂存在下进行反应(D), 可使用任何溶剂作为这样的溶剂, 只要该溶剂对该反应为惰性。例如, 可从芳烃(如苯、甲苯、二甲苯和氯苯); 脂环烃或非脂环烃(四氯化碳、二氯甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷和环己烷); 醚类(如二噁烷、四氢呋喃和二乙醚); 酯类(如乙酸甲酯和乙酸乙

10 酯); 极性的质子惰性溶剂(如二甲基亚砷、四氢噻吩砷、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶); 腈类(如乙腈、丙腈和丙烯腈); 酮类(如丙酮和甲基乙基酮); 胺类(如单甲胺、二甲胺和三乙胺); 醇类(甲醇、乙醇、丙醇和叔丁醇); 有机酸(乙酸和丙酸); 氨水; 和水中适当选择一种或多种使用。

反应(D)的反应温度一般为 30-300 °C, 优选 50-200 °C, 反应时间一般为 0.1-48

15 小时, 优选 1-24 小时。

现在描述上述反应(E)。反应(E)中,  $R_1$ 、X、Y、Z、l、n 和(I-1)按上述的定义,  $R_2'$ 是甲基、-A- $R_3$ 、可被取代的苯基、可被取代的吡啶基或可被苯基取代的烯丙基(其中的 A 和  $R_3$  按上述)。

如果必要, 可以在碱存在下进行反应(E)中的缩合反应。作为这样的碱, 可从

20 碳酸盐(如碳酸钾和碳酸钠); 碳酸氢盐(如碳酸氢钾和碳酸氢钠); 金属氢氧化物(如氢氧化钾和氢氧化钠); 金属氢化物(如氢化钾和氢化钠); 胺类(单甲胺、二甲胺和三乙胺); 吡啶(如吡啶和 4-甲基氨基吡啶)中适当选择一种或多种使用。

如果必要, 可以在溶剂存在下进行反应(E), 可使用任何溶剂作为这样的溶剂, 只要该溶剂对该反应为惰性。例如, 可从芳烃(如苯、甲苯、二甲苯和氯苯); 脂

25 环烃或非脂环烃(四氯化碳、二氯甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷和环己烷); 醚类(如二噁烷、四氢呋喃和二乙醚); 酯类(如乙酸甲酯和乙酸乙酯); 极性的质子惰性溶剂(如二甲基亚砷、四氢噻吩砷、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶); 腈类(如乙腈、丙腈和丙烯腈); 酮类(如丙酮和甲基乙基酮); 胺类(如单甲胺、二甲胺和三乙胺); 醇类(甲醇、乙醇、丙醇和叔

30 丁醇); 有机酸(乙酸和丙酸); 氨水; 和水中适当选择一种或多种使用。

如果必要, 可以在相转移催化剂和/或碘化钾存在下进行反应(E)中的缩合反应。作为这样的相转移催化剂, 可从对上述反应(A)中的缩合反应所述的那些催化



剂中适当选择一种或多种使用。

反应(E)中的缩合反应的反应温度一般为 0-200 °C，优选 15-150 °C，反应时间一般为 0.1-48 小时，优选 0.1-24 小时。

5 现在描述上述反应(F)。在反应(F)中， $R_1$ 、 $X$ 、 $Z$ 、 $l$  和  $n$  按上述定义， $R_5$  是烷基，优选  $C_{1-4}$  的烷基， $X'$  是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、烷氧基羰基、 $-SO_2N(R_8)R_9$ 、 $-N(R_{10})SO_2R_{11}$ 、 $-CH_2S(O)_qR_{12}$  或  $-OSO_2R_{13}$ ，其中的  $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  和  $R_{13}$  按上述定义， $m$  是 1 或 2， $q'$  是 1 或 2。反应(F)中，用于从(IV-1)制备(IV-2)的氧化反应以及从(I-5)制备(I-4)的氧化反应(以后简称为氧化反应)一般在氧化剂和溶剂存在下进  
10 行。作为这样的氧化剂，可从如间氯过苯甲酸和过氧化氢中适当选择一个或多个使用。可使用任何溶剂作为这样的溶剂，只要该溶剂对该反应为惰性。例如，可从对上述反应(B)中的缩合反应所述的那些溶剂中适当选择一种或多种使用。

反应(F)中的氧化反应的反应温度一般为 0-80 °C，反应时间一般为 0.1-48 小时，优选 0.1-24 小时。

15 可根据上述反应(A)中的重排反应进行反应(F)中的重排反应。

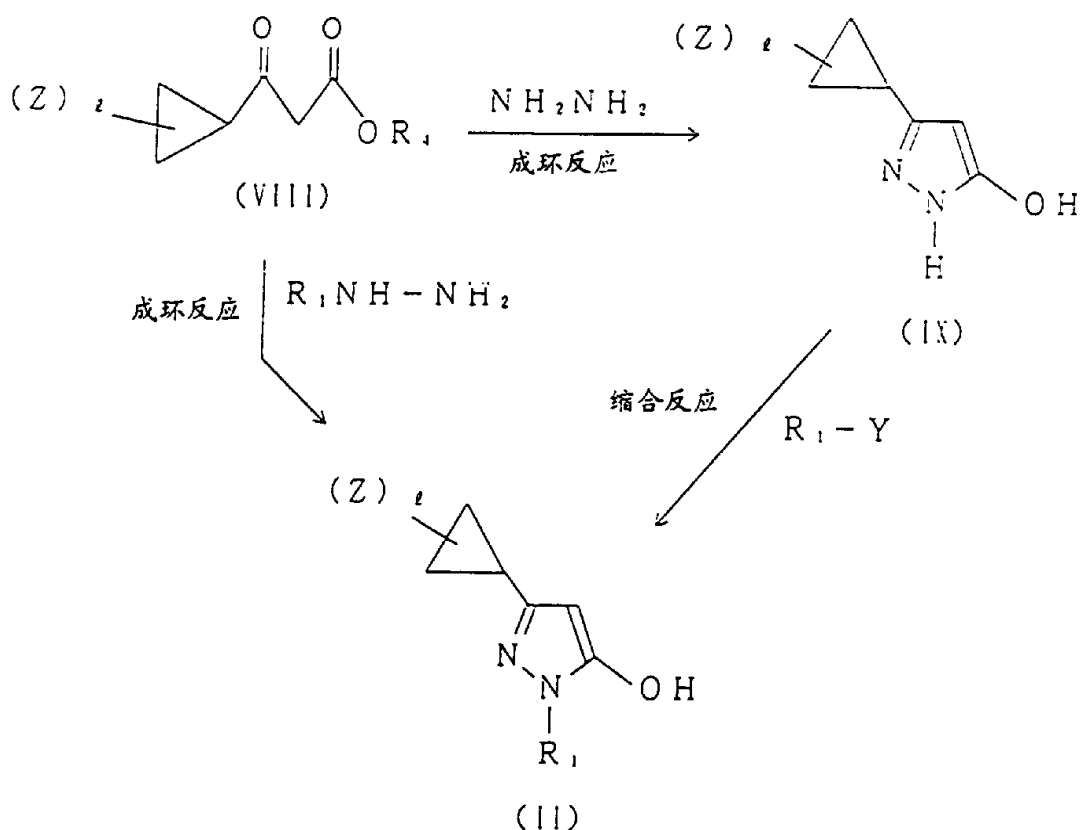
现在描述上述反应(G)。反应(G)中， $R_1$ 、 $R_2'$ 、 $R_3$ 、 $X$ 、 $X'$ 、 $Z$ 、 $l$ 、 $m$  和  $n$  按上述的定义。

根据上述反应(F)中的氧化反应进行反应(G)中的氧化反应。

上述反应(A)、(B)、(C)和(D)中的式(II)的化合物是可用于制备本发明的化合物  
20 的新颖中间体化合物，并可通过如反应(H)的方法制备。



(H)



现在描述反应(H)。反应(H)中， $R_1$ 、 $Y$ 、 $Z$ 和 $l$ 按上述定义， $R_4$ 是 $C_{1-6}$ 烷基。

- 反应(H)，如果必要可在溶剂存在下进行由(VIII)制备(II)的成环反应和由(VIII)制备(IX)的成环反应(以后简称为成环反应)。可使用任何溶剂，只要该溶剂对该反应为惰性。例如，可从芳烃(如苯、甲苯、二甲苯和氯苯)；脂环烃或非脂环烃(四氯化碳、二氯甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷和环己烷)；醚类(如二噁烷、四氢呋喃和二乙醚)；酯类(如乙酸甲酯和乙酸乙酯)；极性的质子惰性溶剂(如二甲基亚砷、四氢噻吩砷、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶)；腈类(如乙腈、丙腈和丙烯腈)；酮类(如丙酮和甲基乙基酮)；胺类(如单甲胺、二甲胺和三乙胺)；醇类(甲醇、乙醇、丙醇和叔丁醇)；有机酸(乙酸和丙酸)；氨水；和水中适当选择一种或多种使用。

如果必要，可以在共沸脱水条件下进行反应(H)中的成环反应。

- 反应(H)的成环反应的反应温度一般为 $0-200\text{ }^\circ\text{C}$ ，优选 $20-150\text{ }^\circ\text{C}$ ，反应时间一般为 $0.1-48$ 小时，优选 $0.1-24$ 小时。

一般在碱和溶剂存在下进行反应(H)中的缩合反应。作为这类碱，可从碳酸盐(如碳酸钾和碳酸钠)；金属氢化物(如氢化钾和氢化钠)中适当选择一种或多种使用。特别优选碳酸钾。



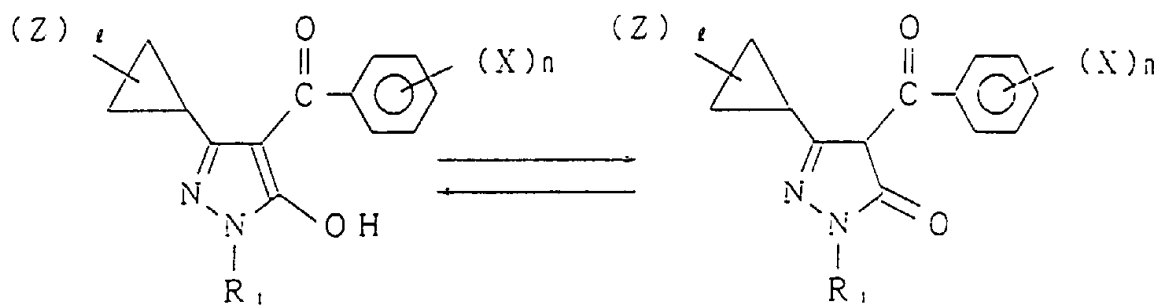
可使用任何溶剂，只要该溶剂对该反应为惰性。例如，可从醚类(如二噁烷、四氢呋喃和二乙醚)；和极性的质子惰性溶剂(如二甲基亚砷、四氢噻吩砷、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶和六甲基磷酰三胺)适当选择一种或多种使用。特别优选六甲基磷酰三胺。

5 反应(H)中的缩合反应的反应温度一般为-20℃至150℃，优选-15℃至60℃，反应时间一般为0.1-24小时，优选0.1-10小时。

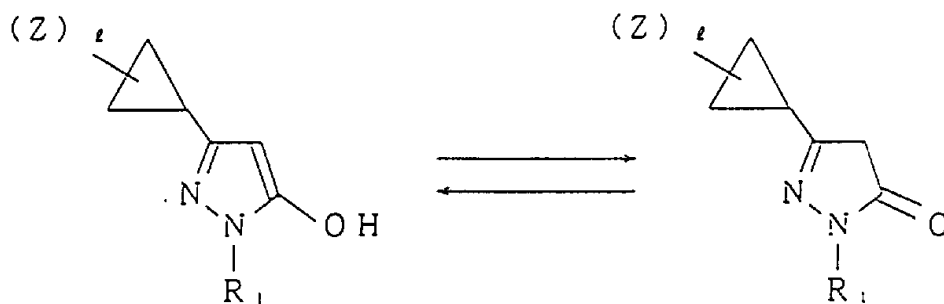
由该反应(H)中的成环反应制得的式(IX)的化合物是可用于制备本发明化合物的新颖中间体化合物。

10 本发明的化合物以及用于制备该化合物的中间体化合物有下列异构体。这些异构体(各异构体和这些异构体的混合物)都在本发明的范围内。

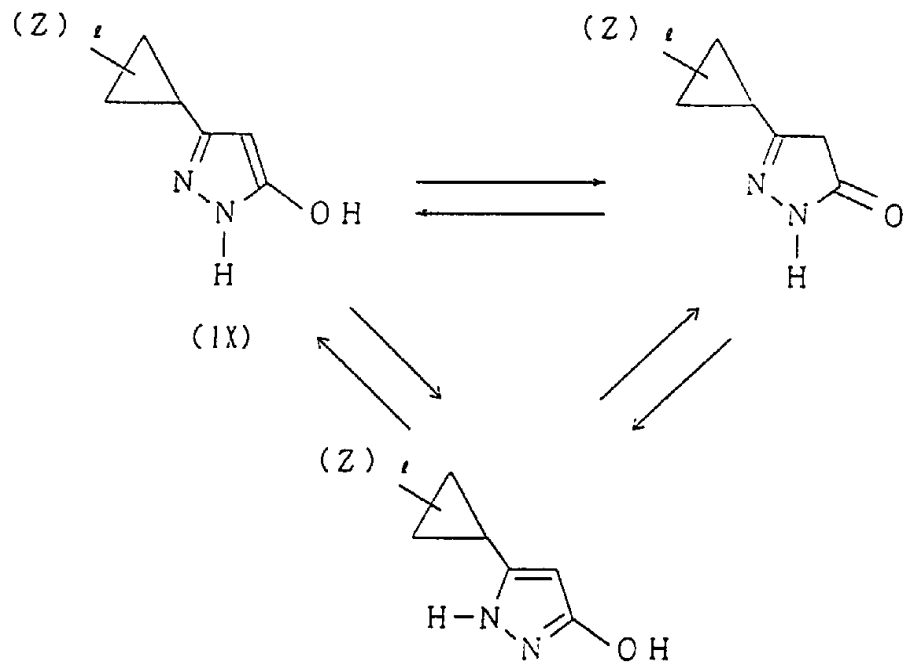
(1)由上式(I)表示的本发明的化合物中，其中R<sub>2</sub>是氢原子的化合物，以及由上式(II)和(IX)表示的中间体化合物分别具有下列互变异构体。



(I-1)

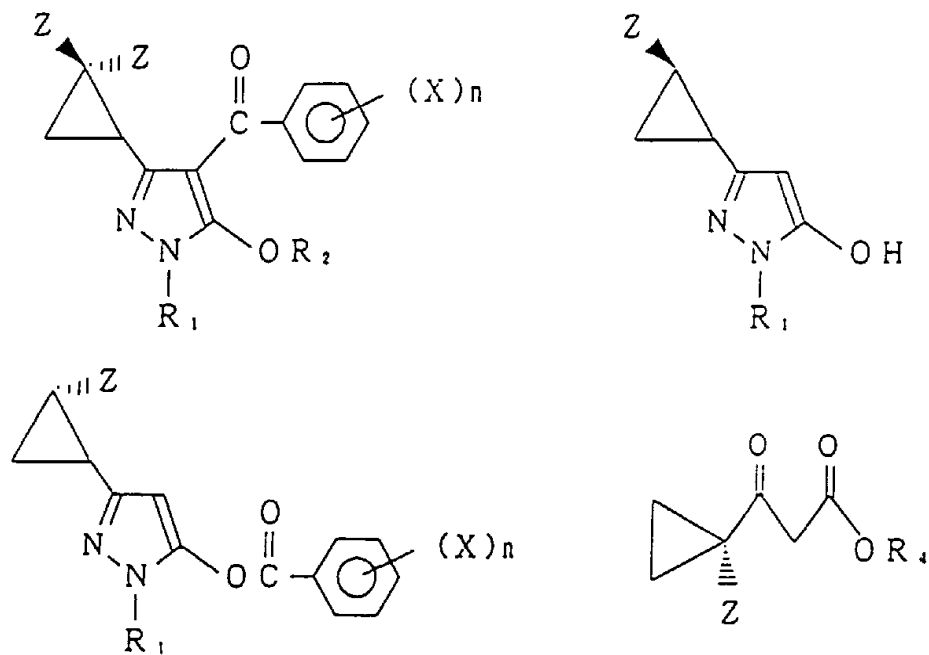


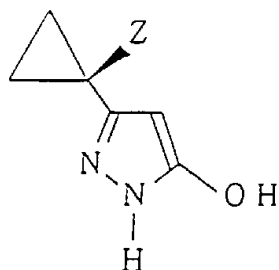
(II)



其中， $R_1$ 、 $X$ 、 $Z$ 、 $l$ 和 $n$ 按上述定义。

(2)在由上式(I)表示的本发明化合物以及由上式(II)、(IV)、(VIII)和(IX)表示的中间体化合物中， $l$ 至少为1的化合物有旋光异构体。有下列一些例子，但应理解本发明的旋光异构体不限于这些具体的例子。





其中  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 、 $X$ 、 $Z$  和  $n$  按上述定义。

在本申请的说明书中, 除非特别指出, 这样的旋光异构体指异构体的混合物(外消旋体)。

(3)由上式(I)表示的本发明化合物中, 其中  $R_2$  是  $-A-R_3$ , 并且  $R_3$  是可被取代的  
5 烯基的化合物, 具有几何异构体(E-异构体和 Z-异构体)。

本发明的化合物在用作除草剂的活性组分时显示优良的除草效果。可广泛应用于农作物土地, 如稻田、山地农场、果园和桑园, 以及非农作物土地, 如森林、农场道路、运动场和工厂。施投法可从土壤处理施投法和叶子施投法中加以选择。

10 含有本发明化合物的除草剂组合物能够控制有害杂草, 包括草类(或禾本科), 如仓前草(*Echinochloa crus-galli* L.)、马唐(*Digitaria sanguinalis* L.)、狗尾草(*Setaria viridis* L.)、蟋蟀草(*Eleusine indica* L.)、野生燕麦(*Avena fatua* L.)、约翰逊草(*Sorghum halepense* L.)、匍匐冰草(*Agropyron repens* L.)、亚历山大草(*Brachiaria plantaginea*)、帕拉草(*Panicum purpurascens*)、千金子属草(*Leptochloa chinensis*)和  
15 red sprangletop(*Leptochloa panicea*); 薹属植物(或 Cyperaceae), 如稻平薹草(*Cyperus iria* L.)、紫色果薹草(*Cyperus rotundus* L.)、日本灯心草(*Scirpus juncooides*)、平薹草(*Cyperus serotinus*)、小花伞莎草(*Cyperus difformis*)、slender  
spikerush(*Eleocharis acicularis*)和水栗树(*Eleocharis kuroguwai*); 泽泻科, 如日本  
锯齿宽叶慈菇(*Sagittaria pymaea*)、箭头(*Sagittaria trifolia*)和窄叶水泽泻(*Alisma*  
20 *canaliculatum*); 雨久花科, 如雨久花属(*Monochoria vaginalis*)和 *monochoria*  
*species*(*Monochoria korsakwii*); 玄参属, 如 flase pimpernel(*Lindernia pyxidaria*)和  
*abunome*(*Dopatrium junceum*); 千屈菜科, 如紫水苋菜(*Rotala indica*)和 red  
stem(*Ammannia multiflora*); 和宽叶榄仁树, 如 velvetleaf(*Abutilon theophrasti*  
MEDIC)、长牵牛花(*Iponmoea purpurea* L.)、普通灰条菜(*Chenopodium album* L.)、  
25 多刺黄花捻(*Sida spionsa* L.)、普通马齿苋(*Portulaca oleracea* L.)、细苋紫  
(*Amaranthus retroflexus* L.)、镰果灯心草(*Cassia obtusifolia* L.)、黑龙葵(*Solanum*  
*nigrum* L.)、灰红蓼(*Polygonum lapathifolium* L.)、普通繁缕(*Stellaria media* L.)、



普通欧龙牙草(Xanthium strumarium L.)、锯齿状野芥菜(Cardamine flexuosa WITH.)、宝盖草(Lamium amplexicula L.)和铁苋菜属(Acalypha australis L.)、

因此，它对种植农作物中非选择性或选择性控制有害杂草有用，例如对于种植作物玉米(Zea mays L.)、大豆(Glycine max Merr.)、棉花(Gossypium spp.)、小麦  
5 (Triticum spp.)、稻(Oryza sativa L.)、大麦(Hordeum vulgare L.)、燕麦(Avena sativa L.)、高粱(Sorghum bicolor moench)、油菜(Brassica napus L.)、向日葵(Helianthus annus L.)、制糖甜菜(Beta vulgaris L.)、甘蔗(Saccharum officinarum L.)、花生(Arachis hypogaris L.)或亚麻(Linum usitatissimum L.)。本发明的化合物对种植玉米、小麦或水稻，尤其是种植玉米中选择性控制有害杂草特别有效。

10 含本发明化合物的除草剂组合物一般通过将该化合物与各种农用添加剂混合来配制，并且可以是如粉剂、颗粒、可分散于水的颗粒、可湿粉末、可乳化浓缩物、水基悬浮浓缩物、油基悬浮浓缩物、水溶性颗粒(或粉末)、片剂或胶囊的配方形式使用。但只要能适合于本发明的目的，该化合物可配制成本发明领域常规采用的任何配方形式。

15 这样的农用添加剂包括固体载体，如硅藻土、熟石灰、碳酸钙、滑石、白碳、高岭土、膨润土、高岭土和丝云母的混合物、粘土、碳酸钠、碳酸氢钠、芒硝、沸石和淀粉；溶剂，如水、甲苯、二甲苯、溶剂石脑油、二噁烷、丙酮、异佛尔酮、甲基异丁基酮、氯苯、环己烷、二甲亚砷、二甲基甲酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、以及醇类；阴离子表面活性剂和铺展剂，如脂肪酸盐、苯甲酸盐、琥珀酸  
20 烷基酯磺酸盐、琥珀酸二烷基酯磺酸盐、多羧酸盐、烷基硫酸酯盐、烷基硫酸盐、烷基芳基硫酸盐、烷基二甘醇醚硫酸盐、醇硫酸酯盐、烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、芳基磺酸盐、木素磺酸盐、烷基二苯基醚二磺酸盐、聚苯乙烯磺酸盐、烷基磷酸酯盐、磷酸烷基芳基酯、磷酸苯乙烯基芳基酯、聚氧乙烯烷基醚硫酸酯盐、聚氧乙烯烷基芳基醚硫酸盐、聚氧乙烯烷基芳基醚硫酸酯、聚氧乙烯烷基醚磷酸  
25 盐、聚氧乙烯烷基芳基磷酸酯盐、萘磺酸盐与甲醛水缩合物盐；非离子表面活性剂和铺展剂，如脱水山梨(糖)醇脂肪酸酯、甘油脂肪酸酯、脂肪酸聚甘油酯、脂肪醇聚甘油醚、炔二醇、炔醇、氧化烯嵌段聚合物、聚氧乙烯烷基醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯苯乙烯基芳基醚、聚氧乙烯二醇烷基醚、聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脱水山梨(糖)醇脂肪酸酯、聚氧乙烯甘油脂肪酸酯、聚氧乙烯加氢  
30 蓖麻油、和聚氧乙烯脂肪酸酯；植物油和矿物油，如橄榄油、爪哇木棉油、蓖麻油、棕榈油、山茶油、椰子油、芝麻油、玉米油、米糠油、花生油、棉籽油、大豆油、菜籽油、亚麻子油、桐油、以及液体石蜡。可在本领域已知的那些添加剂



中选择这些添加剂使用，只要能达到本发明的目的。还可以使用常规使用的各种添加剂，如填料、增稠剂、抗沉降剂、抗冻剂、分散稳定剂、植物毒性衰减剂、以及抗霉菌剂。

5 本发明的化合物与各种农用添加剂的重量比一般为 0.1:99.9 至 95:5，优选 0.2:99.8 至 85:15。

本发明的除草剂组合物的剂量不能一概而论，因为它随气候条件、土壤条件、配方类型、需控制的有害杂草类型、施用季节等改变。但是，一般施用时应使本发明的化合物的施用量为 0.5-5000 克/公顷，优选 1-1000 克/公顷。本发明包括通过施用这样的除草剂组合物来控制有害杂草的方法。

10 本发明的除草剂组合物可以和农用化学品、化肥或植物毒性衰减剂混合或与这些物质组合使用。在这种情况下，它们显示更好的效果和活性。作为其它农用化学品，有例如，除草剂、杀菌剂、抗菌素、植物激素或杀虫剂。尤其是本发明的化合物和一种或多种其它除草剂的活性组分混合或组合的除草剂组合物，可以提高除草剂活性、扩大施用季节和可施用的杂草的种类范围。而且，本发明的化  
15 合物和其它除草剂活性组分可以分别配制，在施用混合，或将它们配制在一起。本发明包括了这样混合的除草剂组合物。

本发明的化合物与其它除草剂活性组分的混合比不能一概而论，因为它随气候条件、土壤条件、配方类型、施用季节、施用方式等改变。但是，其它除草剂的一种活性组分的最低加入量，以本发明的化合物为 1 重量份计，一般为 0.001-  
20 1000 重量份，优选 0.01-1000 重量份。所有活性组分的总剂量一般为 0.1-1000 克/公顷，优选 0.2-5000 克/公顷。本发明包括通过施用这样的除草剂组合物来控制有害杂草的方法。

作为其它除草剂的活性组分，可举出下列物质(俗称)。

(1)据信是通过干扰植物的苗长素活性显示除草效果的那些物质，包括苯氧基  
25 乙酸型，如 2,4-D、MCPA、MCPB 或 naproanilide，芳族羧酸型，如 2,3,6-TBA、  
麦草畏、毒莠定或二氯吡啶酸，以及其它如草除灵、二氯喹啉酸、喹草酸或  
diflufenzopyr。

(2) 据信是通过抑制植物光合作用来显示除草效果的那些物质，包括脲类，如  
敌草隆、利谷隆、异丙隆或 metobenzuron，敌菌灵类如西玛津、莠去津、莠去通、  
30 西草净、扑草净、二甲丙乙净、嗪草酮、特丁津、氰草津、莠灭净，尿嘧啶类如  
除草定或环草定，酰苯胺类如敌稗或环丙草胺，氨基甲酸酯类如灭草灵或甜菜  
宁，羟基苄腈类如溴苯腈、溴苯腈-辛酸酯或碘苯腈，以及其它如 pyridate 或



bentazon。

(3)季铵盐类，如百草枯或敌草快，据信是通过自身在植物内形式活性氧被转化为自由基，并因此显示快速除草效果的那些物质。

5 (4)据信是通过抑制植物的叶绿素合成和在植物内异常积累光敏过氧化物来显示除草效果的那些物质，包括二苯醚类如除草醚、甲氧除草醚、甲羧除草醚、三氟除草醚-钠、氟黄胺草醚或乙氧氟草醚，环状亚胺类如氯胺亚胺、flumioxadine、flumiclorac-pentyl、[2-氯-4-氟-5-(5,6,7,8-四氢-3-氧代-1H,3H-[1,3,4]噻二唑)[3,4-a]吡嗪-1-亚氨基)苯基硫代]乙酸甲酯(日本农药科技协会第19次会议会刊第60页公开的化合物)、和其它如 oxadiation、sulfentrazone、carsulfentrazone-ethyl、10 thidiazimin、2-氯-5-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基吡唑-3-基)-4-氟苯氧基乙酸乙酯(日本农药科技协会第21次会议会刊第70-71页公开的化合物)。

(5)据信是以通过抑制植物的生色素如胡萝卜素生成作用而使活性物变白为特点，显示除草效果的那些物质，包括吡嗪酮类如吡草伏或二甲吡草伏，吡唑类如吡唑特、苜草唑或吡草酮，和其它如氟定酮、咪草唑、吡氟草胺、甲氧苯酮、异15 噁草酮、sulcotrione、2-(2'-硝基-4'-甲基磺酰基-苯甲酰基)-1,3-环己二酮(美国专利5,506,195公开的化合物)、isoxaflutole或双本唑快。

(6)尤其对禾本科植物显示除草效果的那些物质，包括芳氧基苯氧基丙酸类，如禾草灵-甲基、pyriphenop-sodium、吡氟禾草灵、吡氟氯禾灵-甲基、啶禾灵或20 cyhalofop-butyl，和环己二酮类，如禾草灭-钠、烯草酮。烯禾定或肟草酮。

(7)据信是通过抑制植物的氨基酸生物合成来显示除草效果的那些物质，包括磺酰脲类，如氯嘧黄隆、嘧黄隆、氟嘧黄隆、苜嘧黄隆、绿黄隆、甲黄隆、醚黄隆、吡嘧黄隆、azimsulfuron、啶嘧黄隆、rimuslfuron、烟嘧黄隆、25 imazosulfuron、cyclosulfamuron、prosulfuron、flupyrsulfuron、trisulfuron-methyl、halosulfuron-methyl或噻黄隆，三吡咯嘧啶磺酰胺类，如flumetsulam或metosulam，咪唑啉酮类，如灭草烟、咪草烟、灭草啞、imazamox或imazameth或咪草酯，嘧啶基水杨酸类，如pyrithiobac-sodium、bispyibac-sodium或pyriminobac-methyl，和其它如草甘膦-铵、草甘膦-异丙胺、草铵膦-铵或双丙氨酰膦。

(8)据信是通过抑制植物的细胞有丝分裂来显示除草效果的那些物质，包括二30 硝基苯胺类，如氟乐灵、安磺灵、磺乐灵或二甲戊乐灵，有机磷类，如甲基胺草磷、抑草磷、莎稗磷或哌草磷，氨基甲酸苯酯类，如氨苯胺灵或燕麦灵，枯基胺类，如杀草隆、cumyluron或溴丁酰草胺，和其它如磺草灵或氟硫草定。



(9)据信是通过抑制植物的蛋白质产物合成或脂类生物合成来显示除草效果的那些物质，包括硫代氨基甲酸酯类，如硫代氨基甲酸酯类，如 EPTC、butylate、草达灭、哌草丹、禾草畏、杀草丹或稗草畏，或氯乙酰胺类，如甲草胺、丁草胺、丙草胺、异丙甲草胺、thenylchlor、dimethenamid、乙草胺或毒草胺，和其它化合物，如 ethobenzanide、苯噻草胺、thiafluamide、灭草环、cafenstrole、4-(2-氯苯基)-N-环己基-4,5-二氢-N-乙基-5-氧代-1H-四唑-1-羧酰胺(JP-A-6-306061 中公开的化合物)、oxaziclomefon 或 2-乙基-2-[2-(3-氯苯基)-2,3-乙氧丙基]-1,2-二氢化茚-1,3-二酮(JP-A-2-304043 中公开的化合物)。

由下述的试验实施例 1 和 2 证明，本发明化合物包括对有效控制有害杂草显示选择性，同时对农作物如水稻、小麦和玉米显示安全性的那些化合物。当本发明化合物用于种植这些农作物时，通过使用本发明化合物与上述其它除草剂的活性化合物中的下列化合物中的一种或多种混合或与组合，可以获得协合作用。

种植水稻中：

2,4-D、MCPA、MCPB、萘丙胺、二氯喹啉酸、西草净、二甲丙乙净、敌稗、灭草灵、bentazon、除草醚、甲氧除草醚、甲羧除草醚、oxadiazon、吡唑特、苄草唑、吡草酮、甲氧苯酮吡氟禾草灵、苄嘧黄隆、醚黄隆、吡嘧黄隆、azimsulfuron、imazosulfuron、cyclosulfamuron、bispyribac-sodium salt、pyriminobac-methyl、莎稗磷、哌草磷、杀草隆、cumyluron、溴丁酰草胺、氟硫草定、草达灭、哌槽丹、禾草畏、杀槽丹、稗草畏、thenylchlor、丙草胺、丁草胺、enthobenzanide、苯噻草胺、cafenstrole、4-(2-氯苯基)-N-环己基-4,5-二氢-N-乙基-5-氧代-1H-四唑-1-羧酰胺、oxaziclomefon、和 2-乙基-2-[2-(3-氯苯基)-2,3-乙氧丙基]-1,2-二氢化茚-1,3-二酮。

种植玉米中：

2,4-D、MCPA、MCPB、麦草畏、二氯吡啶酸、草除灵、diflufenzopyr、敌草隆、利谷隆、metobenzuron、西玛津、莠去津、莠去通、嗉草酮、特丁津、氟草净、莠灭净、环丙草胺、溴苯腈、溴苯腈-辛酸酯、pyridate、bentazon、百草枯、乙氧氟草醚、flumiclorac-pentyl、[2-氯-4-氟-5-(5,6,7,8-四氢-3-氧代-1H,3H-[1,3,4]噻二唑)[3,4-a]哒嗪-1-亚基氨基)苯基硫代]乙酸甲酯、氟定酮、sulcotrione、2-(2'-硝基-4'-甲基磺酰基-苯甲酰基)-1,3-环己二酮、isoxaflutole、carfentrazone ethyl、氟嘧黄隆-甲基、rimusulfuron、烟嘧黄隆、prosulfuron、halosulfuron-methyl、噻黄隆、flumetsulam、metosulam、咪草烟、草甘膦-铵盐、草甘膦-异丙胺盐、草铵膦-铵盐、氟乐灵、二甲戊乐灵、EPTC、butylate、草不



绿、异丙甲草胺、乙草胺、毒草安、dimethenamid 和灭草环。

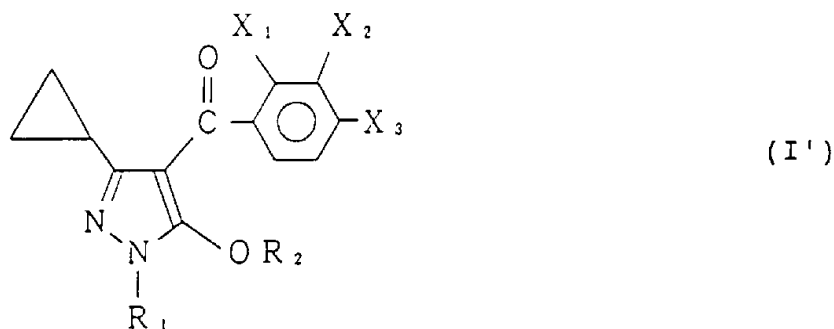
种植小麦中:

MCPB、啶草酸、利谷隆、异丙隆、扑草净、溴苯腈、溴苯腈-辛酸酯、pyridate、甲羧除草醚、carfentrazone ethyl、thidiazimin、2-氯-5-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基吡唑-3-基)-4-氟苯氧基乙酸乙酯、吡草酮、吡氟草胺、sulcotrione、禾草灵、肟草酮、绿黄隆、甲黄隆、prosulfuron、halosulfuron-methyl、flumetsulam、metosulam、二甲戊禾灵、燕麦灵和咪草酯。

下面描述本发明优选的实施方案。

(1)上述式(I)的吡唑化合物或其盐。

10 (2)根据条款 1 的吡唑化合物或其盐, 由式(I')表示式(I):



其中  $R_1$  是烷基,  $R_2$  是氢原子或  $-A-R_3$ ,  $A$  是  $-SO_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CO-$ ,  $R_3$  是可被取代的烷基、可被取代的烯基、可被取代的炔基、可被取代的氰基或苯基,  $X^1$ 、 $X^2$  或  $X^3$  各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、 $-SO_2N(R_8)R_9$ 、 $-N(R_{10})SO_2R_{11}$ 、 $CH_2S(O)_qR_{12}$  或  $OSO_2R_{13}$ ,  $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自是烷基,  $q$  是 0-2 的整数。

(3)根据条款 2 的吡唑化合物或其盐, 其中  $A$  是  $-SO_2-$ 、 $-CH_2-$  或  $-CH_2CO-$ ,  $X^1$ 、 $X^2$  和  $X^3$  各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基或硝基。

20 (4)根据条款 3 的吡唑化合物或其盐, 其中  $X^1$  是烷基硫代基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基。  $X^2$  和  $X^3$  各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基或硝基。

(5)一种除草剂, 它含有条款 1、2、3 或 4 中定义的吡唑化合物或其盐作为活性组分。

25 (6)一种控制有害杂草的方法, 该方法包括施用有效量的条款 1、2、3 或 4 定义的吡唑化合物或其盐。

(7)一种控制有害杂草的方法, 该方法包括将有效量的条款 1、2、3 或 4 定

义的吡啶化合物或其盐施用到高地。

(8)一种控制有害杂草的方法，该方法包括将有效量的条款 1、2、3 或 4 定义的吡啶化合物或其盐施用到玉米田。

5 (9)一种控制有害杂草的方法，该方法包括将有效量的条款 1、2、3 或 4 定义的吡啶化合物或其盐施用到小麦田。

(10)一种控制有害杂草的方法，该方法包括将有效量的条款 1、2、3 或 4 定义的吡啶化合物或其盐施用到稻田。

(11)一种混合的除草剂组合物，该组合物包括至少一种选自条款 1、2、3 或 4 定义的吡啶化合物或其盐和至少一种选自其它除草剂的活性化合物组分。

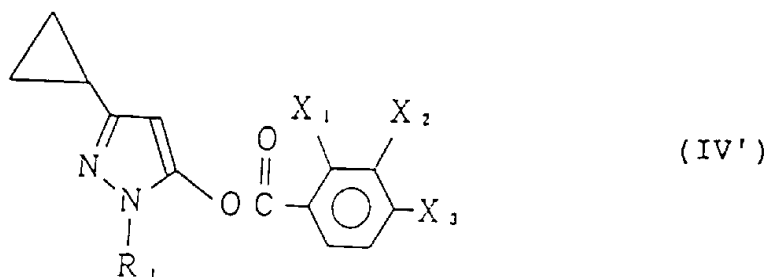
10 (12)上式(II)的化合物。

(13)根据条款 12 的化合物，其中 l 是 0。

(14)是式(IV)的化合物。

(15)根据条款 14 的化合物，其中 l 是 0。

(16)根据条款 14 的化合物，由式(IV')表示式(IV)。



15 其中 R<sub>1</sub> 是烷基、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup> 和 X<sup>3</sup> 各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、硝基、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>8</sub>)R<sub>9</sub>、N(R<sub>10</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>、-CH<sub>2</sub>S(O)<sub>q</sub>R<sub>12</sub> 或 -OSO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>，R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub> 和 R<sub>13</sub> 各自是烷基，q 是 0-2 的整数。

20 (17)根据条款 16 的吡啶化合物或其盐，其中 X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup> 和 X<sup>3</sup> 各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷基硫代基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基或硝基。

(18)根据条款 17 的吡啶化合物或其盐，其中 X<sup>1</sup> 是烷基硫代基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基。X<sup>2</sup> 和 X<sup>3</sup> 各自是氢原子、卤原子、烷基、卤代烷基或硝基。

25

### 实施本发明的最佳模式

下面参考实施例进一步详细地描述本发明。但是，应理解本发明不受这些实



实施例的限制。首先描述本发明的化合物的制备实施例。

### 制备实施例 1

制备 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-11)和对甲苯磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基-5-吡唑基酯(后面提到的化合物 a-12)(第一方法)

1)室温下在 30 毫升溶解有 5.53 克 3-环丙基-3-氧代丙酸叔丁酯的四氢呋喃溶液中加入 1.4 克甲基肼, 回流下使该混合物反应约 2 小时。

反应完成后, 减压蒸馏除去四氢呋喃, 获得 4.14 克 3-环丙基-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的中间体 1a-1)。

10 该产物熔点为 95-121 °C, NMR 谱数据如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

0.76-0.8 (m, 2H), 0.9-0.99 (m, 2H), 1.74-1.81 (m, 1H), 3.06 (s), 3.26 (s, 3H), 4.6 (bs)

2)将 30 毫升溶有 0.41 克碳酸钠的水溶液加到有 1 克上述步骤获得的 3-环丙基-5-羟基-1-甲基吡唑的 30 毫升甲苯溶液中, 随后搅拌 5 分钟, 然后, 通过混合 1.52 克 4-三氟甲基-2-甲基硫代苯甲酸、5 毫升亚硫酸氯和催化量 N,N-二甲基甲酰胺, 并在回流下反应 1 小时, 随后除去过量的亚硫酸氯, 预制成 4-三氟甲基-2-甲基硫苯甲酰氯, 将预制的化合物加入到上述混合物中, 并在 50 °C 反应 1 小时。

反应完成后, 冷却反应混合物, 并倒入水中, 用乙酸乙酯萃取。用饱和的氯化钠水溶液洗涤所获乙酸乙酯层, 然后用无水硫酸钠干燥, 并在减压下蒸馏除去溶剂。由硅胶柱色谱提纯所获的残留物, 获得 0.8 克 4-三氟甲基-2-甲基硫苯甲酸 3-环丙基-1-甲基-5-吡唑基酯的油状物(后面提到的中间体 2a-16)。该产物的 NMR 谱如下:

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

25 0.69-0.73 (m, 2H), 0.86-0.91 (m, 2H), 1.85-1.92 (m, 1H), 2.53 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 5.94 (s, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.53 (s, 1H), 8.24 (d, 1H)

3)室温下, 将 0.91 克间氯过苯甲酸加到 30 毫升溶有 0.75 克上述步骤获得的 4-三氟甲基-2-甲基硫苯甲酸 3-环丙基-1-甲基-5-吡唑基酯的二氯甲烷的溶液中, 使该混合物在室温至 40 °C 的温度范围内反应 1 小时。

30 反应完成后, 将该反应混合物倒入水中, 并用二氯甲烷萃取。

用稀碱, 然后用水洗涤所获的二氯甲烷层, 之后用无水硫酸钠干燥, 并蒸馏除去二氯甲烷。用硅胶柱色谱提纯所获残留物, 获得 0.75 克 4-三氟甲基-2-甲基

磺酰基苯甲酸 3-环丙基-1-甲基-5-吡唑基酯(后面提到的中间体 2a-5), 该产物熔点为 99-102 °C。其 NMR 谱数据如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

0.73-0.77 (m, 2H), 0.86-0.94 (m, 2H), 1.87-1.93 (m, 1H), 2.05 (s, 3H), 3.74 (s, 3H),  
5 5.95 (s, 1H), 8.0 (d, 1H), 8.06 (d, 1H), 8.47 (s, 1H)

4)使用迪安-斯达克共沸脱水装置, 在共沸脱水条件下使包括 0.7 克前面步骤所获的 4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酸 3-环丙基-1-甲基-5-吡唑基酯、 0.3 克干的碳酸钾、 25 毫升甲苯和 5 毫升 N,N-二甲基甲酰胺的混合物反应 1 小时。

10 反应完成后, 冷却反应混合物, 并倒入水中, 用乙酸乙酯洗涤水层。用浓盐酸酸化水层, 用乙酸乙酯萃取。获得的乙酸乙酯层用饱和氯化钠水溶液洗涤, 并用无水硫酸钠干燥。然后, 减压蒸馏除去乙酸乙酯, 获得要求的产物, 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的混合物 a-11)的粘性粗产品。该产品 NMR 数据如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

15 0.42-0.45 (m, 2H), 0.72-0.81 (m, 2H), 0.95-1.05 (m, 1H), 3.34 (s, 3H), 3.67 (s, 3H),  
7.73 (d, 1H), 8.0 (d, 1H), 8.4 (s, 1H)

上述粘性粗产品 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑的熔点为 83-93 °C。

20 5)在包括 0.3 克前面步骤获得的 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑、 0.118 克干碳酸钾、 0.002 克溴化四乙铵、 20 毫升甲苯和 5 毫升 N,N-二甲基甲酰胺的混合物中加入 0.155 克对甲苯磺酰氯, 搅拌下, 使该混合物在 40-50 °C 温度范围反应约 1 小时。

25 反应完成后, 将反应混合物倒入水中, 用乙酸乙酯萃取。获得的乙酸乙酯层用水洗涤, 再用饱和氯化钠水溶液洗涤, 之后用无水硫酸钠干燥, 减压蒸馏除去乙酸乙酯。用硅胶柱色谱提纯获得的残留物, 获得 0.3 克粘性的所需产品对甲苯磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基)-1-甲基-5-吡唑基酯。该产物的 NMR 数据如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

30 0.52-0.56 (m, 2H), 0.8-0.84 (m, 2H), 1.48-1.55 (m, 1H), 2.47 (s, 3H), 3.32 (s, 3H),  
3.65(s,3H), 7.37 (d, 2H), 7.58 (d, 1H), 7.82 (d, 2H), 7.89 (d, 1H), 8.28 (s, 1H)

上述粘性的对甲苯磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基)-1-甲基-5-吡唑基酯的熔点为 67-70 °C。

### 制备实施例 2

制备 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-11)和对甲苯磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基-5-吡唑基酯(后面提到的化合物 a-12)(第二方法)

1)使用迪安-斯达克共沸脱水装置,在共沸脱水条件下使包括 3.88 克 4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酸 3-环丙基-1-甲基-5-吡唑基酯(后面提到的中间体 2a-5)、1.52 克干的碳酸钾、100 毫升甲苯和 20 毫升 N,N-二甲基甲酰胺的混合物反应 1 小时。

10 反应完成后,冷却反应混合物,并倒入水中,随后进行液体分离。用浓盐酸酸化所获水层,并用乙酸乙酯萃取。获得的乙酸乙酯层用饱和氯化钠水溶液洗涤,并用无水硫酸钠干燥。然后,减压蒸馏除去乙酸乙酯,获得 3.88 克 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑的粘稠状粗产物。静置该产物,以充分除去溶剂,获得 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-11)的结晶作为所需的产品,该产品熔点为 153-157 °C。

2)在包括 0.7 克前面步骤获得的晶体 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑、0.27 克干碳酸钾、0.005 克溴化四乙铵、20 毫升甲苯和 4 毫升 N,N-二甲基甲酰胺的混合物中加入 0.36 克对甲苯磺酰氯,搅拌下,使该混合物在 40-50 °C 温度范围反应约 1.5 小时。

反应完成后,将反应混合物倒入水中,用乙酸乙酯萃取。获得的乙酸乙酯层用饱和氯化钠水溶液洗涤,之后用无水硫酸钠干燥,然后减压蒸馏除去乙酸乙酯。用硅胶柱色谱提纯获得的残留物,获得 0.7 克所需产品的对甲苯磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基-5-吡唑基酯晶体。该产品熔点为 135-138 °C。

### 制备实施例 3

制备 3-环丙基-4-(2,4-二氯-3-甲基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-8)

30 1)在 30 毫升 1,2-二氯乙烷中加入 2.76 克 3-环丙基-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的中间体 1a-1)和 3.9 克 2,6-二氯甲苯,并在搅拌下,温度不超过 50 °C 下在上述溶液中分批加入 6.7 克干氯化铝。添加完毕后,在 35-40 °C 范围继续搅拌 10-15



分钟。然后在同样温度下，在该溶液中滴加 4 毫升溶有 4.0 克四氯化碳的 1,2-二氯乙烷溶液。滴加完毕后使该混合物在 40-45 °C 下反应 1.5 小时。

反应完成后，反应混合物倒入 150 毫升冰水中，分离 1,2-二氯乙烷层。

2) 加入 0.5 毫升水，并将该混合物加热至 50 °C，混合物中逐滴加入 3.5 毫升浓硫酸。滴加完毕，回流下使该混合物反应 1.5 小时。

反应完成后，使反应混合物冷却，在其中加入 150 毫升水，随后进行液体分离。用水洗涤获得的 1,2-二氯乙烷层，然后用 100 毫升有 3.5 克氢氧化钠的水溶液萃取。之后，加入 50 % 硫酸，使液体为弱酸性，并用二氯甲烷萃取。获得的二氯甲烷层用无水硫酸钠干燥，减压蒸馏除去二氯甲烷，获得 3.5 克熔点为 112-115 °C 的所需产品。该产品的 NMR 数据如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

0.66-0.71 (m, 2H), 0.93-0.99 (m, 2H), 1.15-1.22 (m, 1H), 2.72 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 7.34 (d, 1H), 7.57 (d, 1H)

#### 15 制备实施例 4

制备 4-(2,4-二氯苯甲酰基)-3-环丙基-1-乙基-5-羟基吡唑(后面提到的化合物 a-18)

1) 将 5 毫升有 0.87 克无水肼的干四氢呋喃溶液加入到 30 毫升溶有 5 克 3-环丙基-3-氧代丙酸叔丁酯的干四氢呋喃溶液中，回流下使该混合物反应 1 小时。

20 反应完成后，减压蒸馏除去四氢呋喃等，获得 3.3 克熔点为 213-217 °C 的 3-环丙基-5-羟基吡唑(后面提到的中间体 3-1)。该产物的 NMR 数据如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: 重 DMSO]

0.57-0.61 (m, 2H), 0.81-0.86 (m, 2H), 1.70-1.77 (m, 1H), 5.1 (s, 1H), 10.16 (bs, 1H)

25 2) 1.61 克前面步骤获得的 3-环丙基-5-羟基吡唑与 20 毫升溶有 1.89 克干碳酸钾的六甲基磷酰胺溶液混合，将该混合物冷却至 0-2 °C。然后在 0-5 °C，耗时约 15 分钟在该混合物中滴加碘乙烷。之后，使该混合物在同样温度下反应 1 小时，并在室温至 40 °C 范围内再反应 1 小时。

30 3) 室温下，在上述反应物中加入 2.72 克 2,4-二氯苯甲酰氯，该混合物在同样温度下反应 0.5 小时，并在 40 °C 进一步反应 0.5 小时。

反应完成后，将反应混合物倒入水中，并用甲苯萃取。获得的甲苯层用水，然后用饱和氯化钠水溶液彻底洗涤，然后用无水硫酸钠干燥。之后，减压蒸馏除

去甲苯，通过硅胶柱色谱提纯获得的残留物，获得 1.2 克熔点为 61-63 °C 的 2,4-二氯苯甲酸 3-环丙基-1-乙基-5-吡唑基酯(后面提到的中间体 2a-7)。该产物的 NMR 数据如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

5 0.69-0.73 (m, 2H), 0.87-0.9 (m, 2H), 1.4 (t, 3H), 1.85-1.92 (m, 1H), 4.02-4.08 (q, 2H), 5.92(s,1H), 7.39 (d, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.94 (d, 1H)

4)按照与制备实施例 1 中的步骤 4)相同的方式，用 1.1 克前面步骤获得的 2,4-二氯苯甲酸 3-环丙基-1-乙基-5-吡唑基酯，获得 0.843 克熔点为 74-77 °C 的要求产物。

10

#### 制备实施例 5

制备苯磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基-5-吡唑基酯(后面提到的化合物 a-27)

1)在锥形烧瓶中加入 0.57 克 4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酸 3-环丙基-1-甲基  
15 -5-吡唑基酯(后面提到的化合物 2a-5)、20 毫升甲苯和 1 毫升 N,N-二甲基甲酰胺，并在其中加入 0.11 克碳酸钾。在共沸脱水条件下使该混合物反应 15 小时，获得含 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑的钾盐的反应混合物。

2)使前面步骤获得的反应混合物冷却，在其中加入 0.1 克氯化四乙铵和 0.1 克  
20 碘化钾。之后再加入 0.27 克苯磺酰氯。搅拌下使该混合物在 55 °C 反应 5.5 小时。

反应完成后，将反应混合物倒入水中，并用乙酸乙酯萃取。萃取物用水洗涤。获得的有机层用无水硫酸钠干燥。之后，通过硅胶柱色谱浓缩和提纯，获得 0.49 克熔点为 175-178 °C 的所需产品。该产物的 NMR 数据如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

25 0.46-0.05 (m, 2H), 0.73-0.81 (m, 2H), 1.33-1.41 (m, 1H), 3.27 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 7.53-7.58 (m, 3H), 7.7 (t, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.96 (d, 2H), 8.27 (s, 1H)

#### 制备实施例 6

正丙烷磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基-5-吡唑  
30 基酯(后面提到的化合物 a-89)

搅拌下使包括 0.4 克 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-11)、20 毫升甲苯、5 毫升 N,N-二甲基甲酰胺、



5 毫克溴化四乙铵和 0.16 克正丙烷磺酰氯的混合物约反应 12 小时。

反应完成后，将反应混合物倒入水中，并用乙酸乙酯萃取。获得的乙酸乙酯层用饱和氯化钠水溶液洗涤然后用无水硫酸钠干燥。蒸馏除去乙酸乙酯。通过硅胶柱色谱提纯所获得残留物，获得 0.34 克熔点为 128-131 °C 的所需产品。该产物的 NMR 数据如下。

$^1\text{H-NMR}$   $\delta\text{ppm}$  [溶剂:  $\text{CDCl}_3$ ]

0.43-0.51 (m, 2H), 0.78-0.82 (m, 2H), 1.12 (t, 3H), 1.1-1.2 (m, 1H), 2.0-2.1 (m, 2H), 3.33 (s, 3H), 3.53 (t, 2H), 3.82 (s, 3H), 7.70 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 8.38 (s, 1H)

#### 10 制备实施例 7

制备 5-苄氧基-3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-94)

在包括 0.4 克 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-11)、0.16 克干碳酸钾、5 毫克氯化苄基三乙铵、5 毫克碘化钾、20 毫升甲苯和 5 毫升 N,N-二甲基甲酰胺的混合物中加入 0.14 克苄基氯，搅拌下使该混合物在 50-70 °C 内反应 24 小时。

反应完成后，将反应混合物倒入水中，并用乙酸乙酯萃取。获得的乙酸乙酯层用饱和氯化钠水溶液洗涤，并用无水硫酸钠干燥。之后，减压下蒸馏除去乙酸乙酯。通过硅胶柱色谱提纯所获得残留物，获得 0.25 克熔点为 154-157 °C 的所需产品。该产物的 NMR 数据如下。

$^1\text{H-NMR}$   $\delta\text{ppm}$  [溶剂:  $\text{CDCl}_3$ ]

0.68-0.71 (m, 2H), 0.85-0.88 (m, 2H), 1.8-2.0 (m, 1H), 3.35 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 5.00 (s, 2H), 7.11-7.12(m,2H), 7.26-7.30(m,3H), 7.58-7.60 (d, 1H), 7.58-7.88(d,1H), 8.34 (s, 1H)

25

#### 制备实施例 8

制备 5-(2-氯-2-丙烯氧基)-3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-213)

搅拌下使包括 0.776 克 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的化合物 a-11)、30 毫升甲苯、4 毫升 N,N-二甲基甲酰胺、5 毫克溴化四乙铵和 0.245 克 2,3-二氯丙烯的混合物在室温反应 1 小时然后在 60-80 °C 反应 4 小时。

反应完成后，将反应混合物倒入水中，并用乙酸乙酯萃取。获得的乙酸乙酯层用饱和氯化钠水溶液洗涤，并用无水硫酸钠干燥。之后，减压下蒸馏除去乙酸乙酯。通过硅胶柱色谱提纯所获得残留物，获得 0.65 克熔点为 180-111 °C 的所需产品。该产物的 NMR 数据如下。

5  $^1\text{H-NMR}$   $\delta\text{ppm}$  [溶剂:  $\text{CDCl}_3$ ]

0.59-0.61 (m, 2H), 0.84-0.86 (m, 2H), 1.6-1.7 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.68 (s, 2H), 5.37-5.4 (d, 2H), 7.62 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 8.38 (s, 1H)

### 制备实施例 9

10 3-环丙基-1-甲基-4-(2-甲基硫代-4-三氟甲基苯甲酰基)-5-羟基吡唑(后面提到的化合物 a-82)、对甲苯磺酸 3-环丙基-1-甲基-4-(2-甲基硫代-4-三氟甲基苯甲酰基)-5-吡唑基酯(后面提到的化合物 a-72)和对甲苯磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基-5-吡唑基酯(后面提到的化合物 a-12)

15 1)在 200 毫升高压釜中，加入 1.59 克根据下面制备实施例 10 制备的 4-碘-3-甲基硫代三氟甲苯、1.38 克 3-环丙基-5-羟基-1-甲基吡唑(后面提到的中间体 1a-1)、0.5 克三乙胺、3.1 克碳酸钾、0.22 克二(三苯膦)氯化钨(II)和 40 毫升二噁烷并密封，并用一氧化碳(压力: 65 公斤/厘米<sup>2</sup>)吹扫高压釜内部，随后在 140 °C 反应 8 小时。反应完成后，蒸馏除去溶剂，将残留物溶于水中，然后过滤除去不溶物。用二氯甲烷洗涤滤液。洗涤后的产物用浓盐酸酸化(pH=1)，并用二氯甲烷  
20 萃取。获得的萃取溶液用无水硫酸钠干燥，蒸馏除去溶剂，获得 1.59 克红棕色固体的 3-环丙基-1-甲基-4-(2-甲基硫代-4-三氟甲基苯甲酰基)-5-羟基吡唑(后面提到的化合物 a-82)。

2)1.59 克前面步骤获得的未提纯 3-环丙基-1-甲基-4-(2-甲基硫代-4-三氟甲基苯甲酰基)-5-羟基吡唑与 20 毫升甲苯、4 毫升 N,N-二甲基甲酰胺、0.94 克对甲苯磺酰氯和 0.34 克碳酸钾混合，使该混合物在 60 °C 反应 3 小时。反应完成后，在反应混合物中加入水，该混合物用乙酸乙酯萃取。萃取溶液用无水硫酸钠干燥，并蒸馏除去溶剂。通过硅胶柱色谱(展开溶剂: 乙酸乙酯/己烷 = 1/4)提纯所获的残留物，获得 0.53 克对甲苯磺酸 3-环丙基-1-甲基-4-(2-甲基硫代-4-三氟甲基苯甲酰基)-5-吡唑基酯(后面提到的化合物 a-72)。该产品的 NMR 数据如下。

30  $^1\text{H-NMR}$   $\delta\text{ppm}$  [溶剂:  $\text{CDCl}_3$ ]

0.79 (m, 2H), 0.90 (m, 2H), 1.97 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 7.23 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.53 (d, 2H)

3)将 0.46 克前面步骤获得的对甲苯磺酸 3-环丙基-1-甲基-4-(2-甲基硫代-4-三氟甲基苯甲酰基)-5-吡唑基酯溶于 10 毫升二氯甲烷中,用冰冷却,在其中加入 0.47 克 85 % 间氯过苯甲酸。然后,使该混合物恢复至室温,并在搅拌下反应过夜。反应完成后,在反应混合物中加入碳酸氢钠水溶液,并用二氯甲烷萃取该混合物。萃取层用无水硫酸钠干燥,蒸馏除去溶剂。通过硅胶柱色谱(展开溶剂:乙酸乙酯/己烷 = 3/7)提纯所获的残留物,获得 0.49 克对甲苯磺酸 3-环丙基-4-(4-三氟甲基-2-甲基磺酰基苯甲酰基)-1-甲基-5-吡唑基酯(后面提到的化合物 a-12)。

### 制备实施例 10

#### 10 制备 4-碘-3-甲基硫代三氟甲苯

1)在 200 毫升溶有 42.23 克 4-氯-3-硝基三氟甲苯的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入 123.85 克碘化钠,该混合物在 140 °C 反应 17 小时。反应完成后,将反应混合物倒入水中,并用乙醚萃取。用水洗涤乙醚层,并用无水硫酸钠干燥。然后蒸馏除去溶剂。通过硅胶柱色谱提纯所获的残留物,获得 44.15 克 4-碘-3-硝基三氟甲苯。该产物的 NMR 谱如下。

<sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

7.52 (dd, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.22 (d, 1H)

2)加热 300 毫升溶有 30 克前面步骤获得的 4-碘-3-硝基三氟甲苯的乙酸溶液,并在 85-95 °C, 耗费 15 分钟,在上述溶液中加入 26.43 克还原铁。然后该混合物在同样温度下再反应 5 分钟。

反应完成后,用冰冷却反应混合物,用硅藻土过滤除去不溶物。用乙酸乙酯彻底洗涤滤饼,洗液与滤液混合,随后用水洗涤 5 次。所获乙酸乙酯层用无水硫酸钠干燥,减压下蒸馏除去乙酸乙酯。所获得残留物通过硅胶柱色谱提纯,获得 25.52 克 3-氨基-4-碘三氟甲苯油状物。该产物的 NMR 谱数据如下。

25 <sup>1</sup>H-NMR δppm [溶剂: CDCl<sub>3</sub>]

6.70 (dd, 1H), 6.93 (d, 1H), 7.73 (d, 1H)

3)25-30 °C 下,在含有前面步骤所得的一份 5.1 克 3-氨基-4-碘三氟甲苯、16.75 克二甲二硫和 80 毫升氯仿的溶液中同时滴加溶于 20 毫升氯仿的其余部份(20.42 克)前面步骤所获得的 3-氨基-4-碘三氟甲苯和 11.92 克亚硝酸叔丁酯。滴加完毕,该混合物在室温反应 16 小时。

反应完成后,在反应混合物中加入 200 毫升二氯甲烷,该混合物用 pH 为 1 至 2 的盐酸水溶液洗涤。然后用水洗涤二氯甲烷层。所获残留物通过硅胶柱色谱提



纯，获得 19.89 克油状的所需产物。该产物的 NMR 谱数据如下。

$^1\text{H-NMR}$   $\delta\text{ppm}$  [溶剂:  $\text{CDCl}_3$ ]

2.51 (s, 3H), 7.08 (dd, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.90 (dd, 1H)

5 根据上述制备实施例或上述各种制备本发明的化合物的方法，可以制备本发明的其它化合物。由上式(II)表示的中间体化合物的典型例列于表 1，由上式(IV)表示的中间体化合物的典型例列于表 2a 和 2b，由上式(IX)表示的中间体化合物的典型例列于表 3，由上式(I)表示的本发明化合物的典型例列于表 4a 和 4b。

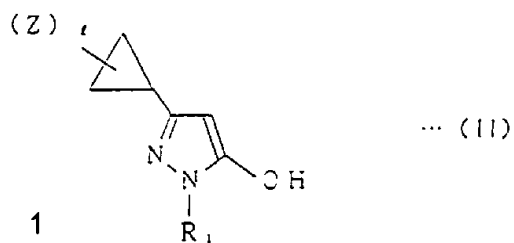
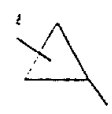






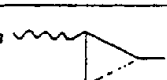
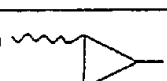
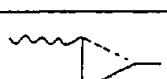
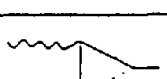


表 1

中间体	R <sub>1</sub>	(Z) 	物理性质
1 a - 1	CH <sub>3</sub>		
1 a - 2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		熔点 95 - 121°C
1 a - 3	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>		
1 a - 4	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
1 a - 5	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
1 b - 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> 	
1 b - 2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> 	
1 b - 3	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub> 	
1 b - 4	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub> 	
1 b - 5	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> 	

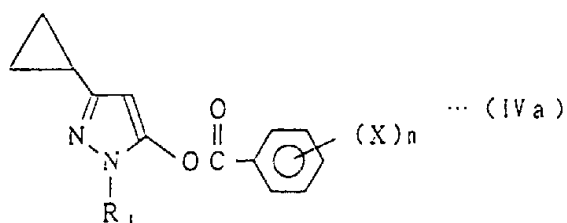

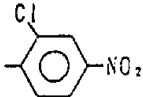
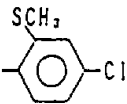
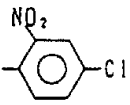
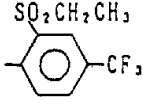
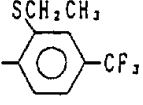
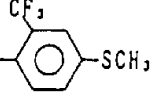
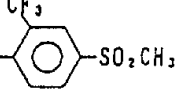
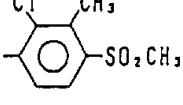
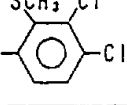


表 2a

中间体	R <sub>1</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
2 a - 1	CH <sub>3</sub>		
2 a - 2	CH <sub>3</sub>		熔点 84—87℃
2 a - 3	CH <sub>3</sub>		熔点 148—150℃
2 a - 4	CH <sub>3</sub>		
2 a - 5	CH <sub>3</sub>		熔点 99—102℃
2 a - 6	CH <sub>3</sub>		
2 a - 7	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		熔点 61—63℃
2 a - 8	CH <sub>3</sub>		



表 2a (续)

中间体	R <sub>1</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
2 a - 18	CH <sub>3</sub>		
2 a - 19	CH <sub>3</sub>		熔点 90—93℃
2 a - 20	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
2 a - 21	CH <sub>3</sub>		粘性
2 a - 22	CH <sub>3</sub>		粘性
2 a - 23	CH <sub>3</sub>		粘性
2 a - 24	CH <sub>3</sub>		熔点 146—149℃
2 a - 25	CH <sub>3</sub>		熔点 125—130℃
2 a - 26	CH <sub>3</sub>		

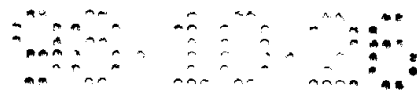
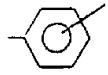
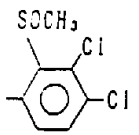
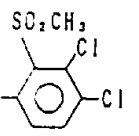
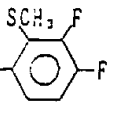
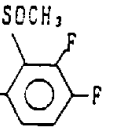
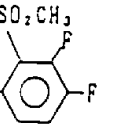

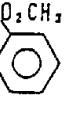
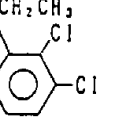


表 2a (续)

中间体	R <sub>1</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
2 a - 27	CH <sub>3</sub>		
2 a - 28	CH <sub>3</sub>		熔点 134 - 136 °C
2 a - 29	CH <sub>3</sub>		
2 a - 30	CH <sub>3</sub>		
2 a - 31	CH <sub>3</sub>		
2 a - 32	CH <sub>3</sub>		
2 a - 33	CH <sub>3</sub>		
2 a - 34	CH <sub>3</sub>		

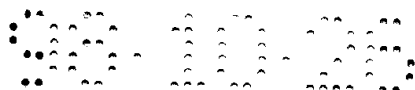


表 2a (续)

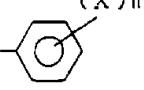
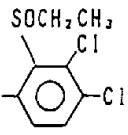
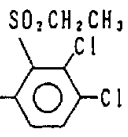
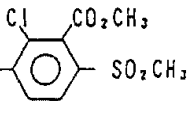
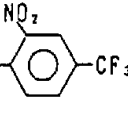
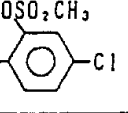
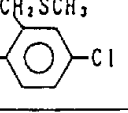
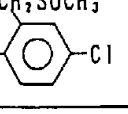
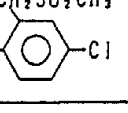
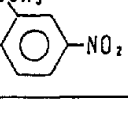
中间体	R <sub>1</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
2 a - 35	CH <sub>3</sub>		
2 a - 36	CH <sub>3</sub>		
2 a - 37	CH <sub>3</sub>		
2 a - 38	CH <sub>3</sub>		
2 a - 39	CH <sub>3</sub>		
2 a - 40	CH <sub>3</sub>		
2 a - 41	CH <sub>3</sub>		
2 a - 42	CH <sub>3</sub>		
2 a - 43	CH <sub>3</sub>		熔点 118 - 122 °C



表 2a (续)

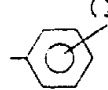
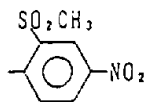
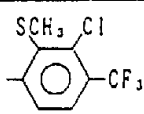
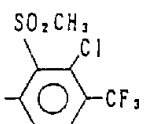
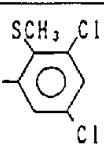
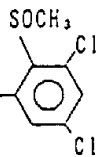
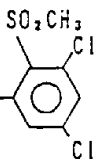
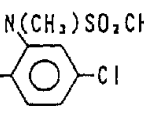
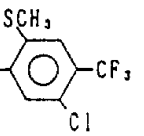
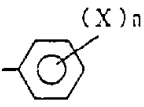
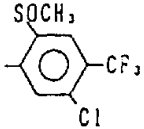
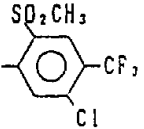
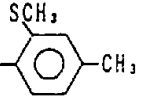
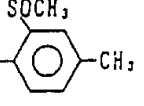
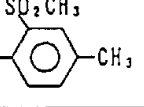
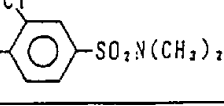
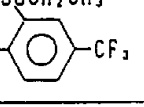
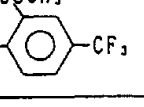
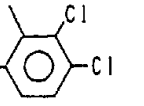
中间体	R <sub>1</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
2 a - 44	CH <sub>3</sub>		
2 a - 45	CH <sub>3</sub>		粘性
2 a - 46	CH <sub>3</sub>		
2 a - 47	CH <sub>3</sub>		
2 a - 48	CH <sub>3</sub>		
2 a - 49	CH <sub>3</sub>		
2 a - 50	CH <sub>3</sub>		
2 a - 51	CH <sub>3</sub>		



表 2a (续)

中间体	R <sub>1</sub>		物理性质
2 a - 52	CH <sub>3</sub>		
2 a - 53	CH <sub>3</sub>		
2 a - 54	CH <sub>3</sub>		
2 a - 55	CH <sub>3</sub>		
2 a - 56	CH <sub>3</sub>		
2 a - 57	CH <sub>3</sub>		
2 a - 58	CH <sub>3</sub>		
2 a - 59	CH <sub>3</sub>		
2 a - 60	CH <sub>3</sub>		

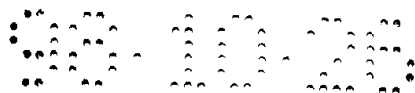

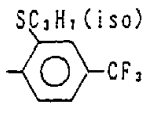
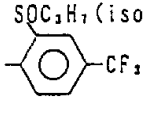
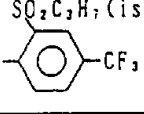
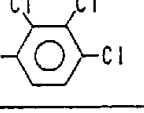
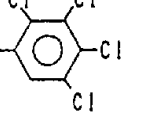


表 2a (续)

中间体	R <sub>1</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
2 a - 61	CH <sub>3</sub>	SC <sub>2</sub> H <sub>7</sub> (iso) 	
2 a - 62	CH <sub>3</sub>	SOC <sub>2</sub> H <sub>7</sub> (iso) 	
2 a - 63	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>7</sub> (iso) 	
2 a - 64	CH <sub>3</sub>		
2 a - 65	CH <sub>3</sub>		



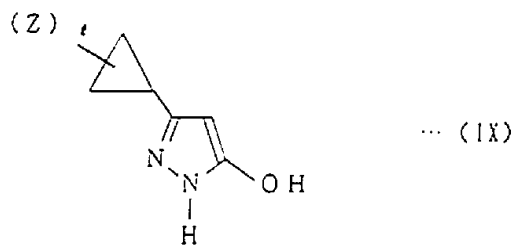





表 3

中间体	(Z) 	物理性质
3-1		熔点 213 - 217 °C
3-2	CH <sub>3</sub> 	

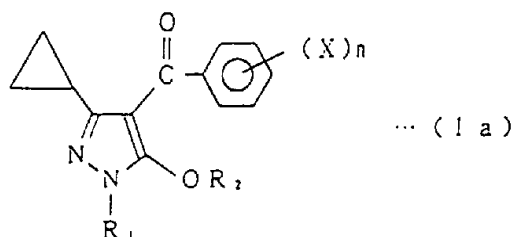


表 4a

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-1	CH <sub>3</sub>	H		熔点 131-133°C
a-2	CH <sub>3</sub>			折射率 n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5779
a-3	CH <sub>3</sub>	H		熔点 65-70°C
a-4	CH <sub>3</sub>			熔点 130-133°C
a-5	CH <sub>3</sub>	H		熔点 163-166°C
a-6	CH <sub>3</sub>			熔点 172-174°C
a-7	CH <sub>3</sub>			熔点 145-147°C
a-8	CH <sub>3</sub>	H		熔点 112-115°C

表 4a (续)

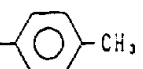
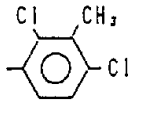
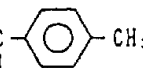
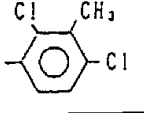
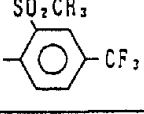
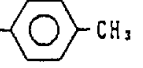
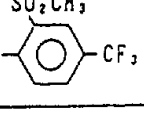

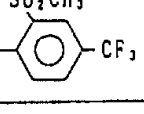
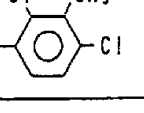
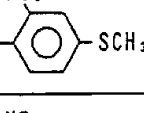
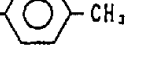
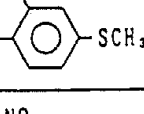

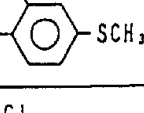
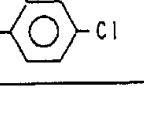
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-9	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 115 - 118°C
a-10	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(=O)-  -CH <sub>3</sub>		熔点 126 - 129°C
a-11	CH <sub>3</sub>	H		熔点 153 - 157°C
a-12	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 135 - 138°C
a-13	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(=O)- 		熔点 124 - 127°C
a-14	CH <sub>3</sub>	-C(=O)CH <sub>3</sub>		熔点 112 - 115°C
a-15	CH <sub>3</sub>	H		熔点 115 - 122°C
a-16	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 146 - 148°C
a-17	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(=O)- 		粘性
a-18	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H		熔点 74 - 77°C

表 4a (续)

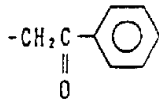
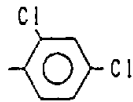
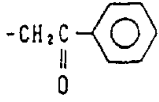
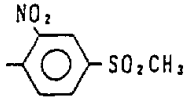
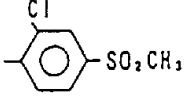
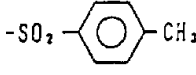
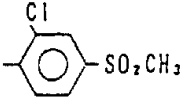
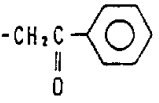
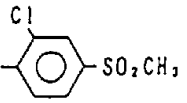
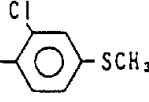
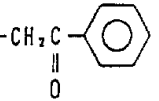
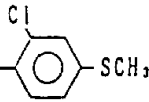
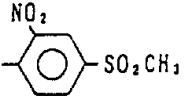
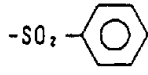
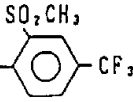
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-19	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			粘性
a-20	CH <sub>3</sub>			熔点 181 - 183°C
a-21	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H		熔点 158 - 161°C
a-22	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			熔点 116 - 118°C
a-23	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			熔点 146 - 148°C
a-24	CH <sub>3</sub>	H		熔点 111 - 114°C
a-25	CH <sub>3</sub>			折射率 n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.6001
a-26	CH <sub>3</sub>	H		熔点 140 - 145°C
a-27	CH <sub>3</sub>			熔点 175 - 178°C

表 4a (续)

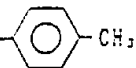
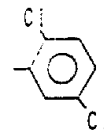
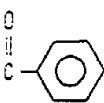
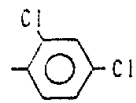
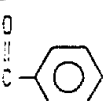
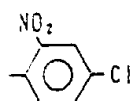
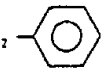
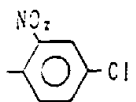
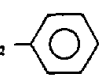
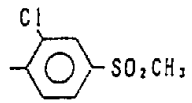
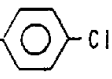
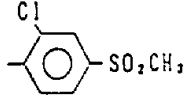
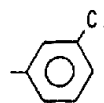
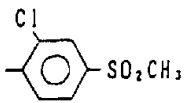
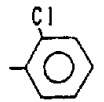
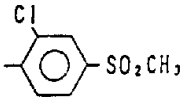
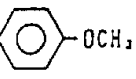
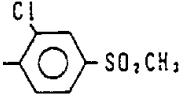
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-28	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		
a-29	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		
a-30	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		
a-31	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-32	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-33	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-34	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-35	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-36	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		

表 4a (续)

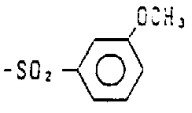
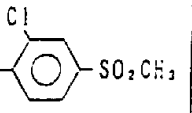
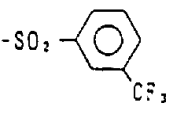
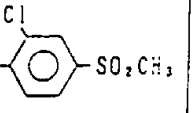
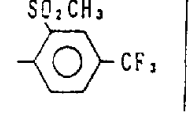
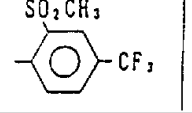
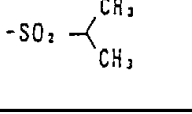
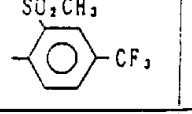
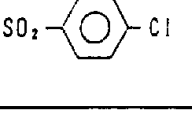
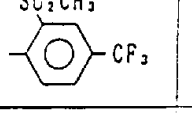
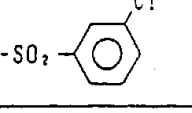
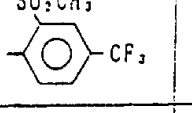
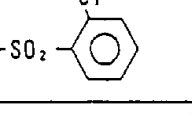
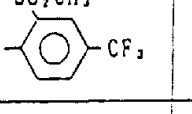
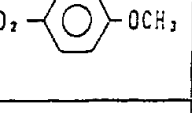
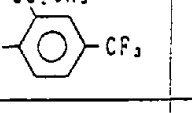
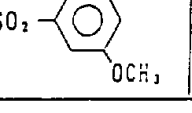
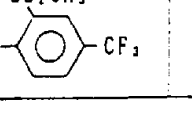
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-37	CH <sub>3</sub>			
a-38	CH <sub>3</sub>			
a-39	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		熔点 143 - 146°C
a-40	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		熔点 127 - 130.5°C
a-41	CH <sub>3</sub>			熔点 117 - 120°C
a-42	CH <sub>3</sub>			熔点 196 - 199°C
a-43	CH <sub>3</sub>			折射率 157 - 160°C
a-44	CH <sub>3</sub>			熔点 168 - 171°C
a-45	CH <sub>3</sub>			熔点 157 - 160°C
a-46	CH <sub>3</sub>			

表 4a (续)

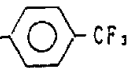
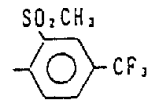
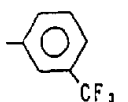
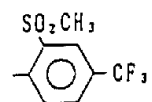
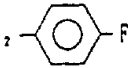
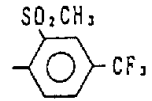
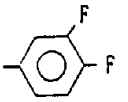
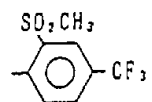
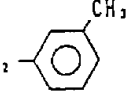
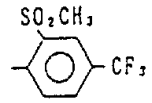
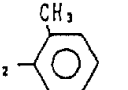
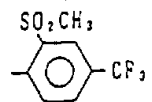
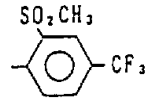
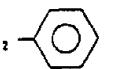
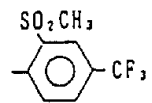
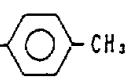
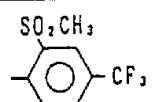
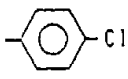
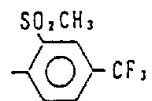
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-47	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>		熔点 185 - 188°C
a-48	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>		熔点 124 - 127°C
a-49	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -F		熔点 152 - 155°C
a-50	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -F		
a-51	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 166 - 169°C
a-52	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 145 - 149°C
a-53	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> (n)		熔点 142 - 145°C
a-54	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点
a-55	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 156 - 159°C
a-56	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -Cl		

表 4a (续)


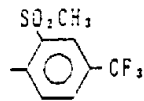
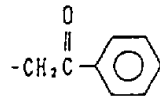
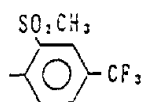
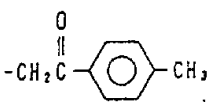
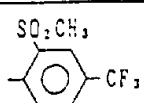
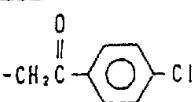
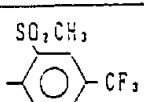

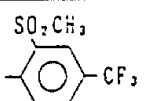

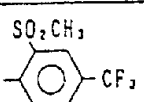

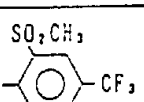
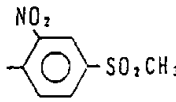

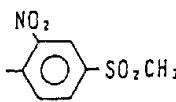

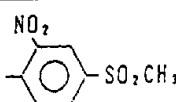
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a - 57	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a - 58	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			熔点 136 - 138°C
a - 59	CH <sub>3</sub>			粘性
a - 60	CH <sub>3</sub>			粘性
a - 61	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a - 62	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a - 63	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a - 64	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
a - 65	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a - 66	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		

表 4a (续)

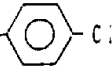
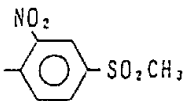
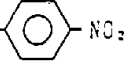
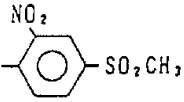
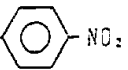
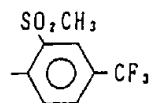
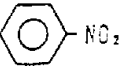
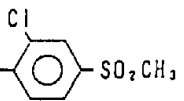
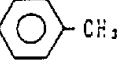
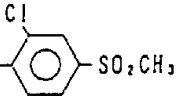
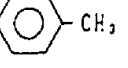
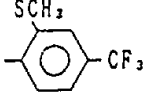
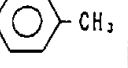
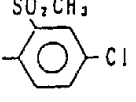
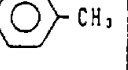
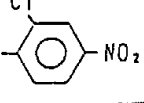
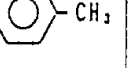
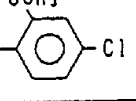
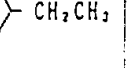
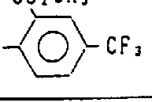
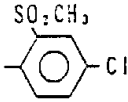
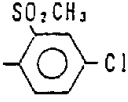
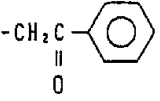
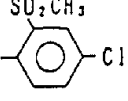
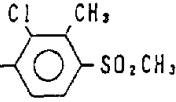
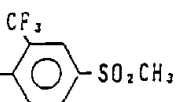
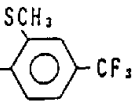
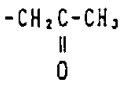
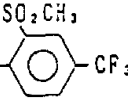
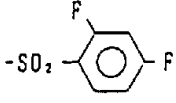
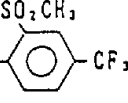
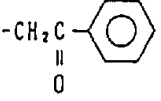
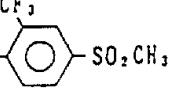
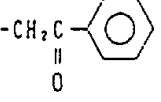
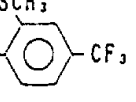
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-67	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-68	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-69	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 208 - 211°C
a-70	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-71	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-72	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 107 - 109°C
a-73	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 158 - 164°C
a-74	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-75	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		
a-76	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		粘性

表 4a (续)

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-77	CH <sub>3</sub>	H		熔点 190 - 204°C
a-78	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		熔点 134 - 138°C
a-79	CH <sub>3</sub>			熔点 137 - 139°C
a-80	CH <sub>3</sub>	H		熔点 177 - 180°C
a-81	CH <sub>3</sub>	H		熔点 141 - 143°C
a-82	CH <sub>3</sub>	H		熔点 107 - 110°C
a-83	CH <sub>3</sub>			粘性
a-84	CH <sub>3</sub>			熔点 189 - 193°C
a-85	CH <sub>3</sub>			熔点 113 - 115°C
a-86	CH <sub>3</sub>			熔点 146 - 148°C

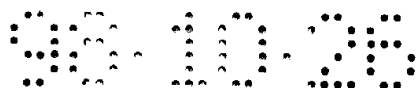
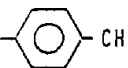
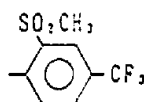

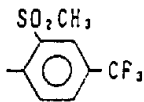
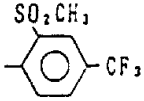
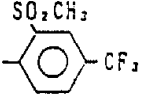
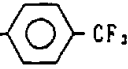
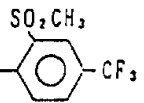
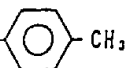
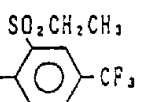
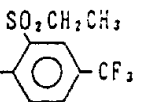
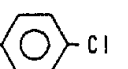
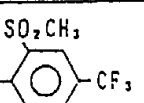
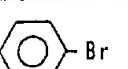
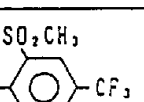
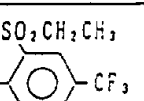


表 4a (续)

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-87	CH <sub>3</sub>			熔点 148-151°C
a-88	CH <sub>3</sub>			熔点 137-141°C
a-89	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		熔点 128-131°C
a-90	CH <sub>3</sub>			粘性
a-91	CH <sub>3</sub>			熔点 188-192°C
a-92	CH <sub>3</sub>			粘性
a-93	CH <sub>2</sub>			熔点 128-131°C
a-94	CH <sub>3</sub>			熔点 154-157°C
a-95	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN		熔点 135-140°C
a-96	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>		折射率 n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5133



表 4a (续)

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-97	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 161 - 163°C
a-98	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 163 - 166°C
a-99	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C≡CH		熔点 123 - 127°C
a-100	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		熔点 125 - 128°C
a-101	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>		熔点 159 - 161°C
a-102	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 63 - 70°C
a-103	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		熔点 130 - 133°C
a-104	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -  -Cl		熔点 151 - 154°C
a-105	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -  -Br		熔点 160 - 163°C
a-106	CH <sub>3</sub>	H		熔点 140 - 143°C

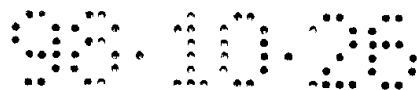


表 4a (续)

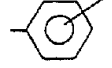
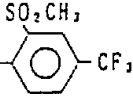
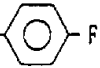
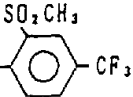

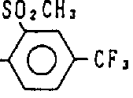

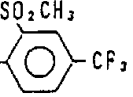
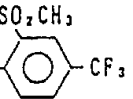
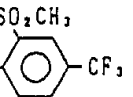
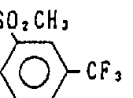
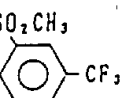
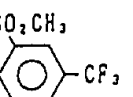
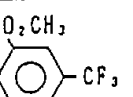
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a - 107	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H		熔点 109 - 114°C
a - 108	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		
a - 109	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		
a - 110	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		
a - 111	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>		
a - 112	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
a - 113	CH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CH}_2\text{COCH}_3 \end{array}$		粘性
a - 114	CH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CH}_2\text{COCH}_2\text{CH}_3 \end{array}$		
a - 115	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>		
a - 116	CH <sub>3</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		粘性

表 4a (续)

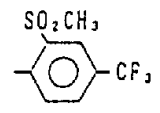
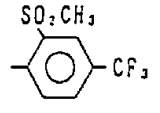
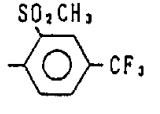
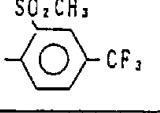
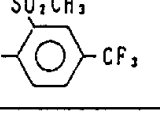
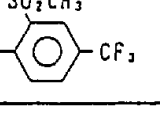
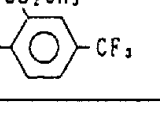
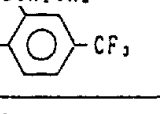
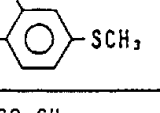
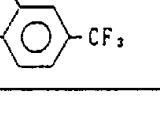
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a - 117	CH <sub>3</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> (n)		
a - 118	CH <sub>3</sub>	$\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CCH}_3 \end{matrix}$		熔点 156 - 158°C
a - 119	CH <sub>3</sub>	$\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CCH}_2\text{CH}_3 \end{matrix}$		
a - 120	CH <sub>3</sub>	$\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{C}_3\text{H}_7(n) \end{matrix}$		熔点 143 - 145°C
a - 121	CH <sub>3</sub>	$\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{C}_4\text{H}_9(n) \end{matrix}$		
a - 122	CH <sub>3</sub>	$\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3 \end{matrix}$		熔点 179 - 182°C
a - 123	CH <sub>3</sub>	$\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl}) \end{matrix}$		
a - 124	CH <sub>3</sub>	$-\text{SO}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$		
a - 125	CH <sub>3</sub>	$-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$		熔点 116 - 118°C
a - 126	CH <sub>3</sub>	$-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$		熔点 154 - 158°C

表 4a (续)

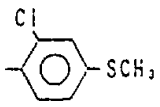
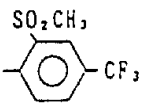
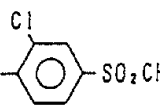
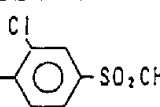
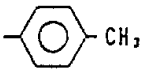
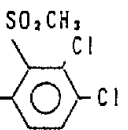
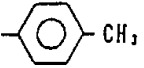
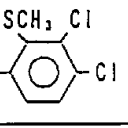
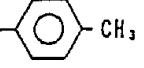
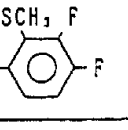
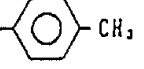
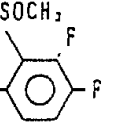
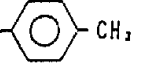
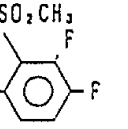
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-127	CH <sub>3</sub>	-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		熔点 136 - 138°C
a-128	CH <sub>3</sub>	-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
a-129	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		熔点 50 - 60°C
a-130	CH <sub>3</sub>	-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		熔点 200 - 203°C
a-131	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 57 - 60°C
a-132	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		粘性
a-133	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 105 - 107°C
a-134	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 131 - 133°C
a-135	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 169 - 172°C

表 4a (续)


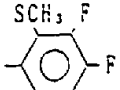

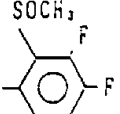

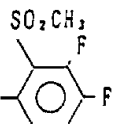
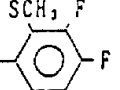

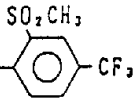
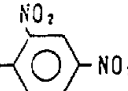
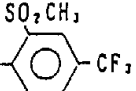




化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-136	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		油性
a-137	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		粘性
a-138	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 125 - 128°C
a-139	CH <sub>3</sub>	H		油性
a-140	CH <sub>3</sub>	-CH-    CH <sub>3</sub>		熔点 139 - 142°C
a-141	CH <sub>3</sub>			熔点 150 - 151°C
a-142	CH <sub>3</sub>	H		熔点 95 - 103°C
a-143	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 92 - 96°C
a-144	CH <sub>3</sub>	H		熔点 60 - 70°C

表 4a (续)

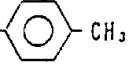

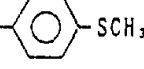
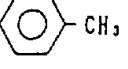
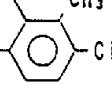

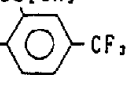
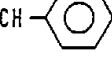
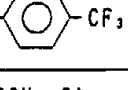

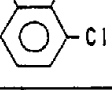

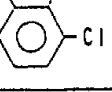

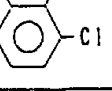
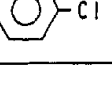
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-145	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 75 - 80°C
a-146	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub> 	熔点 70 - 85°C
a-147	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> 	
a-148	CH <sub>3</sub>	-CHCO-    CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 152 - 153°C
a-149	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH- 	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	粘性
a-150	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	SCH <sub>3</sub> Cl 	粘性
a-151	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	SOCH <sub>3</sub> Cl 	粘性
a-152	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> Cl 	熔点 157 - 160°C
a-153	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> (n)	SCH <sub>3</sub> Cl 	熔点 82 - 85°C

表 4a (续)

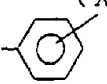
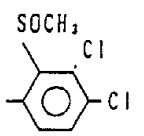
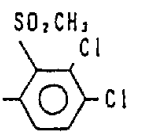
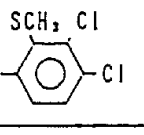
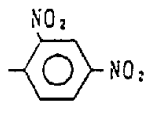
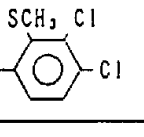
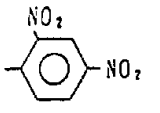
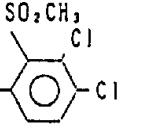
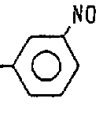
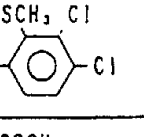
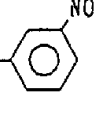
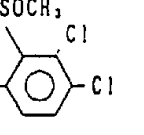
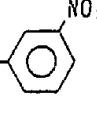
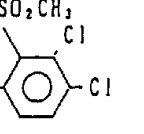
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a - 154	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		粘性
a - 155	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		熔点 165 - 169°C
a - 156	CH <sub>3</sub>	H		粘性
a - 157	CH <sub>3</sub>			粘性
a - 158	CH <sub>3</sub>			熔点 120 - 130°C
a - 159	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 Viscous
a - 160	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 177 - 178°C
a - 161	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 173 - 175°C

表 4a (续)


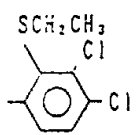

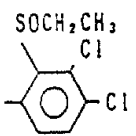

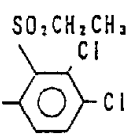
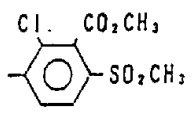

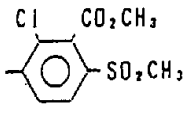

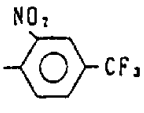
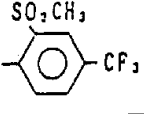

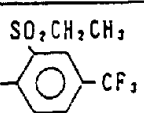
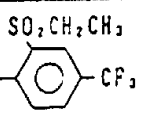
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-162	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		粘性
a-163	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		粘性
a-164	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 65 - 75°C
a-165	CH <sub>3</sub>	H		熔点 208°C (分解)
a-166	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 144 - 147°C
a-167	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>		熔点 120 - 141°C
a-168	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		熔点 140 - 144°C
a-169	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 119 - 122°C
a-170	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C≡CH		油性

表 4a (续)


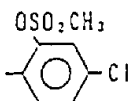
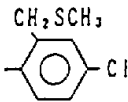
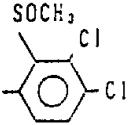
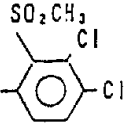
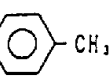
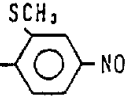
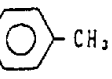
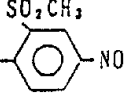
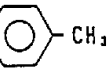
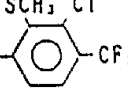
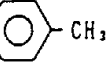
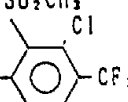
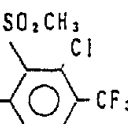
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-171	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		粘性
a-172	CH <sub>3</sub>	H		油性
a-173	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN		粘性
a-174	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN		粘性
a-175	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 153-156°C
a-176	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		粘性
a-177	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		粘性
a-178	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		粘性
a-179	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		熔点 140-144°C

表 4a (续)


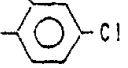

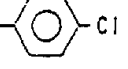

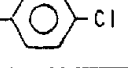







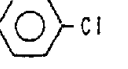
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-180	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> 	粘性
a-181	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub> 	粘性
a-182	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 55 - 62°C
a-183	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>3</sub> Cl 	粘性
a-184	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	SCH <sub>3</sub> Cl 	粘性
a-185	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	SOCH <sub>3</sub> Cl 	熔点 154 - 155°C
a-186	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> Cl 	熔点 165 - 167°C
a-187	CH <sub>3</sub>	H	N(CH <sub>3</sub> )SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 50 - 58°C

表 4a (续)


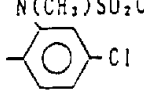
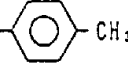
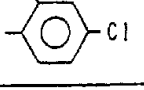
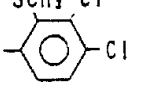
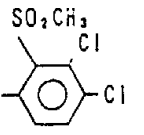
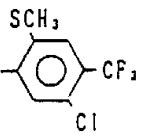

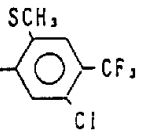

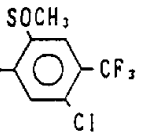

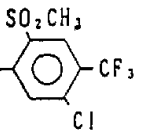
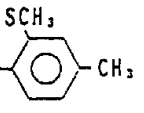
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a - 188	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> (n)		熔点 181 - 184°C
a - 189	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 70 - 73°C
a - 190	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C≡CH		粘性
a - 191	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C≡CH		熔点 40 - 50°C
a - 192	CH <sub>3</sub>	H		粘性
a - 193	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 107 - 110°C
a - 194	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 48 - 52°C
a - 195	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 140 - 148°C
a - 196	CH <sub>3</sub>	H		熔点 115 - 130°C

表 4a (续)


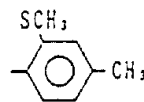

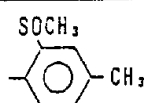

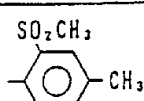

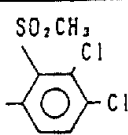
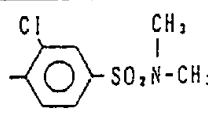
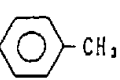
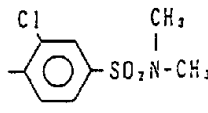
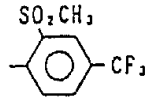

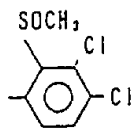
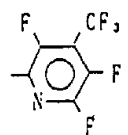
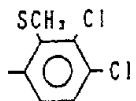
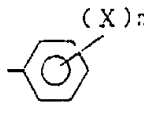
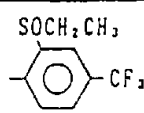
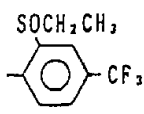
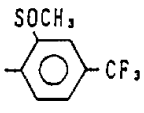
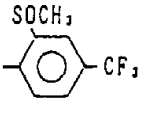

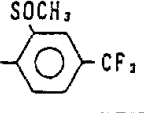
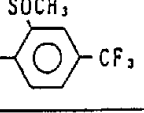
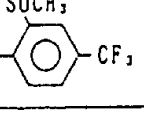
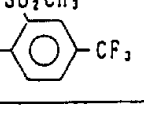
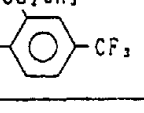
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub>	物理性质
a-197	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 79 - 93°C
a-198	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 114 - 125°C
a-199	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 143 - 146°C
a-200	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO- 		熔点 173 - 178°C
a-201	CH <sub>3</sub>	H		熔点 155 - 156°C
a-202	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> - 		熔点 150 - 151°C
a-203	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		熔点 183 - 188°C
a-204	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO- 		粘性
a-205	CH <sub>3</sub>			熔点 111 - 126°C

表 4a (续)

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>		物理性质
a -206	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C≡CH		油性
a -207	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		粘性
a -208	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		熔点 134 - 135°C
a -209	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C≡CH		粘性
a -210	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		粘性
a -211	CH <sub>3</sub>	H		熔点 122 - 138°C
a -212	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN		粘性
a -213	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>   Cl		熔点 108 - 111°C
a -214	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Cl		熔点 113 - 118°C

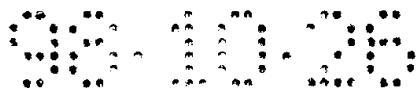


表 4a (续)



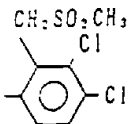
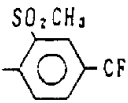
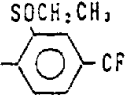
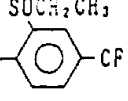

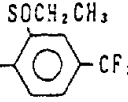
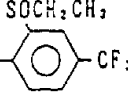
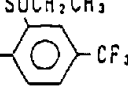
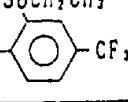
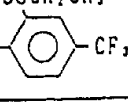
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a-215	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		熔点 50 - 60°C
a-216	CH <sub>3</sub>	-CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Cl		熔点 133 - 135°C
a-217	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>		粘性
a-218	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN		粘性
a-219	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> - 		粘性
a-220	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		熔点 125 - 130°C
a-221	CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		粘性
a-222	CH <sub>3</sub>	H		熔点 153 - 156°C
a-223	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		粘性

表 4a (续)

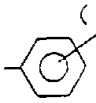
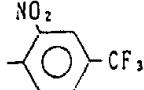
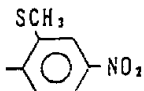
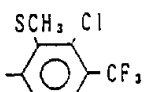
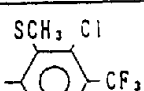
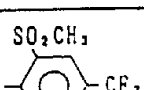
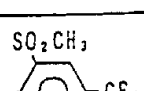
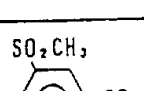
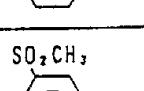
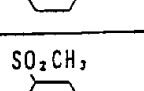
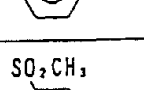
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a-224	CH <sub>3</sub>	H		
a-225	CH <sub>3</sub>	H		粘性
a-226	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		粘性
a-227	CH <sub>3</sub>	H		油性
a-228	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CHCl		熔点 100 - 103°C
a-229	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>		熔点 122 - 125°C
a-230	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>   Br		油性
a-231	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
a-232	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=C(Cl) <sub>2</sub>		熔点 142 - 145°C
a-233	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>		熔点 101 - 106°C



表 4a (续)


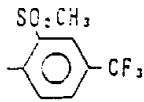
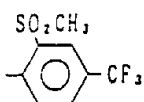
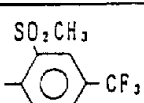
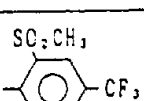
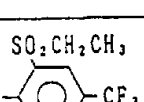
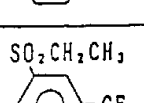
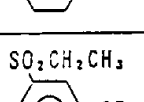
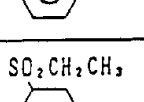
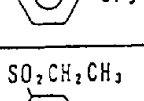
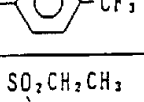
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a - 234	CH <sub>3</sub>	-CHCH=CH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	油性
a - 235	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a - 236	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>   Cl	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a - 237	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a - 238	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a - 239	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>   Br	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 124 - 126°C
a - 240	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a - 241	CH <sub>3</sub>	-CHCH=CH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	粘性
a - 242	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a - 243	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>n</sub> H <sub>2n</sub> (n)	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	



表 4a (续)


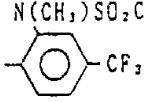
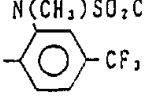
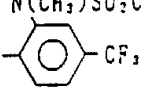
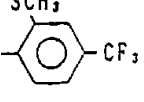
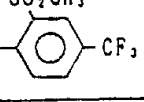
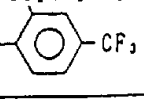
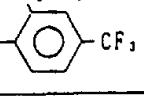
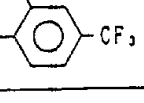
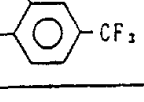
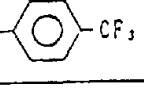
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a -244	CH <sub>3</sub>	H		油性 60 - 65°C
a -245	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		
a -246	CH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2\text{C}=\text{CH}_2 \\   \\ \text{Cl} \end{array}$		
a -247	CH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2\text{C}=\text{CH}_2 \\   \\ \text{Cl} \end{array}$		
a -248	CH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2\text{C}=\text{C}(\text{CH}_3)_2 \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$		
a -249	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>		粘性
a -250	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN		粘性
a -251	CH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2\text{C}=\text{CH}_2 \\   \\ \text{Cl} \end{array}$		粘性
a -252	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CHCl		粘性
a -253	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CHCl		粘性

表 4a (续)


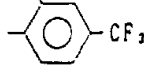
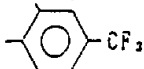
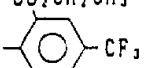
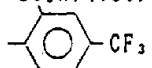
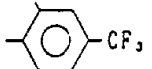
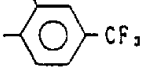
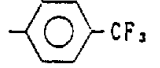
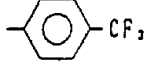
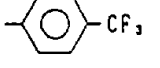
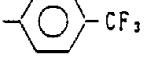

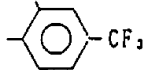
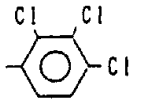
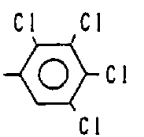
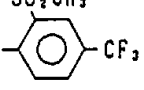
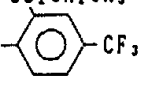
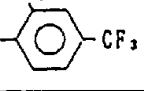
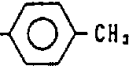
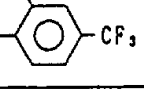
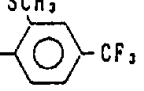
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a - 254	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C=CH <sub>2</sub>   Cl	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 120 - 125°C
a - 255	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>	SOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 97 - 105°C
a - 256	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 116 - 117°C
a - 257	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso) 	粘性
a - 258	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 164 - 165°C
a - 259	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	粘性
a - 260	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso) 	熔点 112 - 115°C
a - 261	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (iso) 	粘性
a - 262	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(=O)CH <sub>2</sub> C(=O)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	粘性
a - 263	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	粘性

表 4a (续)

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	(X) <sub>n</sub> 	物理性质
a -264	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> Cl   CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 123~125°C
a -265	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		
a -266	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		
a -267	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a -268	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a -269	CH <sub>3</sub>	-COC=CH <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	
a -270	CH <sub>3</sub>	-SO <sub>2</sub> -  -CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> )SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> 	熔点 67~72°C
a -271	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=C(Cl) <sub>2</sub>	SCH <sub>3</sub> 	粘性

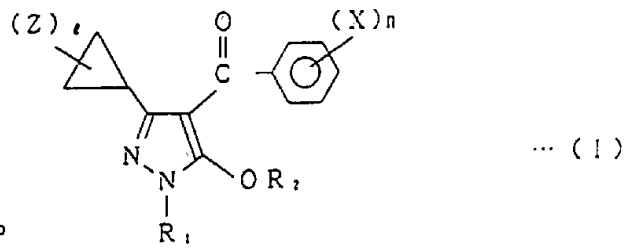
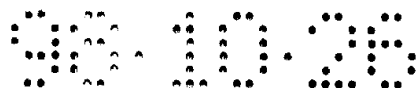


表 4b

化合物	R <sub>1</sub>	(Z) <sup>a</sup>	R <sub>2</sub>	(X) <sup>n</sup>	物理性质
b-1	CH <sub>3</sub>				熔点 46-56°C
b-2	CH <sub>3</sub>				粘性
b-3	CH <sub>3</sub>				
b-4	CH <sub>3</sub>		-SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)		
b-5	CH <sub>3</sub>				
b-6	CH <sub>3</sub>		H		



下面描述本发明的试验实施例。

#### 试验实施例 1

将高地土放入 1/150,000 公顷的盆中，并播种各种耕种植物的种子。当植物达到预定的叶子阶段时([1]仓前草(Echinochloa crus-galli L.), EC: 1.3-2.6 叶阶段, [2]马唐(Digitaria sanguinalis L.), DS: 1.0-2.5 叶阶段, [3]美州茶藜 (Amaranthus retroflexus L.), AR: 0.1-1.2 叶阶段, [4]多刺黄花捻(Sida spinosa L.), SS: 0.1-1.2 叶阶段[5]长牵牛花(Pharbitis purpurea L.), PP: 0.3-1.3 叶阶段, [6]欧龙牙草(Xanthium strumarium L.), XS: 0.1-1.8 叶阶段, [7]水稻(Oryza sativa L.), OS: 1.0-2.5 叶阶段, [8]小麦(Triticum spp.), TR: 2.2-2.9 叶阶段, 10 [9]玉米(Zea mays L.), ZM: 1.8-3.5 叶阶段, [10]大豆(Glycine max Merr.), GM: 初叶-0.3 叶阶段), 称取根据常规方法配制的有本发明化合物的可湿性粉末, 使活性组分达到预定量, 并按 500 升/公顷的量用水稀释。在稀释的溶液中加入 0.1 % (v/v)的农用铺展剂。通过用于叶处理的小批量喷撒, 施用由此配制的除草剂。在施用除草剂后的第 18 天和 30 天, 肉眼观察各植物的生长, 并由生长控制 15 度(%)评价除草剂效果, 生长控制度范围为 0(相当于没有处理过的区域)至 100(完全杀除), 所获结果列于表 5。表 5 中化合物的编号对应于前面表 4a 和 4b 中的化合物编号。

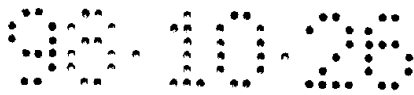


表 5

化合物	活性 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	PP	XS	OS	TR	ZM	GM	
a-3	500	0	0	70	60	60	70	40	0	0	0	23
a-5	500	30	40	70	0	60	60	50	10	0	10	18
a-11	63	40	20	90	20	80	80	50	0	0	50	22
	125	70	40	90	20	80	100	80	0	0	70	
	500	90	50	100	50	100	100	100	0	0	80	
a-12	63	80	40	90	30	80	95	80	0	20	70	18
	125	80	70	80	20	90	80	90	0	0	70	
	500	90	80	90	60	90	80	100	0	0	80	
a-13	500	80	60	90	60	80	100	90	0	0	60	18
a-24	500	40	50	80	10	60	80	50	-	10	30	18
a-25	500	70	90	80	10	70	90	50	-	30	60	18
a-27	500	60	20	100	20	80	80	50	0	0	40	20
a-39	63	70	30	80	20	60	80	50	0	10	60	20
	125	80	60	90	30	60	100	70	0	10	60	
	500	90	80	90	30	70	100	70	10	20	80	
a-40	63	90	30	90	10	90	80	90	-	30	50	18
	125	90	40	90	30	90	90	100	-	50	70	
	500	100	90	100	60	90	100	100	-	70	70	
a-41	63	90	20	90	20	90	70	90	-	0	50	18
	125	90	40	90	20	90	80	90	-	0	70	
	500	100	90	100	40	100	100	100	-	20	90	
a-42	500	60	40	100	30	70	80	50	10	20	50	20
a-43	125	50	30	90	20	60	80	40	0	20	50	20
	500	70	80	100	30	80	100	70	20	20	70	
a-44	63	80	50	80	20	60	80	60	-	0	60	18
	125	90	70	80	20	70	90	80	-	20	70	
	500	90	90	90	30	90	100	80	-	20	80	
a-45	125	40	30	80	20	80	60	10	10	40	50	20
	500	70	50	90	20	80	100	20	20	20	50	
a-47	125	40	40	90	30	60	80	20	-	0	0	18
	500	80	50	100	60	80	80	70	-	30	40	

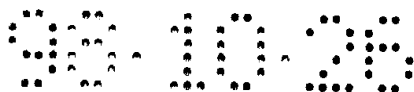


表 5 (续)

化合物	活性 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	PP	XS	OS	TR	ZM	GM	
a-48	63	80	40	90	10	40	70	50	-	0	50	18
	125	90	60	90	30	70	100	60	-	20	60	
	500	100	80	100	60	90	100	80	-	40	70	
a-49	125	80	40	100	30	70	90	60	10	20	60	20
	500	80	70	100	30	80	90	80	20	20	60	
a-51	125	90	60	80	10	80	80	70	-	0	70	19
	500	90	90	100	30	90	90	80	-	10	70	
a-52	63	90	60	80	20	70	80	60	-	20	80	18
	125	90	70	80	30	80	90	70	-	30	90	
	500	90	90	90	50	90	100	80	-	40	90	
a-53	63	70	10	90	0	70	80	50	-	0	50	18
	125	80	20	90	10	80	90	50	-	0	60	
	500	90	90	90	20	90	100	90	-	10	70	
a-59	500	70	40	80	0	80	90	30	0	10	60	20
a-60	63	90	50	80	10	90	90	60	-	0	100	19
	125	90	80	90	20	100	100	70	-	20	90	
	500	90	90	100	30	100	100	90	-	60	90	
a-69	500	40	40	90	50	70	100	60	0	10	40	20
a-72	125	70	20	80	0	60	90	50	-	0	40	19
	500	100	30	90	0	70	100	80	-	0	60	
a-73	500	60	30	90	40	70	80	10	-	30	50	18
a-76	63	70	30	90	0	80	90	70	0	10	70	20
	125	80	60	90	20	80	90	70	10	20	70	
	500	90	90	100	40	100	100	70	20	40	80	
a-77	125	90	30	80	10	70	70	50	-	10	60	18
	500	90	60	90	30	70	90	90	-	30	70	
a-78	63	80	40	70	20	60	80	40	-	10	60	18
	125	80	40	90	20	90	90	60	-	20	70	
	500	100	50	100	40	90	100	60	-	50	70	
a-79	500	60	30	100	50	80	90	30	-	0	70	18
a-80	500	80	90	80	20	60	80	80	-	60	10	19

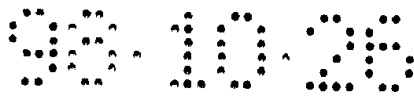


表 5 (续)

化合物	活注 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	FP	XS	OS	TR	ZM	GM	
a-81	125 500	60 90	60 90	90 90	10 30	80 90	40 -	10 40	- -	0 10	30 50	19
a-82	125 500	40 80	30 30	80 90	20 20	80 90	100 100	60 80	- -	0 10	60 70	19
a-83	63 125 500	50 60 90	60 70 90	80 80 90	30 40 40	70 80 90	100 100 90	60 60 80	- - -	0 10 30	10 20 70	18
a-84	63 125 500	70 80 90	30 50 90	70 80 90	30 20 50	40 60 90	100 100 90	30 60 100	- - -	0 0 20	50 60 70	18
a-87	125 500	80 100	20 70	90 95	10 10	70 100	100 -	60 80	- -	10 0	60 95	19
a-88	63 125 500	90 90 100	60 80 90	80 90 90	30 60 60	80 80 90	90 90 100	70 70 80	- - -	10 20 60	70 80 90	18
a-89	63 125 500	90 90 100	90 90 100	90 90 100	30 30 60	90 90 100	100 100 100	100 90 100	- - -	10 20 80	90 100 100	19
a-90	125 500	80 90	90 100	70 80	0 10	60 70	80 100	60 80	- -	40 80	10 70	19
a-92	500	80	90	90	20	90	-	50	-	0	20	19
a-93	125 500	60 80	40 50	95 100	0 20	60 100	100 -	10 70	- -	0 0	70 100	19
a-94	63 125 500	90 100 90	90 90 90	80 90 90	10 - 20	90 100 100	80 100 100	70 90 90	- - -	0 10 20	60 70 70	19
a-95	63 125 500	100 100 100	70 90 100	100 100 100	10 10 40	80 95 100	90 100 -	90 100 100	- - -	20 35 70	95 95 100	19
a-96	125 500	80 100	70 100	80 100	20 30	80 100	90 100	60 70	10 20	40 60	80 90	20
a-97	63 125 500	90 80 90	30 40 90	90 80 90	0 10 20	40 50 70	50 70 80	10 30 50	- - -	0 0 20	20 30 60	18

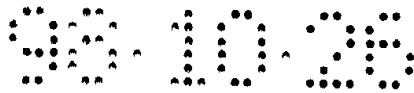


表 5 (续)

化合物	活性 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	PP	XS	OS	TR	ZM	GM	
a-98	63	90	30	90	0	60	70	30	-	0	40	18
	125	90	40	100	30	80	70	40	-	0	50	
	500	90	90	90	30	90	100	100	-	20	60	
a-99	63	90	40	100	40	80	80	70	-	40	70	18
	125	100	60	100	40	90	100	90	-	50	70	
	500	100	100	100	70	100	100	100	-	80	100	
a-100	125	80	40	90	30	80	70	0	-	0	50	18
	500	90	90	100	40	90	100	50	-	10	60	
a-101	125	90	30	90	0	30	20	0	-	0	50	18
	500	90	40	90	30	30	60	0	-	20	60	
a-102	63	90	40	90	20	70	80	80	-	0	100	19
	125	95	60	90	30	80	80	100	-	10	60	
	500	100	90	100	70	90	80	90	-	20	100	
a-103	63	90	30	90	40	60	70	50	-	0	50	19
	125	100	50	60	40	80	100	50	-	0	50	
	500	100	90	80	50	100	100	100	-	40	70	
a-104	125	80	20	90	0	10	0	0	-	0	10	19
	500	90	20	100	10	10	0	0	-	0	20	
a-105	63	90	30	100	30	40	20	10	-	10	40	19
	125	90	40	100	0	60	80	30	-	0	50	
	500	100	80	80	30	90	-	50	-	80	90	
a-106	63	10	30	80	50	60	-	20	-	0	30	21
	125	70	70	100	50	90	90	90	-	20	40	
	500	90	70	70	-	100	50	100	-	50	80	
a-116	125	50	10	100	30	70	-	30	-	10	30	24
	500	50	50	90	20	90	-	20	-	0	40	
a-118	63	70	30	100	30	70	90	100	-	10	70	21
	125	80	50	80	30	80	-	100	-	40	100	
	500	90	80	100	-	100	100	100	-	60	100	
a-120	63	90	50	100	20	50	80	90	-	0	70	21
	125	100	50	100	50	80	100	100	-	0	80	
	500	90	90	-	100	60	100	100	-	70	100	
a-122	63	70	50	100	40	60	90	60	-	10	50	21
	125	80	90	100	50	70	90	90	-	30	60	
	500	90	90	-	-	50	100	100	-	40	70	

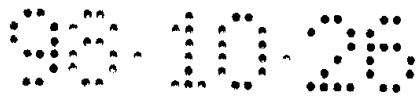


表 5 (续)

化合物	活性 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	PP	XS	OS	TR	ZM	GM	
a-131	500	80	40	60	30	80	100	50	-	30	20	19
a-132	125 500	80 90	70 90	60 60	20 20	90 90	50 50	10 40	- -	30 70	0 10	19
a-133	500	10	30	90	40	70	10	0	-	40	30	21
a-136	125 500	20 100	30 100	90 80	50 30	70 70	- 50	0 0	- -	40 100	40 50	21
a-137	125 500	20 90	30 60	90 100	0 10	100 100	- 80	0 40	- -	40 80	30 50	21
a-138	500	100	80	90	70	100	20	0	-	90	50	21
a-139	500	10	50	90	50	70	70	0	-	80	50	21
a-140	63 125 500	90 90 100	10 30 90	100 100 -	10 20 30	40 80 100	70 80 80	0 20 90	- - -	0 10 0	30 40 50	21
a-141	125 500	80 90	60 90	100 -	30 60	90 100	90 100	90 90	- -	20 30	70 80	21
a-143	500	90	30	50	20	80	100	20	-	20	60	18
a-144	500	50	90	30	40	60	100	50	-	0	20	18
a-146	125 500	20 60	30 80	80 80	40 40	80 90	50 100	40 60	- -	20 30	40 70	19
a-148	125 500	60 90	10 80	100 100	50 50	70 80	10 20	20 20	- -	10 40	10 40	21
a-149	63 125 500	60 90 100	20 30 80	90 80 100	40 50 70	80 80 100	- - 100	0 40 100	- - -	10 20 60	60 70 90	21
a-150	125 500	90 100	70 90	50 70	20 20	80 100	- 70	40 70	- -	100 100	60 70	25

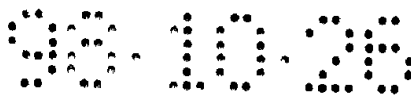


表 5 (续)

化合物	活性 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	PP	XS	OS	TR	ZM	GM	
a-151	125 500	100 100	90 90	40 100	30 30	80 100	30 80	20 20	- -	50 90	30 50	25
a-152	125 500	100 100	60 90	70 90	10 50	60 100	20 100	10 20	- -	60 50	10 40	25
a-153	125 500	60 90	20 60	50 60	10 30	40 50	80 -	10 20	- -	0 10	0 20	24
a-154	500	90	70	70	10	70	60	50	-	0	30	25
a-155	500	60	70	100	10	70	100	20	-	0	40	25
a-156	250	90	70	20	20	70	-	20	-	10	40	21
a-158	125 250	60 70	40 50	90 90	20 20	70 90	70 -	50 50	- -	40 60	50 50	21
a-162	500	60	20	0	10	80	-	10	0	10	0	21
a-164	500	70	70	20	10	90	-	10	0	40	50	21
a-165	63 125 500	100 100 100	95 95 100	100 100 100	40 100 100	100 100 100	50 - -	99 100 100	50 50 80	50 90 95	40 60 100	30
a-166	63 125 500	95 100 100	80 95 100	100 - 100	40 50 50	90 100 100	20 20 -	70 100 100	10 50 50	40 40 70	40 40 50	30
a-167	125 500	10 40	20 30	100 100	0 90	100 100	90 100	40 70	- -	0 30	40 100	21
a-168	63 125 500	90 100 100	60 70 100	100 100 100	50 60 60	90 100 100	90 - -	100 100 100	- - -	40 70 100	50 70 100	21
a-169	63 125	90 90	60 70	100 90	30 40	100 100	10 10	10 20	- -	10 10	30 60	21
a-170	63 125	90 90	60 80	80 100	20 50	100 100	70 70	90 100	- -	10 60	90 100	21

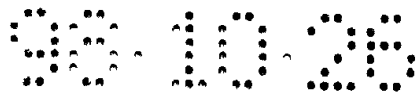


表 5 (续)

化合物	活性 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	PP	XS	OS	TR	ZM	GM	
a-171	500	40	10	40	0	80	-	0	0	0	60	21
a-172	125 500	60 100	20 50	80 90	30 60	80 100	80 -	80 100	0 0	0 50	50 95	21
a-173	125 500	70 90	30 60	30 40	10 30	80 100	30 -	100 100	0 0	0 40	50 60	21
a-174	125 500	70 100	40 60	50 90	0 30	80 100	70 -	100 80	0 0	0 50	70 80	21
a-177	500	80	50	30	0	90	-	10	0	20	40	21
a-178	500	60	40	60	0	80	-	50	0	0	50	21
a-179	500	70	70	90	90	70	-	50	0	0	80	21
a-180	125 500	80 100	20 50	50 90	20 30	100 100	50 -	100 50	0 0	0 60	70 80	21
a-181	125 500	70 100	20 40	70 60	10 20	100 100	70 -	50 90	0 0	0 40	70 80	21
a-182	125 500	60 60	20 60	80 80	0 10	100 100	50 -	50 50	0 0	0 20	50 90	21
a-183	500	0	40	10	10	100	100	0	0	10	40	21
a-184	500	50	20	10	20	100	-	0	0	0	40	21
a-187	500	70	20	100	40	95	-	50	0	0	60	21
a-188	500	50	10	90	40	95	-	10	0	0	70	21
a-189	500	90	10	100	40	95	-	90	0	0	70	21
a-191	125 500	90 100	30 50	90 90	20 40	90 90	- -	20 40	0 0	0 0	50 50	21



表 5 (续)

化合物	活性 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	PP	XS	OS	TR	EM	GM	
a-192	500	30	0	30	0	80	90	30	0	10	60	21
a-194	500	0	30	20	0	100	90	0	0	0	50	22
a-200	500	70	50	95	20	100	90	20	0	0	40	26
a-201	500	20	40	90	40	20	70	40	0	0	0	26
a-203	125 500	20 70	60 80	90 100	10 50	80 100	80 95	20 90	0 0	0 0	60 90	22
a-204	500	70	50	30	0	80	80	20	0	0	50	22
a-206	125 500	80 100	30 80	30 100	20 50	100 100	100 100	90 100	0 0	0 70	90 100	22
a-207	125 500	70 90	20 60	20 90	0 40	100 100	80 100	80 100	0 0	0 20	80 100	22
a-208	125 500	30 70	40 60	90 70	10 40	80 90	100 100	50 95	0 0	0 0	50 60	22
a-209	500	40	10	30	0	90	80	70	0	0	70	22
a-210	125 500	90 100	60 90	70 100	10 40	90 100	90 90	90 90	0 0	0 60	80 100	27
a-211	125 500	40 80	20 50	70 90	0 20	50 70	80 90	70 70	0 0	0 0	40 50	27
a-212	125 500	70 100	0 10	40 70	0 0	0 90	70 80	60 80	0 0	0 0	50 80	27
a-213	125 500	100 100	80 100	95 100	30 70	100 100	100 100	80 100	0 0	20 70	95 100	26
a-214	125 500	60 100	60 90	100 100	20 70	90 100	70 90	100 100	0 0	0 0	50 70	27
a-215	500	0	0	90	20	90	80	0	0	0	40	23



表 5 (续)

化合物	活性 组分 剂量 (g/ha)	生长控制度(%)										评价 天数
		EC	DS	AR	SS	PP	XS	OS	TR	ZM	GM	
a-216	125 500	50 90	70 90	90 100	10 60	70 80	70 100	50 100	0 0	0 0	40 70	23
a-217	125 500	60 30	30 60	50 80	10 20	100 100	80 100	70 100	0 0	0 70	70 100	20
a-218	125 500	70 90	20 60	10 50	10 20	90 100	70 80	70 90	0 0	0 40	80 100	20
a-219	125 500	70 100	30 70	10 60	0 30	100 100	80 100	50 80	0 0	0 70	80 100	20
a-220	125 500	10 70	10 30	10 30	0 20	70 90	80 80	10 60	0 0	0 0	40 40	20
a-221	125 500	60 80	0 60	0 40	0 30	80 100	80 100	50 50	0 0	0 0	70 90	20
a-222	125 500	30 80	10 50	30 80	10 50	80 90	70 90	20 70	0 0	0 10	40 60	20
a-257	125 500	70 90	10 60	10 10	0 10	90 100	70 100	20 30	0 0	0 30	50 100	28
a-258	125 500	50 90	10 70	30 80	0 30	90 100	70 100	10 50	0 0	0 0	40 70	28
a-259	125 500	70 90	70 100	0 20	0 0	80 90	90 100	10 40	0 0	0 0	60 80	28
b-1	500	80	50	80	20	90	-	60	-	20	60	19
b-2	500	90	20	70	20	90	60	60	-	0	60	18

## 试验实施例 2

1/1,000,000 公顷的盆中放入稻田土，播种仓前草(Echinochloa crus-galli L.)和日本灯心草(Scirpus juncooides), 并略盖上土。然后将盆置于温室，处于浸没水深达 0.5-1 厘米状态，两天后，种植日本锯齿宽叶慈菇(Sagittaria pygmaea)。之后，  
5 浸没水深保持在 3-4 厘米水平，当仓前草和日本灯心草达到 0.5 叶阶段，日本锯齿宽叶慈菇达到初叶阶段时，根据常规的配制方法配制有本发明化合物的可湿性粉末的稀释水溶液，在浸没条件下用移液管均匀施用该溶液，使活性组分剂量在预定水平。

另一方面，在 1/1,000,000 公顷的盆中放入稻田土，捣实并弄平，浸没水深度  
10 达 3-4 厘米。1 天后，将 2 叶阶段的水稻(Oryza sativa L. var. Nihonbare)移植在 3 厘米深度。移植后第 4 天，按与上述相同的方式施用本发明的化合物。

施用除草剂后的第 14 天，肉眼观察仓前草、日本灯心草和日本锯齿宽叶慈菇的生长，并在施用后第 21 天肉眼观察水稻的生长，并由生长控制度(%)评价除草剂效果，生长控制度范围为 0(相当于没有处理的区域)至 100(完全杀除)，所获结果  
15 列于表 6。表 6 中化合物的编号对应于前面表 4a 和 4b 中的化合物编号。编号 a-101 及其后面各项(除 a-131、a-132、a-145、a-146 和 b-1 外)的化合物对水稻的生长控制度为这两次试验结果的平均值。



表 6

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SC	SP	OS
a-1	1000	50	100	100	—
	500	40	100	—	—
a-2	500	90	85	90	0
	250	85	85	85	0
a-3	1000	95	100	95	10
	500	95	100	85	0
a-4	500	100	85	85	0
	250	100	50	60	0
a-5	1000	40	85	85	90
	500	0	85	70	30
a-6	500	100	90	90	50
	250	100	85	85	30
a-7	500	100	100	85	80
	250	99	95	85	70
a-8	1000	0	85	85	0
	500	0	50	85	0
a-9	500	10	50	70	30
a-10	500	80	50	85	0
	250	60	50	85	0
a-11	250	100	95	90	100
	125	100	90	85	100
a-12	500	100	100	90	100
	250	100	100	90	100
a-13	500	100	100	90	100
	250	100	100	90	100
a-14	500	40	85	90	10
	250	10	85	85	0
a-15	500	100	85	70	0
	250	50	70	70	0
a-16	500	100	50	30	30
	250	99	0	30	0
a-17	500	100	85	50	20
	250	99	50	50	0

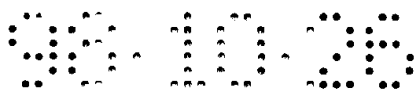


表 6(续)

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-18	500	0	90	95	0
	250	0	85	95	0
a-19	500	70	90	90	10
	250	40	90	85	0
a-20	500	90	85	30	60
	250	85	50	0	35
a-21	500	50	95	90	30
	250	30	90	50	30
a-22	500	95	95	90	30
	250	100	95	50	20
a-23	500	100	99	90	0
	250	50	99	50	0
a-24	250	40	85	90	10
	125	20	80	85	0
a-25	250	100	90	90	0
	125	85	85	85	0
a-26	1000	90	90	10	10
	500	50	90	10	0
a-27	250	100	95	90	100
	125	100	90	85	40
a-39	125	100	90	85	35
	63	100	85	50	30
a-40	125	100	100	90	80
	63	100	99	90	40
a-41	125	100	95	85	100
	63	100	90	85	70
a-42	250	100	90	90	90
	125	100	90	0	90
a-43	250	100	90	90	90
	125	100	85	50	99
a-44	250	100	95	90	95
	125	100	90	85	80
a-45	250	100	99	85	100
	125	100	90	50	90

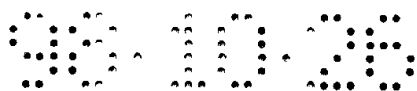


表 6(续)

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-47	250	100	100	95	99
	125	100	85	60	70
a-48	250	100	95	90	95
	125	99	85	50	50
a-49	250	100	90	85	100
	125	100	90	50	100
a-51	250	100	99	85	90
	125	100	95	10	60
a-52	250	100	99	30	100
	125	100	90	30	95
a-53	125	100	95	90	80
	63	100	90	90	0
a-55	250	100	95	20	30
	125	100	50	0	30
a-58	250	100	85	50	40
	125	99	70	50	40
a-59	63	100	90	10	30
	31	100	50	-	30
a-60	250	100	100	70	95
	125	100	95	30	70
a-69	250	100	99	50	100
	125	100	85	50	35
a-72	125	90	85	20	40
	63	60	85	20	35
a-73	125	100	90	50	80
	63	100	70	50	30
a-76	125	100	90	30	0
	63	100	85	0	0
a-77	125	90	85	50	70
	63	70	50	30	40
a-78	250	100	85	85	80
	125	85	60	85	30
a-79	250	100	95	90	90
	125	100	85	50	40



表 6(续)

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-80	500	100	100	95	90
	250	99	100	95	90
a-81	500	95	99	90	30
	250	85	90	50	30
a-82	125	40	85	50	35
	63	20	10	0	20
a-83	250	99	99	90	60
	125	95	99	90	40
a-84	250	100	99	50	90
	125	100	95	50	50
a-85	250	100	85	50	20
	125	95	70	0	20
a-86	125	10	70	10	0
	63	10	60	10	0
a-87	250	100	90	30	40
	125	100	85	0	30
a-88	250	100	90	50	100
	125	100	90	20	95
a-89	250	100	99	90	99
	125	99	99	50	95
a-90	250	99	95	90	80
	125	99	90	85	70
a-91	500	99	99	90	35
	250	99	95	85	30
a-92	250	99	90	10	35
	125	85	85	0	10
a-93	250	100	100	-	40
	125	100	100	85	0
a-94	250	100	99	90	99
	125	100	95	10	99
a-95	250	100	100	-	-
	125	100	100	85	-
a-96	250	100	95	85	100
	125	100	90	10	99

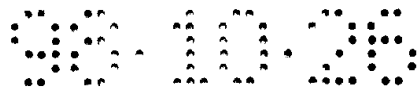


表 6(续)

化合物	活性组分剂量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-97	63	95	30	50	50
	31	95	0	0	50
a-98	63	100	80	70	60
	31	100	60	0	30
a-99	125	100	95	50	100
	63	100	-	50	100
a-100	125	50	70	10	30
	63	10	10	0	0
a-101	63	100	10	0	40
	31	80	0	0	30
a-102	63	95	85	50	40
	31	85	50	0	25
a-103	63	95	90	50	65
	31	85	10	30	10
a-104	63	99	0	0	30
	31	99	0	0	30
a-105	63	95	0	0	40
	31	90	0	0	10
a-106	250	100	70	70	50
	125	99	30	50	15
a-118	250	100	90	60	95
	125	100	70	60	55
a-120	250	100	99	50	98
	125	100	90	40	90
a-122	250	100	100	70	95
	125	100	100	60	100
a-127	1000	20	60	70	-
a-131	250	100	90	-	80
	125	100	85	90	50
a-132	250	100	85	-	-
	125	100	50	50	30
a-135	250	100	20	0	10
	125	70	0	0	0
a-138	125	100	20	0	5
	63	80	-	0	15

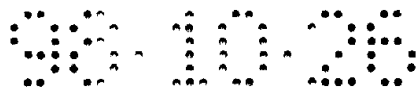


表 6(续)

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-139	5 0 0	7 0	6 0	5 0	-
	2 5 0	7 0	2 0	2 0	-
a-140	2 5 0	1 0 0	9 0	3 0	9 8
	1 2 5	1 0 0	9 0	-	3 5
a-141	2 5 0	1 0 0	1 0 0	3 0	1 0 0
	1 2 5	1 0 0	1 0 0	0	9 5
a-143	5 0 0	1 0 0	1 0	3 0	-
	2 5 0	1 0 0	0	1 0	-
a-144	5 0 0	9 9	2 0	9 0	-
	2 5 0	7 0	1 0	8 5	-
a-145	2 5 0	1 0 0	6 0	5 0	0
	1 2 5	1 0 0	5 0	4 0	1 0
a-146	5 0 0	9 0	9 0	9 0	3 0
	2 5 0	6 0	7 0	7 0	0
a-148	1 2 5	1 0 0	7 0	0	0
	6 3	1 0 0	7 0	0	0
a-149	1 2 5	9 0	3 0	0	0
	6 3	8 5	1 0	0	0
a-150	2 5 0	1 0 0	5 0	6 0	0
	1 2 5	9 5	0	3 0	5
a-151	2 5 0	1 0 0	0	0	3 0
	1 2 5	1 0 0	0	-	5
a-152	2 5 0	1 0 0	6 0	0	1 0 0
	1 2 5	1 0 0	3 0	0	1 0 0
a-153	2 5 0	9 9	9 0	7 0	1 0
	1 2 5	1 0 0	3 0	3 0	2 0
a-154	2 5 0	1 0 0	2 0	4 0	6 0
	1 2 5	9 9	0	0	2 0
a-155	2 5 0	1 0 0	7 0	0	8 5
	1 2 5	1 0 0	6 0	0	5 0
a-157	2 5 0	9 0	9 5	7 0	0
	1 2 5	9 0	0	0	0
a-158	2 5 0	1 0 0	8 0	3 0	9 0
	1 2 5	1 0 0	5 0	6 0	9 0

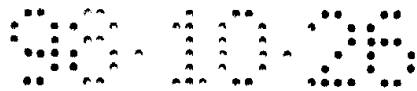


表 6(续)

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制率(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-160	250	80	50	0	0
	125	70	-	0	0
a-161	250	70	0	0	5
	125	70	0	0	0
a-162	250	100	0	0	10
	125	100	0	0	0
a-164	250	100	0	0	60
	125	100	0	0	10
a-165	125	100	80	30	100
	63	95	60	0	35
a-166	125	100	60	0	100
	63	100	20	0	85
a-167	250	100	95	60	35
	125	100	70	0	10
a-168	125	100	95	0	55
	63	100	90	0	50
a-169	125	100	40	0	90
	63	100	40	0	55
a-170	125	100	30	0	85
	63	100	10	0	45
a-171	250	70	0	0	0
a-172	250	80	30	50	50
a-173	250	99	20	0	100
	125	70	-	0	25
a-174	250	100	60	0	100
	125	100	60	0	100
a-175	250	80	50	0	0
	125	80	30	0	0
a-177	250	100	50	0	0
	125	100	30	0	0
a-178	250	100	30	0	10
	125	100	30	0	0
a-179	250	100	90	0	100
	125	100	30	0	90

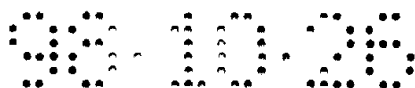


表 6 (续)

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-180	2 5 0	1 0 0	3 0	0	8 0
	1 2 5	1 0 0	0	0	6 0
a-181	2 5 0	1 0 0	0	2 0	5 0
a-182	2 5 0	1 0 0	7 0	0	4 5
	1 2 5	1 0 0	0	0	1 5
a-184	2 5 0	8 5	0	0	0
a-185	2 5 0	7 0	0	0	0
a-187	2 5 0	7 0	8 0	2 0	1 5
	1 2 5	3 0	8 0	0	0
a-188	2 5 0	1 0 0	5 0	2 0	9 5
	1 2 5	1 0 0	5 0	0	8 0
a-189	2 5 0	1 0 0	5 0	2 0	5 5
	1 2 5	1 0 0	5 0	0	5 0
a-191	2 5 0	1 0 0	2 0	2 0	3 5
	1 2 5	9 5	0	0	0
a-194	2 5 0	9 0	3 0	0	1 0
a-200	2 5 0	1 0 0	9 0	0	7 0
	1 2 5	1 0 0	9 0	0	8 0
a-202	2 5 0	1 0 0	7 0	0	1 0
	1 2 5	8 5	2 0	0	1 0
a-203	2 5 0	1 0 0	1 0 0	9 5	1 0 0
	1 2 5	1 0 0	9 5	9 5	1 0 0
a-204	2 5 0	1 0 0	3 0	3 0	1 0
	1 2 5	9 9	0	0	5
a-205	2 5 0	8 5	0	0	5
a-206	2 5 0	1 0 0	0	6 0	1 0 0
	1 2 5	9 5	0	7 0	9 0
a-207	2 5 0	9 5	0	6 0	5 0
	1 2 5	8 0	0	8 0	2 5
a-208	2 5 0	1 0 0	3 0	7 0	8 0
	1 2 5	1 0 0	0	6 0	5 0
a-210	2 5 0	1 0 0	4 0	7 0	1 0 0
	1 2 5	1 0 0	7 0	6 0	8 5

表 6

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-213	250	100	50	0	95
	125	100	20	0	65
a-214	250	100	60	20	60
	125	99	60	0	15
a-216	250	100	80	0	95
	125	100	40	0	15
a-217	250	100	20	0	100
	125	95	0	0	50
a-218	250	100	70	20	100
	125	70	30	0	85
a-219	250	100	30	0	100
	125	100	0	0	70
a-230	63	100	0	0	-
	31	100	0	0	-
a-232	63	100	30	-	-
	31	100	0	0	-
a-233	63	70	0	0	-
	31	50	0	0	-
a-239	63	100	0	0	0
	31	80	0	0	0
a-249	250	100	0	0	95
	125	100	0	0	40
a-250	63	100	40	0	80
	31	100	0	0	45
a-253	63	100	0	0	35
	31	100	0	0	30
a-254	63	100	0	-	5
	31	100	0	0	0
a-256	63	100	0	0	0
	31	80	0	0	0
a-257	250	100	20	0	0
	125	100	0	0	0
a-258	250	60	0	20	5
	125	70	0	0	0

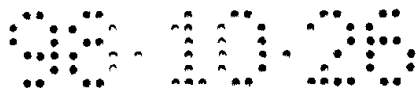
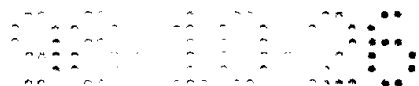


表 6 (续)

化合物	活性组分量 (g/ha)	生长控制度(%)			
		EC	SJ	SP	OS
a-259	250	100	0	0	10
	125	100	0	0	0
a-260	250	100	0	20	10
	125	85	0	0	0
a-261	250	100	0	40	5
	125	70	0	40	0
a-262	250	100	10	0	10
	125	100	0	0	0
a-263	250	100	0	0	10
	125	95	0	0	0
a-264	250	85	0	0	30
	125	70	0	0	15
a-271	63	100	0	0	-
	31	95	0	0	-
b-1	250	100	85	50	50
	125	100	50	50	20



下面为本发明的配方实施例。配方实施例中的化合物编号对应于前面表 4a 和 4b 中的化合物编号。

#### 配方实施例 1

(1)No.a-12 化合物	75 重量份
(2)N-甲基-N-油酰基牛磺酸钠 (商品名: Geropon T-77, 由 Rhone-Poulenc 生产)	14.5 重量份
(3)NaCl	10 重量份
(4)糊精	0.5 重量份

5 在高速混合造粒机中放入上述组分, 与 20 重量% 水混合, 造粒, 并干燥形成可分散于水的颗粒。

#### 配方实施例 2

(1)高岭土	78 重量份
(2)萘磺酸钠和福尔马林缩合物 (商品名: Laveline FAN, 由 Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co. Ltd.生产)	2 重量份
(3)聚氧乙烯烷基芳基醚硫酸钠-与白碳的预混物 (商品名: Sorpol 5039, 由 Toho Chemical Industry Co., Ltd 生产)	5 重量份
(4)白碳(商品名: Carplex, 由 Shionogi Seiyaku Co., Ltd 生产)	15 重量份

上述组分(1)-(4)与 N0.a-6 化合物按 9:1 的重量比混合, 获得可湿性粉末。

10

#### 配方实施例 3

(1)滑石细粉 (商品名: Hi-Filler No.10, 由 Matsumura Sangyo Co., Ltd 生产)	33 重量份
(2)磺基琥珀酸二烷酯-与白碳的预混物 (商品名: Sorpol 5050, 由 Toho Chemical Industry Co. Ltd.生产)	3 重量份
(3)聚氧乙烯烷基芳基醚硫酸盐和聚氧乙烯单甲基醚碳酸盐混合物, 与白碳(商品名: Sorpol 5073, 由 Toho Chemical Industry Co., Ltd 生产)互相预混	4 重量份
(4)No.a-42 化合物	60 重量份

混合上述组分(1)-(4), 获得可湿性粉末。



#### 配方实施例 4

(1)No.a-27 化合物	4 重量份
(2)膨润土	30 重量份
(3)碳酸钙	61.5 重量份
(4)多羧酸型表面活性剂 (商品名: Toxanon GR-31A, 由 Sanyo Chemical Industry Co., Ltd 生产)	3 重量份
(5)木素磺酸钙	1.5 重量份

将粉碎的组分(1)、组分(2)和组分(3)预混,然后再与组分(4)和(5)和水混合。挤压该混合物并造粒,随后干燥并调整粒度,获得颗粒。

#### 5 配方实施例 5

(1)No.a-22 化合物	30 重量份
(2)高岭土和丝云母混合物的粉状产品 (商品名: Zieclite, 由 Zieclite Co. Ltd.生产)	60 重量份
(3)萘磺酸烷酯 (商品名: New Kalgen WG-1, 由 Takemoto Oils and Fats Co., Ltd 生产)	5 重量份
(4)聚氧乙烯烯丙基苯基醚硫酸盐 (商品名: New Kalgen FS-7, 由 Takemoto Oils and Fats Co., Ltd 生产)	5 重量份

混合组分(1)、(2)和(3),并通过一分碎机,然后加入组分(4)。捏合该混合物,然后挤压造粒,随后干燥并调整粒度,获得可分散于水的颗粒。

#### 配方实施例 6

(1)No.a-13 化合物	28 重量份
(2)氧乙烯化芳基多酚磷酸酯的三乙醇胺盐 (商品名: Soprophor FL, 由 Rhone-Poulenc 生产)	2 重量份
(3)聚氧乙烯苯乙基苯基醚和烷基芳基磺酸盐的混合物 (商品名: Sorpol 355, 由 Toho Chemical Industry Co. Ltd.生产)	1 重量份
(4)异链烷烃 (商品名: IP 溶剂 1620, 由 Idemitsu Petrochemical Co., Ltd 生产)	32 重量份

# 实施例 6

(5)乙二醇

6 重量份

(6)水

31 重量份

混合上述组分(1)-(6)，并用湿磨机(Dyno-mill)粉碎，获得水基悬浮浓缩物。