



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 1988802 B

(45) 授权公告日 2011.03.23

(21) 申请号 200580024638.8

(22) 申请日 2005.07.21

(30) 优先权数据

216399/2004 2004.07.23 JP

73005/2005 2005.03.15 JP

(85) PCT申请进入国家阶段日

2007.01.22

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2005/007948 2005.07.21

(87) PCT申请的公布数据

W02006/008159 EN 2006.01.26

(73) 专利权人 拜耳作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 荒木恒一 工藤祐夫 佐藤善孝

伊藤雅仁 五味渊琢也 狗田铁也

新木康夫 远藤惠次 白仓伸一

中村新

(74) 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专

利商标事务所 11038

代理人 殷骏

(51) Int. Cl.

A01N 43/54 (2006.01)

A01N 43/66 (2006.01)

C07D 239/24 (2006.01)

C07D 239/52 (2006.01)

C07D 251/12 (2006.01)

C07D 251/20 (2006.01)

(56) 对比文件

WO 9309099 A, 1993.05.13, 权利要求 1-8.

US 6458748 B, 2002.10.01, 摘要, 实施例 1-4, 表 1-6.

审查员 索翌

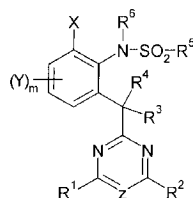
权利要求书 5 页 说明书 90 页

(54) 发明名称

磺酰替苯胺用作农业和园艺杀真菌剂的用途

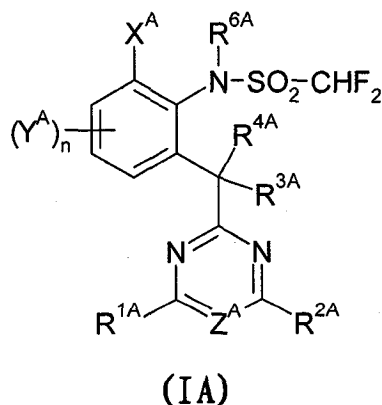
(57) 摘要

式 (I) 化合物用作农业和园艺杀真菌剂, 其中 Z 表示 C-R⁷ 或 N, 并且 R⁵ 表示可以任选经取代的烷基、烯基、炔基、环烷基或烷氧羰基氨基。



(I)

1. 下式所代表的磺酰替苯胺类化合物



其中

X^A 表示氢、 C_{1-6} 烷基、卤素、 C_{1-6} 烷氧基，

Y^A 表示卤素、 C_{1-6} 烷基，并且在 n 为 2 的情形下，2 个 Y^A 彼此可以相同或不同，

Z^A 表示 $C-R^{7A}$ 或 N，

n 表示 0、1 或 2 的整数，

R^{1A} 和 R^{2A} 各自独立地为 C_{1-6} 烷氧基，

R^{3A} 和 R^{4A} 各自独立地为氢、 C_{1-6} 烷基，

R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢，或

R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ ，

R^{6A} 表示氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基-羰基、 C_{1-6} 烷基羰基或 C_{3-7} 环烷基羰基，并且

R^{7A} 表示氢，

除如下 (T-1)-(T-3) 的情形外；

(T-1) 情形是其中 X^A 表示烷基，并且 n 表示 0，

(T-2) 情形是其中 X^A 表示氢， n 表示 0， Z^A 表示 CH， R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基， R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢，或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ ，并且 R^{6A} 表示氢，

(T-3) 情形是其中 X^A 表示卤素， n 表示 0， Z^A 表示 CH 或 N， R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基， R^{3A} 和 R^{4A} 表示氢， R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢，或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ ，并且 R^{6A} 表示氢。

2. 根据权利要求 1 的化合物，其中

X^A 表示氢、氟、氯、 C_{1-4} 烷基，

Y^A 表示氟、氯、 C_{1-4} 烷基，并且在 n 为 2 的情形下，2 个 Y^A 彼此相同或不同，

Z^A 表示 $C-R^{7A}$ 或 N，

n 表示 0、1 或 2，

R^{1A} 和 R^{2A} 各自独立地为 C_{1-4} 烷氧基，

R^{3A} 和 R^{4A} 各自独立地为氢或 C_{1-4} 烷基，

R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢，或

R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ ，

R^{6A} 表示氢、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基-羰基、 C_{1-4} 烷基-羰基、 C_{3-5} 环

烷基-羰基,并且

R^{7A} 表示氢,

除如下 (T-1)-(T-3) 的情形外:

(T-1) 情形是其中 X^A 表示 C_{1-6} 烷基,并且 n 表示 0,

(T-2) 情形是其中 X^A 表示氢, n 表示 0, Z^A 表示 CH, R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基, R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢,或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$,并且 R^{6A} 表示氢,

(T-3) 情形是其中 X^A 表示氟或氯, n 表示 0, Z^A 表示 CH 或 N, R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基, R^{3A} 和 R^{4A} 表示氢, R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢,或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$,并且 R^{6A} 表示氢。

3. 根据权利要求 1 的化合物,其中

X^A 表示氢、氟、氯、 C_{1-4} 烷基,

Y^A 表示氟、氯、 C_{1-4} 烷基,并且在 n 为 2 的情形下,2 个 Y^A 彼此相同或不同,

Z^A 表示 $C-R^{7A}$ 或 N,

n 表示 0、1 或 2,

R^{1A} 和 R^{2A} 各自独立地为 C_{1-4} 烷氧基,

R^{3A} 和 R^{4A} 各自独立地为氢或 C_{1-4} 烷氧基,

R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢,或

R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$,

R^{6A} 表示氢、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基- C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基-羰基、 C_{1-4} 烷基-羰基、 C_{3-5} 环烷基-羰基,并且

R^{7A} 表示氢,

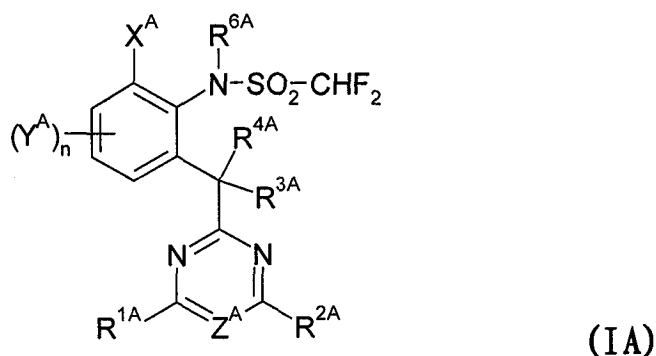
除如下 (T-1)-(T-3) 的情形外:

(T-1) 情形是其中 X^A 表示 C_{1-4} 烷基,并且 n 表示 0,

(T-2) 情形是其中 X^A 表示氢, n 表示 0, Z^A 表示 CH, R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基, R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢,或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$,并且 R^{6A} 表示氢,

(T-3) 情形是其中 X^A 表示氟或氯, n 表示 0, Z^A 表示 CH 或 N, R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基, R^{3A} 和 R^{4A} 表示氢, R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢,或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$,并且 R^{6A} 表示氢。

4. 一种制备式 (IA) 化合物的方法



其中

X^A 表示氢、 C_{1-6} 烷基、卤素、 C_{1-6} 烷氧基,

Y^A 表示卤素、 C_{1-6} 烷基,并且在 n 为 2 的情形下,2 个 Y^A 彼此相同或不同,

Z^A 表示 $C-R^{7A}$ 或 N ,

n 表示 0 至 3 的整数,

R^{1A} 和 R^{2A} 各自独立地为 C_{1-6} 烷氧基,

R^{3A} 和 R^{4A} 各自独立地为氢或 C_{1-6} 烷硫基,

R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢, 或

R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$,

R^{6A} 表示氢、 C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 烷氧基 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基 - 羰基、 C_{1-6} 烷基羰基或 C_{3-7} 环烷基羰基, 并且

R^{7A} 表示氢,

除如下 (T-1)-(T-3) 的情形外;

(T-1) 情形是其中 X^A 表示烷基, 并且 n 表示 0,

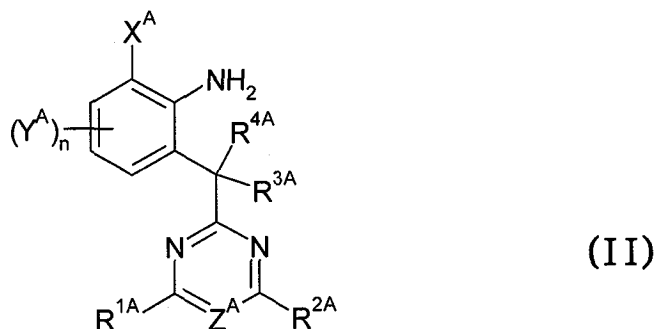
(T-2) 情形是其中 X^A 表示氢, n 表示 0, Z^A 表示 CH , R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基, R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢, 或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$, 并且 R^{6A} 表示氢,

(T-3) 情形是其中 X^A 表示卤素, n 表示 0, Z^A 表示 CH 或 N , R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基, R^{3A} 和 R^{4A} 表示氢, R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢, 或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$, 并且 R^{6A} 表示氢,

其特征在于:

a) 在 R^{6A} 表示氢或二氟甲磺酰基的情形下:

将式 (II) 化合物



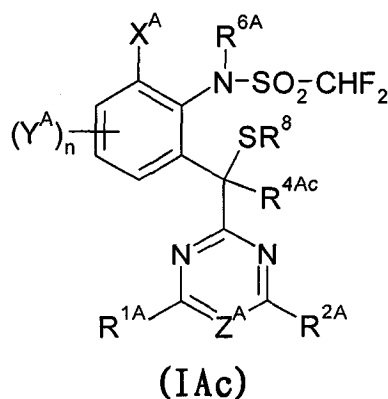
其中

X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^{3A} 和 R^{4A} 具有上述相同定义,

与二氟甲磺酰氯反应, 该反应在惰性溶剂存在下, 并且任选在酸结合剂存在下进行, 或,

c) 在 R^{3A} 表示氢并且 R^{4A} 表示氢的情形下:

将式 (IAC) 化合物



其中

R^{4Ac} 表示氢,

R^8 表示 C_{1-6} 烷基,

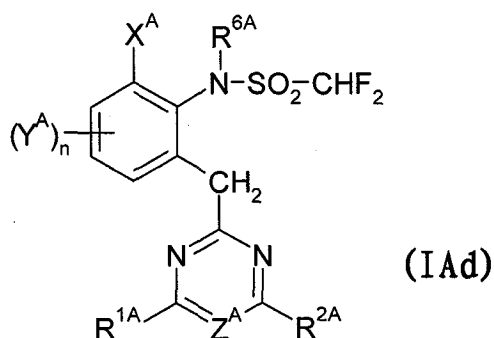
X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义,

与还原剂反应,该反应在惰性溶剂存在下进行,

或,

d) 在 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ 的情形下:

将式 (IAd) 的化合物



其中

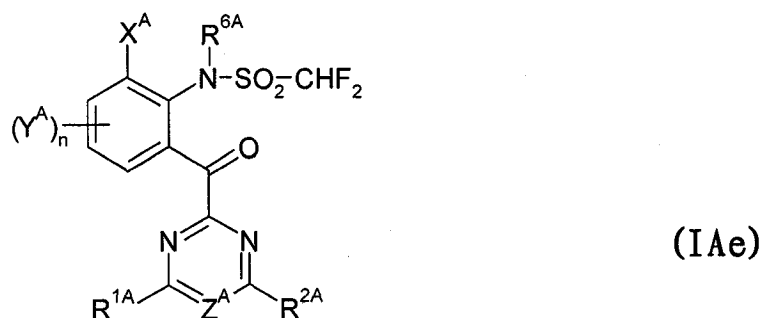
X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义,

与氧化剂反应,该反应在惰性溶剂中,并且任选在酸催化剂存在下进行,

或,

f) 在 R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢的情形下:

将式 (IAe) 的化合物



其中

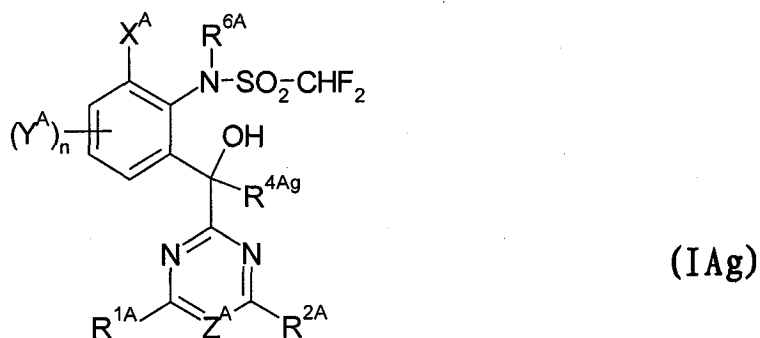
X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义,

与碱金属氢化物络合物或硼烷络合物反应,该反应在惰性溶剂存在下进行,

或,

g) 在 R^{3A} 表示氢并且 R^{4A} 表示氢的情形下:

将式 (IAg) 的化合物



其中

R^{4Ag} 表示氢,

X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义,

与卤化剂反应,该反应在惰性溶剂存在下进行。

5. 一种防治不期望微生物的方法,其特征在于将权利要求1的式 (IA) 的磺酰替苯胺类化合物施用至微生物和 / 或其栖息地。

6. 一种将权利要求1的式 (IA) 的磺酰替苯胺类化合物用于防治不期望的微生物的用途。

7. 一种用于制备杀微生物组合物的方法,其特征在于将权利要求1的式 (I A) 的磺酰替苯胺类化合物与增容剂和 / 或表面活性剂相混合。

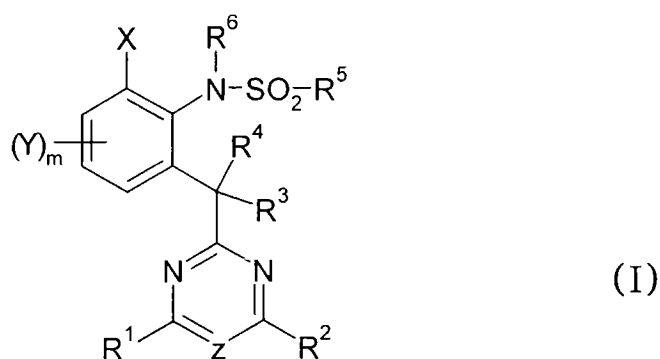
磺酰替苯胺用作农业和园艺杀真菌剂的用途

[0001] 本发明涉及磺酰替苯胺用作农业和园艺杀真菌剂的用途，涉及新的磺酰替苯胺及其制备方法。

[0002] 已知部分磺酰替苯胺显示具有除草剂作用（参见例如，PCT 国际公开小册子 W0 93/9099，PCT 国际公开小册子 W0 96/41799，日本公开专利公开号 No. 60562/1999，日本公开专利公开号 No. 2000-44546，日本公开专利公开号 No. 2000-63360）。

[0003] 现已发现如下式 (I) 的磺酰替苯胺类具有杀真菌活性：

[0004]



[0005] 其中

[0006] X 表示氢、卤素、烷基、烷氧羰基、酰基、二烷基氨基羰基、烷氧基、烷基磺酰基、烷基磺酰基氧基、二烷基氨基、卤烷基、卤烷氧基、卤烷硫基、卤烷基亚磺酰基、卤烷基磺酰基、卤烷基磺酰基氧基、甲酰基、羧基、氰基、硝基或苯氧基，

[0007] Y 表示卤素、可以任选经取代的烷基、烷氧基烷基、烷氧羰基、酰基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤烷氧基、卤烷硫基、卤烷基亚磺酰基、卤烷基磺酰基、二烷基氨基、氰基、氨基或硝基，并且在 m 为 2 或 3 的情形下，2 或 3 个 Y 彼此可以相同或不同，

[0008] Z 表示 C-R⁷ 或 N，

[0009] m 表示 0 至 3 的整数，

[0010] R¹ 和 R² 各自独立地为氢、卤素、可以任选经取代的烷基、环烷基、烷氧基、卤烷氧基、烷硫基或氨基，

[0011] R³ 和 R⁴ 各自独立地为氢、卤素、烷基、可以任选经取代的烷氧基、烷硫基、烷基磺酰基或氨基，

[0012] R³ 表示羟基并且 R⁴ 表示氢或烷基，或

[0013] R³ 和 R⁴ 与其键合的碳原子可以一起形成 C=O，

[0014] R⁵ 表示可以任选经取代的烷基、烯基、炔基、环烷基或烷氧羰基氨基，

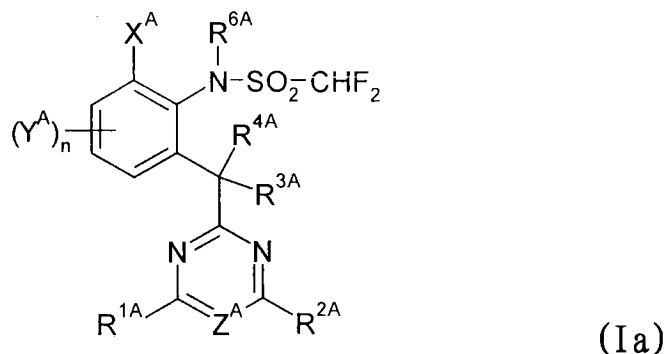
[0015] R⁶ 表示氢、可以任选经取代的烷基、烯基、烷氧基烷基、烷氧羰基、酰基或基团 -SO₂R⁵，并且

[0016] R⁷ 表示氢或烷基。

[0017] 下式 (IA) 所代表的并且包括在上述本发明式 (I) 中的磺酰替苯胺是未在现有出版物中描述的新化合物。

[0018] 式

[0019]



[0020] 其中

[0021] X^A 表示氢、卤素、烷基、烷氧羰基、酰基、二烷基氨基羰基、烷氧基、烷基磺酰基、烷基磺酰基氧基、二烷基氨基、卤烷氧基、卤烷硫基、卤烷基亚磺酰基、卤烷基磺酰基、卤烷基磺酰基氧基、甲酰基、羧基、氰基、硝基或苯氧基，

[0022] Y^A 表示卤素、可以任选经取代的烷基、烷氧基烷基、烷氧羰基、酰基、烷氧基、烷基磺酰基、卤烷氧基、卤烷硫基、卤烷基亚磺酰基、卤烷基磺酰基、二烷基氨基、氰基或硝基，并且在 n 为 2 或 3 的情形下，2 或 3 个 Y^A 彼此可以相同或不同，

[0023] Z^A 表示 $C-R^{7A}$ 或 N，

[0024] n 表示 0 至 3 的整数，

[0025] R^{1A} 和 R^{2A} 各自独立地为氢、卤素、可以任选经取代的烷基、环烷基、烷氧基、卤烷氧基或烷硫基，

[0026] R^{3A} 和 R^{4A} 各自独立地为氢、卤素、烷基、烷氧基、烷硫基或烷基磺酰基，

[0027] R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢或烷基，或

[0028] R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子可以一起形成 $C=O$ ，

[0029] R^{6A} 表示氢、可以任选经取代的烷基、烷氧基烷基、烷氧羰基、酰基或基团 $-SO_2R^{5A}$ ，

[0030] R^{5A} 表示可以任选经取代的烷基，并且

[0031] R^{7A} 表示氢或烷基，

[0032] 除如下 (T-1)-(T-3) 的情形外；

[0033] (T-1) 情形是其中 X^A 表示烷基，并且 n 表示 0，

[0034] (T-2) 情形是其中 X^A 表示氢， n 表示 0， Z^A 表示 CH， R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基， R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢，或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ ，并且 R^{6A} 表示氢，

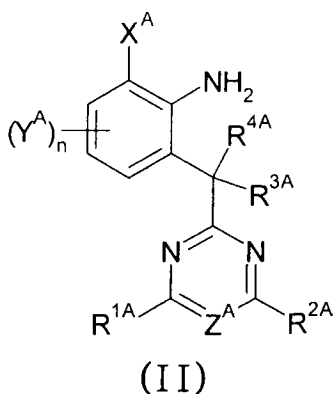
[0035] (T-3) 情形是其中 X^A 表示卤素， n 表示 0， Z^A 表示 CH 或 N， R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基， R^{3A} 和 R^{4A} 表示氢， R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢，或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ ，并且 R^{6A} 表示氢，

[0036] 类似于已知于 PCT 国际公开小册子 WO 93/9099，PCT 国际公开小册子 WO 96/41799，日本公开专利公开号 No. 60562/1999，日本公开专利公开号 No. 2000-44546 的式 (I) 化合物，式 (IA) 化合物可以通过如下方法获得，其中

[0037] a) 在 R^{6A} 表示氢或二氟甲磺酰基的情形下：

[0038] 将式 (II) 化合物

[0039]



[0040] 其中

[0041] X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^{3A} 和 R^{4A} 具有上述相同定义，

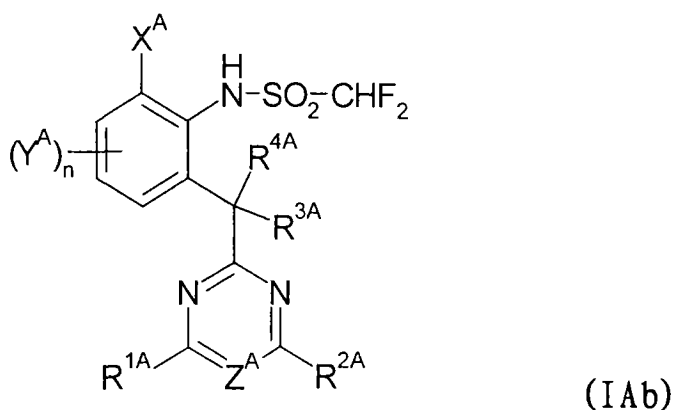
[0042] 与二氟甲磺酰氯反应，该反应在惰性溶剂存在下，并且任选在酸结合剂 (binder) 存在下进行，

[0043] 或，

[0044] b) 在 R^{6A} 表示可以任选经取代的烷基、烷氧基烷基、酰基、烷氧羰基或基团 $-SO_2R^{5A}$ 的情形下：

[0045] 将式 (IAb) 化合物

[0046]



[0047] 其中

[0048] X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^{3A} 和 R^{4A} 具有上述相同定义，

[0049] 与式 (III) 化合物反应

[0050] $R^{6A}-L^b$ (III)

[0051] 其中

[0052] R^{6A} 表示可以任选经取代的烷基、烷氧基烷基、酰基、烷氧羰基或基团 $-SO_2R^{5A}$ ，

[0053] L^b 表示卤素，

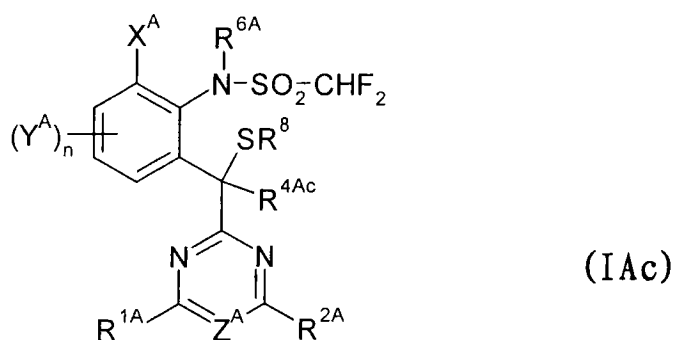
[0054] 该反应在惰性溶剂存在下，并且任选在酸结合剂存在下进行，

[0055] 或，

[0056] c) 在 R^{3A} 表示氢并且 R^{4A} 表示氢或烷基的情形下：

[0057] 将式 (IAc) 化合物

[0058]



[0059] 其中

[0060] R^{4Ac} 表示氢或烷基，

[0061] R^8 表示烷基，

[0062] X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义，

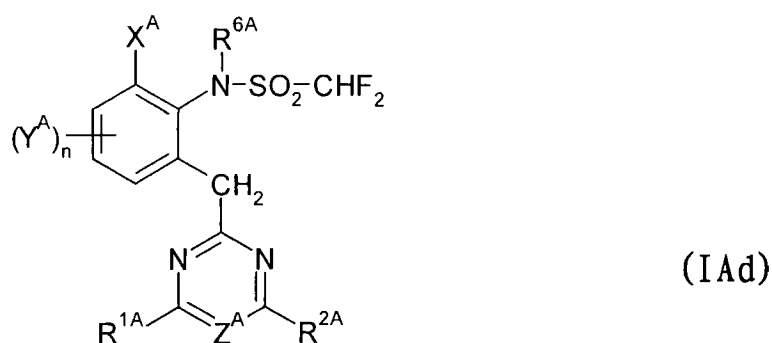
[0063] 与还原剂反应，该反应在惰性溶剂存在下进行，

[0064] 或，

[0065] d) 在 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ 的情形下：

[0066] 将式 (IAc) 的化合物

[0067]



[0068] 其中

[0069] X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义，

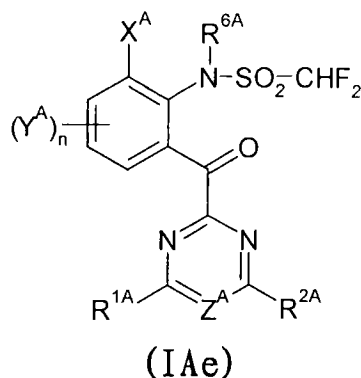
[0070] 与氧化剂反应，该反应在惰性溶剂中，并且任选在酸催化剂存在下进行，

[0071] 或，

[0072] e) 在 R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示烷基的情形下：

[0073] 将式 (IAc) 的化合物

[0074]



[0075] 其中

[0076] X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义，

[0077] 与式 (IV) 化合物反应

[0078] $R^{4Ae}-Mg-L^e$ (IV)

[0079] 其中

[0080] R^{4Ae} 表示烷基，

[0081] L^e 表示卤素，

[0082] 该反应在惰性溶剂存在下进行，

[0083] 或，

[0084] f) 在 R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢的情形下：

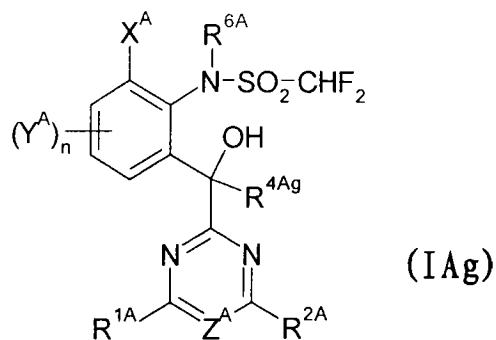
[0085] 将上述式 (IAe) 的化合物与碱金属氢化物络合物或硼烷络合物反应，该反应在惰性溶剂存在下进行，

[0086] 或，

[0087] g) 在 R^{3A} 表示氢并且 R^{4A} 表示氢或烷基的情形下：

[0088] 将式 (IAg) 的化合物

[0089]



[0090] 其中

[0091] R^{4Ag} 表示氢或烷基，

[0092] X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义，

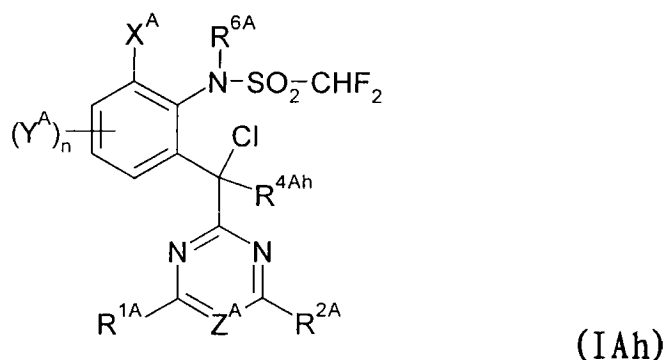
[0093] 与卤化剂反应，该反应在惰性溶剂存在下进行，

[0094] 或，

[0095] h) 在 R^{3A} 表示烷氧基或烷硫基并且 R^{4A} 表示氢或烷基的情形下：

[0096] 将式 (IAh) 的化合物

[0097]



[0098] 其中

[0099] R^{4Ah} 表示氢或烷基，

- [0100] X^A 、 Y^A 、 Z^A 、 n 、 R^{1A} 、 R^{2A} 和 R^{6A} 具有上述相同定义，
- [0101] 与式 (V) 化合物反应
- [0102] $R^{3Ah}-M$ (V)
- [0103] 其中
- [0104] R^{3Ah} 表示烷氧基或烷硫基，
- [0105] M 表示氢或碱金属，
- [0106] 该反应在惰性溶剂存在下，并且任选在酸结合剂存在下进行。
- [0107] 式 (I) 所代表的化合物，包括新的式 (IA) 化合物显示了强植物害虫控制作用。
- [0108] 在本说明书中，
- [0109] “卤素”表示氟、氯、溴或碘，优选表示氟或氯。
- [0110] “烷基”可以是直链或支链，并且可以提及的是例如 C_{1-6} 烷基，具体为甲基、乙基、正 - 或异 - 丙基、正 -、异 -、仲 - 或叔 - 丁基、正 - 或新 - 戊基、正己基等。
- [0111] “环烷基”：可以提及的是例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基等。
- [0112] “烯基”可以是直链或支链，并且可以提及的是例如 C_{2-7} 烯基，具体为乙烯基、烯丙基、异丙烯基、1- 丙烯基、1- 丁烯基、2- 丁烯基、3- 丁烯基、1- 甲基 -1- 丙烯基、2- 甲基 -1- 丙烯基、1- 戊烯基、2- 戊烯基、1- 己烯基、2- 己烯基、1- 庚烯基、2- 庚烯基等。
- [0113] “炔基”可以是直链或支链，并且可以提及的是例如 C_{2-7} 炔基，具体为乙炔基、1- 丙炔基、2- 丙炔基、1- 丁炔基、2- 丁炔基、3- 丁炔基、1- 戊炔基、2- 戊炔基、1- 己炔基、2- 己炔基、1- 庚炔基、2- 庚炔基等。
- [0114] “烷氧基”表示烷基 -O- 基团，其烷基部分具有上述含义，并且可以为例如 C_{1-6} 烷氧基，并且具体可以提及的是甲氧基、乙氧基、正 - 或异 - 丙氧基、正 -、异 -、仲 - 或叔 - 丁氧基、正 - 戊氧基、正 - 己氧基等。
- [0115] “烷硫基”表示烷基 -S- 基团，其烷基部分具有上述含义，并且可以为例如 C_{1-6} 烷硫基，并且具体可以提及的是甲硫基、乙硫基、正 - 或异丙硫基、正 -、异 -、仲 - 或叔 - 丁硫基、正 - 戊硫基、正 - 己硫基等。
- [0116] “烷基亚磺酰基”表示烷基 -S(O)- 基团，其烷基部分具有上述含义，并且可以为例如 C_{1-6} 烷基亚磺酰基，并且具体可以提及的是甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正 - 或异 - 丙基亚磺酰基、正 -、异 -、仲 - 或叔 - 丁基亚磺酰基、正 - 戊基亚磺酰基、正 - 己基亚磺酰基等。
- [0117] “烷基磺酰基”表示烷基 -SO₂- 基团，其烷基部分具有上述含义，并且可以为例如 C_{1-6} 烷基磺酰基，并且具体可以提及的是甲基磺酰基、乙基磺酰基、正 - 或异丙基磺酰基、正 -、异 -、仲 - 或叔 - 丁基磺酰基、正 - 戊基磺酰基、正 - 己基磺酰基等。
- [0118] “烷基磺酰基氧基”表示烷基 -SO₂-O- 基团，其烷基部分具有上述含义，并且可以为例如 C_{1-6} 烷基磺酰基氧基，并且具体可以提及的是甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、正 - 或异丙基磺酰基氧基、正 -、异 -、仲 - 或叔 - 丁基磺酰基氧基、正 - 戊基磺酰基氧基、正 - 己基磺酰基氧基等。
- [0119] “卤烷基”表示直链或支链烷基，至少一个氢经卤素取代，并且可以提及的是例如经 1 至 6 个氟、氯和 / 或溴取代的 C_{1-6} 烷基，并且作为具体实例可以提及的是氟甲基、氯甲基、二氯甲基、溴甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯二氟甲基、三氯甲基、2- 氟乙基、2- 氯乙基、2,2,2- 三氟乙基、2- 氯 -1,1,2- 三氟乙基、3- 氟丙基、3- 氯丙基、2,2,3,3,3- 五氟丙基、1,

2,2,3,3,3- 六氟丙基等。

[0120] “卤烷氧基”、“卤烷硫基”、“卤烷基亚磺酰基”、“卤烷基磺酰基”和“卤烷基磺酰基氧基”中的卤烷基部分可以具有上述“卤烷基”的相同定义,并且

[0121] 具体的“卤烷氧基”可以提及的是例如二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯甲氧基、2- 氟乙氧基、2- 氯乙氧基、2,2,2- 三氟乙氧基、3- 氯丙氧基等,

[0122] 具体的“卤烷硫基”可以提及的是例如二氟甲硫基、三氟甲硫基、2,2,2- 三氟乙硫基、3- 氟丙硫基等,

[0123] 具体的“卤烷基亚磺酰基”可以提及的是例如二氟甲基亚磺酰基、三氟甲基亚磺酰基、2,2,2- 三氟乙基亚磺酰基、3- 氟丙基亚磺酰基等,

[0124] 具体的“卤烷基磺酰基”可以提及的是例如二氟甲基磺酰基、三氟甲基磺酰基、2,2,2- 三氟乙基磺酰基、3- 氟丙基磺酰基等,并且

[0125] 具体的“卤烷基磺酰基氧基”可以提及的是例如二氟甲基磺酰基氧基、三氟甲基磺酰基氧基、2,2,2- 三氟乙基磺酰基氧基、3- 氟丙基磺酰基氧基等,

[0126] “酰基”包括烷基 $-(C=O)-$ 基团,其烷基部分具有上述含义,和环烷基 $-(C=O)-$ 基团,其环烷基部分具有上述含义,并且可以为例如 C_{1-6} 烷基 $-(C=O)-$ 基团或 C_{2-7} 环烷基 $-(C=O)-$ 基团,并且具体可以提及的是甲基羰基(乙酰基)、乙基羰基(丙酰基)、环丙基羰基、环戊基羰基、环己基羰基等。

[0127] “二烷基氨基”为经两个相同或不同烷基取代的氨基,并且其具体可以提及的是例如二甲基氨基、二乙基氨基、二(正-或异-丙基)氨基等。

[0128] 作为“烷氧羰基”可以提及的是例如甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-或异-丙氧基羰基等。

[0129] 作为“二烷基氨基羰基”:可以提及的是例如二甲基氨基羰基、二乙基氨基羰基、二(正丙基)氨基羰基等。

[0130] 作为“烷氧羰基氨基”可以提及的是例如甲氧基羰基氨基、乙氧基羰基氨基、正-或异-丙氧基羰基氨基等。

[0131] 作为“烷氧基烷基”可以提及的是例如甲氧基甲基、2- 甲氧基乙基、1- 甲氧基乙基、3- 甲氧基丙基、乙氧基甲基、2- 乙氧基乙基等。

[0132] 作为在“可以任选经取代的烷基”中的取代基,可以提及的是氰基、苯基、烷氧羰基、卤素等。并且可以用这类取代基取代的烷基包括例如可以经氰基取代的 C_{1-6} 烷基,可以经苯基取代的 C_{1-6} 烷基,可以经 C_{1-6} 烷氧羰基取代的 C_{1-6} 烷基,其至少一个氢可以经卤素原子,尤其是经 1-6 个氟、氯和 / 或溴取代的 C_{1-6} 烷基,并且具体可以提及的是甲基、乙基、正-或异丙基、正-、异-、仲-或叔丁基、正-或新戊基、正庚基;氰基甲基、1- 氰基乙基、2- 氰基乙基;苄基、2- 苄基乙基、1- 苄基乙基(苄乙基)、1- 苄基丙基、2- 苄基丙基、3- 苄基丙基;甲氧基羰基甲基、乙氧基羰基甲基、(正-或异)丙氧基羰基甲基、(正-、异-、仲-或叔)丁氧基羰基甲基、2- 甲氧基羰基乙基、3- 甲氧基羰基丙基;氟甲基、氯甲基、二氯甲基、溴甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯二氟甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2- 三氟乙基、2- 氯-1,1,2- 三氟乙基、3- 氟丙基、3- 氯丙基、2,2,3,3,3- 五氟丙基、1,2,2,3,3,3- 六氟丙基等。

[0133] 在上述式 (IA) 化合物中,优选

[0134] X^A 表示氢、氟、氯、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基-羰基、 C_{1-6} 烷基-羰基、 C_{3-7} 环烷基-羰基、

二 (C_{1-6} 烷基) 氨基羰基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷基磺酰基、 C_{1-6} 烷基磺酰基氧基、二 (C_{1-6} 烷基) 氨基、 C_{1-6} 卤烷氧基、 C_{1-6} 卤烷硫基、 C_{1-6} 卤烷基亚磺酰基、 C_{1-6} 卤烷基磺酰基、 C_{1-6} 卤烷基磺酰基氧基、甲酰基、羧基、氰基、硝基或苯氧基,

[0135] Y^A 表示氟、氯、其中至少一个氢可以任选经卤素取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基 - C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基 - 羰基、 C_{1-6} 烷基 - 羰基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷基磺酰基、 C_{1-6} 卤烷氧基、 C_{1-6} 卤烷硫基、 C_{1-6} 卤烷基亚磺酰基、 C_{1-6} 卤烷基磺酰基、二 (C_{1-6} 烷基) 氨基、氰基或硝基, 并且在 n 为 2 的情形下, 2 个 Y^A 彼此可以相同或不同,

[0136] Z^A 表示 $C-R^{7A}$ 或 N,

[0137] n 表示 0、1 或 2,

[0138] R^{1A} 和 R^{2A} 各自独立地为氢、氯、其中至少一个氢可以任选经卤素取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-7} 环烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 卤烷氧基或 C_{1-6} 烷硫基,

[0139] R^{3A} 和 R^{4A} 各自独立地为氢、氟、氯、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基或 C_{1-6} 烷基磺酰基,

[0140] R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢或 C_{1-6} 烷基, 或

[0141] R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子可以一起形成 $C=O$,

[0142] R^{6A} 表示氢、其中至少一个氢可以任选经卤素取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基 - C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基 - 羰基、 C_{1-6} 烷基 - 羰基、 C_{3-7} 环烷基 - 羰基, 或基团 $-SO_2R^{5A}$,

[0143] R^{5A} 表示 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 卤烷基或经氰基取代的 C_{1-6} 烷基, 并且

[0144] R^{7A} 表示氢或 C_{1-6} 烷基,

[0145] 除如下 (T-1)-(T-3) 的情形外:

[0146] (T-1) 情形是其中 X^A 表示 C_{1-6} 烷基, 并且 n 表示 0,

[0147] (T-2) 情形是其中 X^A 表示氢, n 表示 0, Z^A 表示 CH, R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基, R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢, 或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$, 并且 R^{6A} 表示氢,

[0148] (T-3) 情形是其中 X^A 表示氟或氯, n 表示 0, Z^A 表示 CH 或 N, R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基, R^{3A} 和 R^{4A} 表示氢, R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢, 或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$, 并且 R^{6A} 表示氢。

[0149] 在上述式 (IA) 化合物中, 尤其优选

[0150] X^A 表示氢、氟、氯、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基 - 羰基、 C_{1-4} 烷基 - 羰基、 C_{3-5} 环烷基 - 羰基、二 (C_{1-4} 烷基) 氨基羰基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷基磺酰基、 C_{1-4} 烷基磺酰基氧基、二 (C_{1-4} 烷基) 氨基、 C_{1-4} 卤烷氧基、 C_{1-4} 卤烷硫基、 C_{1-4} 卤烷基亚磺酰基、 C_{1-4} 卤烷基磺酰基、 C_{1-4} 卤烷基磺酰基氧基、甲酰基、羧基、氰基、硝基或苯氧基,

[0151] Y^A 表示氟、氯、其中至少一个氢可以任选经氟取代的 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基 - C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基 - 羰基、 C_{1-4} 烷基 - 羰基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷基磺酰基、 C_{1-4} 卤烷氧基、 C_{1-4} 卤烷硫基、 C_{1-4} 卤烷基亚磺酰基、 C_{1-4} 卤烷基磺酰基、二 (C_{1-4} 烷基) 氨基、氰基或硝基、并且在 n 为 2 的情形下, 2 个 Y^A 彼此可以相同或不同,

[0152] Z^A 表示 $C-R^{7A}$ 或 N,

[0153] n 表示 0、1 或 2,

[0154] R^{1A} 和 R^{2A} 各自独立地为氢、氯、其中至少一个氢可以任选经氟取代的 C_{1-4} 烷基、 C_{3-5} 环烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 卤烷氧基或 C_{1-4} 烷硫基,

[0155] R^{3A} 和 R^{4A} 各自独立地为氢、氟、氯、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基或 C_{1-4} 烷基磺酰基，

[0156] R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢或 C_{1-4} 烷基，或

[0157] R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子可以一起形成 $C=O$ ，

[0158] R^{6A} 表示氢、其中至少一个氢可以任选经氟取代的 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基 - C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基 - 羰基、 C_{1-4} 烷基 - 羰基、 C_{3-5} 环烷基 - 羰基，或基团 $-SO_2R^{5A}$ ，

[0159] R^{5A} 表示 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 卤烷基或经氰基取代的 C_{1-4} 烷基，并且

[0160] R^{7A} 表示氢或 C_{1-4} 烷基，

[0161] 除如下 (T-1)-(T-3) 的情形外：

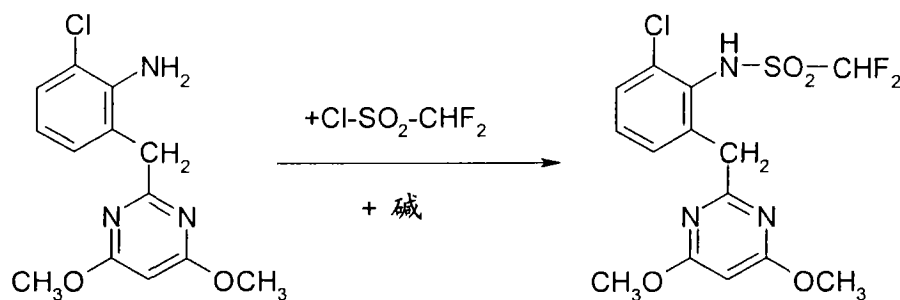
[0162] (T-1) 情形是其中 X^A 表示 C_{1-4} 烷基，并且 n 表示 0，

[0163] (T-2) 情形是其中 X^A 表示氢， n 表示 0， Z^A 表示 CH ， R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基， R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢，或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ ，并且 R^{6A} 表示氢，

[0164] (T-3) 情形是其中 X^A 表示氟或氯， n 表示 0， Z^A 表示 CH 或 N ， R^{1A} 和 R^{2A} 表示甲氧基， R^{3A} 和 R^{4A} 表示氢， R^{3A} 表示羟基并且 R^{4A} 表示氢，或 R^{3A} 和 R^{4A} 与其键合的碳原子一起形成 $C=O$ ，并且 R^{6A} 表示氢。

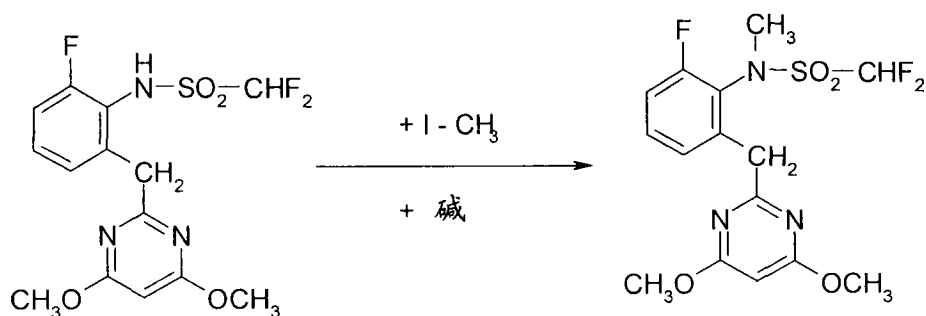
[0165] 如果例如将 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺和二氟甲磺酰氯用作初始物质，上述制备方法 (a) 可以通过如下反应图示加以说明。

[0166]



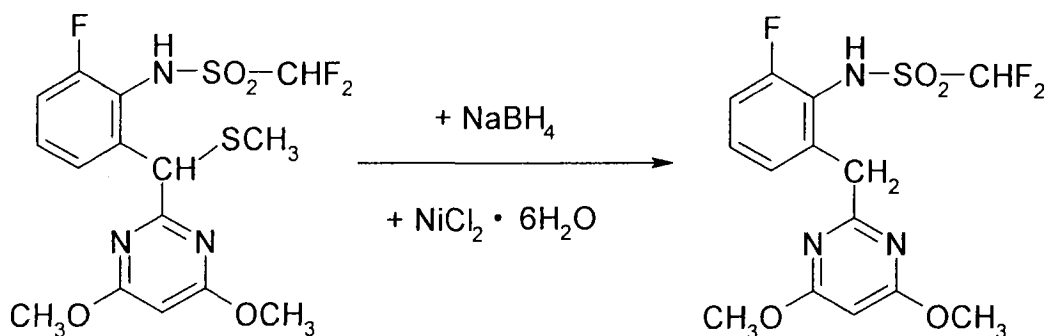
[0167] 如果例如将 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺和碘代甲烷用作初始物质，上述制备方法 (b) 可以通过如下反应图示加以说明。

[0168]



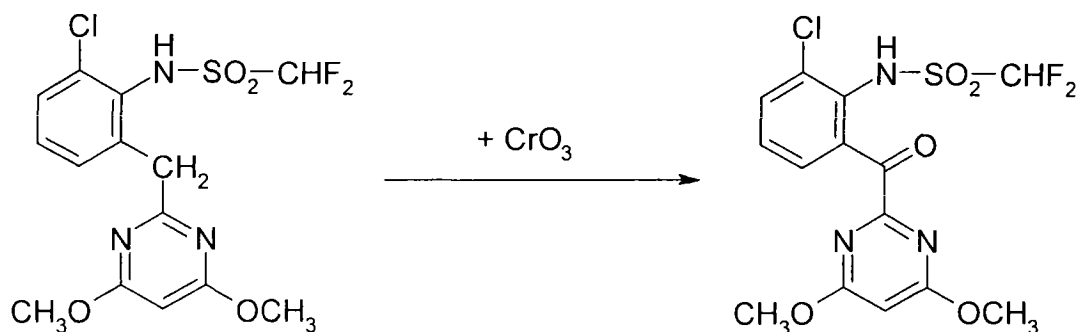
[0169] 如果例如将 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺，以及作为还原剂的例如硼氢化钠和氯化镍 (II) 六水合物用作初始物质，上述制备方法 (c) 可以通过如下反应图示加以说明。

[0170]



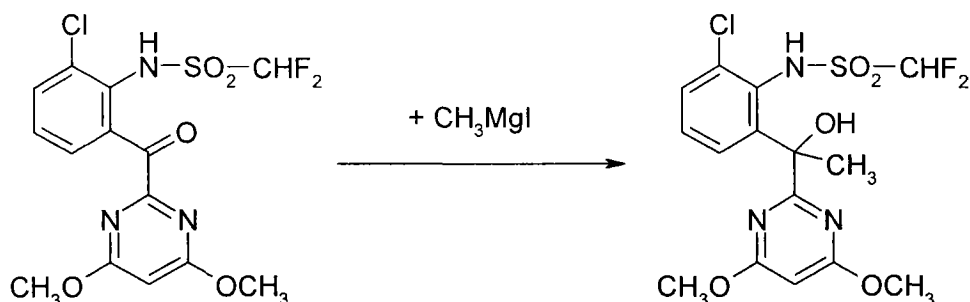
[0171] 如果例如将 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺和氧化铬(VI)用作初始物质,上述制备方法(d)可以通过如下反应图示加以说明。

[0172]



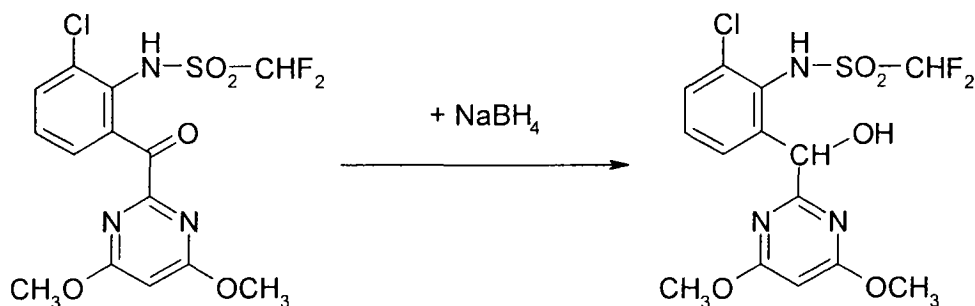
[0173] 如果例如将 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺和碘化甲基镁用作初始物质,上述制备方法(e)可以通过如下反应图示加以说明。

[0174]



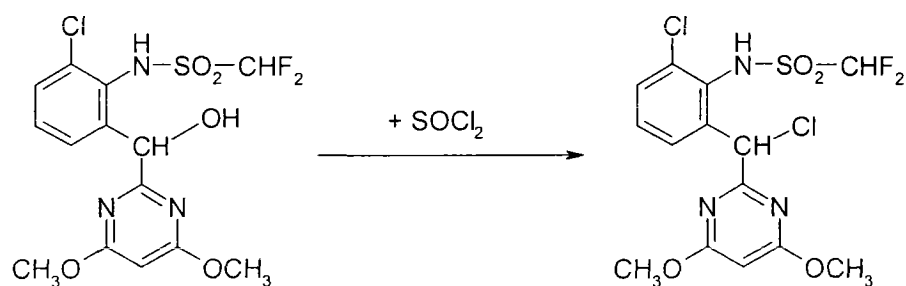
[0175] 如果例如将 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,以及作为还原剂的例如硼氢化钠用作初始物质,上述制备方法(f)可以通过如下反应图示加以说明。

[0176]



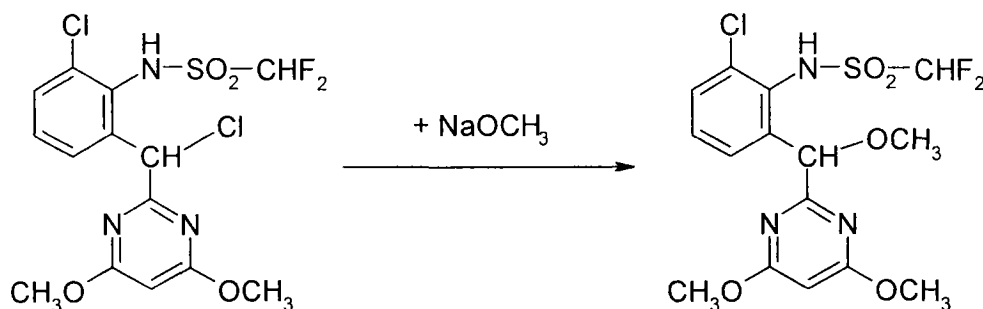
[0177] 如果例如将 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羟基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺和亚硫酸二氯用作初始物质,上述制备方法(g)可以通过如下反应图示加以说明。

[0178]



[0179] 如果例如将 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺和甲醇钠用作初始物质,上述制备方法(h)可以通过如下反应图示加以说明。

[0180]



[0181] 在上述制备方法(a)中用作初始物质的式(II)化合物包括描述于上述专利文献1-3中的已知化合物,其部分是在现有文献中没有描述的新化合物,它们可以根据上述专利文献1-3任一所述的方法制得。可以提及的式(I I)化合物的具体实例如下:

[0182] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0183] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0184] 2-溴-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0185] 2-碘-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0186] 2-三氟甲氧基-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0187] 3-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0188] 3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0189] 4-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0190] 4-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0191] 5-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0192] 5-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0193] 2,3-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0194] 2,3-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0195] 2-氟-3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0196] 3-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0197] 2,4-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0198] 2,4-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0199] 2-氟-4-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0200] 4-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

[0201] 2,5-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,

- [0202] 2,5-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0203] 2-氟-5-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0204] 5-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0205] 3,4-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0206] 3,4-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0207] 3,5-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0208] 3,5-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0209] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0210] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0211] 2-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0212] 2-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0213] 2-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0214] 2-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0215] 3-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0216] 3-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0217] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基乙基]苯胺,
[0218] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基乙基]苯胺,
[0219] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基乙基]苯胺,
[0220] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-甲硫基乙基]苯胺,
[0221] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0222] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0223] 2-溴-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0224] 2-碘-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0225] 3-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0226] 3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0227] 2,3-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0228] 2,3-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]苯胺,
[0229] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基乙基]苯胺,
[0230] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基乙基]苯胺,
[0231] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)-1-甲硫基乙基]苯胺,
[0232] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)-1-甲硫基乙基]苯胺,
[0233] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0234] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0235] 2-氟-6-[(4,6-二甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0236] 2-氯-6-[(4,6-二甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0237] 2,3-二氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0238] 2,3-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0239] 2-氟-3-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0240] 3-氟-2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,

- [0241] 2,4-二氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0242] 2,4-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0243] 2-氟-4-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0244] 4-氟-2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0245] 2,5-二氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0246] 2,5-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0247] 2-氟-5-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0248] 5-氟-2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0249] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)乙基]苯胺,
[0250] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)乙基]苯胺,
[0251] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)乙基]苯胺,
[0252] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)乙基]苯胺,
[0253] 3-氟-6-[(4,6-二甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0254] 3-氯-6-[(4,6-二甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0255] 2-氟-6-[(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0256] 2-氯-6-[(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0257] 2-氟-6-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0258] 2-氯-6-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0259] 3-氟-6-[(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0260] 3-氯-6-[(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)甲基]苯胺,
[0261] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)甲基]苯胺,
[0262] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)甲基]苯胺,
[0263] 2,3-二氟-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)甲基]苯胺,
[0264] 2,3-二氯-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)甲基]苯胺,
[0265] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)乙基]苯胺,
[0266] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)乙基]苯胺,
[0267] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)乙基]苯胺,
[0268] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)乙基]苯胺,
[0269] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0270] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0271] 2,3-二氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0272] 2,3-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0273] 2-氟-3-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0274] 3-氟-2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0275] 2,4-二氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0276] 2,4-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0277] 2-氟-4-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0278] 4-氟-2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0279] 2,5-二氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,

- [0280] 2,5-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0281] 2-氟-5-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0282] 5-氟-2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0283] 2-氟-6-[(4,6-二甲基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0284] 2-氯-6-[(4,6-二甲基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0285] 2-氟-6-[(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0286] 2-氯-6-[(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0287] 2-氟-6-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0288] 2-氯-6-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0289] 3-氟-6-[(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0290] 3-氯-6-[(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)羰基]苯胺,
[0291] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)羰基]苯胺,
[0292] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)羰基]苯胺,
[0293] 2-溴-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)羰基]苯胺,
[0294] 2-碘-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)羰基]苯胺,
[0295] 2,3-二氟-6-[(4,6-二甲氧基吡啶-2-基)羰基]苯胺,
[0296] 2,3-二氯-6-[(4,6-二甲氧基吡啶-2-基)羰基]苯胺,
[0297] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0298] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0299] 2,3-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0300] 2,3-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0301] 2-氟-3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0302] 3-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0303] 2,4-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0304] 2,4-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0305] 2-氟-4-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0306] 4-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0307] 2,5-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0308] 2,5-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0309] 2-氟-5-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0310] 5-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0311] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基乙基]苯胺,
[0312] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基乙基]苯胺,
[0313] 3-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基乙基]苯胺,
[0314] 2-氯-6-[(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-羟基乙基]苯胺,
[0315] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0316] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0317] 2-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0318] 2-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,

- [0319] 2-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0320] 2-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0321] 3-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0322] 3-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0323] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0324] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0325] 2-溴-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0326] 2-碘-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0327] 2,3-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0328] 2,3-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基甲基]苯胺,
[0329] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基乙基]苯胺,
[0330] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基乙基]苯胺,
[0331] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)-1-羟基乙基]苯胺,
[0332] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)-1-羟基乙基]苯胺,
[0333] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0334] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0335] 2-溴-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0336] 2-碘-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0337] 2-三氟甲氧基-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0338] 3-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0339] 3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0340] 4-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0341] 4-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0342] 5-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0343] 5-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0344] 2,3-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0345] 2,3-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0346] 2-氟-3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0347] 3-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0348] 2,4-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0349] 2,4-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0350] 2-氟-4-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0351] 4-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0352] 2,5-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0353] 2,5-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0354] 2-氟-5-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0355] 5-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0356] 3,4-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0357] 3,4-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,

- [0358] 3,5-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0359] 3,5-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0360] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0361] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0362] 2-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0363] 2-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0364] 2-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0365] 2-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0366] 3-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0367] 3-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0368] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0369] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0370] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯乙基]苯胺,
[0371] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯乙基]苯胺,
[0372] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-氯乙基]苯胺,
[0373] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)-1-氯乙基]苯胺,
[0374] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0375] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0376] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0377] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0378] 2,3-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0379] 2,4-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氯甲基]苯胺,
[0380] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氯乙基]苯胺,
[0381] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氯乙基]苯胺,
[0382] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)-1-氯乙基]苯胺,
[0383] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲基三嗪-2-基)-1-氯乙基]苯胺,
[0384] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0385] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0386] 2,3-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0387] 2,3-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0388] 2-氟-3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0389] 3-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0390] 2,4-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0391] 2,4-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0392] 2-氟-4-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0393] 4-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0394] 2,5-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0395] 2,5-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0396] 2-氟-5-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,

[0397] 5-氟-2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0398] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0399] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0400] 2-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0401] 2-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0402] 2-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0403] 2-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0404] 3-氟-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0405] 3-氯-6-[1-(4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0406] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0407] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0408] 2,3-二氟-6-[1-(4,6-二甲氧基吡啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺,
[0409] 2,3-二氯-6-[1-(4,6-二甲氧基吡啶-2-基)-1-氟甲基]苯胺等,
[0410] 在如上制备方法 (a) 中与上述式 (II) 化合物反应的二氟甲磺酰氯是本身已知的物质。

[0411] 在上述制备方法 (b) 中用作初始物质的式 (IAb) 化合物相应于可以通过上述制备方法 (a)、(c)、(d)、(e)、(f)、(g) 或 (h) 制得的部分本发明式 (IA) 化合物。其可以提及的具体实例如下：

[0412] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0413] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基乙基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0414] 2-氟-3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0415] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0416] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)乙基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0417] 2,3-二氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0418] 2-氟-5-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0419] 2,4-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0420] 3,5-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0421] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲基-1-羟基乙基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0422] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氟甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0423] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氟甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,
[0424] 2-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氟甲基]-6-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺等。

[0425] 在如上制备方法 (b) 中与上述式 ((IAb) 化合物反应的式 (III) 化合物是本身已知的物质,并且其可以提及的具体实例如下：

[0426] 碘代甲烷、碘代乙烷、1,1,1-三氟-2-碘乙烷、氯甲甲醚、氯甲乙醚、溴乙酸甲酯、溴丙酸甲酯、乙酰氯、丙酰氯、环丙烷碳酰氯、2,2-二氯-1-乙基-3-甲基-环丙烷碳酰氯、氯甲酸甲酯、氯甲酸乙酯、氯甲酸丙酯、氯甲酸异丙酯等,甲磺酰氯、氯甲磺酰氯、二氟甲磺酰氯、三氟甲磺酰氯、2,2,2-三氟乙磺酰氯、氰基甲基磺酰氯、N,N-二甲基氨磺酰氯、2,2-二氟-2-(氟磺酰基)乙酸甲酯等;乙酸酐、三氟乙酸酐、甲磺酸酐、三氟甲磺酸酐等;乙酸、环己烷羧酸、2,2-二氯-1-甲基环丙烷羧酸等;甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇等。

[0427] 在上述制备方法(c)中用作初始物质的式(IAc)化合物相应于可以通过上述制备方法(a)或(b)制得的部分本发明式(IA)化合物,并且其可以提及的具体实例如下:

[0428] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0429] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基乙基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0430] 2-氟-3-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0431] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0432] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0433] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0434] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-三氟乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0435] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-甲基甲氧基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0436] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0437] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-甲硫基甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺等。

[0438] 在上述制备方法(c)中,作为还原剂用于用氢取代上述式(IAc)化合物中的-SR⁸可以提及的是例如硼氢化钠和氯化镍(II)的组合,或阮内镍等。

[0439] 在上述制备方法(d)中用作初始物质的式(IAd)化合物相应于可以通过上述制备方法(a)、(b)或(c)制得的部分本发明式(IA)化合物,并且其可以提及的具体实例如下:

[0440] 2,3-二氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0441] 2-氟-5-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0442] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0443] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0444] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-三氟乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0445] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-甲基甲氧基-N-二氟甲磺酰替

苯胺,

[0446] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0447] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺等。

[0448] 在上述制备方法 (d) 中,作为氧化剂通过氧化反应用于将上述式 (IAd) 化合物中的亚甲基 ($-\text{CH}_2-$) 转化成羰基 ($=\text{CO}$) 可以提及的是例如氧化铬 (VI)、二氧化锰、二氧化硒等。

[0449] 在上述制备方法 (e) 或 (f) 中用作初始物质的式 (IAe) 化合物相应于可以通过上述制备方法 (a)、(b) 或 (d) 制得的部分本发明式 (IA) 化合物,并且其可以提及的具体实例如下:

[0450] 2,4-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0451] 3,5-二氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0452] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0453] 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0454] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-三氟乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0455] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-甲基甲氧基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0456] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)羰基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0457] 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)羰基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺等。

[0458] 在如上制备方法 (e) 中与上述式 (IAe) 化合物反应的式 (IV) 化合物是本身已知的物质,并且例如其可以提及的具体实例如下:

[0459] 溴化甲基镁、溴化乙基镁、氯化乙烯基镁、溴化烯丙基镁等。

[0460] 在上述制备方法 (f) 中,用于在上述式 (IAe) 化合物中还原羰基 ($=\text{CO}$) 的碱金属氢化物络合物或硼烷络合物可以提及的是例如硼氢化钠、氢化铝锂、二甲硫硼烷、吡啶-硼烷等。

[0461] 在上述制备方法 (g) 中用作初始物质的式 (IAG) 化合物相应于可以通过上述制备方法 (a)、(b)、(f) 或 (e) 制得的部分本发明式 (IA) 化合物,并且其可以提及的具体实例如下:

[0462] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基乙基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0463] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0464] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0465] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]-N-三氟乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0466] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-羟基甲基]-N-甲基甲氧基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0467] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0468] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-羟基甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺等。

[0469] 在上述制备方法 (g) 中,作为卤化剂用于上述式 (IAg) 化合物卤化作用可以提及的是例如二乙胺硫三氟化物、磷酰氯、亚硫酸二氯等。

[0470] 在上述制备方法 (h) 中用作初始物质的式 (IAh) 化合物相应于可以通过上述制备方法 (g) 制得的部分本发明式 (IA) 化合物,并且其可以提及的具体实例如下:

[0471] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0472] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯乙基]-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0473] 2-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]-6-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0474] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0475] 2-氯-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0476] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]-N-三氟乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0477] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-氯甲基]-N-甲基甲氧基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0478] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氯甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺,

[0479] 2-氟-6-[1-(4,6-二甲氧基三嗪-2-基)-1-氯甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺等。

[0480] 在如上制备方法 (h) 中与上述式 (IAh) 化合物反应的式 (V) 化合物是本身已知的物质,并且例如其可以提及的具体实例如下:

[0481] 甲醇钠、乙醇钠、硫代甲醇钠、硫代乙醇钠、硫代丙醇钠等。

[0482] 上述制备方法 (a) 的反应可以在适宜的稀释剂中进行。在该情形下所使用稀释剂的实例可提及的是脂族、脂环族和芳族烃(可以任选经氯代),例如戊烷、己烷、环己烷、石油醚、挥发油、苯、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、氯苯、二氯苯等;醚类,例如乙醚、甲基乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷(DME)、四氢呋喃(THF)、二甘醇二甲醚(DGM)等;酮类例如丙酮、甲基乙基酮(MEK)、甲基异丙酮、甲基异丁酮(MIBK)等;腈类例如乙腈、丙腈等;酯类例如乙酸乙酯、乙酸戊酯等;碱类例如吡啶等。

[0483] 制备方法 (a) 可以在酸结合剂存在下进行,作为所述酸结合剂可以提及的是碱金属或碱土金属的无机碱、氢化物、氢氧化物、碳酸盐、碳酸氢盐等,例如氢化钠、氢化锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸钠、碳酸钾、氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙等;无机的碱金属氢化物例如氨基化锂、氨基化钠、氨基化钾等;作为有机碱类,叔胺、二烷基氨基苯胺和吡啶类,例如三乙胺、1,1,4,4-四甲基乙二胺(TMEDA)、N,N-二甲基苯胺、N,N-二乙基苯胺、吡啶、4-二甲基氨基吡啶(DMAP)、1,4-二氮杂二环[2,2,2]辛烷(DABCO)和1,8-二氮杂二环[5,4,0]十一碳-7-烯(DBU)等。

[0484] 制备方法 (a) 可以在相当宽范围的温度下进行。然而,优选的是一般在约 -100 至约 60℃ 的温度范围下进行,尤其是约 -80 至约 40℃。尽管期望所述反应在常压下进行,其也可以任选在加压或减压下进行。

[0485] 在进行制备方法 (a) 中,通过例如将 1 至 5 摩尔的二氟甲磺酰氯与 1 摩尔的式 (II) 化合物在稀释剂例如二氯甲烷中反应可以获得目标化合物,该反应在 1 至 5 摩尔吡啶存在下进行。

[0486] 上述制备方法 (b) 的反应可以在适宜的稀释剂中进行。在该情形下所使用的稀释剂实例可以提及的是脂族、脂环族和芳族烃(可以任选经氯代),例如己烷、环己烷、挥发油、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、氯苯等;醚类,例如乙醚、甲基乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷(DME)、四氢呋喃(THF)、二甘醇二甲醚(DGM)等;酮类例如丙酮、甲基乙基酮(MEK)、甲基异丙酮、甲基异丁酮(MIBK)等;腈类例如乙腈、丙腈、丙烯腈等;酯类例如乙酸乙酯、乙酸戊酯等;酰胺类例如二甲替甲酰胺(DMF)、二甲替乙酰胺(DMA)、N-甲基吡咯烷酮、1,3-二甲基-2-咪唑啉二酮、六甲替磷酰三胺(HMPA)等;砜、亚砜类例如二甲亚砜(DMSO)、环丁砜等;碱类例如吡啶等。

[0487] 制备方法 (b) 可以在酸结合剂存在下进行,作为所述酸结合剂可以提及的是碱金属或碱土金属的无机碱、氢化物、氢氧化物、碳酸盐、碳酸氢盐等,例如氢化钠、氢化锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸钠、碳酸钾、氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙等;无机的碱金属氢化物例如氨基化锂、氨基化钠、氨基化钾等;作为有机碱类,醇化物、叔胺、二烷基氨基苯胺和吡啶类,例如三乙胺、1,1,4,4-四甲基乙二胺(TMEDA)、N,N-二甲基苯胺、N,N-二乙基苯胺、吡啶、4-二甲基氨基吡啶(DMAP)、1,4-二氮杂二环[2,2,2]辛烷(DABCO)和 1,8-二氮杂二环[5,4,0]十一碳-7-烯(DBU)等;有机锂化合物,例如甲基锂、正丁基锂、仲丁基锂、叔丁基锂、苯基锂、二甲基铜锂、二异丙基酰胺锂、环己基异丙基酰胺锂、二环己基酰胺锂、正丁基锂·DABCO、正丁基锂·DBU、正丁基锂·TMEDA 等。

[0488] 制备方法 (b) 可以在相当宽范围的温度下进行。然而,优选的是一般在约 -100 至约 130℃ 的温度范围下进行,尤其是约 -80 至约 130℃。尽管期望所述反应在常压下进行,其也可以任选在加压或减压下进行。

[0489] 在进行制备方法 (b) 中,通过例如将 1 至 5 摩尔的式 (III) 化合物与 1 摩尔的式 (IAb) 化合物在稀释剂例如乙腈中反应可以获得目标化合物,该反应在 2 至 5 摩尔的碳酸钾存在下进行。

[0490] 在式 (III) 中 R^{6A} 表示酰基或基团 SO_2R^{5A} 的情形下,可以使用衍生自相应的式 (III) 化合物的酸酐,并且在 R^{6A} 表示酰基的情形下,在缩合剂例如 1,1-羰二咪唑(CDI)、1,3-二环己基碳二亚胺(DCC)、1-(3-二甲基二氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺氢氯化物(WSC)、苯并三唑-1-基氧基-三(二甲基氨基)磷六氟磷酸盐(BOP)等存在下可以使用衍生自相应的式 (III) 化合物的羧酸,并且此外,在 R^{6A} 表示烷氧羰基的情形下,可以使用相应的醇和缩合剂例如 1,1-羰二咪唑(CDI),以获得各目标化合物。

[0491] 上述制备方法 (c) 的反应可以在适宜的稀释剂中进行。在该情形下所使用的稀释剂实例可以提及的是脂族、脂环族和芳族烃(可以任选经氯代),例如己烷、环己烷、挥发油、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、氯苯等;醚类,例如乙醚、甲基

乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷 (DME)、四氢呋喃 (THF)、二甘醇二甲醚 (DGM) 等 ; 醇类, 例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇、乙二醇等 ; 酸类, 例如乙酸等。

[0492] 制备方法 (c) 可以在相当宽范围的温度下进行。然而, 优选的是一般在约 -100 至约 80°C 的温度范围下进行, 尤其是约 -80 至约 80°C。尽管期望所述反应在常压下进行, 其也可以任选在加压或减压下进行。

[0493] 在进行制备方法 (c) 中, 通过例如将 1 至 8 摩尔的硼氢化钠与 1 摩尔的式 (IAc) 化合物在稀释剂例如甲醇中反应可以获得目标化合物, 该反应在 1 至 8 摩尔的氯化镍 (II) 六水合物存在下进行。

[0494] 上述制备方法 (d) 的反应可以在适宜的稀释剂中进行。在该情形下所使用的稀释剂实例可以提及的是水 ; 脂族、脂环族和芳族烃 (可以任选经氯代), 例如己烷、环己烷、挥发油、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2- 二氯乙烷、氯苯等 ; 醚类, 例如乙醚、甲基乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷 (DME)、四氢呋喃 (THF)、二甘醇二甲醚 (DGM) 等 ; 酮类例如丙酮、甲基乙基酮 (MEK)、甲基异丙酮、甲基异丁酮 (MIBK) 等 ; 腈类例如乙腈、丙腈、丙烯腈等 ; 酯类例如乙酸乙酯、乙酸戊酯等 ; 酰胺类例如二甲替甲酰胺 (DMF)、二甲替乙酰胺 (DMA)、N- 甲基吡咯烷酮、1,3- 二甲基 -2- 咪唑啉二酮、六甲替磷酸三胺 (HMPA) 等 ; 砜、亚砜类例如二甲亚砜 (DMSO)、环丁砜等 ; 碱类例如吡啶等。

[0495] 制备方法 (d) 可以在酸催化剂存在下进行, 并且其中所述酸催化剂的实例可以提及的是无机酸, 例如盐酸、硫酸、硝酸、氢溴酸、亚硫酸氢钠等 ; 有机酸, 例如甲酸、乙酸、三氟乙酸、丙酸、甲磺酸、苯磺酸、对甲苯磺酸等。

[0496] 制备方法 (d) 可以在相当宽范围的温度下进行。然而, 优选的是一般在约 -100 至约 150°C 的温度范围下进行, 尤其是约 20 至约 120°C。尽管期望所述反应在常压下进行, 其也可以任选在加压或减压下进行。

[0497] 在进行制备方法 (d) 中, 通过例如将 1 至 10 摩尔的氧化铬 (VI) 与 1 摩尔的式 (IAd) 化合物在稀释剂例如乙酸中反应可以获得目标化合物。

[0498] 上述制备方法 (e) 的反应可以在适宜的稀释剂中进行。在该情形下可以使用的稀释剂实例可以提及的是醚类, 例如乙醚、甲基乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷 (DME)、四氢呋喃 (THF)、二甘醇二甲醚 (DGM) 等 ;

[0499] 制备方法 (e) 可以在相当宽范围的温度下进行。然而, 优选的是一般在约 -100 至约 60°C 的温度范围下进行, 尤其是约 -80 至约 30°C。尽管期望所述反应在常压下进行, 其也可以任选在加压或减压下进行。

[0500] 在进行制备方法 (e) 中, 通过例如将 1 至 4 摩尔的式 (IV) 化合物与 1 摩尔的式 (IAe) 化合物在稀释剂例如四氢呋喃中反应可以获得目标化合物。

[0501] 上述制备方法 (f) 的反应可以在适宜的稀释剂中进行。在该情形下所使用的稀释剂实例可以提及的是水 ; 脂族、脂环族和芳族烃 (可以任选经氯代), 例如戊烷、己烷、环己烷、石油醚、挥发油、苯、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2- 二氯乙烷、氯苯、二氯苯等 ; 醚类, 例如乙醚、甲基乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷 (DME)、四氢呋喃 (THF)、二甘醇二甲醚 (DGM) 等 ; 腈类例如乙腈、丙腈等 ; 醇类, 例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇、乙二醇等 ; 酯类例如乙酸乙酯、乙酸戊酯等 ; 酰胺类例如二甲替甲酰胺 (DMF)、二甲替乙

酰胺 (DMA)、N- 甲基吡咯烷酮、1,3- 二甲基-2- 咪唑啉二酮、六甲替磷酰三胺 (HMPA) 等 ; 砜、亚砜类例如二甲亚砜 (DMSO)、环丁砜等 ; 碱类例如吡啶等。

[0502] 制备方法 (f) 可以在相当宽范围的温度下进行。然而, 优选的是一般在约 -100 至约 60℃ 的温度范围下进行, 尤其是约 -80 至约 40℃。尽管期望所述反应在常压下进行, 其也可以任选在加压或减压下进行。

[0503] 在进行制备方法 (f) 中, 通过例如将 0.25 至 2 摩尔的硼氢化钠与 1 摩尔的式 (IAe) 化合物在稀释剂例如甲醇中反应可以获得目标化合物。

[0504] 上述制备方法 (g) 的反应可以在适宜的稀释剂中进行。在将氟化剂例如上述二乙胺硫三氟化物 (diethylamine sulfur trifluoride) 等用作卤化剂的情形下, 所使用的稀释剂实例可以提及的是脂族、脂环族和芳族烃 (可以任选经氯代), 例如己烷、环己烷、挥发油、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2- 二氯乙烷、氯苯等 ; 醚类, 例如乙醚、甲基乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷 (DME)、四氢呋喃 (THF)、二甘醇二甲醚 (DGM) 等, 并且在将氯化剂例如上述磷酰氯、亚硫酰氯等用作卤化剂的情形下, 稀释剂可以提及的是脂族、脂环族和芳族烃 (可以任选经氯代), 例如己烷、环己烷、挥发油、苯、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2- 二氯乙烷、氯苯等 ; 醚类, 例如乙醚、甲基乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷 (DME)、四氢呋喃 (THF)、二甘醇二甲醚 (DGM) 等 ; 酰胺类例如二甲替甲酰胺 (DMF)、二甲替乙酰胺 (DMA)、N- 甲基吡咯烷酮、1,3- 二甲基-2- 咪唑啉二酮、六甲替磷酰三胺 (HMPA) 等。

[0505] 制备方法 (g) 可以在相当宽范围的温度下进行。在将上述氟化剂用作卤化剂的情形下, 优选的是一般在约 -100 至约 30℃ 的温度范围下进行, 尤其是约 -80 至约 30℃。尽管期望所述反应在常压下进行, 其也可以任选在加压或减压下进行。

[0506] 在将上述氯化剂用作卤化剂的情形下, 该方法优选一般在约 -100 至约 130℃ 的温度范围下进行, 尤其是约 -80 至约 130℃。尽管期望所述反应在常压下进行, 其也可以任选在加压或减压下进行。

[0507] 在进行制备方法 (g) 中, 通过例如将 1 至 5 摩尔的二乙胺硫三氟化物与 1 摩尔的式 (IAG) 化合物在稀释剂例如二氯甲烷中反应可以获得目标化合物。

[0508] 此外, 在进行制备方法 (g) 中, 通过例如将 1 摩尔至将其用作溶剂的量的亚硫酰氯与 1 摩尔的式 (IAG) 化合物在稀释剂例如二氯甲烷中反应可以获得目标化合物。

[0509] 上述制备方法 (h) 的反应可以在适宜的稀释剂中进行。在该情形下所使用的稀释剂实例可以提及的是水 ; 脂族、脂环族和芳族烃 (可以任选经氯代), 例如己烷、环己烷、挥发油、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2- 二氯乙烷、氯苯等 ; 醚类, 例如乙醚、甲基乙基醚、异丙醚、丁醚、二噁烷、二甲氧基乙烷 (DME)、四氢呋喃 (THF)、二甘醇二甲醚 (DGM) 等 ; 腈类例如乙腈、丙腈、丙烯腈等 ; 酯类例如乙酸乙酯、乙酸戊酯等 ; 酰胺类例如二甲替甲酰胺 (DMF)、二甲替乙酰胺 (DMA)、N- 甲基吡咯烷酮、1,3- 二甲基-2- 咪唑啉二酮、六甲替磷酰三胺 (HMPA) 等 ; 砜、亚砜类例如二甲亚砜 (DMSO)、环丁砜等 ; 碱类例如吡啶等。

[0510] 制备方法 (h) 可以在酸结合剂存在下进行, 作为所述酸结合剂可以提及的是碱金属或碱土金属的无机碱、氢化物、氢氧化物、碳酸盐、碳酸氢盐等, 例如氢化钠、氢化锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸钠、碳酸钾、氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙等 ; 无机的碱金

属氨化物例如氨基化锂、氨基化钠、氨基化钾等；作为有机碱类，叔胺、二烷基氨基苯胺和吡啶类，例如三乙胺、1,1,4,4-四甲基乙二胺 (TMEDA)、N,N-二甲基苯胺、N,N-二乙基苯胺、吡啶、4-二甲基氨基吡啶 (DMAP)、1,4-二氮杂二环 [2,2,2] 辛烷 (DABCO) 和 1,8-二氮杂二环 [5,4,0] 十一碳-7-烯 (DBU) 等；有机锂化合物，例如甲基锂、正丁基锂、仲丁基锂、叔丁基锂、苯基锂、二甲基铜锂、二异丙基酰胺锂、环己基异丙基酰胺锂、二环己基酰胺锂、正丁基锂 • DABCO、正丁基锂 • DBU、正丁基锂 • TMEDA 等。

[0511] 制备方法 (h) 可以在相当宽范围的温度下进行。然而，优选的是一般在约 -100 至约 130℃ 的温度范围下进行，尤其是约 -80 至约 130℃。尽管期望所述反应在常压下进行，其也可以任选在加压或减压下进行。

[0512] 在进行制备方法 (h) 中，通过例如将 1 至 3 摩尔的式 (V) 化合物与 1 摩尔的式 (IAh) 化合物在稀释剂例如 N,N-二甲替甲酰胺中反应可以获得目标化合物。

[0513] 本发明式 (I) 活性成分化合物显示强的杀菌作用，并且事实上，其可以用于控制不期望的植物病原体。

[0514] 本发明式 (I) 活性成分化合物通常可以用作杀菌剂以控制由根肿菌纲 (Plasmodiophoromycetes)、卵菌纲 (Oomycetes)、接合菌亚纲 (Zygomycetes)、子囊菌纲 (Ascomycetes)、担子菌纲 (Basidiomycetes) 或半知菌纲 (Deuteromycetes) 引起的多种植物病害，并且显示了尤其控制例如植物病原体如稻瘟病梨孢霉 (*Pyricularia oryzae*)、灰色葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) 等的优良效果。

[0515] 以上列举的导致真菌病害的部分病原体属名作为实例来提及，而不是对此进行限制：

[0516] 白粉病，例如

[0517] 例如由禾谷白粉菌 (*Blumeria graminis*) 引起的白粉病 (*Blumeria*) 病害

[0518] 例如由苹果白粉病柄球菌 (*Podosphaera leucotricha*) 引起的柄球菌病害

[0519] 例如由苍耳单丝壳菌 (*Sphaerotheca fuliginea*) 引起的白粉病 (*Sphaerotheca*) 病害

[0520] 例如由葡萄白粉病菌 (*Uncinula necator*) 引起的白粉病 (*Uncinula*) 病害

[0521] 锈病，例如

[0522] 例如由苹果胶锈菌 (*Gymnosporangium sabinae*) 引起的胶锈菌病害

[0523] 例如由咖啡驼孢锈菌 (*Hemileia vastatrix*) 引起的驼孢锈菌病害

[0524] 例如由大豆锈菌 (*Phakopsora pachyrhizi*) 引起的锈菌病害

[0525] 例如由隐匿柄锈菌 (*Puccinia recondita*) 引起的柄锈菌病害；

[0526] 例如由疣顶单孢锈菌 (*Uromyces appendiculatus*) 引起的单孢锈菌病害；

[0527] 卵菌 (Oomycete) 病害，例如

[0528] 例如由莴苣盘梗霉 (*Bremia lactucae*) 引起的盘梗霉病害；

[0529] 例如由芸苔霜霉 (*Peronospora brassicae*) 引起的霜霉病害；

[0530] 例如由蔓延疫霉 (*Phytophthora infestans*) 引起的疫霉病害；

[0531] 例如由葡萄生单轴霉 (*Plasmopara viticola*) 引起的单轴霉病害；

[0532] 例如由古巴假霜霉 (*Pseudoperonospora cubensis*) 引起的假霜霉病害；

[0533] 例如由终极腐霉 (*Pythium ultimum*) 引起的腐霉病害。

- [0534] 叶斑病 (Leafspot)、叶斑病 (Leaf blotch) 和叶枯病,例如
- [0535] 例如由马铃薯早疫病链格孢 (*Alternaria solani*) 引起的链格孢菌病害;
- [0536] 例如由甜菜褐斑病菌 (*Cercospora beticola*) 引起的褐斑病菌病害;
- [0537] 例如由 *Cladosporium cucumerinum* 引起的 *Cladosporium* 病害;
- [0538] 例如由禾旋孢霉 (*Cochliobolus sativus*) 引起的旋孢霉菌病害;
- [0539] 例如由菜豆炭疽病菌 (*Colletotrichum lindemuthianum*) 引起的炭疽病菌病害;
- [0540] 例如由油橄榄孔雀斑病 (*Cycloconium oleaginum*) 引起的孔雀斑病菌病害;
- [0541] 例如由柑桔褐色蒂腐病菌 (*Diaporthe citri*) 引起的腐病菌病害;
- [0542] 例如由柑橘痂囊腔菌 (*Elsinoe fawcettii*) 引起的痂囊腔菌病害;
- [0543] 例如由桃炭疽病菌 (*Gloeosporium laeticolor*) 引起的炭疽病菌 (*Gloeosporium*) 病害;
- [0544] 例如由苹果炭疽病菌 (*Glomerella cingulata*) 引起的炭疽病菌 (*Glomerella*) 病害;
- [0545] 例如由葡萄黑腐病菌 (*Guignardia bidwellii*) 引起的黑腐病菌病害;
- [0546] 例如由油菜腐烂病菌 (*Leptosphaeria maculans*) 引起的腐烂病菌病害;
- [0547] 例如由稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*) 引起的稻瘟病病害;
- [0548] 例如由 *Mycosphaerella graminicola* 引起的 *Mycosphaerella* 病害;
- [0549] 例如由小麦叶枯病菌 (*Phaeosphaeria nodorum*) 引起的叶枯病菌病害;
- [0550] 例如由圆核腔菌 (*Pyrenophora teres*) 引起的核腔菌病害;
- [0551] 例如由 *Ramularia collo-cygni* 引起的 *Ramularia* 病害;
- [0552] 例如由大麦云纹病菌 (*Rhynchosporium secalis*) 引起的云纹病菌病害;
- [0553] 例如由芹菜小壳针孢菌 (*Septoria apii*) 引起的斑枯病 (*Septoria*) 病害;
- [0554] 例如由 *Thyphula incarnata* 引起的 *Thyphula* 病害;
- [0555] 例如由苹果黑星菌 (*Venturia inaequalis*) 引起的黑星菌病害;
- [0556] 根 - 和茎病害,例如
- [0557] 例如由 *Corticium graminearum* 引起的 *Corticium* 病害;
- [0558] 例如由尖孢镰刀菌 (*Fusarium oxysporum*) 引起的镰刀菌病害;
- [0559] 例如由禾顶囊壳菌 (*Gaeumannomyces graminis*) 引起的囊壳菌病害;
- [0560] 例如由立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*) 引起的丝核菌病害;
- [0561] 例如由 *Tapesia acuformis* 引起的 *Tapesia* 病害;
- [0562] 例如由根串珠霉菌 (*Thielaviopsis basicola*) 引起的珠霉菌病害;
- [0563] 鼠耳病和 Panicle Diseases,例如
- [0564] 例如由链格孢属 (*Alternaria* spp.) 引起的链格孢病害;
- [0565] 例如由黄曲霉 (*Aspergillus flavus*) 引起的果腐病 (*Aspergillus*) 病害;
- [0566] 例如由 *Cladosporium* spp. 引起的 *Cladosporium* 病害;
- [0567] 例如由黑麦麦角菌 (*Claviceps purpurea*) 引起的麦角菌病害;
- [0568] 例如由大刀镰孢菌 (*Fusarium culmorum*) 引起的镰孢菌病害;
- [0569] 例如由小麦赤霉病 (*Gibberella zeae*) 引起的赤霉病害;
- [0570] 例如由小麦雪霉叶枯病菌 (*Monographella nivalis*) 引起的叶枯病菌病害;

- [0571] 黑粉病和团粒病,例如
- [0572] 例如由玉米丝黑穗病菌 (*Sphacelotheca reiliana*) 引起的丝黑穗病菌病害;
- [0573] 例如由小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*) 引起的腥黑粉菌病害;
- [0574] 例如由黑麦秆黑穗病菌 (*Urocystis occulta*) 引起的秆黑穗病菌病害;
- [0575] 例如由裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*) 引起的黑粉菌病害;
- [0576] 果实腐烂病和霉病,例如
- [0577] 例如由黄曲霉 (*Aspergillus flavus*) 引起的果腐病 (*Aspergillus*) 病害;
- [0578] 例如由灰色葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) 引起的葡萄孢菌病害;
- [0579] 例如由扩展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 引起的青霉菌病害;
- [0580] 例如由油菜核盘菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 引起的核盘菌病害;
- [0581] 例如由棉花黄萎病菌 (*Verticillium alboatrum*) 引起的黄萎病病害;
- [0582] 种子和土壤传播的衰变 (Decay)、霉菌、枯萎、腐烂和猝倒病害
- [0583] 例如由大麦镰孢菌 (*Fusarium culmorum*) 引起的镰孢菌病害;
- [0584] 例如由恶疫霉 (*Phytophthora cactorum*) 引起的疫霉菌病害;
- [0585] 例如由终极腐霉菌 (*Pythium ultimum*) 引起的腐霉菌病害;
- [0586] 例如由立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*) 引起的丝核菌病害;
- [0587] 例如由白绢病菌 (*Sclerotium rolfsii*) 引起的白绢病菌病害;
- [0588] 溃疡病、枣疯病 (Broom) 和梢枯病,例如
- [0589] 例如由梨树溃疡病菌 (*Nectria galligena*) 引起的溃疡病病害;
- [0590] 枯萎病例如
- [0591] 例如由桃褐腐病菌 (*Monilinia laxa*) 引起的褐腐病病害;
- [0592] 叶疱病或缩叶病,例如
- [0593] 例如由桃缩叶病菌 (*Taphrina deformans*) 引起的缩叶病病害;
- [0594] 木本植物的衰退病,例如
- [0595] 例如由 *Phaeomoniella clamydospora* 引起的 Esca diseases;
- [0596] 花和种子病害,例如
- [0597] 例如由灰色葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) 引起的葡萄孢病害;
- [0598] 块茎病害,例如
- [0599] 例如由立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*) 引起的丝核菌病害。
- [0600] 在需要控制植物病原体的活性化合物的浓度下,本发明式 (I) 活性成分化合物显示了对植物的良好相容性,并且利用该化合物化学处理植物地上部分、化学处理储存部分或种子以及土壤处理是可能的。
- [0601] 本发明式 (I) 活性成分化合物可以进一步用于保护多种材料,以保护它们免受不需要微生物的侵染和破坏。
- [0602] 在本说明书中,材料应理解为指广泛使用的人造的无生命物品。
- [0603] 可以受到本发明活性化合物保护而免于由微生物侵袭引起的变化或破坏的多种材料可以例如是粘合剂、胶料 (sizes)、纸和纸板、纺织品、皮革、木材、涂料和合成涂料、冷润滑剂和其他可被微生物侵袭和破坏的材料。在待保护的材料中还可以包括生产设备的部件,例如可被微生物的繁殖损坏的冷却水循环系统。

[0604] 可提及的引起材料变质或改变的微生物实例为：细菌、霉菌、酵母、藻类、粘土有机体 (slime organisms) 等。

[0605] 作为控制目标,可以提及如下种类的微生物实例：

[0606] 链格孢属 (*Alternaria*),如纤细链格孢 (*Alternaria tenuis*)；

[0607] 曲霉属 (*Aspergillus*),如黑曲霉 (*Aspergillus niger*)；

[0608] 毛壳属 (*Chaetomium*),如球毛壳霉 (*Chaetomium globosum*)；

[0609] 粉孢革菌属 (*Coniophora*),如单纯粉孢革菌 (*Coniophorapuetana*)；

[0610] 香菇属 (*Lentinus*),如 *Lentinus tigrinus*；

[0611] 青霉属 (*Penicillium*),如灰绿青霉 (*Penicillium glaucum*)；

[0612] 多孔菌属 (*Polyporus*),如变色多孔菌 (*Polyporus versicolor*)；

[0613] 短柄霉属 (*Aureobasidium*),如出芽短柄霉 (*Aureobasidium pullulans*)；

[0614] *Sclerophoma*,如 *Sclerophoma pityophila*；

[0615] 木霉属 (*Trichoderma*),如特德哈氏属 (*Trichoderma viride*)；

[0616] 艾希氏杆菌属 (*Escherichia*),如大肠杆菌 (*Escherichia coli*)；

[0617] 假单胞菌属 (*Pseudomonas*),如铜绿色极毛杆菌 (*Pseudomonas aeruginosa*)；

[0618] 葡萄球菌属 (*Staphylococcus*),如金黄色葡萄球菌 (*Staphylococcus aureus*) 等。

[0619] 此外,本发明的式 (I) 活性化合物对温血动物是低毒性的并且可以安全使用。

[0620] 如果用作农业化学品,本发明的式 (I) 活性化合物可以配制成常规制剂形式。可以提及的制剂形式为,例如溶液、可湿性粉剂、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、糊剂、片剂、颗粒剂、气雾剂、活性化合物浸渍的天然和合成物质、微胶囊剂、种子包衣剂、ULV[冷弥雾剂、热弥雾剂]等。

[0621] 这些制剂可以采用本身已知的方法制备,例如通过将活性化合物与增容剂,即液体稀释剂、固体稀释剂或载体,并且任选与表面活性剂即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂相混合来制备。

[0622] 通常可以提及的液体稀释剂或载体为芳族烃类(例如二甲苯、甲苯或烷基萘等),氯代芳族类或氯代脂族烃类(例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷等),脂族烃类[例如环己烷等,或链烷烃类(例如矿物油馏分等)],醇类(例如丁醇、乙二醇等)及其醚和酯类等,酮类(例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮等),强极性溶剂(例如二甲替甲酰胺和二甲基亚砷等),以及水。在利用水作为增容剂的情形下,例如有机溶剂可以用作助溶剂。

[0623] 可以提及的固体稀释剂例如磨碎的天然矿物(例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱土或硅藻土等),磨碎的合成矿物(例如高分散硅酸、氧化铝和硅酸盐等)。

[0624] 可以提及的用于颗粒剂的固体载体例如粉碎和分级的岩石(例如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石等),无机和有机粉末合成颗粒,有机材料的颗粒(例如锯末、坚果壳、玉米穗茎和烟草茎等)等。

[0625] 可以提及的乳化剂和/或发泡剂例如非离子和阴离子乳化剂[例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪酸醇醚(例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐等)],清蛋白水解产物等。

[0626] 分散剂包括例如木质素亚硫酸废液、甲基纤维素等。

[0627] 增粘剂也可以用于制剂（粉剂、颗粒剂、乳油）中。可以提及的可利用的增粘剂为例如羧甲基纤维素、天然和合成聚合物（例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯等）。

[0628] 还可以使用着色剂。可以提及的所述着色剂为无机颜料（例如氧化铁、氧化钛、普鲁士蓝等），有机染料如茜素染料、偶氮染料或金属酞菁染料，以及其它的痕量营养物如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌或这类金属的盐类。

[0629] 所述制剂可以含有通常比例范围为 0.1 至 95 重量%，优选为 0.5 至 90 重量%的本发明的式 (I) 活性化合物。

[0630] 本发明的式 (I) 活性化合物可以以上述制剂或多种施用形式与其它已知的活性化合物一起存在，例如杀菌剂（杀真菌剂、杀细菌剂）、杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、除草剂、驱鸟剂、生长调节剂、肥料和 / 或土壤改良剂、

[0631] 本发明的活性化合物可以作为与其它已知活性化合物的混合物存在于制剂或多种使用形式中，这些已知活性化合物是例如杀真菌剂、杀细菌剂、杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、除草剂、驱鸟剂、生长因子、植物营养素和土壤结构改良剂。

[0632] 在多数情形下，获得增效作用，即混合物的活性超过单个组分的活性。

[0633] 混合物中共组分的实例是如下化合物：

[0634] 杀真菌剂：

[0635] 1. 抑制核酸合成：

[0636] 1.1 苯霜灵 (benalaxyl)、苯霜灵 -M、乙嘧酚磺酸酯 (bupirimate)、chiralaxyl、clozylacon、二甲嘧酚 (dimethirimol)、乙嘧酚 (ethirimol)、呋霜灵 (furalaxyl)、恶霉灵 (hymexazol)、甲霜灵 -M (metalaxyl-M)、呋酰胺 (ofurace)、恶霜灵 (oxadixyl)、喹菌酮 (oxolinic acid)；

[0637] 2. 抑制有丝分裂和细胞分裂：

[0638] 2.1 苯菌灵 (benomyl)、多菌灵 (carbendazim)、乙霉威 (diethofencarb)、麦穗宁 (fuberidazole)、戊菌隆 (pencycuron)、噻菌灵 (thiabendazole)、硫菌灵 (thiophanate-methyl)、苯酰菌胺 (zoxamide)；

[0639] 3. 抑制呼吸作用：

[0640] 3.1 CI : diflumetorim,

[0641] 3.2 CII : boscalid、萎锈灵 (carboxin)、甲呋酰胺 (fenfuram)、氟酰胺 (flutolanil)、呋吡唑灵 (furametpyr)、灭锈胺 (mepronil)、氧化萎锈灵 (oxycarboxine)、penthioopyrad、噻氟菌胺 (thi.fluzamide),

[0642] 3.3 CIII : 嘧菌酯 (azoxystrobin)、氰霜唑 (cyazofamid)、dimoxystrobin、enestrobin、恶唑菌酮 (famoxadone)、咪唑菌酮 (fenamidone)、fluoxastrobin、醚菌酯 (kresoxim-methyl)、苯氧菌胺 (metominostrobin)、orysastrobin、唑菌胺酯 (pyraclostrobin)、picoxystrobin、肟菌酯 (trifloxystrobin),

[0643] 3.4 解偶联剂 (uncouplers) : 二硝酯 (dinocap)、氟啶胺 (fluazinam),

[0644] 3.5 抑制 ATP 产生 : 三苯基乙酸锡 (fentin acetate)、三苯锡氯 (fentin chloride)、毒菌锡 (fentin hydroxide)、silthiofam,

[0645] 4. 抑制 AA 和蛋白质生物合成

- [0646] 4.1 andoprim、灭瘟素 (blasticidin-S)、嘧菌环胺 (cyprodinil)、春雷霉素 (kasugamycin)、春雷霉素盐酸盐水合物 (kasugamycinhydrochloride hydrate)、嘧菌胺 (mepaniprim)、嘧霉胺 (pyrimethanil),
- [0647] 5. 抑制信号传导
- [0648] 5.1 拌种咯 (fenpiclonil)、咯菌腈 (fludioxonil)、苯氧喹啉 (quinoxifen),
- [0649] 6. 抑制类脂和膜合成
- [0650] 6.1 乙菌利 (chlozolate)、异菌脲 (iprodione)、腐霉利 (procymidone)、乙烯菌核利 (vinclozolin),
- [0651] 6.2 吡菌磷 (pyrazophos)、敌瘟磷 (edifenphos)、异稻瘟净 (iprobenfos (IBP))、稻瘟灵 (isoprothiolane),
- [0652] 6.3 甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)、联苯 (biphenyl),
- [0653] 6.4 iodocarb、霜霉威 (propamocarb)、霜霉威盐酸盐 (propamocarb hydrochloride),
- [0654] 7. 抑制麦角甾醇生物合成
- [0655] 7.1 环酰菌胺 (fenhexamid),
- [0656] 7.2 氧环唑 (azaconazole)、联苯三唑醇 (bitertanol)、糠菌唑 (bromuconazole)、环丙唑醇 (cyproconazole)、diclobutrazole、苯醚甲环唑 (difenoconazole)、烯唑醇 (diniconazole)、烯唑醇-M、氟环唑 (epoxiconazole)、乙环唑 (etaconazole)、腈苯唑 (fenbuconazole)、氟唑唑 (fluquinconazole)、氟硅唑 (flusilazole)、粉唑醇 (flutriafol)、呋菌唑 (furconazole)、顺式呋菌唑、己唑醇 (hexaconazole)、亚胺唑 (imibenconazole)、种菌唑 (ipconazole)、叶菌唑 (metconazole)、腈菌唑 (myclobutanil)、多效唑 (paclobutrazol)、戊菌唑 (penconazole)、丙环唑 (propiconazole)、prothioconazole、硅氟唑 (simeconazole)、戊唑醇 (tebuconazole)、四氟醚唑 (tetraconazole)、三唑酮 (triadimefon)、三唑醇 (triadimenol)、灭菌唑 (triticonazole)、烯效唑 (uniconazole)、voriconazole、抑霉唑 (imazalil)、抑霉唑硫酸盐 (imazalil sulfate)、恶咪唑 (oxpoconazole)、氯苯嘧啶醇 (fenarimol)、呋啉醇 (flurprimidol)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、啉斑肟 (pyrifenox)、噻胺灵 (triforine)、稻瘟酯 (pefurazoate)、咪酰胺 (prochloraz)、氟菌唑 (triflumizole)、烯霜苄唑 (viniconazole),
- [0657] 7.3 aldimorph、十二环吗啉 (dodemorph)、十二环吗啉乙酸盐 (dodemorph acetate)、丁苯吗啉 (fenpropimorph)、十三吗啉 (tridemorph)、苯锈啉 (fenpropidin)、螺环菌胺 (spiroxamine),
- [0658] 7.4 naftifine、稗草丹 (pyributicarb)、terbinafine,
- [0659] 8. 抑制细胞壁合成
- [0660] 8.1 benthiavalicarb、双丙氨膦 (bialaphos)、烯酰吗啉 (dimethomorph)、氟吗啉 (flumorph)、异丙菌胺 (iprovalicarb)、多氧菌素 (polyoxins)、polyoxorim、有效霉素 A (validamycin A),
- [0661] 9. 抑制黑素生物合成
- [0662] 9.1 环丙酰菌胺 (carpropamid)、双氯氰菌胺 (diclocymet)、氰菌胺 (fenoxanil)、

phtalide、咯嗪酮 (pyroquilon)、三环唑 (tricyclazole),

[0663] 10. 宿主防御引诱剂

[0664] 10.1 噻二唑素 (acibenzolar-S-methyl)、烯丙苯噻唑 (probenazole)、tiadinil,

[0665] 11. 多位点 (Multisite)

[0666] 11.1 敌菌丹 (captafol)、克菌丹 (captan)、百菌清 (chlorothalonil)、铜制品例如:氢氧化铜、环烷酸铜、氯化铜、硫酸铜、氧化铜、喹铜和波尔多液混合物,苯氟磺胺 (dichlofluanid)、二氰蒽醌 (dithianon)、多果定 (dodine)、多果定游离碱 (dodinefree base)、福镁铁 (ferbam)、fluorofolpet、灭菌丹 (folpet)、双胍盐 (guazatine)、guazatien acetate、双胍辛胺 (iminoctadine)、双八胍盐 (iminoctadine albesilate)、双辛醋酸盐 (iminoctadinetriacetate)、代森锰铜 (mancopper)、代森锰锌 (mancozeb)、代森锰 (maneb)、代森联 (metiram)、代森联锌 (metiram zinc)、丙森锌 (propineb)、硫和硫制品,其包括多硫化钙,福美双 (thiram)、甲苯氟磺胺 (tolylfluanid)、代森锌 (zineb)、福美锌 (ziram),

[0667] 12. 未知作用机制

[0668] 12.1 amibromdole、苯噻硫氰 (benthiazole)、bethoxazin、capsimycin、香芹酮 (carvone)、灭螨猛 (chinomethionat)、氯化苦 (chloropicrin)、硫杂灵 (cufraneb)、cyflufenamid、霜脲氰 (cymoxanil)、棉隆 (dazomet)、咪菌威 (debacarb)、哒菌酮 (diclomezine)、双氯酚 (dichlorophen)、氯硝胺 (dicloran)、野燕枯 (difenzoquat)、野燕枯甲基硫酸盐 (difenzoquatmethyilsulphate)、二苯胺 (diphenylamine)、噻唑菌胺 (ethaboxam)、噁菌脒 (ferimzone)、氟酰菌胺 (flumetover)、磺菌胺 (flusulfamide)、藻菌磷铝盐 (fosetyl-aluminium)、藻菌磷钙盐 (fosetyl-calcium)、藻菌磷钠盐 (fosetyl-sodium)、fluopicolide、fluoroimide、六氯苯 (hexachlorobenzene)、8-羟基喹啉硫酸盐 (8-hydroxyquinoline sulfate)、人间霉素 (irumamycin)、methasulphocarb、表苯菌酮 (metrafenone)、异硫氰酸甲酯 (methyl isothiocyanate)、米多霉素 (mildiomycin)、多马霉素 (natamycin)、福美镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、异丙消 (nitrothal-isopropyl)、辛噻酮 (octhilinone)、oxamocarb、oxyfenthiin、五氯苯酚 (pentachlorophenol) 及其盐、2-苯基苯酚 (2-phenylphenol) 及其盐、亚磷酸及其盐、病花灵 (piperalin)、propanosine-sodium、丙氧喹啉 (proquinazid)、硝吡咯菌素 (pyrrolnitrine)、五氯硝基苯 (quintozene)、叶枯酞 (tecloftalam)、四氯硝基苯 (tecnazene)、咪唑嗪 (triazoxide)、水杨菌胺 (trichlamide)、氰菌胺 (zarilamid) 和 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)-吡啶、N-(4-氯-2-硝基苯基)-N-乙基-4-甲基-苯磺酰胺、2-氨基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑羧酰胺、2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶羧酰胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噻唑啉-3-基]吡啶、顺式-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-环庚醇、1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、3,4,5-三氯-2,6-吡啶二腈、2-[[[环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫基]甲基]- α -(甲氧基-亚甲基)-苯乙酸甲酯、4-氯- α -丙炔基氧基-N-[2-[3-甲氧基-4-(2-丙炔基氧基)苯基]乙基]-苯乙酰胺、(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔基]氧基]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺酰基)氨基]-丁酰胺、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯

基)[1,2,4]三唑[1,5-a]嘧啶-5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-N-[(1R)-1,2,2-三甲基丙基][1,2,4]三唑[1,5-a]嘧啶-7-胺、5-氯-N-[(1R)-1,2-二甲基丙基]-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑[1,5-a]嘧啶-7-胺、N-[1-(5-溴代-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、N-(5-溴代-3-氯吡啶-2-基)甲基-2,4-二氯烟酰胺、2-丁氧基-6-碘代-3-丙基-苯并吡喃-4-酮、N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基-乙酰胺、N-(3-乙基-3,5,5-三甲基-环己基)-3-甲酰基氨基-2-羟基-苯甲酰胺、2-[[[1-[3(1-氟-2-苯基乙基)氧基]苯基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]- α -(甲氧基亚氨基)-N-甲基- α E-苯乙酰胺、N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苯甲酰胺、N-(3',4'-二氯-5-氟二苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-1-羧酸、0-[1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基]-1H-咪唑-1-硫代羧酸、2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺。

[0669] 杀细菌剂：

[0670] 溴硝醇 (bronopol)、双氯酚 (dichlorophen)、三氯甲基吡啶 (nitrapyrin)、福美镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、春雷霉素 (kasugamycin)、辛噻酮 (octhilinone)、呋喃甲酸 (furancarboxylic acid)、土霉素 (oxytetracyclin)、噻菌灵 (probenazole)、链霉素 (streptomycin)、叶枯酞 (tecloftalam)、硫酸铜和其它铜制剂。

[0671] 杀虫剂 / 杀螨剂 / 杀线虫剂：

[0672] 1. 乙酰胆碱酯酶 (AChE) 抑制剂

[0673] 1.1 氨基甲酸酯类 (例如棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、涕灭砒威 (aldoxycarb)、除害威 (allyxycarb)、灭害威 (aminocarb)、甲基吡恶磷 (azamethiphos)、恶虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、合必威 (bufencarb)、畜虫威 (butacarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮砒威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、克百威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、chloethocarb、蝇毒磷 (coumaphos)、苯腈磷 (cyanofenphos)、杀螟腈 (cyanophos)、敌蝇威 (dimetilan)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、苯硫威 (fenothiocarb)、伐虫脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、威百亩 (metam-sodium)、甲硫威 (methiocarb)、灭多威 (methomyl)、速灭威 (metolcarb)、杀线威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、猛杀威 (promecarb)、残杀威 (propoxur)、硫双威 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、啮蚜威 (triazamate)、混杀威 (trimethacarb)、XMC、灭杀威 (xylylcarb)；

[0674] 1.2 有机磷酸酯类 (例如乙酰乙胺磷 (acephate)、甲基吡恶磷 (azamethiphos)、谷硫磷 (azinphos(-甲酯, -乙酯)、溴硫磷乙酯 (bromophos-ethyl)、bromfenvinfos(-methyl)、特噻硫磷 (butathiofos)、硫线磷 (cadusafos)、三硫磷 (carbophenothion)、氯氧磷 (chloroethoxyfos)、毒虫畏 (chlorofenvinphos)、氯甲硫磷 (chloromephos)、毒死蜱 (chloropyrifos(-methyl/-ethyl))、蝇毒磷 (coumaphos)、苯腈磷 (cyanofenphos)、杀螟腈 (cyanophos)、毒虫畏 (chlorofenvinphos)、甲基-O五九 (demeton-s-methyl)、磺吸磷 (demeton-s-methylsulphon)、氯亚胺硫磷 (dialifos)、二嗪磷 (diazinon)、除线磷 (dichlofenthion)、敌敌畏/DDVP、百治磷 (dicrotophos)、

乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、蔬果磷 (dioxabenzofos)、乙拌磷 (disulfoton)、EPN、乙硫磷 (ethion)、灭线磷 (ethoprophos)、乙嘧硫磷 (etrimfos)、伐灭磷 (famphur)、苯线磷 (fenamiphos)、杀螟硫磷 (fenitrothion)、线虫磷 (fensulfothion)、倍硫磷 (fenthion)、吡氟硫磷 (flupyrazofos)、地虫硫磷 (fonofos)、安硫磷 (formothion)、丁苯硫磷 (fosmethilan)、噻唑磷 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、碘硫磷 (iodofenphos)、异稻瘟净 (iprobenfos)、氯唑磷 (isazofos)、异柳磷 (isofenphos)、异丙基 O-水杨酸盐 (isopropyl o-salicylate)、恶唑磷 (isoxathion)、马拉硫磷 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、虫螨畏 (methacrifos)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧乐果 (omethoate)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、对硫磷 (parathion(-methyl/-ethyl))、稻丰散 (phenthoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀硫磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、磷虫威 (phosphocarb)、辛硫磷 (phoxim)、嘧啶磷 (pirimiphos(-methyl/-ethyl))、丙溴磷 (profenofos)、丙虫磷 (propaphos)、胺丙畏 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、发硫磷 (prothoate)、吡唑硫磷 (pyraclofos)、哒嗪硫磷 (pyridaphenthion)、pyridathion、喹硫磷 (quinalphos)、硫线磷 (sebufos)、治螟磷 (sulfotep)、硫丙磷 (sulprofos)、丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁磷 (terbufos)、杀虫畏 (tetrachlorovinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、trichlorfon、蚜灭磷 (vamidothion)；

[0675] 2. 钠通道调节剂 / 电压依赖性钠通道阻断剂

[0676] 2.1 拟除虫菊酯类 (例如氟丙菊酯 (acrinathrin)、烯丙菊酯 (d-顺-反式, d-反式)、 β -氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、氟氯菊酯 (bifenthrin)、生物烯丙菊酯 (bioallethrin)、生物烯丙菊酯-S-环戊基-异构体、bioethanomethrin、生物氯菊酯 (biopermethrin)、生物苄呋菊酯 (bioresmethrin)、chlovaporthrin、顺式-氯氰菊酯 (cis-cypermethrin)、顺式-苄呋菊酯 (cis-resmethrin)、顺式-氯菊酯 (cis-permethrin)、clocythrins、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氯氰菊酯 (α -、 β -、 θ -、 ζ -)、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)、DDT、溴氰菊酯 (deltamethrin)、右旋烯炔菊酯 (1R-异构体)、S-氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (etofenprox)、五氟苯菊酯 (fenfluthrin)、甲氰菊酯 (fenpropathrin)、fenpyrithrin、氰戊菊酯 (fenvalerate)、flubrocycythrinate、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、三氟醚菊酯 (flufenprox)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、氟胺氰菊酯 (fluvalinate)、fubfenprox、 γ -氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、咪炔菊酯 (imiprothrin)、噻噁菊酯 (kadethrin)、 λ -氯氟氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)、metofluthrin、氯菊酯 (顺式-、反式-)、苯醚菊酯 (1R-反式异构体)、炔酮菊酯 (prallethrin)、profluthrin、protrifenbute、反灭虫菊 (pyresmethrin)、苄呋菊酯 (resmethrin)、RU 15525、氟硅菊酯 (silafaluofen)、氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)、七氟菊酯 (tefluthrin)、环戊烯丙菊酯 (terallethrin)、胺菊酯 (1R-异构体)、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟苯菊酯 (transfluthrin)、ZXI 8901、除虫菊素 (除虫菊))；

[0677] 2.2 噁二嗪类 (例如茚虫威)

[0678] 3. 乙酰胆碱受体激动剂 / 拮抗剂

- [0679] 3.1 氯烟碱类 (chloronicotinyIs)/ 拟新烟碱类 (neonicotinoids) (例如啉虫脒 (acetamiprid)、clothianidin、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、烯啶虫胺 (nitenpyram)、硝虫噻唑 (nithiazine)、噻虫啉 (thiacloprid)、噻虫嗪 (thiamethoxam)) ;
- [0680] 3.2 烟碱 (nicotine)、杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹 (cartap) ;
- [0681] 4. 乙酰胆碱受体调节剂
- [0682] 4.1 多杀菌素 (例如多杀菌素 (spinosad))
- [0683] 5. 经 GABA 控制的氯化物通道的拮抗剂
- [0684] 5.1 环戊二烯有机氯类 (例如毒杀芬 (camphechloro)、氯丹 (chlorodane)、硫丹 (endosulfan)、 γ -HCH、HCH、七氯 (heptachloro)、林丹 (lindane)、甲氧滴滴涕 (methoxychloro)) ;
- [0685] 5.2 fiproles (例如 acetoprole、ethiprole、氟虫腈 (fipronil)、氟吡啉虫 (vaniliprole))
- [0686] 6. 氯化物通道活化剂
- [0687] 6.1 mectins (例如阿维菌素 (abamectin)、齐墩螨素 (avermectin)、emamectin、emamectin-benzoate、双氢除虫菌素 (ivermectin)、弥拜菌素 (milbemectin)、milbemycin) ;
- [0688] 7. 保幼激素模拟物
- [0689] (例如苯虫醚 (diofenolan)、保幼醚 (epofenonane)、苯氧威 (fenoxycarb)、烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene)、烯虫酯 (methoprene)、蚊蝇醚 (pyriproxifen)、烯虫硫酯 (triprene)) ;
- [0690] 8. 蜕皮激素激动剂 / 中断剂 (disruptors)
- [0691] 8.1 二酰基肼 (例如环虫酰肼 (chromafenozide)、氯虫酰肼 (halofenozide)、甲氧虫酰肼 (methoxyfenozide)、虫酰肼 (tebufenozide)) ;
- [0692] 9. 几丁质生物合成抑制剂
- [0693] 9.1 苯甲酰脲类 (例如 bistrifluron、chloflazuron、除虫脲 (diflubenzuron)、啉蜉脲 (fluazuron)、氟蜉脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、虱蜉脲 (lufenuron)、氟酰脲 (novaluron)、noviflumuron、氟幼脲 (penfluron)、氟苯脲 (teflubenzuron)、杀铃脲 (triflumuron)) ;
- [0694] 9.2 噻嗪酮 (buprofezin)
- [0695] 9.3 灭蝇胺 (cyromazine)
- [0696] 10. 氧化磷酸化抑制剂, ATP 中断剂
- [0697] 10.1 丁醚脲 (diafenthiuron)
- [0698] 10.2 有机锡类 (例如三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin)、杀螨锡 (fenbutatin-oxide))
- [0699] 11. 通过中断 H⁺ 质子梯度的氧化磷酸化作用的去偶剂
- [0700] 11.1 吡咯类 (例如溴虫腈 (chlorofenapyr))
- [0701] 11.2 二硝基酚类 (例如 binapacyrl、消螨通 (dinobuton)、二硝酯 (dinocap)、DNOC)
- [0702] 12. 部位 -I 电子转运抑制剂

- [0703] 12.1 METI's (例如喹螨醚 (fenazaquin)、唑螨酯 (fenpyroximate)、嘧螨醚 (pyrimidifen)、哒螨灵 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad)、tolfenpyrad)
- [0704] 12.2 伏蚁腴 (hydramethylnone)
- [0705] 12.3 三氯杀螨醇 (dicofol)
- [0706] 13. 部位 -II 电子转运抑制剂
- [0707] 13.1 鱼藤酮 (rotenone)
- [0708] 14. 部位 -III 电子转运抑制剂
- [0709] 14.1 灭螨醌 (acequinocyl)、嘧螨酯 (fluacrypyrim)
- [0710] 15. 昆虫肠道膜的微生物中断剂
- [0711] 苏云金杆菌菌株 (*Bacillus thuringiensis* strains)
- [0712] 16. 脂肪合成抑制剂
- [0713] 16.1 季酮酸 (例如 spirodiclofen、spiromesifen)
- [0714] 16.2 四酰胺酸 [例如 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1-氮杂螺 [4.5] 癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯 (别名: 碳酸, 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1-氮杂螺 [4.5] 癸-3-烯-4-基乙酯, CAS 登录号: 382608-10-8) 以及碳酸, 顺式-3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1-氮杂螺 [4.5] 癸-3-烯-4-基乙基酯 (CAS Reg. No. : 203313-25-1)]
- [0715] 17. 羧酰胺类
- [0716] (例如 flonicamid)
- [0717] 18. Octopaminergic 激动剂
- [0718] (例如双甲脒 (amitraz))
- [0719] 19. 镁刺激的 ATP 酶抑制剂
- [0720] (例如炔螨特 (propargite))
- [0721] 20. 邻苯二酰胺类
- [0722] (例如 N²-[1,1-二甲基-2-(甲基磺酰基)乙基]-3-碘代-N¹-[2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1,2-苯二羧酰胺 (CAS 登录号: 272451-657)、flubendiamide)
- [0723] 21. Nereistoxin 类似物
- [0724] (例如硫环杀 (thiocyclam hydrogen oxalate)、杀虫双 (thiosultap-sodium))
- [0725] 22. 生物制品, 激素类或信息素
- [0726] (例如印楝素 (azadirachtin)、杆菌属 (*Bacillus spec.*)、*Beauveria spec.*、十二碳二烯醇 (Codlemone)、*Metarrhizium spec.*、*Paecilomyces spec.*、*Thuringiensin*、轮枝孢菌属 (*Verticillium spec.*))
- [0727] 23. 具有未知或不确定作用机理的活性化合物
- [0728] 23.1 熏蒸剂 (例如磷化铝 (aluminium phosphide)、溴甲烷 (methylbromide)、硫酰氟 (sulphuryl fluoride))
- [0729] 23.2 选择性拒食剂 (例如冰晶石 (cryolite)、flonicamid、吡蚜酮 (pymetrozine))
- [0730] 23.3 螨生长抑制剂 (例如四螨嗪 (clofentezine)、乙螨唑 (etoxazole)、噻螨酮

(hexythiazox))

[0731] 23.4 amidoflumet、benclothiaz、苯 螨 特 (benzoximate)、联 苯 肼 酯 (bifenazate)、溴 螨 酯 (bromopropylate)、噻 嗪 酮 (buprofezin)、灭 螨 猛 (chinomethionat)、杀 虫 脒 (chlorodimeform)、乙 酯 杀 螨 醇 (chlorobenzilate)、氯化 苦 (chloropicrin)、clothiazoben、cycloprene、cyflumetofen、环 虫 腈 (dicyclanil)、fenoxacrim、氟 硝 二 苯 胺 (fentrifanil)、氟 螨 噻 (flubenzimine)、flufenerim、flutenzin、诱 虫 十 六 酯 (gossyplure)、灭 蚊 脒 (hydramethylnone)、japonilure、恶 虫 酮 (metoxadiazone)、石 油 (petroleum)、增 效 醚 (piperonylbutoxide)、油 酸 钾 (potassium oleate)、pyrafluprole、pyridalyl、pyriprole、氟 虫 胺 (sulfluramid)、三 氟 杀 螨 砒 (tetradifon)、杀 螨 硫 醚 (tetrasul)、苯 螨 噻 (triarathene)、增 效 炔 醚 (verbutin),

[0732] 此外还有化合物 3- 甲基苯基丙基氨基甲酸酯 (Tsumacide Z), 化合物 3-(5- 氯 -3- 吡啶基) -8-(2,2,2- 三氟乙基) -8- 氮杂二环 [3.2.1] 辛烷 -3- 腈 (CAS 登录号 185982-80-3), 以及相应的 3- 内 - 异构体 (CAS 登录号 185984-60-5) (参考 W0 96/37494, W0 98/25923), 以及包含杀虫活性植物提取物、线虫、真菌或病毒的配制品。

[0733] 与其它已知活性化合物例如除草剂或与肥料以及生长调节剂、安全剂或化学信息素的混合物也是可能的。

[0734] 该活性化合物可以以其本身、以其制剂形式或通过进一步稀释而由此制得的使用形式如即用型溶液、乳剂、悬浮剂、粉剂、片剂、糊剂、微胶囊剂和颗粒剂。其以常规方式来使用, 例如浇水、浸渍、喷洒、雾化、喷雾、汽化、注射、形成浆料、刷涂、喷粉、散布、干拌种、湿拌种 (moist dressing)、湿拌种 (wet dressing)、浆料拌种或包被。

[0735] 在处理植物部分中, 应用形式中的活性化合物浓度可以在基本范围内变化。该范围通常为 1 至 0.0001 重量%, 优选为 0.5 至 0.001%。

[0736] 对于处理种子而言, 通常使用活性化合物的量为 0.1 至 10g, 尤其是 1 至 5g/ 千克种子。

[0737] 在处理土壤时, 在作用点, 通常使用活性化合物的浓度为 0.00001 至 0.1 重量%, 尤其是 0.0001 至 0.02%。

[0738] 如上所述, 可按照本发明处理所有植物及其部分。在一个优选的实施方案中, 处理天然产生的植物种类和植物品种, 或通过常规的生物育种方法, 如杂交或原生质体融合得到的植物种类和植物品种及其部分。在另一个优选的实施方案中, 处理通过基因工程方法, 任选与常规方法联合 (基因修饰生物体) 得到的转基因植物和植物品种及其部分。术语 “ 部分 ” 或 “ 植物的部分 ” 或 “ 植物部分 ” 在上面已作过解释。

[0739] 按照本发明, 特别优选处理市售可得的或在任何特定时间使用的植物品种的植物。植物品种应理解为表示具有特定的性质 (“ 特征 ”), 并且已通过常规育种、通过诱变或通过重组 DNA 技术获得的植物。它们可以是品种型、生物型或基因型。

[0740] 根据植物种类或品种、它们的栖息地和生长条件 (所涉及的土壤、气候、植物生长期和营养类型), 按照本发明方法的处理还可导致超加和的 (“ 协同 ”) 作用。因此, 例如可达到减少用量和 / 或拓宽活性谱和 / 或提高可用于本发明的化合物和组合物的活性、改善的植物生长、增强对高或低温的耐受性、增强对于干旱条件或水涝条件和土壤盐量的耐受性、增加开花的能力、易于收获、加速成熟、提高收获量、提高收获产品的品质和 / 或提高产品

的营养价值、提高收获产品的储存稳定性和 / 或可加工性,这些超出了本身所期望的效果。

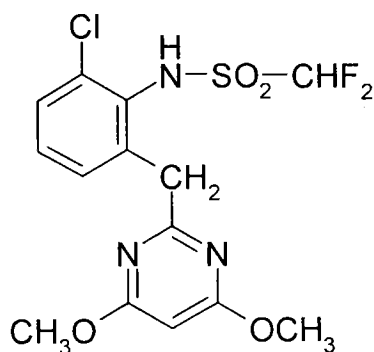
[0741] 本发明优选进行处理的转基因植物或植物品种(即通过基因工程得到的)包括由于相关基因修饰而使该植物接受了使其具有特别有利的有用性质(“特征”)的基因材料的所有植物。这种性能的例子是改善的植物生长、增强对高或低温的耐受性、增强对干旱条件或水涝条件或土壤盐量的耐受性、增加开花的能力、易于收获、加速成熟、较高的收获产量、收获产品较好的质量和 / 或较高的营养价值、收获产品较好的储存稳定性和 / 或可加工性。进一步和特别强调的所述性能的例子是提高植物对动物和微生物害虫,如昆虫、螨、植物病原真菌、细菌和 / 或病毒的抵御性,以及提高植物对某些除草活性化合物的耐受性。可提及的转基因植物的例子是重要的农作物,如谷类(小麦和水稻)、玉米、大豆、马铃薯、棉花、油菜和水果植物(生产苹果、梨、柑橘类水果和葡萄),其中特别强调的是玉米、大豆、马铃薯、棉花和油菜。特别强调的性质“特征”是通过在植物中产生的毒素,特别是通过来自 *Bacillus Thuringiensis* 杆菌的基因材料(例如通过基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 及它们的组合)(下文称作“Bt 植物”) 在植物中产生的那些以增强植物对昆虫的抵御性能。还特别需要强调的性质“特征”是通过系统获得的抗性(SAR)、系统素(systemin)、植物抗毒素、诱导剂(elicitors)和抗性基因以及相应表达的蛋白和毒素来提高植物对真菌、细菌和病毒的抵御作用。此外,特别强调的性质(“特征”)是植物对某些除草活性化合物,如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦类或膦基麦黄酮(例如“PAT”基因)的增强的耐受性。赋予所需性质(“特征”)的基因也可以在转基因植物中相互组合而存在。可提及的“Bt 植物”的例子是以商标名 YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)和 NewLeaf®(马铃薯)出售的玉米品种、棉花品种、大豆品种和马铃薯品种。可提及的耐受除草剂的植物的例子是以商标名 Roundup Ready®(耐受草甘膦,例如玉米、棉花、大豆)、LibertyLink®(耐受膦基麦黄酮,例如油菜)、IMI®(耐受咪唑啉酮类)和 STS®(耐受磺酰脲类,例如玉米)出售的玉米品种、棉花品种和大豆品种。可提及的耐除草剂的植物(以常规方式进行的除草剂耐受育种)包括以商标名 Clearfield®出售的品种(例如玉米)。当然,这些叙述也适用于具有所述的或将来还要改良的遗传性质(“特征”)的、将来开发的植物品种或将来投放市场的植物品种。

[0742] 上述植物可以按照本发明以特别有利的方式用本发明通式(I)的化合物或者活性化合物混合物进行处理。在上述活性化合物或混合物中给出的优选范围也适用于这些植物的处理。特别强调的是用本文中特别提及的化合物或混合物处理植物。

[0743] 随后通过下列实施例更详细地描述本发明化合物的制备和应用。然而,本发明不得以任何方式限制于此。

[0744] 合成实施例 1

[0745]

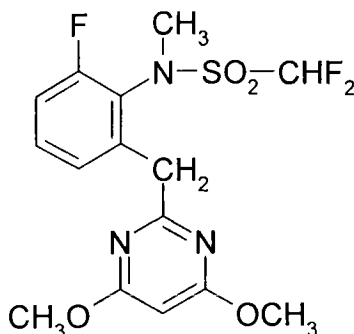


[0746] 将 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]苯胺 1.54g (5.51mmol) 溶解于二氯甲烷 (12ml) 中,随后向其中加入吡啶 0.87g (11.01mmol)。将溶液冷却至 -5°C ,并且向其中加入二氟甲磺酰氯 1.66g (11.01mmol) 的二氯甲烷 (2ml) 溶液。将反应溶液在室温下搅拌 4 天,随后向其中加入水,并且用二氯甲烷萃取 3 次。用水洗涤有机层并干燥后,减压蒸馏出二氯甲烷。将所获得的油状物质用柱层析法 (其利用 1 : 6 的乙酸乙酯和己烷混合溶剂作为洗脱剂) 进行处理,获得目标化合物 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺 1.2g (产率 55%),其为白色晶体。

[0747] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.94 (6H, s), 4.30 (2H, s), 5.92 (1H, s), 6.74 (1H, t), 7.18-7.21 (1H, m), 7.33-7.38 (2H, m), 11.09 (1H, br)。

[0748] 合成实施例 2

[0749]

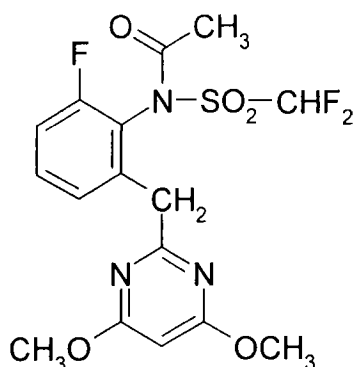


[0750] 向 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺 0.1g (0.27mmol) 的乙腈 (3ml) 溶液中加入碳酸钾 0.06g (0.40mmol) 和碘代甲烷 0.08g,并且将混合物在室温下搅拌 24 小时。将所获得的反应溶液进行过滤,并且将在减压下通过蒸馏滤液获得的粗晶体用 1 : 6 的乙醚和己烷混合溶剂进行洗涤,获得目标化合物 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-甲基-N-二氟甲磺酰替苯胺 0.1g (产率 93%),其为白色晶体。

[0751] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.97 (6H, s), 4.26 (2H, s), 5.94 (1H, s), 6.59 (1H, t), 7.05-7.13 (1H, m), 7.16-7.23 (2H, m), 11.14 (1H, br)。

[0752] 合成实施例 3

[0753]

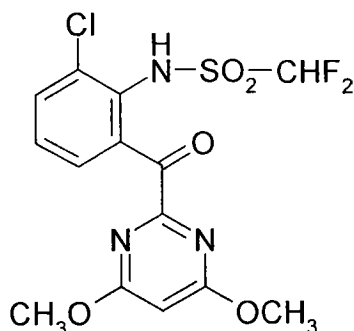


[0754] 将 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺 0.1g (0.27mmol) 和三乙胺 0.04g (0.40mmol) 的二氯甲烷 (3ml) 溶液用冰冷却。向该溶液中加入乙酰氯 0.03g (0.32mmol), 并且将混合溶液在室温下搅拌 24 小时。向所获得的反应溶液中加入水, 并且分离有机层。将水层进一步用二氯甲烷萃取三次。用水洗涤有机层并且干燥后, 减压蒸馏出二氯甲烷, 并且用 1 : 6 的乙醚和己烷的混合溶剂洗涤所获得的粗晶体, 获得目标化合物 2-氟-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)甲基]-N-乙酰基-N-二氟甲磺酰替苯胺 0.1g (产率 89%), 其为白色晶体。

[0755] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 1.94 (3H, s), 3.87 (6H, s), 4.10 (1H, d, $J = 15\text{Hz}$), 4.30 (1H, d, $J = 15\text{Hz}$), 5.89 (1H, s), 6.97 (1H, t), 7.14-7.17 (1H, m), 7.33-7.45 (2H, m)。

[0756] 合成实施例 4

[0757]

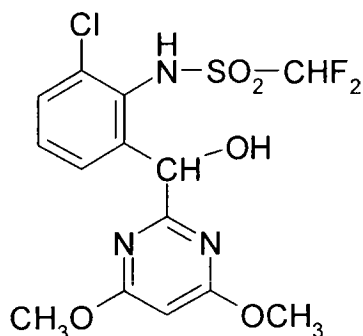


[0758] 将 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-二氟甲磺酰替苯胺 0.4g (1.02mmol) 溶解于乙酸 (6ml) 中, 随后向其中加入氧化铬 (VI) 0.31g (3.05mmol), 并将溶液加热至 30°C 。将溶液搅拌 6 小时, 并在室温下再搅拌 12 小时。用水稀释反应溶液, 并且用乙醚萃取三次。用水洗涤有机相并进行干燥, 在减压下蒸馏出乙醚。将所获得的油状物质用柱色谱法 (其利用 1 : 3 的乙酸乙酯和己烷混合溶剂作为洗脱剂) 进行处理, 获得目标化合物 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-二氟甲磺酰替苯胺 0.28g (产率 67%), 其为白色晶体。

[0759] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.93 (6H, s), 6.19 (1H, s), 6.34 (1H, t), 7.37-7.43 (1H, m), 7.63-7.69 (2H, m)。

[0760] 合成实施例 5

[0761]



[0762] 将 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羰基]-N-二氟甲磺酰替苯胺 0.14g (0.34mmol) 溶解于甲醇 5ml 中, 并且将溶液冷却至 5℃, 并且在搅拌的同时向其中加入硼氢化钠 0.026g (0.69mmol)。将反应溶液在室温下搅拌 2 小时, 随后进行减压蒸馏。将所获得的晶体溶解于水和二氯甲烷中, 并且用柠檬酸进行中和。分离有机层, 并且再用二氯甲烷萃取水层 3 次。用水洗涤有机层并且干燥后, 减压下蒸馏出二氯甲烷, 获得目标化合物 2-氯-6-[(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)羟基甲基]-N-二氟甲磺酰替苯胺 0.11g (产率 78%), 其为白色晶体。

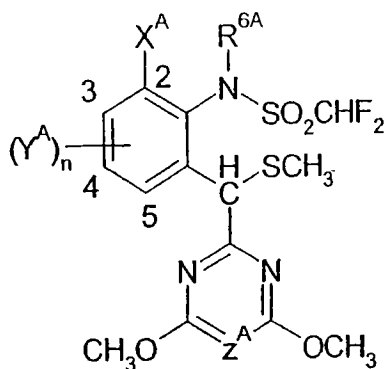
[0763] $^1\text{H NMR}$ -(300MHz, CDCl_3) δ 3.99 (6H, s), 4.99 (1H, br), 5.99 (1H, s), 6.24 (1H, s), 6.76 (1H, t), 7.27-7.30 (1H, m), 7.39-7.42 (1H, m), 7.64-7.67 (1H, m), 10.62 (1H, br)。

[0764] 以上述合成实施例 1 至 5 的相同方法获得的, 以及根据上述制备方法 (a) 至 (h) 的常规制备方法易于获得的化合物的实例与上述合成实施例 1 至 5 的化合物一起示于下表 1 至 7 中, 并且其物理和化学性能示于表 8 中。

[0765] 在表中, Me 表示甲基, Et 表示乙基, iPr 表示异丙基, CH_2Ph 表示苄基, cycloPr 表示环丙基, cyclohexyl 表示环己基, OMe 表示甲氧基, OEt 表示乙氧基, OPh 表示苯氧基, SMe 表示甲硫基, SMe 表示甲基亚磺酰基, SO_2Me 表示甲基磺酰基, COMe 表示乙酰基, COcPr 表示环丙基羰基, CO_2Me 或 COOMe 表示甲氧基羰基, vinyl 表示乙烯基, allyl 表示烯丙基, propargyl 表示炔丙基, MOM 表示甲氧基甲基, 并且 CH_2OEt 表示乙氧基甲基。

[0766] 表 1

[0767]



[0768]

化合物号	X ^A	(Y ^A) _n	R ^{6A}	Z ^A
1-1	H	H	H	CH
1-2	H	H	CH ₃	CH
1-3	H	H	CH ₂ OCH ₃	CH
1-4	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
1-5	H	H	COCH ₃	CH
1-6	H	H	CO ₂ CH ₃	CH
1-7	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
1-8	H	H	SO ₂ CH ₃	CH
1-9	H	H	SO ₂ CHF ₂	CH
1-10	H	H	SO ₂ CF ₃	CH
1-11	H	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
1-12	H	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
1-13	H	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
1-14	F	H	H	CH
1-15	F	H	CH ₃	CH
1-16	F	H	CH ₂ OCH ₃	CH
1-17	F	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
1-18	F	H	COCH ₃	CH
1-19	F	H	CO ₂ CH ₃	CH
1-20	F	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
1-21	F	H	SO ₂ CH ₃	CH
1-22	F	H	SO ₂ CHF ₂	CH
1-23	F	H	SO ₂ CF ₃	CH
1-24	F	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
1-25	F	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
1-26	F	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
1-27	Cl	H	H	CH
1-28	Cl	H	CH ₃	CH
1-29	Cl	H	CH ₂ OCH ₃	CH
1-30	Cl	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
1-31	Cl	H	COCH ₃	CH
1-32	Cl	H	CO ₂ CH ₃	CH
1-33	Cl	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH

[0769]

1-34	Cl	H	SO ₂ CH ₃	CH
1-35	Cl	H	SO ₂ CHF ₂	CH
1-36	Cl	H	SO ₂ CF ₃	CH
1-37	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
1-38	Cl	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
1-39	Cl	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
1-40	H	H	H	N
1-41	H	H	CH ₃	N
1-42	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
1-43	H	H	COCH ₃	N
1-44	H	H	CO ₂ CH ₃	N
1-45	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
1-46	F	H	H	N
1-47	F	H	CH ₃	N
1-48	F	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
1-49	F	H	COCH ₃	N
1-50	F	H	CO ₂ CH ₃	N
1-51	F	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
1-52	Cl	H	H	N
1-53	Cl	H	CH ₃	N
1-54	Cl	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
1-55	Cl	H	COCH ₃	N
1-56	Cl	H	CO ₂ CH ₃	N
1-57	Cl	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
1-58	H	H	H	C-CH ₃
1-59	F	H	H	C-CH ₃
1-60	Cl	H	H	C-CH ₃
1-61	H	3-F	H	CH
1-62	H	4-F	H	CH
1-63	H	5-F	H	CH
1-64	H	3-Cl	H	CH
1-65	H	4-Cl	H	CH
1-66	H	5-Cl	H	CH
1-67	H	3,5-F ₂	H	CH
1-68	H	3,5-Cl	H	CH
1-69	H	4,5-F ₂	H	CH
1-70	H	4,5-Cl ₂	H	CH
1-71	H	3-CH ₃	H	CH
1-72	H	4-CH ₃	H	CH
1-73	H	5-CH ₃	H	CH
1-74	H	3-CF ₃	H	CH
1-75	H	4-CF ₃	H	CH
1-76	H	5-CF ₃	H	CH
1-77	H	3-CH ₂ OCH ₃	H	CH
1-78	H	4-CH ₂ OCH ₃	H	CH
1-79	H	5-CH ₂ OCH ₃	H	CH
1-80	H	3-OCH ₃	H	CH
1-81	H	4-OCH ₃	H	CH
1-82	H	5-OCH ₃	H	CH

[0770]

1-83	H	3-CO ₂ CH ₃	H	CH
1-84	H	4-CO ₂ CH ₃	H	CH
1-85	H	5-CO ₂ CH ₃	H	CH
1-86	H	3-SO ₂ CH ₃	H	CH
1-87	H	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
1-88	H	5-SO ₂ CH ₃	H	CH
1-89	H	3-SCF ₃	H	CH
1-90	H	4-SCF ₃	H	CH
1-91	H	5-SCF ₃	H	CH
1-92	H	3-SOCF ₃	H	CH
1-93	H	4-SOCF ₃	H	CH
1-94	H	5-SOCF ₃	H	CH
1-95	H	3-SO ₂ CF ₃	H	CH
1-96	H	4-SO ₂ CF ₃	H	CH
1-97	H	5-SO ₂ CF ₃	H	CH
1-98	H	3-N(CH ₃) ₂	H	CH
1-99	H	4-N(CH ₃) ₂	H	CH
1-100	H	5-N(CH ₃) ₂	H	CH
1-101	H	3-NO ₂	H	CH
1-102	H	4-NO ₂	H	CH
1-103	H	5-NO ₂	H	CH
1-104	H	3-CN	H	CH
1-105	H	4-CN	H	CH
1-106	H	5-CN	H	CH
1-107	H	3-COCH ₃	H	CH
1-108	H	4-COCH ₃	H	CH
1-109	H	5-COCH ₃	H	CH
1-110	F	3-F	H	CH
1-111	F	4-F	H	CH
1-112	F	5-F	H	CH
1-113	F	3-Cl	H	CH
1-114	F	4-Cl	H	CH
1-115	F	5-Cl	H	CH
1-116	F	3-CH ₃	H	CH
1-117	F	4-CH ₃	H	CH
1-118	F	5-CH ₃	H	CH
1-119	F	3-OCH ₃	H	CH
1-120	F	4-OCH ₃	H	CH
1-121	F	5-OCH ₃	H	CH
1-122	F	4-CN	H	CH
1-123	F	3,4-F ₂	H	CH
1-124	F	4,5-F ₂	H	CH
1-125	F	4-F-3-Cl	H	CH
1-126	F	3-F-5-Cl	H	CH
1-127	F	5-F-4-CN	H	CH
1-128	F	3-F-4-CF ₃	H	CH
1-129	F	3-CF ₃	H	CH
1-130	F	5-CF ₃	H	CH
1-131	F	4-Br	H	CH

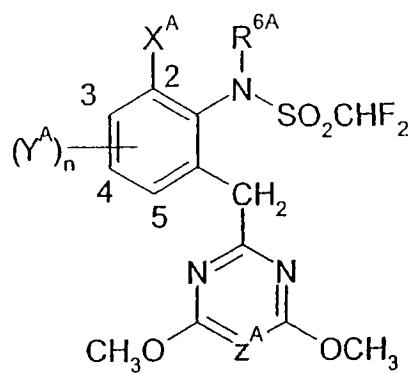
[0771]

1-132	F	5-OCF ₃ -4-F	H	CH
1-133	Cl	3-F	H	CH
1-134	Cl	4-F	H	CH
1-135	Cl	5-F	H	CH
1-136	Cl	3-Cl	H	CH
1-137	Cl	4-Cl	H	CH
1-138	Cl	5-Cl	H	CH
1-139	Cl	3-CH ₃	H	CH
1-140	Cl	4-CH ₃	H	CH
1-141	Cl	5-CH ₃	H	CH
1-142	Cl	3-OCH ₃	H	CH
1-143	Cl	4-OCH ₃	H	CH
1-144	Cl	5-OCH ₃	H	CH
1-145	Cl	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
1-146	Cl	3-SCF ₃	H	CH
1-147	Cl	4-SCF ₃	H	CH
1-148	Cl	5-SCF ₃	H	CH
1-149	Cl	3-SOCF ₃	H	CH
1-150	Cl	4-SOCF ₃	H	CH
1-151	Cl	5-SOCF ₃	H	CH
1-152	Cl	3-SO ₂ CF ₃	H	CH
1-153	Cl	4-SO ₂ CF ₃	H	CH
1-154	Cl	5-SO ₂ CF ₃	H	CH
1-155	Cl	4-CN	H	CH
1-156	Cl	3,4-Cl ₂	H	CH
1-157	Cl	4,5-Cl ₂	H	CH
1-158	Cl	3-Cl-4-CF ₃	H	CH
1-159	Cl	4-Cl-3-CH ₃	H	CH
1-160	Cl	5-OCF ₃ -4-F	H	CH
1-161	Cl	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
1-162	Cl	4-CF ₃	H	CH
1-163	Cl	5-CF ₃	H	CH
1-164	CHO	H	H	CH
1-165	COCH ₃	H	H	CH
1-166	COcPr	H	H	CH
1-167	CO ₂ CH ₃	H	H	CH
1-168	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	CH
1-169	CON(CH ₃) ₂	H	H	CH
1-170	N(CH ₃) ₂	H	H	CH
1-171	OCH ₃	H	H	CH
1-172	OCF ₃	H	H	CH
1-173	OCHF ₂	H	H	CH
1-174	OPh	H	H	CH
1-175	SO ₂ CH ₃	H	H	CH
1-176	SCF ₃	H	H	CH
1-177	SOCF ₃	H	H	CH
1-178	SO ₂ CF ₃	H	H	CH
1-179	CN	H	H	CH
1-180	NO ₂	H	H	CH

[0772]	1-181	OSO ₂ CH ₃	H	H	CH
	1-182	OSO ₂ CF ₃	H	H	CH
	1-183	OSO ₂ CHF ₂	H	H	CH
	1-184	OSO ₂ CH ₂ Cl	H	H	CH
	1-185	OSO ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	CH
	1-186	OSO ₂ CH ₂ CN	H	H	CH
	1-187	COCH ₃	H	H	N
	1-188	COcPr	H	H	N
	1-189	CO ₂ CH ₃	H	H	N
	1-190	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	N

[0773] 表 2

[0774]



化合物号	X ^A	(Y ^A) _n	R ^{6A}	Z ^A
2-1	H	H	H	CH
2-2	H	H	CH ₃	CH
2-3	H	H	CH ₂ OCH ₃	CH
2-4	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
2-5	H	H	COCH ₃	CH
2-6	H	H	CO ₂ CH ₃	CH
2-7	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
2-8	H	H	SO ₂ CH ₃	CH
2-9	H	H	SO ₂ CHF ₂	CH
2-10	H	H	SO ₂ CF ₃	CH
2-11	H	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
2-12	H	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
2-13	H	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
2-14	F	H	CH ₃	CH
2-15	F	H	CH ₂ CF ₃	CH
2-16	F	H	CH ₂ OCH ₃	CH
[0775] 2-17	F	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
2-18	F	H	COCH ₃	CH
2-19	F	H	CO ₂ CH ₃	CH
2-20	F	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
2-21	F	H	SO ₂ CH ₃	CH
2-22	F	H	SO ₂ CHF ₂	CH
2-23	F	H	SO ₂ CF ₃	CH
2-24	F	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
2-25	F	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
2-26	F	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
2-27	Cl	H	CH ₃	CH
2-28	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CH
2-29	Cl	H	CH ₂ OCH ₃	CH
2-30	Cl	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
2-31	Cl	H	COCH ₃	CH
2-32	Cl	H	CO ₂ CH ₃	CH
2-33	Cl	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
2-34	Cl	H	SO ₂ CH ₃	CH

[0776]

2-35	Cl	H	SO ₂ CHF ₂	CH
2-36	Cl	H	SO ₂ CF ₃	CH
2-37	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
2-38	Cl	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
2-39	Cl	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
2-40	H	H	H	N
2-41	H	H	CH ₃	N
2-42	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
2-43	H	H	COCH ₃	N
2-44	H	H	CO ₂ CH ₃	N
2-45	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
2-46	F	H	CH ₃	N
2-47	F	H	CH ₂ CF ₃	N
2-48	F	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
2-49	F	H	COCH ₃	N
2-50	F	H	CO ₂ CH ₃	N
2-51	F	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
2-52	Cl	H	CH ₃	N
2-53	Cl	H	CH ₂ CF ₃	N
2-54	Cl	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
2-55	Cl	H	COCH ₃	N
2-56	Cl	H	CO ₂ CH ₃	N
2-57	Cl	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
2-58	H	H	H	C-CH ₃
2-59	F	H	H	C-CH ₃
2-60	Cl	H	H	C-CH ₃
2-61	H	3-F	H	CH
2-62	H	4-F	H	CH
2-63	H	5-F	H	CH
2-64	H	3-Cl	H	CH
2-65	H	4-Cl	H	CH
2-66	H	5-Cl	H	CH
2-67	H	3,5-F ₂	H	CH
2-68	H	3,5-Cl	H	CH
2-69	H	4,5-F ₂	H	CH
2-70	H	4,5-Cl ₂	H	CH
2-71	H	3-CH ₃	H	CH
2-72	H	4-CH ₃	H	CH
2-73	H	5-CH ₃	H	CH
2-74	H	3-CF ₃	H	CH
2-75	H	4-CF ₃	H	CH
2-76	H	5-CF ₃	H	CH
2-77	H	3-CH ₂ OCH ₃	H	CH
2-78	H	4-CH ₂ OCH ₃	H	CH
2-79	H	5-CH ₂ OCH ₃	H	CH
2-80	H	3-OCH ₃	H	CH
2-81	H	4-OCH ₃	H	CH
2-82	H	5-OCH ₃	H	CH

[0777]

2-83	H	3-CO ₂ CH ₃	H	CH
2-84	H	4-CO ₂ CH ₃	H	CH
2-85	H	5-CO ₂ CH ₃	H	CH
2-86	H	3-SO ₂ CH ₃	H	CH
2-87	H	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
2-88	H	5-SO ₂ CH ₃	H	CH
2-89	H	3-SCF ₃	H	CH
2-90	H	4-SCF ₃	H	CH
2-91	H	5-SCF ₃	H	CH
2-92	H	3-SOCF ₃	H	CH
2-93	H	4-SOCF ₃	H	CH
2-94	H	5-SOCF ₃	H	CH
2-95	H	3-SO ₂ CF ₃	H	CH
2-96	H	4-SO ₂ CF ₃	H	CH
2-97	H	5-SO ₂ CF ₃	H	CH
2-98	H	3-N(CH ₃) ₂	H	CH
2-99	H	4-N(CH ₃) ₂	H	CH
2-100	H	5-N(CH ₃) ₂	H	CH
2-101	H	3-NO ₂	H	CH
2-102	H	4-NO ₂	H	CH
2-103	H	5-NO ₂	H	CH
2-104	H	3-CN	H	CH
2-105	H	4-CN	H	CH
2-106	H	5-CN	H	CH
2-107	H	3-COCH ₃	H	CH
2-108	H	4-COCH ₃	H	CH
2-109	H	5-COCH ₃	H	CH
2-110	F	3-F	H	CH
2-111	F	4-F	H	CH
2-112	F	5-F	H	CH
2-113	F	3-Cl	H	CH
2-114	F	4-Cl	H	CH
2-115	F	5-Cl	H	CH
2-116	F	3-CH ₃	H	CH
2-117	F	4-CH ₃	H	CH
2-118	F	5-CH ₃	H	CH
2-119	F	3-OCH ₃	H	CH
2-120	F	4-OCH ₃	H	CH
2-121	F	5-OCH ₃	H	CH
2-122	F	4-CN	H	CH
2-123	F	3,4-F ₂	H	CH
2-124	F	4,5-F ₂	H	CH
2-125	F	4-F-3-Cl	H	CH
2-126	F	3-F-5-Cl	H	CH
2-127	F	5-F-4-CN	H	CH
2-128	F	3-F-4-CF ₃	H	CH
2-129	F	3-CF ₃	H	CH
2-130	F	5-CF ₃	H	CH
2-131	F	4-Br	H	CH

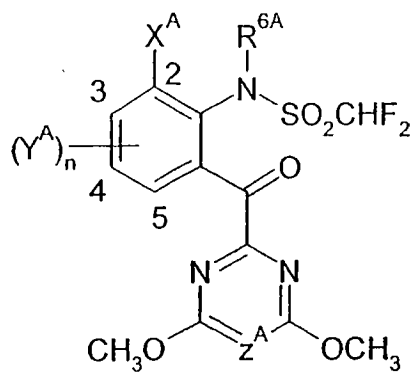
[0778]

2-132	F	5-OCF ₃ -4-F	H	CH
2-133	Cl	3-F	H	CH
2-134	Cl	4-F	H	CH
2-135	Cl	5-F	H	CH
2-136	Cl	3-Cl	H	CH
2-137	Cl	4-Cl	H	CH
2-138	Cl	5-Cl	H	CH
2-139	Cl	3-CH ₃	H	CH
2-140	Cl	4-CH ₃	H	CH
2-141	Cl	5-CH ₃	H	CH
2-142	Cl	3-OCH ₃	H	CH
2-143	Cl	4-OCH ₃	H	CH
2-144	Cl	5-OCH ₃	H	CH
2-145	Cl	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
2-146	Cl	3-SCF ₃	H	CH
2-147	Cl	4-SCF ₃	H	CH
2-148	Cl	5-SCF ₃	H	CH
2-149	Cl	3-SOCF ₃	H	CH
2-150	Cl	4-SOCF ₃	H	CH
2-151	Cl	5-SOCF ₃	H	CH
2-152	Cl	3-SO ₂ CF ₃	H	CH
2-153	Cl	4-SO ₂ CF ₃	H	CH
2-154	Cl	5-SO ₂ CF ₃	H	CH
2-155	Cl	4-CN	H	CH
2-156	Cl	3,4-Cl ₂	H	CH
2-157	Cl	4,5-Cl ₂	H	CH
2-158	Cl	3-Cl-4-CF ₃	H	CH
2-159	Cl	4-Cl-3-CH ₃	H	CH
2-160	Cl	5-OCF ₃ -4-F	H	CH
2-161	Cl	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
2-162	Cl	4-CF ₃	H	CH
2-163	Cl	5-CF ₃	H	CH
2-164	CHO	H	H	CH
2-165	COCH ₃	H	H	CH
2-166	COcPr	H	H	CH
2-167	CO ₂ H	H	H	CH
2-168	CO ₂ CH ₃	H	H	CH
2-169	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	CH
2-170	CON(CH ₃) ₂	H	H	CH
2-171	N(CH ₃) ₂	H	H	CH
2-172	OCH ₃	H	H	CH
2-173	OCF ₃	H	H	CH
2-174	OCHF ₂	H	H	CH
2-175	OPh	H	H	CH
2-176	SO ₂ CH ₃	H	H	CH
2-177	SCF ₃	H	H	CH
2-178	SOCF ₃	H	H	CH
2-179	OSO ₂ CH ₃	H	H	CH

[0779]	2-180	OSO ₂ CF ₃	H	H	CH
	2-181	OSO ₂ CHF ₂	H	H	CH
	2-182	OSO ₂ CH ₂ Cl	H	H	CH
	2-183	OSO ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	CH
	2-184	OSO ₂ CH ₂ CN	H	H	CH
	2-185	COCH ₃	H	H	N
	2-186	COcPr	H	H	N
	2-187	CO ₂ CH ₃	H	H	N
	2-188	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	N
	2-189	H	4-CO ₂ H	H	CH
	2-190	H	3-F-4-CH ₃	H	CH
	2-191	Cl	H	CO ₂ Pr	CH
	2-192	CH ₃	4-CH ₃	H	CH
	2-193	CH ₃	3-F	H	CH
	2-194	CH ₃	4-CF(CF ₃) ₂	H	CH

[0780] 表 3

[0781]



[0782]

化合物号	X ^A	(Y ^A) _n	R ^{6A}	Z ^A
3-1	H	H	CH ₃	CH
3-2	H	H	CH ₂ OCH ₃	CH
3-3	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
3-4	H	H	COCH ₃	CH
3-5	H	H	CO ₂ CH ₃	CH
3-6	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
3-7	F	H	CH ₃	CH
3-8	F	H	CH ₂ OCH ₃	CH
3-9	F	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
3-10	F	H	COCH ₃	CH
3-11	F	H	CO ₂ CH ₃	CH
3-12	F	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
3-13	F	H	SO ₂ CH ₃	CH
3-14	F	H	SO ₂ CHF ₂	CH
3-15	F	H	SO ₂ CF ₃	CH
3-16	F	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
3-17	F	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
3-18	F	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
3-19	Cl	H	CH ₃	CH
3-20	Cl	H	CH ₂ OCH ₃	CH
3-21	Cl	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
3-22	Cl	H	COCH ₃	CH
3-23	Cl	H	CO ₂ CH ₃	CH
3-24	Cl	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
3-25	Cl	H	SO ₂ CH ₃	CH
3-26	Cl	H	SO ₂ CHF ₂	CH
3-27	Cl	H	SO ₂ CF ₃	CH
3-28	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
3-29	Cl	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
3-30	Cl	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
3-31	H	H	H	N
3-32	H	H	CH ₃	N
3-33	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
3-34	H	H	COCH ₃	N

[0783]

3-35	H	H	CO ₂ CH ₃	N
3-36	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
3-37	F	H	CH ₃	N
3-38	F	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
3-39	F	H	COCH ₃	N
3-40	F	H	CO ₂ CH ₃	N
3-41	F	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
3-42	Cl	H	CH ₃	N
3-43	Cl	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
3-44	Cl	H	COCH ₃	N
3-45	Cl	H	CO ₂ CH ₃	N
3-46	Cl	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
3-47	H	H	H	C-CH ₃
3-48	F	H	H	C-CH ₃
3-49	Cl	H	H	C-CH ₃
3-50	H	4-F	H	CH
3-51	H	5-F	H	CH
3-52	H	3-Cl	H	CH
3-53	H	4-Cl	H	CH
3-54	H	5-Cl	H	CH
3-55	H	3,5-F ₂	H	CH
3-56	H	3,5-Cl	H	CH
3-57	H	4,5-F ₂	H	CH
3-58	H	4,5-Cl ₂	H	CH
3-59	H	3-CH ₃	H	CH
3-60	H	4-CH ₃	H	CH
3-61	H	5-CH ₃	H	CH
3-62	H	3-CF ₃	H	CH
3-63	H	4-CF ₃	H	CH
3-64	H	5-CF ₃	H	CH
3-65	H	3-CH ₂ OCH ₃	H	CH
3-66	H	4-CH ₂ OCH ₃	H	CH
3-67	H	5-CH ₂ OCH ₃	H	CH
3-68	H	3-OCH ₃	H	CH
3-69	H	4-OCH ₃	H	CH
3-70	H	5-OCH ₃	H	CH
3-71	H	3-CO ₂ CH ₃	H	CH
3-72	H	4-CO ₂ CH ₃	H	CH
3-73	H	5-CO ₂ CH ₃	H	CH
3-74	H	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
3-75	H	5-SO ₂ CH ₃	H	CH
3-76	H	3-SCF ₃	H	CH
3-77	H	4-SCF ₃	H	CH
3-78	H	5-SCF ₃	H	CH
3-79	H	3-SOCF ₃	H	CH
3-80	H	4-SOCF ₃	H	CH
3-81	H	5-SOCF ₃	H	CH
3-82	H	3-SO ₂ CF ₃	H	CH

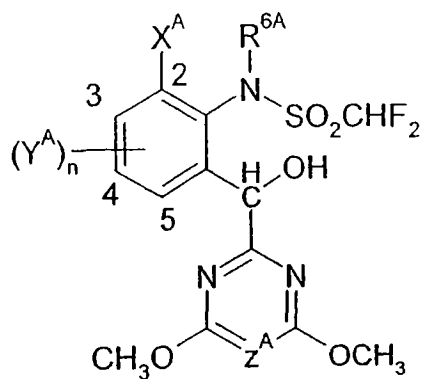
[0784]

3-83	H	4-SO ₂ CF ₃	H	CH
3-84	H	5-SO ₂ CF ₃	H	CH
3-85	H	3-N(CH ₃) ₂	H	CH
3-86	H	4-N(CH ₃) ₂	H	CH
3-87	H	5-N(CH ₃) ₂	H	CH
3-88	H	3-NO ₂	H	CH
3-89	H	4-NO ₂	H	CH
3-90	H	5-NO ₂	H	CH
3-91	H	3-CN	H	CH
3-92	H	4-CN	H	CH
3-93	H	5-CN	H	CH
3-94	H	3-COCH ₃	H	CH
3-95	H	4-COCH ₃	H	CH
3-96	H	5-COCH ₃	H	CH
3-97	F	3-F	H	CH
3-98	F	4-F	H	CH
3-99	F	5-F	H	CH
3-100	F	3-Cl	H	CH
3-101	F	4-Cl	H	CH
3-102	F	5-Cl	H	CH
3-103	F	3-CH ₃	H	CH
3-104	F	4-CH ₃	H	CH
3-105	F	5-CH ₃	H	CH
3-106	F	3-OCH ₃	H	CH
3-107	F	4-OCH ₃	H	CH
3-108	F	5-OCH ₃	H	CH
3-109	F	4-CN	H	CH
3-110	F	3,4-F ₂	H	CH
3-111	F	4,5-F ₂	H	CH
3-112	F	4-F-3-Cl	H	CH
3-113	F	3-F-5-Cl	H	CH
3-114	F	5-F-4-CN	H	CH
3-115	F	3-F-4-CF ₃	H	CH
3-116	F	3-CF ₃	H	CH
3-117	F	5-CF ₃	H	CH
3-118	F	4-Br	H	CH
3-119	F	5-OCF ₃ -4-F	H	CH
3-120	Cl	3-F	H	CH
3-121	Cl	4-F	H	CH
3-122	Cl	5-F	H	CH
3-123	Cl	3-Cl	H	CH
3-124	Cl	4-Cl	H	CH
3-125	Cl	5-Cl	H	CH
3-126	Cl	3-CH ₃	H	CH
3-127	Cl	4-CH ₃	H	CH
3-128	Cl	5-CH ₃	H	CH
3-129	Cl	3-OCH ₃	H	CH
3-130	Cl	4-OCH ₃	H	CH
3-131	Cl	5-OCH ₃	H	CH
3-132	Cl	4-SO ₂ CH ₃	H	CH

	3-133	Cl	3-SCF ₃	H	CH
	3-134	Cl	4-SCF ₃	H	CH
	3-135	Cl	5-SCF ₃	H	CH
	3-136	Cl	3-SOCF ₃	H	CH
	3-137	Cl	4-SOCF ₃	H	CH
	3-138	Cl	5-SOCF ₃	H	CH
	3-139	Cl	3-SO ₂ CF ₃	H	CH
	3-140	Cl	4-SO ₂ CF ₃	H	CH
	3-141	Cl	5-SO ₂ CF ₃	H	CH
	3-142	Cl	4-CN	H	CH
	3-143	Cl	3,4-Cl ₂	H	CH
	3-144	Cl	4,5-Cl ₂	H	CH
	3-145	Cl	3-Cl-4-CF ₃	H	CH
	3-146	Cl	4-Cl-3-CH ₃	H	CH
	3-147	Cl	5-OCF ₃ -4-F	H	CH
	3-148	Cl	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
	3-149	Cl	4-CF ₃	H	CH
	3-150	Cl	5-CF ₃	H	CH
	3-151	CHO	H	H	CH
	3-152	COCH ₃	H	H	CH
	3-153	COcPr	H	H	CH
	3-154	CO ₂ CH ₃	H	H	CH
[0785]	3-155	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	CH
	3-156	CON(CH ₃) ₂	H	H	CH
	3-157	N(CH ₃) ₂	H	H	CH
	3-158	OCH ₃	H	H	CH
	3-159	OCF ₃	H	H	CH
	3-160	OCHF ₂	H	H	CH
	3-161	OPh	H	H	CH
	3-162	SO ₂ CH ₃	H	H	CH
	3-163	SCF ₃	H	H	CH
	3-164	SOCF ₃	H	H	CH
	3-165	SO ₂ CF ₃	H	H	CH
	3-166	CN	H	H	CH
	3-167	NO ₂	H	H	CH
	3-168	OSO ₂ CH ₃	H	H	CH
	3-169	OSO ₂ CF ₃	H	H	CH
	3-170	OSO ₂ CHF ₂	H	H	CH
	3-171	OSO ₂ CH ₂ Cl	H	H	CH
	3-172	OSO ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	CH
	3-173	OSO ₂ CH ₂ CN	H	H	CH
	3-174	COCH ₃	H	H	N
	3-175	COcPr	H	H	N
	3-176	CO ₂ CH ₃	H	H	N
	3-177	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	N

[0786] 表 4

[0787]



化合物号	X ^A	(Y ^A) _n	R ^{6A}	Z ^A
4-1	H	H	CH ₃	CH
4-2	H	H	CH ₂ OCH ₃	CH
4-3	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
4-4	H	H	COCH ₃	CH
4-5	H	H	CO ₂ CH ₃	CH
4-6	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
4-7	H	H	SO ₂ CH ₃	CH
4-8	H	H	SO ₂ CHF ₂	CH
4-9	H	H	SO ₂ CF ₃	CH
4-10	H	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
4-11	H	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
4-12	H	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
4-13	F	H	CH ₃	CH
4-14	F	H	CH ₂ OCH ₃	CH
4-15	F	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
4-16	F	H	COCH ₃	CH
4-17	F	H	CO ₂ CH ₃	CH
4-18	F	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
4-19	F	H	SO ₂ CH ₃	CH
4-20	F	H	SO ₂ CHF ₂	CH
4-21	F	H	SO ₂ CF ₃	CH
4-22	F	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
4-23	F	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
4-24	F	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
4-25	Cl	H	CH ₃	CH
4-26	Cl	H	CH ₂ OCH ₃	CH
4-27	Cl	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
4-28	Cl	H	COCH ₃	CH
4-29	Cl	H	CO ₂ CH ₃	CH
4-30	Cl	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH
4-31	Cl	H	SO ₂ CH ₃	CH
4-32	Cl	H	SO ₂ CHF ₂	CH
4-33	Cl	H	SO ₂ CF ₃	CH

[0788]

[0789]

4-34	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl	CH
4-35	Cl	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH
4-36	Cl	H	SO ₂ CH ₂ CN	CH
4-37	H	H	H	N
4-38	H	H	CH ₃	N
4-39	H	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
4-40	H	H	COCH ₃	N
4-41	H	H	CO ₂ CH ₃	N
4-42	H	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
4-43	F	H	CH ₃	N
4-44	F	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
4-45	F	H	COCH ₃	N
4-46	F	H	CO ₂ CH ₃	N
4-47	F	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
4-48	Cl	H	CH ₃	N
4-49	Cl	H	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
4-50	Cl	H	COCH ₃	N
4-51	Cl	H	CO ₂ CH ₃	N
4-52	Cl	H	CO ₂ CH ₂ CH ₃	N
4-53	H	H	H	C-CH ₃
4-54	F	H	H	C-CH ₃
4-55	Cl	H	H	C-CH ₃
4-56	H	5-Cl	H	CH
4-57	H	3,5-F ₂	H	CH
4-58	H	3,5-Cl	H	CH
4-59	H	4,5-F ₂	H	CH
4-60	H	4,5-Cl ₂	H	CH
4-61	H	3-CH ₃	H	CH
4-62	H	4-CH ₃	H	CH
4-63	H	5-CH ₃	H	CH
4-64	H	3-CF ₃	H	CH
4-65	H	4-CF ₃	H	CH
4-66	H	5-CF ₃	H	CH
4-67	H	3-CH ₂ OCH ₃	H	CH
4-68	H	4-CH ₂ OCH ₃	H	CH
4-69	H	5-CH ₂ OCH ₃	H	CH
4-70	H	3-OCH ₃	H	CH
4-71	H	4-OCH ₃	H	CH
4-72	H	5-OCH ₃	H	CH
4-73	H	3-CO ₂ CH ₃	H	CH
4-74	H	4-CO ₂ CH ₃	H	CH
4-75	H	5-CO ₂ CH ₃	H	CH
4-76	H	3-SO ₂ CH ₃	H	CH
4-77	H	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
4-78	H	5-SO ₂ CH ₃	H	CH
4-79	H	3-SCF ₃	H	CH
4-80	H	4-SCF ₃	H	CH
4-81	H	5-SCF ₃	H	CH

[0790]

4-82	H	3-SOCF ₃	H	CH
4-83	H	4-SOCF ₃	H	CH
4-84	H	5-SOCF ₃	H	CH
4-85	H	3-SO ₂ CF ₃	H	CH
4-86	H	4-SO ₂ CF ₃	H	CH
4-87	H	5-SO ₂ CF ₃	H	CH
4-88	H	3-N(CH ₃) ₂	H	CH
4-89	H	4-N(CH ₃) ₂	H	CH
4-90	H	5-N(CH ₃) ₂	H	CH
4-91	H	3-NO ₂	H	CH
4-92	H	4-NO ₂	H	CH
4-93	H	5-NO ₂	H	CH
4-94	H	3-CN	H	CH
4-95	H	4-CN	H	CH
4-96	H	5-CN	H	CH
4-97	H	3-COCH ₃	H	CH
4-98	H	4-COCH ₃	H	CH
4-99	H	5-COCH ₃	H	CH
4-100	F	3-F	H	CH
4-101	F	4-F	H	CH
4-102	F	5-F	H	CH
4-103	F	3-Cl	H	CH
4-104	F	4-Cl	H	CH
4-105	F	5-Cl	H	CH
4-106	F	3-CH ₃	H	CH
4-107	F	4-CH ₃	H	CH
4-108	F	5-CH ₃	H	CH
4-109	F	3-OCH ₃	H	CH
4-110	F	4-OCH ₃	H	CH
4-111	F	5-OCH ₃	H	CH
4-112	F	4-CN	H	CH
4-113	F	3,4-F ₂	H	CH
4-114	F	4,5-F ₂	H	CH
4-115	F	4-F-3-Cl	H	CH
4-116	F	3-F-5-Cl	H	CH
4-117	F	5-F-4-CN	H	CH
4-118	F	3-F-4-CF ₃	H	CH
4-119	F	3-CF ₃	H	CH
4-120	F	5-CF ₃	H	CH
4-121	F	4-Br	H	CH
4-122	F	5-OCF ₃ -4-F	H	CH
4-123	Cl	3-F	H	CH
4-124	Cl	4-F	H	CH
4-125	Cl	5-F	H	CH
4-126	Cl	3-Cl	H	CH
4-127	Cl	4-Cl	H	CH
4-128	Cl	5-Cl	H	CH
4-129	Cl	3-CH ₃	H	CH
4-130	Cl	4-CH ₃	H	CH
4-131	Cl	5-CH ₃	H	CH

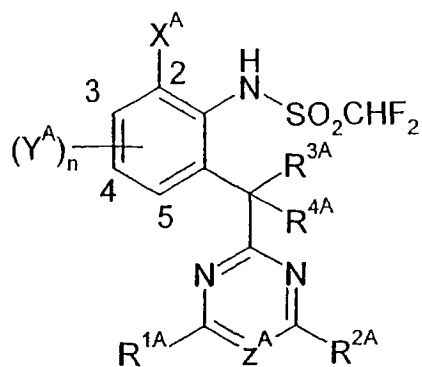
[0791]

4-132	Cl	3-OCH ₃	H	CH
4-133	Cl	4-OCH ₃	H	CH
4-134	Cl	5-OCH ₃	H	CH
4-135	Cl	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
4-136	Cl	3-SCF ₃	H	CH
4-137	Cl	4-SCF ₃	H	CH
4-138	Cl	5-SCF ₃	H	CH
4-139	Cl	3-SOCF ₃	H	CH
4-140	Cl	4-SOCF ₃	H	CH
4-141	Cl	5-SOCF ₃	H	CH
4-142	Cl	3-SO ₂ CF ₃	H	CH
4-143	Cl	4-SO ₂ CF ₃	H	CH
4-144	Cl	5-SO ₂ CF ₃	H	CH
4-145	Cl	4-CN	H	CH
4-146	Cl	3,4-Cl ₂	H	CH
4-147	Cl	4,5-Cl ₂	H	CH
4-148	Cl	3-Cl-4-CF ₃	H	CH
4-149	Cl	4-Cl-3-CH ₃	H	CH
4-150	Cl	5-OCF ₃ -4-F	H	CH
4-151	Cl	4-SO ₂ CH ₃	H	CH
4-152	Cl	4-CF ₃	H	CH
4-153	Cl	5-CF ₃	H	CH
4-154	CHO	H	H	CH
4-155	COCH ₃	H	H	CH
4-156	COcPr	H	H	CH
4-157	CO ₂ CH ₃	H	H	CH
4-158	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	CH
4-159	CON(CH ₃) ₂	H	H	CH
4-160	N(CH ₃) ₂	H	H	CH
4-161	OCH ₃	H	H	CH
4-162	OCF ₃	H	H	CH
4-163	OCHF ₂	H	H	CH
4-164	OPh	H	H	CH
4-165	SO ₂ CH ₃	H	H	CH
4-166	SCF ₃	H	H	CH
4-167	SOCF ₃	H	H	CH
4-168	SO ₂ CF ₃	H	H	CH
4-169	CN	H	H	CH
4-170	NO ₂	H	H	CH
4-171	OSO ₂ CH ₃	H	H	CH
4-172	OSO ₂ CF ₃	H	H	CH
4-173	OSO ₂ CHF ₂	H	H	CH
4-174	OSO ₂ CH ₂ Cl	H	H	CH
4-175	OSO ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	CH
4-176	OSO ₂ CH ₂ CN	H	H	CH
4-177	COCH ₃	H	H	N
4-178	COcPr	H	H	N
4-179	CO ₂ CH ₃	H	H	N

[0792]	4-180	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	N
	4-181	H	4-F	H	CH
	4-182	H	3-F-4-CH ₃	H	CH
	4-183	H	5-F-4-CH ₃	H	CH
	4-184	CH ₃	3-F	H	CH
	4-185	H	5-F	H	CH
	4-186	H	3-F	H	CH
	4-187	CH ₃	3-CH ₃	H	CH

[0793] 表 5

[0794]

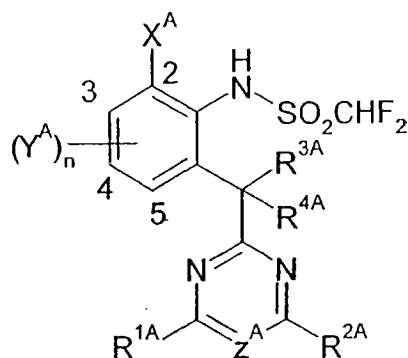


[0795]

化合物号	X ^A	(Y ^A) _n	R ^{3A}	R ^{4A}	R ^{6A}	Z ^A
5-1	H	H	Cl	H	H	CH
5-2	F	H	Cl	H	H	CH
5-3	Cl	H	Cl	H	H	CH
5-4	COCH ₃	H	Cl	H	H	CH
5-5	H	H	Cl	H	H	N
5-6	F	H	Cl	H	H	N
5-7	Cl	H	Cl	H	H	N
5-8	H	H	F	H	H	CH
5-9	F	H	F	H	H	CH
5-10	Cl	H	F	H	H	CH
5-11	COCH ₃	H	F	H	H	CH
5-12	H	H	F	H	H	N
5-13	F	H	F	H	H	N
5-14	Cl	H	F	H	H	N
5-15	H	H	OCH ₃	H	H	CH
5-16	F	H	OCH ₃	H	H	CH
5-17	Cl	H	OCH ₃	H	H	CH
5-18	H	H	CH ₃	H	H	CH
5-19	F	H	CH ₃	H	H	CH
5-20	Cl	H	CH ₃	H	H	CH
5-21	H	H	OH	CH ₃	H	CH
5-22	H	H	OH	CH ₂ CH ₃	H	CH
5-23	H	H	OH	iPr	H	CH
5-24	F	H	OH	CH ₃	H	CH
5-25	F	H	OH	CH ₂ CH ₃	H	CH
5-26	F	H	OH	iPr	H	CH
5-27	Cl	H	OH	CH ₃	H	CH
5-28	Cl	H	OH	CH ₂ CH ₃	H	CH
5-29	Cl	H	OH	iPr	H	CH
5-30	H	H	SCH ₃	CH ₃	H	CH
5-31	F	H	SCH ₃	CH ₃	H	CH
5-32	Cl	H	SCH ₃	CH ₃	H	CH
5-33	H	H	SO ₂ CH ₃	H	H	CH
5-34	F	H	SO ₂ CH ₃	H	H	CH
5-35	Cl	H	SO ₂ CH ₃	H	H	CH
5-36	H	H	SO ₂ CH ₃	H	H	N
5-37	F	H	SO ₂ CH ₃	H	H	N
5-38	Cl	H	SO ₂ CH ₃	H	H	N

[0796] 表 6

[0797]



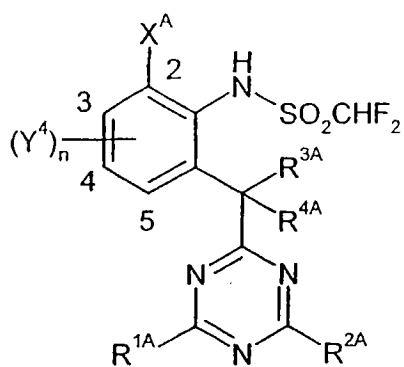
[0798]

化合物号	X ^A	(Y ^A) _n	R ^{1A}	R ^{2A}	R ^{3A}	R ^{4A}	Z ^A
6-1	H	H	H	H	H	H	CH
6-2	H	H	H	Cl	H	H	CH
6-3	H	H	H	CH ₃	H	H	CH
6-4	H	H	H	CF ₃	H	H	CH
6-5	H	H	H	OCH ₃	H	H	CH
6-6	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH
6-7	H	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	H	CH
6-8	H	H	H	SCH ₃	H	H	CH
6-9	H	H	CH ₃	Cl	H	H	CH
6-10	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	CH
6-11	H	H	CH ₃	iPr	H	H	CH
6-12	H	H	CH ₃	环 Pr	H	H	CH
6-13	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	CH
6-14	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	CH
6-15	H	H	CH ₃	OCH ₃	H	H	CH
6-16	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH
6-17	H	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	H	CH
6-18	H	H	CH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-19	H	H	OCH ₃	Cl	H	H	CH
6-20	H	H	OCH ₃	CF ₃	H	H	CH
6-21	H	H	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH
6-22	H	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	H	CH
6-23	H	H	OCH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-24	H	H	CF ₃	Cl	H	H	CH
6-25	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	CH
6-26	H	H	CF ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH
6-27	H	H	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	H	CH
6-28	H	H	CF ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-29	H	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH
6-30	H	H	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH
6-31	H	H	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-32	H	H	SCH ₃	H	H	H	CH
6-33	H	H	SCH ₃	Cl	H	H	CH
6-34	F	H	CH ₃	Cl	H	H	CH

6-35	F	H	CH ₃	CH ₃	H	H	CH
6-36	F	H	CH ₃	CF ₃	H	H	CH
6-37	F	H	CH ₃	OCH ₃	H	H	CH
6-38	F	H	CH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-39	F	H	OCH ₃	Cl	H	H	CH
6-40	F	H	OCH ₃	CF ₃	H	H	CH
6-41	F	H	OCH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-42	F	H	CF ₃	Cl	H	H	CH
6-43	F	H	CF ₃	CF ₃	H	H	CH
6-44	F	H	CF ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-45	F	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH
6-46	F	H	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH
6-47	F	H	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-48	F	H	SCH ₃	Cl	H	H	CH
6-49	F	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	H	H	CH
6-50	Cl	H	CH ₃	Cl	H	H	CH
6-51	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	CH
6-52	Cl	H	CH ₃	CF ₃	H	H	CH
6-53	Cl	H	CH ₃	OCH ₃	H	H	CH
6-54	Cl	H	CH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-55	Cl	H	OCH ₃	Cl	H	H	CH
6-56	Cl	H	OCH ₃	CF ₃	H	H	CH
6-57	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH
[0799] 6-58	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	H	CH
6-59	Cl	H	OCH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-60	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	CH
6-61	Cl	H	CF ₃	CF ₃	H	H	CH
6-62	Cl	H	CF ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-63	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH
6-64	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH
6-65	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃	H	H	CH
6-66	Cl	H	SCH ₃	Cl	H	H	CH
6-67	Cl	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	H	H	CH
6-68	F	H	CH ₃	Cl		C=O	CH
6-69	F	H	CH ₃	CH ₃		C=O	CH
6-70	F	H	CH ₃	CF ₃		C=O	CH
6-71	F	H	CH ₃	OCH ₃		C=O	CH
6-72	F	H	CH ₃	SCH ₃		C=O	CH
6-73	F	H	OCH ₃	Cl		C=O	CH
6-74	F	H	OCH ₃	CF ₃		C=O	CH
6-75	F	H	OCH ₃	SCH ₃		C=O	CH
6-76	F	H	CF ₃	Cl		C=O	CH
6-77	F	H	CF ₃	CF ₃		C=O	CH
6-78	F	H	CF ₃	SCH ₃		C=O	CH
6-79	F	H	OCH ₂ CH ₃	Cl		C=O	CH
6-80	F	H	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃		C=O	CH
6-81	F	H	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃		C=O	CH

	6-82	F	H	SCH ₃	Cl	C=O		CH
	6-83	F	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	C=O		CH
	6-84	Cl	H	CH ₃	Cl	C=O		CH
	6-85	Cl	H	CH ₃	CH ₃	C=O		CH
	6-86	Cl	H	CH ₃	CF ₃	C=O		CH
	6-87	Cl	H	CH ₃	OCH ₃	C=O		CH
	6-88	Cl	H	CH ₃	SCH ₃	C=O		CH
	6-89	Cl	H	OCH ₃	Cl	C=O		CH
	6-90	Cl	H	OCH ₃	CF ₃	C=O		CH
	6-91	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C=O		CH
	6-92	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	C=O		CH
	6-93	Cl	H	OCH ₃	SCH ₃	C=O		CH
	6-94	Cl	H	CF ₃	Cl	C=O		CH
	6-95	Cl	H	CF ₃	CF ₃	C=O		CH
	6-96	Cl	H	CF ₃	SCH ₃	C=O		CH
	6-97	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	C=O		CH
	6-98	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C=O		CH
	6-99	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃	C=O		CH
	6-100	Cl	H	SCH ₃	Cl	C=O		CH
	6-101	Cl	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	C=O		CH
	6-102	F	H	CH ₃	Cl	OH	H	CH
	6-103	F	H	CH ₃	CH ₃	OH	H	CH
	6-104	F	H	CH ₃	CF ₃	OH	H	CH
[0800]	6-105	F	H	CH ₃	OCH ₃	OH	H	CH
	6-106	F	H	CH ₃	SCH ₃	OH	H	CH
	6-107	F	H	OCH ₃	Cl	OH	H	CH
	6-108	F	H	OCH ₃	CF ₃	OH	H	CH
	6-109	F	H	OCH ₃	SCH ₃	OH	H	CH
	6-110	F	H	CF ₃	Cl	OH	H	CH
	6-111	F	H	CF ₃	CF ₃	OH	H	CH
	6-112	F	H	CF ₃	SCH ₃	OH	H	CH
	6-113	F	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	OH	H	CH
	6-114	F	H	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH	H	CH
	6-115	F	H	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃	OH	H	CH
	6-116	F	H	SCH ₃	Cl	OH	H	CH
	6-117	F	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	OH	H	CH
	6-118	Cl	H	CH ₃	Cl	OH	H	CH
	6-119	Cl	H	CH ₃	CH ₃	OH	H	CH
	6-120	Cl	H	CH ₃	CF ₃	OH	H	CH
	6-121	Cl	H	CH ₃	OCH ₃	OH	H	CH
	6-122	Cl	H	CH ₃	SCH ₃	OH	H	CH
	6-123	Cl	H	OCH ₃	Cl	OH	H	CH
	6-124	Cl	H	OCH ₃	CF ₃	OH	H	CH
	6-125	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH	H	CH
	6-126	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	OH	H	CH
	6-127	Cl	H	OCH ₃	SCH ₃	OH	H	CH
	6-128	Cl	H	CF ₃	Cl	OH	H	CH

	6-129	Cl	H	CF ₃	CF ₃	OH	H	CH
	6-130	Cl	H	CF ₃	SCH ₃	OH	H	CH
	6-131	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	OH	H	CH
[0801]	6-132	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH	H	CH
	6-133	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃	OH	H	CH
	6-134	Cl	H	SCH ₃	Cl	OH	H	CH
	6-135	Cl	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	OH	H	CH
[0802]	表 7							
[0803]								



化合物号	X ^A	(Y ^A) _n	R ^{1A}	R ^{2A}	R ^{3A}	R ^{4A}
7-1	F	H	H	H	H	H
7-2	F	H	CH ₃	Cl	H	H
7-3	F	H	CH ₃	CH ₃	H	H
7-4	F	H	CH ₃	OCH ₃	H	H
7-5	F	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	H
7-6	F	H	OCH ₃	Cl	H	H
7-7	F	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	H
7-8	F	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	H	H
7-9	F	H	H	H		C=O
7-10	F	H	CH ₃	Cl		C=O
7-11	F	H	CH ₃	CH ₃		C=O
7-12	F	H	CH ₃	OCH ₃		C=O
7-13	F	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃		C=O
7-14	F	H	OCH ₃	Cl		C=O
7-15	F	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃		C=O
7-16	F	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂		C=O
[0804] 7-17	F	H	H	H	OH	H
7-18	F	H	CH ₃	Cl	OH	H
7-19	F	H	CH ₃	CH ₃	OH	H
7-20	F	H	CH ₃	OCH ₃	OH	H
7-21	F	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	OH	H
7-22	F	H	OCH ₃	Cl	OH	H
7-23	F	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	OH	H
7-24	F	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	OH	H
7-25	Cl	H	H	H	H	H
7-26	Cl	H	CH ₃	Cl	H	H
7-27	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H
7-28	Cl	H	CH ₃	OCH ₃	H	H
7-29	Cl	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	H
7-30	Cl	H	OCH ₃	Cl	H	H
7-31	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	H
7-32	Cl	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	H	H
7-33	Cl	H	H	H		C=O
7-34	Cl	H	CH ₃	Cl		C=O

[0805]	7-35	Cl	H	CH ₃	CH ₃		C=O
	7-36	Cl	H	CH ₃	OCH ₃		C=O
	7-37	Cl	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃		C=O
	7-38	Cl	H	OCH ₃	Cl		C=O
	7-39	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃		C=O
	7-40	Cl	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂		C=O
	7-41	Cl	H	H	H	OH	H
	7-42	Cl	H	CH ₃	Cl	OH	H
	7-43	Cl	H	CH ₃	CH ₃	OH	H
	7-44	Cl	H	CH ₃	OCH ₃	OH	H
	7-45	Cl	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	OH	H
	7-46	Cl	H	OCH ₃	Cl	OH	H
	7-47	Cl	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	OH	H
	7-48	Cl	H	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	OH	H

[0806] 表 8

[0807]

表 8

化合物号	物理和化学性质 (mp (°C), n _D ²⁰ 或 ¹ H-NMR (300MHz, CDCl ₃) δ)
1-14	2.07(3H,s), 3.98(6H,s), 5.30(1H,s), 5.95(1H,s), 6.62(1H,t), 7.09-7.16(1H,m), 7.20-7.25(1H,m), 7.45-7.47(1H,m)
1-27	2.07(3H,s), 3.94(6H,s), 5.63(1H,s), 5.90(1H,s), 6.76(1H,t), 7.26-7.31(1H,m), 7.38-7.41(1H,m), 7.90-7.93(1H,m), 9.97(1H,br)
1-46	2.08(3H,s), 4.10(6H,s), 5.31(1H,s), 6.63(1H,t), 7.15-7.73(3H), 9.75(1H,br)
1-64	2.04(3H,s), 3.98(6H,s), 5.25(1H,s), 5.94(1H,s), 6.45(1H,t), 7.24(1H,m), 7.64(2H,m), 11.04(1H,bs)
1-65	2.04(3H,s), 3.93(6H,s), 5.26(1H,s), 5.94(1H,s), 6.42(1H,t), 7.28(1H,m), 7.55(1H,m), 7.76(1H,m), 10.91(1H,bs)
1-72	2.02(3H, s), 2.34(3H, s), 3.98(6H, s), 5.26(1H, br s), 5.92(1H, br s), 6.41(1H, t, J = 54 Hz), 7.10 - 7.30(1H, m), 7.50(2H, m), 10.8(1H, br s)
1-112	2.17(3H,s), 4.00(6H,s), 5.60(1H,s), 6.00(1H,s), 6.62(1H,t), 6.95-7.03(1H,m), 7.07-7.15(1H,m), 11.73(1H,br)
1-117	2.08(3H, s), 2.35(3H, s), 3.98(6H, s), 5.26(1H, s), 5.95(1H, s), 6.58(1H, t, J = 54 Hz), 6.94(1H, br d, J = 11 Hz), 7.26(1H, s), 10.7(1H, br s)
2-1	100-104
2-14	3.34(3H,s), 3.88(6H,s), 4.09(1H,d,J=15Hz), 4.40(1H,d,J=15Hz), 5.88(1H,s), 6.40(1H,t), 7.03-7.09(1H,m), 7.27-7.34(2H,m)
2-18	1.94(3H,s), 3.87(6H,s), 4.10(1H,d,J=15Hz), 4.30(1H,d,J=15Hz), 5.89(1H,s), 6.97(1H,t), 7.14-7.17(1H,m), 7.33-7.45(2H,m)
2-31	1.91(3H,s), 3.86(6H,s), 4.33(2H, s), 5.90(1H,s), 7.05(1H,t), 7.35-7.48(3H,m)
2-32	3.38(3H,m), 3.88(6H,s), 4.12(1H, d), 4.34(1H, d), 5.89(1H,s), 6.58(1H,t), 7.28-7.44(3H,m)
2-40	4.06(6H,s), 4.14(2H,s), 6.33(1H,t), 7.20(1H), 7.31(1H), 7.36(1H), 7.60(1H), 10.75(1H,s)
2-46	3.27(3H,s), 4.06-4.14(8H), 6.21(1H,t), 7.39(1H), 7.64(1H), 7.66(1H)
2-61	76-80
2-62	78-81
2-63	98-100
2-64	4.11(6H,s), 4.47(2H,s), 6.43(1H,s), 6.82(1H,t), 7.25(1H,m), 7.52(2H,m)
2-65	3.97(6H,s), 4.13(2H,s), 5.93(1H,s), 6.32(1H,t), 7.22-7.54(3H,m), 11.36(1H,bs)
2-66	3.97(6H,m), 4.43(2H,s), 5.94(1H,s), 6.33(1H,t), 7.16-7.54(3H,m), 11.50(1H,bs)
2-67	106-109
2-68	3.94(6H,s), 4.37(2H,s), 5.95(1H,s), 6.35(1H,t), 7.31(1H,s), 7.55(1H,s), 11.63(1H,bs)
2-71	106-109
2-72	116-117
2-73	106-109
2-110	3.96(6H,s), 4.20(2H,s), 5.94(1H,s), 6.56(1H,t), 6.95-7.20(2H,m)
2-111	3.96(6H,s), 4.23(2H,s), 5.95(1H,s), 6.51(1H,t), 6.85(1H,m), 6.98(1H,m)

[0808]

2-112	3.96(6H,s), 4.31(2H,s), 5.95(1H,s), 6.76(1H,t), 6.95-7.11(2H,m), 11.24(1H,br)	
2-114	3.96(6H,s), 4.21(2H,s), 5.95(1H,s), 6.53(1H,t), 7.10-7.23(2H,m), 11.1(1H,bs)	
2-115	3.96(6H), 4.48(2H,s), 5.95(1H,s), 7.03(1H), 7.30(1H), 11.25(1H,s)	
2-117	145-149	
2-118	131-133	
2-124	121-122	
2-125	111-115	
2-131	137-140	
2-136	3.95(6H,s), 4.28(2H, s), 5.94(1H,s), 6.70(1H,t), 7.29(1H,d), 7.37(1H,d), 11.25(1H,br)	
2-137	3.95(6H,s), 4.26(2H,s), 5.95(1H,s), 6.67(1H,t), 7.35(1H,d), 7.40(1H,d), 11.03(1H,s)	
2-138	3.95(6H,s), 4.56(2H,s), 5.95(1H,s), 6.72(1H,t), 7.31-7.32(2H,m), 11.23(1H,br)	
2-140	132-136	
2-164	3.99(6H,s), 4.33(2H, s), 5.97(1H,s), 6.46(1H,t), 7.41(1H,t), 7.67(1H,dd), 7.91(1H,dd), 10.31(1H,s)	
2-167	3.91(6H,s), 4.37(2H, s), 5.99(1H,s), 6.91(1H,t), 7.41(1H,t), 7.66(1H,dd), 7.87(1H,dd)	
2-168	3.92(3H,s), 3.96(6H,s), 4.28(2H, s), 5.93(1H,s), 6.46(1H,t), 7.26-7.31(1H,m), 7.54-7.56(1H,m), 7.75-7.78(1H,m),	11.27(1H,br)
2-173	3.95(6H,s), 4.30(2H,s), 5.94(1H,s), 6.55(1H,t), 7.25-7.29(2H), 7.37(1H), 11.15(1H,s)	
2-190	120-124	
2-191	0.48-0.55(1H,m), 0.78-0.86(1H,m), 0.99-1.08(3H,m), 3.85(6H,s), 4.14(1H, d), 4.39(1H, d), 5.87(1H,s), 7.05(1H,t), 7.36-7.52(3H,m)	
2-192	1.519	
2-193	2.38(3H, br s), 3.95(6H, s), 4.22(2H, s), 5.91(1H, s), 6.36(1H, t, J = 54 Hz), 6.94(1H, dd, J = 8.6, 8.6 Hz),	
	7.20(1H, dd, J = 8.6, 6.2 Hz), 11.2(1H, br s)	
3-19	3.37(3H,s), 3.94(6H,s), 6.18(1H,s), 6.25(1H,t), 7.43(1H,t), 7.61(1H,dd), 7.67(1H,dd)	
3-22	2.91(3H,s), 3.93(6H,s), 6.20(1H,s), 6.77(1H,t), 7.53(1H,t), 7.62(1H,dd), 7.78(1H,dd)	
3-31	4.11(6H,s), 6.35(1H,t) 7.21(1H) 7.60-7.67(2H) 7.87(1H) 11.14(1H,s)	
3-37	3.27(3H,s), 4.12(6H,s), 6.20(1H,s), 7.27(1H), 7.53(1H), 7.65(1H)	
3-98	3.86(6H,s), 5.89(1H,t), 6.15(1H,s), 6.98-7.08(2H,m) (in CD ₃ CN)	
4-37	4.07(6H,s) 4.62(1H,s) 6.00(1H,s) 6.32(1H,t) 7.26-7.35(2H) 7.61(1H) 7.67(1H) 10.19(1H,s)	
4-57	3.95(6H, s), 6.01(1H, s), 6.11(1H, s), 6.29(1H, t, J = 54 Hz), 6.81 - 6.85(2H, m)	
4-59	4.01(6H, s), 5.95(1H, s), 6.02(1H, s), 6.32(1H, t, J = 54 Hz), 7.43 - 7.57(2H, m)	
4-61	100-103	
4-63	2.57(3H, s), 3.92(6H, s), 5.95(1H, s), 6.20(1H, t, J = 54 Hz), 7.03(1H, d, J = 7.0 Hz), 7.17(1H, dd, J = 7.7, 7.0 Hz),	
	7.39(1H, d, J = 7.7 Hz)	
4-101	4.01(6H,s), 5.00(1H,s), 6.03(1H,s), 6.12(1H,bs), 6.53(1H,t), 6.87(1H,m), 7.30(1H,m)	
4-107	2.34(3H, s), 4.00(6H, s), 4.93(1H, br s), 5.99(1H, s), 6.10(1H, s), 6.57(1H, t, J = 54 Hz), 6.92(1H, br d, J = 11 Hz),	
	7.32(1H, br s), 10.4(1H, br s)	

[0809]

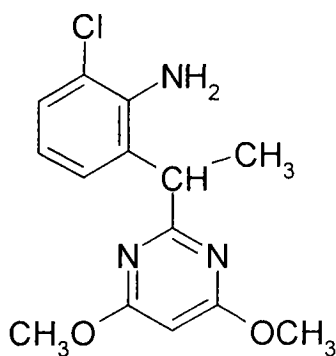
182-183
 2.39(3H, s), 3.97(6H, s), 4.90(1H, br s), 5.94(1H, s), 6.17(1H, br s), 6.39(1H, t, J = 54 Hz), 7.02(1H, dd, J = 9.0, 9.0 Hz), 7.54(1H, dd, J = 9.0, 6.0 Hz), 10.6(1H, br s)
 96-99
 1.5543
 4.01(6H, s), 6.01(1H, s), 6.04(1H, s), 6.63(1H, t), 7.16-7.37(3H, m), 11.09(1H, br)
 3.98(6H, s), 5.97(1H, s), 6.37(1H, s), 6.78(1H, t), 7.31(1H, t), 7.47(1H, dd), 7.75(1H, dd), 9.66(1H, br)
 1.73(3H, s), 2.09(3H, s), 3.84(6H, s), 5.96(1H, s), 6.49(1H, t), 7.14-7.32(3H, m), 8.26(1H, bs)
 3.13(3H, s) 3.97(6H, s) 5.92(1H, s) 6.08(1H, s) 6.41(1H, t) 7.30(1H) 7.43(1H) 7.69-7.75(2H) 8.65(1H, s)
 141-143
 119-123
 109-119

[0810]

参考实施例 1 (中间体的制备)

[0811]

4-130
 4-184
 4-186
 4-187
 5-2
 5-3
 5-31
 5-33
 6-35
 6-51
 6-103

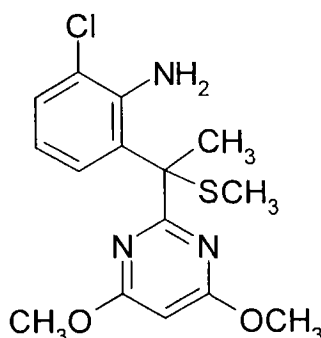


[0812] 在 0℃下,向 2-{1-甲硫基-1-(2-氨基-3-氯苯基)乙基}-4,6-二甲氧基嘧啶 3g(8.8mmol) 的 100ml 甲醇溶液中加入氯化镍(II)六水合物 4.2g(17.7mmol),并将混合物搅拌 30 分钟。随后在该温度下,向其中慢慢地加入硼氢化钠 1.35g(35mmol)。将该溶液在室温下搅拌 1 小时,随后蒸馏出溶剂。向残余物中加入 2N 盐酸,并且随后加入 28%的氨水,将混合物用乙酸乙酯进行萃取。用氢氧化钠水溶液洗涤有机层,并且蒸馏出溶剂。用己烷洗涤后,滤出沉淀的晶体,获得 2-{1-(2-氨基-3-氯苯基)乙基}-4,6-二甲氧基嘧啶 2.12g(82%)。

[0813] ^1H NMR(300MHz, CDCl_3) δ 1.71(3H, d) 3.90(6H, s) 4.3(1H, q) 5.09(1H, bs) 5.85(1H, s) 6.67(1H, m) 7.25(2H, m)。

[0814] 参考实施例 2(中间体的制备)

[0815]

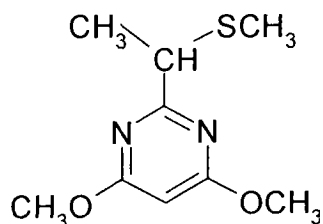


[0816] 将 2-氯苯胺 7g(32.7mmol) 溶解于二氯甲烷 100ml 中,并将溶液冷却至 -65℃。向溶液中滴加叔丁基次氯酸酯(t-butyl hypochlorite)3.55g(32.7mmol) 的二氯甲烷 10ml 的溶液,并将溶液在同样的温度下搅拌 10 分钟。随后向其中滴加 2-(1-甲硫基乙基)-4,6-二甲氧基嘧啶的二氯甲烷溶液,并将溶液在同样的温度下搅拌 1 小时。在滴加甲醇钠 12.6g(65.3mmol) 的甲醇溶液,并且将混合溶液在同样的温度下搅拌 10 分钟后,搅拌反应溶液直至其达到室温。将反应溶液注入水中,并且用二氯甲烷进行萃取。蒸馏出溶剂,并且用柱色谱法(己烷/乙酸乙酯=5/1)纯化残余物,获得 2-{1-甲硫基-1-(2-氨基-3-氯苯基)乙基}-4,6-二甲氧基嘧啶 10.0g(90%)。

[0817] ^1H NMR(300MHz, CDCl_3) δ 1.76(3H, s) 2.07(3H, s) 3.85(6H, s) 4.76(2H, bs) 5.88(1H, s) 6.65(1H, m) 7.25(2H, m)。

[0818] 参考实施例 3(中间体的制备)

[0819]

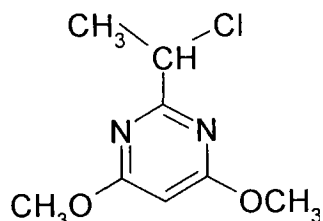


[0820] 将 2-(1-氯乙基)-4,6-二甲氧基嘧啶 15.5g (76.5mmol) 溶解于 DMF 200ml 中, 并且在室温下向其中加入甲硫醇的钠盐 5.4g (76.5mmol)。将溶液在 50℃ 下搅拌 1 小时。将反应溶液注入水中, 并且用乙酸乙酯萃取。蒸馏出溶剂, 并且用柱色谱法 (己烷 / 乙酸乙酯 = 5/1) 纯化残余物, 获得 2-(1-甲硫基乙基)-4,6-二甲氧基嘧啶 14.8g (90%)。

[0821] ^1H NMR (300MHz, CDCl_3) δ 1.66 (3H, d) 2.15 (3H, s) 3.9 (1H, q) 3.94 (6H, s) 5.9 (1H, s)。

[0822] 参考实施例 4 (中间体的制备)

[0823]



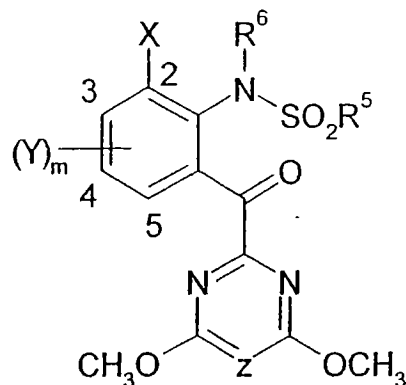
[0824] 将碳酸钾水溶液 (碳酸钾 109g, 791mmol, 水 200ml) 和二氯甲烷 400ml 的混合溶液冷却至 -15℃, 并且用机械搅拌器进行搅拌。向其中慢慢地加入丙二酸二甲酯的 diimide 25.7g (198mmol), 并且将混合物搅拌 1 小时。在同样的温度下向溶液中滴加入氯丙酰基氯 21.6ml (218mmol) 的二氯甲烷 40ml 的溶液。将溶液恢复至室温, 并且搅拌 3 小时。将反应溶液注入水中, 并且用二氯甲烷进行萃取。蒸馏出溶剂, 并且用柱色谱法 (己烷 / 乙酸乙酯 = 5/1) 纯化残余物, 获得 2-(1-氯乙基)-4,6-二甲氧基嘧啶 15.5g (39%)。

[0825] ^1H NMR (300MHz, CDCl_3) δ 1.87 (3H, d) 3.97 (6H, s) 4.98 (1H, q) 5.94 (1H, s)。

[0826] 包括已知化合物的上述式 (I) 的杀真菌的磺酰替苯胺化合物的实例示于下表 9-21 中, 并且其物理和化学性质示于表 22 中。表中各基团的缩写与上述表 1-7 中的描述相同。

[0827] 表 9

[0828]



[0829]

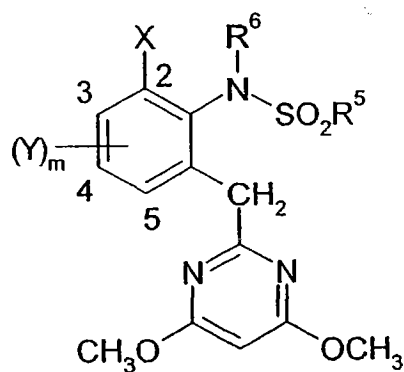
	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z
9-1	H	H	CH ₃	H	CH
9-2	F	H	CH ₃	H	CH
9-3	Cl	H	CH ₃	H	CH
9-4	F	4-F	CH ₃	H	CH
9-5	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
9-6	F	H	CH ₂ Cl	H	CH
9-7	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
9-8	F	4-F	CH ₂ Cl	H	CH
9-9	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
9-10	F	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
9-11	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
9-12	H	H	CH ₂ CN	H	CH
9-13	F	H	CH ₂ CN	H	CH
9-14	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH
9-15	F	4-F	CH ₂ CN	H	CH
9-16	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
9-17	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
9-18	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
9-19	F	4-F	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
9-20	H	H	CF ₃	H	CH
9-21	F	H	CF ₃	H	CH
9-22	Cl	H	CF ₃	H	CH
9-23	F	4-F	CF ₃	H	CH
9-24	H	H	CHF ₂	H	CH
9-25	F	H	CHF ₂	H	CH
9-26	Cl	H	CHF ₂	H	CH
9-27	H	H	CH ₂ Ph	H	CH
9-28	F	H	CH ₂ Ph	H	CH
9-29	Cl	H	CH ₂ Ph	H	CH
9-30	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
9-31	F	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
9-32	Cl	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
9-33	H	H	CH ₃	H	N

[0830]

9-34	F	H	CH ₃	H	N
9-35	Cl	H	CH ₃	H	N
9-36	H	H	CH ₂ Cl	H	N
9-37	F	H	CH ₂ Cl	H	N
9-38	Cl	H	CH ₂ Cl	H	N
9-39	H	H	CH ₂ CF ₃	H	N
9-40	F	H	CH ₂ CF ₃	H	N
9-41	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	N
9-42	H	H	CH ₂ CN	H	N
9-43	F	H	CH ₂ CN	H	N
9-44	Cl	H	CH ₂ CN	H	N
9-45	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
9-46	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
9-47	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
9-48	H	H	CHF ₂	H	N
9-49	CH ₂ OCH ₃	H	CHF ₂	CH ₃	CH

[0831] 表 10

[0832]

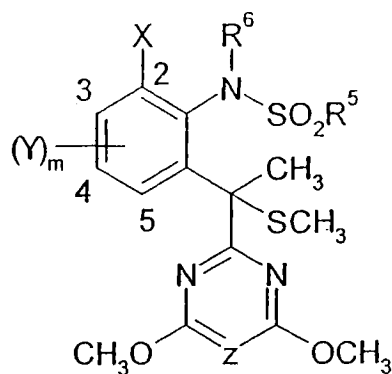


[0833]

	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶
10-1	H	H	CH ₃	CH ₃
10-2	F	H	CH ₃	CH ₃
10-3	Cl	H	CH ₃	CH ₃
10-4	H	H	CH ₂ CN	CH ₃
10-5	F	H	CH ₂ CN	CH ₃
10-6	Cl	H	CH ₂ CN	CH ₃
10-7	H	H	CF ₃	CH ₃
10-8	F	H	CF ₃	CH ₃
10-9	Cl	H	CF ₃	CH ₃
10-10	H	H	CH ₂ Cl	CH ₃
10-11	F	H	CH ₂ Cl	CH ₃
10-12	Cl	H	CH ₂ Cl	CH ₃

[0834] 表 11

[0835]



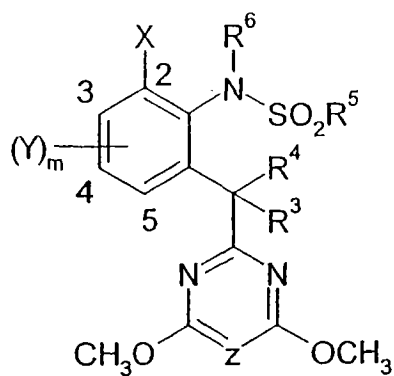
	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z
11-1	H	H	CH ₃	H	CH
11-2	F	H	CH ₃	H	CH
11-3	F	H	C ₈ H ₁₇	H	CH
11-4	Cl	H	CH ₃	H	CH
11-5	F	4-F	CH ₃	H	CH
11-6	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
11-7	F	H	CH ₂ Cl	H	CH
11-8	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
11-9	F	4-F	CH ₂ Cl	H	CH
11-10	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
11-11	F	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
11-12	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
11-13	H	H	CH ₂ CN	H	CH
11-14	F	H	CH ₂ CN	H	CH
11-15	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH
11-16	F	4-F	CH ₂ CN	H	CH
11-17	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
11-18	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
11-19	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
11-20	F	4-F	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
11-21	H	H	CF ₃	H	CH
11-22	F	H	CF ₃	H	CH
11-23	Cl	H	CF ₃	H	CH
11-24	F	4-F	CF ₃	H	CH
11-25	H	H	CH ₂ Ph	H	CH
11-26	F	H	CH ₂ Ph	H	CH
11-27	Cl	H	CH ₂ Ph	H	CH
11-28	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
11-29	F	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
11-30	Cl	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
11-31	H	H	CH ₃	H	N
11-32	F	H	CH ₃	H	N
11-33	Cl	H	CH ₃	H	N
11-34	H	H	CH ₂ Cl	H	N
11-35	F	H	CH ₂ Cl	H	N

[0836]

[0837]	11-36	Cl	H	CH ₂ Cl	H	N
	11-37	H	H	CH ₂ CF ₃	H	N
	11-38	F	H	CH ₂ CF ₃	H	N
	11-39	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	N
	11-40	H	H	CH ₂ CN	H	N
	11-41	F	H	CH ₂ CN	H	N
	11-42	Cl	H	CH ₂ CN	H	N
	11-43	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
	11-44	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
	11-45	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N

[0838] 表 12

[0839]



[0840]

	X	(Y) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Z
12-1	F	3-F	SCH ₃	H	CH ₃	H	CH
12-2	F	3-F	SCH ₃	H	CH ₂ Cl	H	CH
12-3	F	3-F	SCH ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
12-4	F	3-F	SCH ₃	H	CH ₂ CN	H	CH
12-5	F	3-F	SCH ₃	H	CF ₃	H	CH
12-6	F	3-F	SCH ₃	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
12-7	F	3-F	SCH ₃	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
12-8	F	4-Cl	SCH ₃	H	CH ₃	H	CH
12-9	F	4-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ Cl	H	CH
12-10	F	4-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
12-11	F	4-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ CN	H	CH
12-12	F	4-Cl	SCH ₃	H	CF ₃	H	CH
12-13	F	3,4-F ₂	SCH ₃	H	CH ₃	H	CH
12-14	F	3,4-F ₂	SCH ₃	H	CH ₂ Cl	H	CH
12-15	F	3,4-F ₂	SCH ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
12-16	F	3,4-F ₂	SCH ₃	H	CH ₂ CN	H	CH
12-17	F	3,4-F ₂	SCH ₃	H	CF ₃	H	CH
12-18	Cl	4-F	SCH ₃	H	CH ₃	H	CH
12-19	Cl	4-F	SCH ₃	H	CH ₂ Cl	H	CH
12-20	Cl	4-F	SCH ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
12-21	Cl	4-F	SCH ₃	H	CH ₂ CN	H	CH
12-22	Cl	4-F	SCH ₃	H	CF ₃	H	CH
12-23	Cl	4-CH ₃	SCH ₃	H	CH ₃	H	CH
12-24	Cl	4-CH ₃	SCH ₃	H	CH ₂ Cl	H	CH
12-25	Cl	4-CH ₃	SCH ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
12-26	Cl	4-CH ₃	SCH ₃	H	CH ₂ CN	H	CH
12-27	Cl	4-CH ₃	SCH ₃	H	CF ₃	H	CH
12-28	Cl	3-Cl	SCH ₃	H	CH ₃	H	CH
12-29	Cl	3-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ Cl	H	CH
12-30	Cl	3-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
12-31	Cl	3-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ CN	H	CH
12-32	Cl	3-Cl	SCH ₃	H	CF ₃	H	CH
12-33	Cl	4-Cl	SCH ₃	H	CH ₃	H	CH
12-34	Cl	4-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ Cl	H	CH

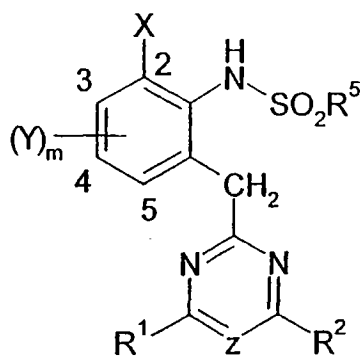
	12-35	Cl	4-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-36	Cl	4-Cl	SCH ₃	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-37	Cl	4-Cl	SCH ₃	H	CF ₃	H	CH
	12-38	F	H	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH
	12-39	F	H	H	H	炔丙基	H	CH
	12-40	F	H	H	H	环己基	H	CH
	12-41	F	3-F	H	H	CH ₃	H	CH
	12-42	F	3-F	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-43	F	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-44	F	3-F	H	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-45	F	3-F	H	H	CF ₃	H	CH
	12-46	F	3-F	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
	12-47	F	3-F	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
	12-48	F	4-Cl	H	H	CH ₃	H	CH
	12-49	F	4-Cl	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-50	F	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-51	F	4-Cl	H	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-52	F	4-Cl	H	H	CF ₃	H	CH
	12-53	F	5-Cl	H	H	CF ₃	H	CH
	12-54	F	5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-55	F	3,4-F ₂	H	H	CH ₃	H	CH
	12-56	F	3,4-F ₂	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-57	F	3,4-F ₂	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-58	F	3,4-F ₂	H	H	CH ₂ CN	H	CH
[0841]	12-59	F	3,4-F ₂	H	H	CF ₃	H	CH
	12-60	Cl	H	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH
	12-61	Cl	H	H	H	炔丙基	H	CH
	12-62	Cl	H	H	H	环己基	H	CH
	12-63	Cl	4-F	H	H	CH ₃	H	CH
	12-64	Cl	4-F	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-65	Cl	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-66	Cl	4-F	H	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-67	Cl	4-F	H	H	CF ₃	H	CH
	12-68	Cl	4-CH ₃	H	H	CH ₃	H	CH
	12-69	Cl	4-CH ₃	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-70	Cl	4-CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-71	Cl	4-CH ₃	H	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-72	Cl	4-CH ₃	H	H	CF ₃	H	CH
	12-73	Cl	3-Cl	H	H	CH ₃	H	CH
	12-74	Cl	3-Cl	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-75	Cl	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-76	Cl	3-Cl	H	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-77	Cl	3-Cl	H	H	CF ₃	H	CH
	12-78	Cl	4-Cl	H	H	CH ₃	H	CH
	12-79	Cl	4-Cl	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-80	Cl	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-81	Cl	4-Cl	H	H	CF ₃	H	CH
	12-82	F	H	OH	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH

	12-83	F	H	OH	H	炔丙基	H	CH
	12-84	F	H	OH	H	环己基	H	CH
	12-85	F	3-F	OH	H	CH ₃	H	CH
	12-86	F	3-F	OH	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-87	F	3-F	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-88	F	3-F	OH	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-89	F	3-F	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-90	F	3-F	OH	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
	12-91	F	3-F	OH	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
	12-92	F	4-Cl	OH	H	CH ₃	H	CH
	12-93	F	4-Cl	OH	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-94	F	4-Cl	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-95	F	4-Cl	OH	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-96	F	4-Cl	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-97	F	3,4-F ₂	OH	H	CH ₃	H	CH
	12-98	F	3,4-F ₂	OH	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-99	F	3,4-F ₂	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-100	F	3,4-F ₂	OH	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-101	F	3,4-F ₂	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-102	Cl	H	OH	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH
	12-103	Cl	H	OH	H	炔丙基	H	CH
	12-104	Cl	H	OH	H	环己基	H	CH
	12-105	Cl	4-F	OH	H	CH ₃	H	CH
[0842]	12-106	Cl	4-F	OH	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-107	Cl	4-F	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-108	Cl	4-F	OH	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-109	Cl	4-F	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-110	Cl	4-CH ₃	OH	H	CH ₃	H	CH
	12-111	Cl	4-CH ₃	OH	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-112	Cl	4-CH ₃	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-113	Cl	4-CH ₃	OH	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-114	Cl	4-CH ₃	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-115	Cl	3-Cl	OH	H	CH ₃	H	CH
	12-116	Cl	3-Cl	OH	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-117	Cl	3-Cl	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-118	Cl	3-Cl	OH	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-119	Cl	3-Cl	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-120	Cl	4-Cl	OH	H	CH ₃	H	CH
	12-121	Cl	4-Cl	OH	H	CH ₂ Cl	H	CH
	12-122	Cl	4-Cl	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-123	Cl	4-Cl	OH	H	CH ₂ CN	H	CH
	12-124	Cl	4-Cl	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-125	Cl	H	CH ₃	H	CF ₃	H	CH
	12-126	I	H	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-127	F	H	Cl	H	CF ₃	H	CH
	12-128	CF ₃	H	OH	H	CF ₃	H	CH
	12-129	F	4-CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-130	Cl	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH

	12-131	F	4-CH ₃	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-132	H	4-CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-133	F	3-F-4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
[0843]	12-134	CL	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-135	F	5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	12-136	F	H	H	H	CHCl ₂	H	CH
	12-137	CH ₃	3-F	OH	H	CH ₂ CF ₃	H	CH

[0844] 表 13

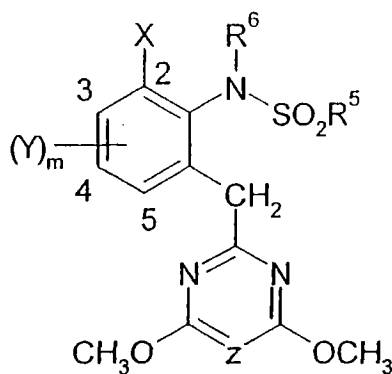
[0845]



		X	(Y) _m	R ¹	R ²	R ⁵	Z
	13-1	F	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH
	13-2	Cl	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH
	13-3	H	4-Cl	OCH ₃	OCH ₃	CF ₃	CH
[0846]	13-4	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH
	13-5	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃	CH
	13-6	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃	CH
	13-7	CH ₃	3-F	OCH ₃	OCH ₃	CF ₃	CH
	13-8	CH ₃	3-F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃	CH
	13-9	CH ₃	3-CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃	CH

[0847] 表 14

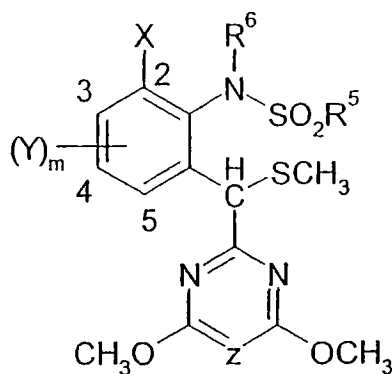
[0848]



	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z	
	14-1	H	H	CH ₂ CN	H	CH
	14-2	H	H	CF ₃	H	CH
	14-3	H	4-Cl	CH ₂ CN	H	CH
	14-4	H	4-F	CH ₃ CN	H	CH
	14-5	H	4-F	CF ₃	H	CH
	14-6	H	4-Br	CF ₃	H	CH
	14-7	F	H	CF ₃	H	CH
	14-8	F	H	CH ₂ Cl	H	CH
	14-9	F	H	CH ₂ Br	H	CH
	14-10	F	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	14-11	F	H	CH ₂ CN	H	CH
	14-12	F	4-F	CH ₃	H	CH
	14-13	F	4-F	CF ₃	H	CH
	14-14	F	4-F	CH ₂ Cl	H	CH
	14-15	F	4-F	CH ₂ CN	H	CH
	14-16	F	4-CH ₃	CH ₃ CN	H	CH
[0849]	14-17	F	4-OCH ₃	CH ₂ CN	H	CH
	14-18	F	4-OC ₂ H ₅	CH ₂ CN	H	CH
	14-19	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH
	14-20	Cl	H	CF ₃	H	CH
	14-21	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
	14-22	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
	14-23	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
	14-24	Cl	4-Cl	CH ₂ CN	H	CH
	14-25	OCH ₃	4-F	CH ₂ CN	H	CH
	14-26	H	H	CF ₃	H	N
	14-27	H	H	CH ₂ CN	H	N
	14-28	F	H	CH ₃ CN	H	N
	14-29	F	H	CF ₃	H	N
	14-30	Cl	H	CF ₃	H	N
	14-31	Cl	H	CH ₂ CN	H	N
	14-32	Cl	4-Cl	CH ₂ CN	H	N
	14-33	F	H	CHF ₂	H	CH
	14-34	F	H	CHF ₂	H	N
	14-35	Cl	H	CHF ₂	H	CH
	14-36	Cl	H	CHF ₂	H	N
	14-37	CH ₃	H	CHF ₂	H	CH
[0850]	14-38	CH ₂ OCH ₃	H	CHF ₂	H	CH
	14-39	CH ₃	H	CHF ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH
	14-40	CH ₂ OCH ₃	3-F	CHF ₂	H	CH

[0851] 表 15

[0852]



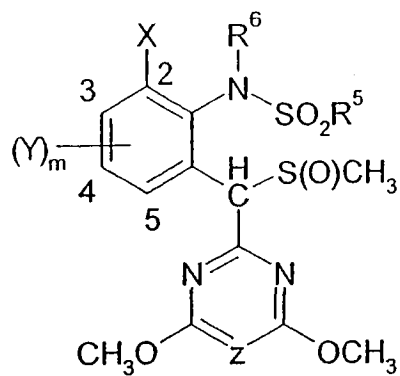
	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z
15-1	H	H	CH ₃	H	CH
15-2	F	H	CH ₃	H	CH
15-3	Cl	H	CH ₃	H	CH
15-4	F	4-F	CH ₃	H	CH
15-5	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
15-6	F	H	CH ₂ Cl	H	CH
15-7	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
15-8	F	4-F	CH ₂ Cl	H	CH
15-9	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
15-10	F	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
15-11	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
15-12	H	H	CH ₂ CN	H	CH
15-13	F	H	CH ₂ CN	H	CH
15-14	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH
15-15	F	4-F	CH ₂ CN	H	CH
15-16	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
15-17	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
15-18	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
15-19	F	4-F	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
15-20	H	H	CF ₃	H	CH
15-21	F	H	CF ₃	H	CH
15-22	Cl	H	CF ₃	H	CH
15-23	F	4-F	CF ₃	H	CH
15-24	H	H	CH ₂ Ph	H	CH
15-25	F	H	CH ₂ Ph	H	CH
15-26	Cl	H	CH ₂ Ph	H	CH
15-27	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
15-28	F	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
15-29	Cl	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
15-30	H	H	CH ₃	H	N
15-31	F	H	CH ₃	H	N
15-32	Cl	H	CH ₃	H	N
15-33	H	H	CH ₂ Cl	H	N
15-34	F	H	CH ₂ Cl	H	N
15-35	Cl	H	CH ₂ Cl	H	N

[0853]

[0854]	15-36	H	H	CH ₂ CF ₃	H	N
	15-37	F	H	CH ₂ CF ₃	H	N
	15-38	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	N
	15-39	H	H	CH ₂ CN	H	N
	15-40	F	H	CH ₂ CN	H	N
	15-41	Cl	H	CH ₂ CN	H	N
	15-42	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
	15-43	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
	15-44	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
	15-45	H	H	CF ₃	H	N
	15-46	F	H	CF ₃	H	N
	15-47	Cl	H	CF ₃	H	N
	15-48	F	4-F	CF ₃	H	N
	15-49	C ₂ H ₅	H	CHF ₂	H	CH
	15-50	CH ₂ OCH ₃	H	CHF ₂	H	CH

[0855] 表 16

[0856]

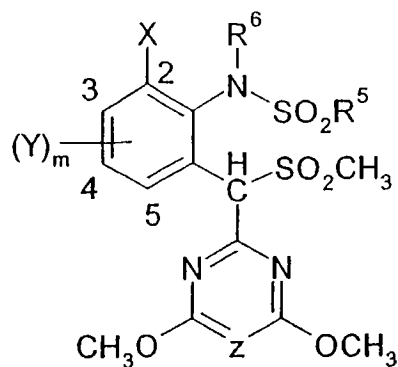


[0857]

	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z
16-1	H	H	CH ₃	H	CH
16-2	F	H	CH ₃	H	CH
16-3	Cl	H	CH ₃	H	CH
16-4	F	4-F	CH ₃	H	CH
16-5	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
16-6	F	H	CH ₂ Cl	H	CH
16-7	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
16-8	F	4-F	CH ₂ Cl	H	CH
16-9	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
16-10	F	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
16-11	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
16-12	H	H	CH ₂ CN	H	CH
16-13	F	H	CH ₂ CN	H	CH
16-14	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH
16-15	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
16-16	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
16-17	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
16-18	H	H	CF ₃	H	CH
16-19	F	H	CF ₃	H	CH
16-20	Cl	H	CF ₃	H	CH
16-21	F	4-F	CF ₃	H	CH
16-22	H	H	CH ₂ Ph	H	CH
16-23	F	H	CH ₂ Ph	H	CH
16-24	Cl	H	CH ₂ Ph	H	CH
16-25	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
16-26	F	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
16-27	Cl	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
16-28	CH ₂ OCH ₃	H	CHF ₂	H	CH

[0858] 表 17

[0859]

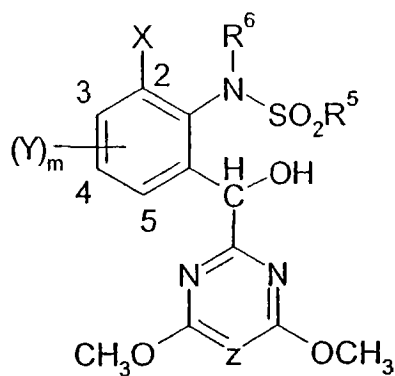


[0860]

	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z
17-1	H	H	CH ₃	H	CH
17-2	F	H	CH ₃	H	CH
17-3	Cl	H	CH ₃	H	CH
17-4	F	4-F	CH ₃	H	CH
17-5	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
17-6	F	H	CH ₂ Cl	H	CH
17-7	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
17-8	F	4-F	CH ₂ Cl	H	CH
17-9	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
17-10	F	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
17-11	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
17-12	H	H	CH ₂ CN	H	CH
17-13	F	H	CH ₂ CN	H	CH
17-14	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH
17-15	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
17-16	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
17-17	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
17-18	H	H	CF ₃	H	CH
17-19	F	H	CF ₃	H	CH
17-20	Cl	H	CF ₃	H	CH
17-21	F	4-F	CF ₃	H	CH
17-22	H	H	CH ₂ Ph	H	CH
17-23	F	H	CH ₂ Ph	H	CH
17-24	Cl	H	CH ₂ Ph	H	CH
17-25	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
17-26	F	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
17-27	Cl	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH

[0861] 表 18

[0862]



[0863]

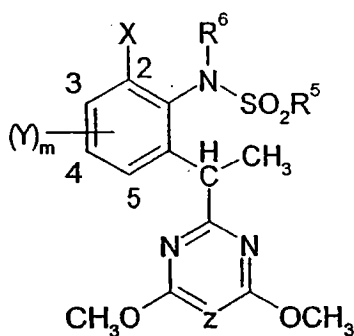
	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z
18-1	H	H	CH ₃	H	CH
18-2	F	H	CH ₃	H	CH
18-3	Cl	H	CH ₃	H	CH
18-4	F	4-F	CH ₃	H	CH
18-5	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
18-6	F	H	CH ₂ Cl	H	CH
18-7	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
18-8	F	4-F	CH ₂ Cl	H	CH
18-9	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
18-10	F	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
18-11	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
18-12	H	H	CH ₂ CN	H	CH
18-13	F	H	CH ₂ CN	H	CH
18-14	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH
18-15	F	4-F	CH ₂ CN	H	CH
18-16	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
18-17	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
18-18	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
18-19	F	4-F	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
18-20	H	H	CF ₃	H	CH
18-21	F	H	CF ₃	H	CH
18-22	Cl	H	CF ₃	H	CH
18-23	F	4-F	CF ₃	H	CH
18-24	H	H	CHF ₂	H	CH
18-25	F	H	CHF ₂	H	CH
18-26	Cl	H	CHF ₂	H	CH
18-27	H	H	CH ₂ Ph	H	CH
18-28	F	H	CH ₂ Ph	H	CH
18-29	Cl	H	CH ₂ Ph	H	CH
18-30	H	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
18-31	F	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
18-32	Cl	H	NHCO ₂ CH ₃	H	CH
18-33	H	H	CH ₃	H	N
18-34	F	H	CH ₃	H	N

[0864]

18-35	Cl	H	CH ₃	H	N
18-36	H	H	CH ₂ Cl	H	N
18-37	F	H	CH ₂ Cl	H	N
18-38	Cl	H	CH ₂ Cl	H	N
18-39	H	H	CH ₂ CF ₃	H	N
18-40	F	H	CH ₂ CF ₃	H	N
18-41	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	N
18-42	H	H	CH ₂ CN	H	N
18-43	F	H	CH ₂ CN	H	N
18-44	Cl	H	CH ₂ CN	H	N
18-45	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
18-46	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
18-47	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N
18-48	H	H	CF ₃	H	N
18-49	F	H	CF ₃	H	N
18-50	Cl	H	CF ₃	H	N
18-51	F	H	CHF ₂	H	N
18-52	Cl	H	CHF ₂	H	N
18-53	CH ₃	H	CHF ₂	H	N

[0865] 表 19

[0866]

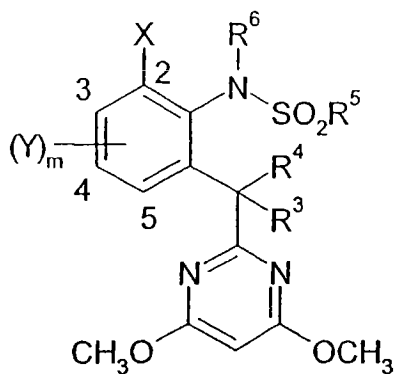


[0867]

	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z
19-1	H	H	CF ₃	H	CH
19-2	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH

[0868] 表 20

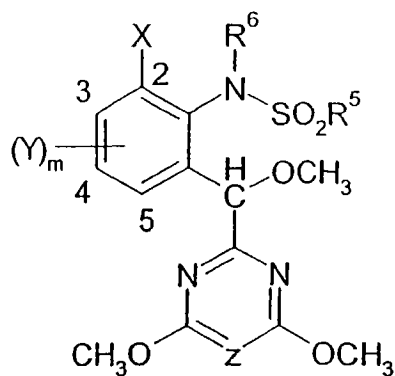
[0869]



	X	(Y) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
[0870]	20-1	F	H	NHCH ₃	H	CH ₂ Cl	H
	20-2	F	H	NHCH ₃	H	CH ₂ CN	H
	20-3	F	H	NHCH ₃	H	CHF ₂	H
	20-4	F	H	NHCH ₃	H	CF ₃	H
	20-5	Cl	H	NHCH ₃	H	CH ₂ Cl	H
	20-6	Cl	H	NHCH ₃	H	CH ₂ CN	H
	20-7	Cl	H	NHCH ₃	H	CHF ₂	H
	20-8	Cl	H	NHCH ₃	H	CF ₃	H
	20-9	F	H	N(CH ₃) ₂	H	CH ₂ Cl	H
	20-10	F	H	N(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CN	H
	20-11	F	H	N(CH ₃) ₂	H	CHF ₂	H
	20-12	F	H	N(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H
	20-13	Cl	H	N(CH ₃) ₂	H	CH ₂ Cl	H
	20-14	Cl	H	N(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CN	H
	20-15	Cl	H	N(CH ₃) ₂	H	CHF ₂	H
	20-16	Cl	H	N(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H

[0871] 表 21

[0872]



[0873]

	X	(Y) _m	R ⁵	R ⁶	Z
21-1	H	H	CH ₃	H	CH
21-2	F	H	CH ₃	H	CH
21-3	Cl	H	CH ₃	H	CH
21-4	H	H	CH ₂ Cl	H	CH
21-5	F	H	CH ₂ Cl	H	CH
21-6	Cl	H	CH ₂ Cl	H	CH
21-7	H	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
21-8	F	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
21-9	Cl	H	CH ₂ CF ₃	H	CH
21-10	H	H	CH ₂ CN	H	CH
21-11	F	H	CH ₂ CN	H	CH
21-12	Cl	H	CH ₂ CN	H	CH
21-13	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
21-14	F	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
21-15	Cl	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH
21-16	H	H	CF ₃	H	CH
21-17	F	H	CF ₃	H	CH
21-18	Cl	H	CF ₃	H	CH

[0874] 表 22

表 22

化合物号	物理和化学性质 (mp (°C), n _D ²⁰ , 或 ¹ H-NMR (300MHz, CDCl ₃) δ)
9-25	3.97(6H,s), 6.20(1H,s), 6.51(1H,t), 7.29-7.34(1H,m), 7.39-7.46(1H,m), 7.55-7.58(1H,m), 11.14(1H,br)
9-26	3.93(6H,s), 6.19(1H,s), 6.34(1H,t), 7.37-7.43(1H,m), 7.63-7.69(2H,m)
9-48	4.10(6H,s), 6.48(1H,t), 7.34(1H), 7.45(1H), 7.55(1H), 9.08(1H,s)
12-127	3.99(6H,s), 6.00(1H,s), 6.13(1H,s), 7.16-7.33(2H,m), 7.42-7.44(1H,m)
12-131	141-145
12-136	3.98(6H,s), 4.27(2H,s), 5.92(1H,s), 6.73(1H,d), 7.04-7.23(2H,m)
12-137	134-136
13-8	143-148
14-8	3.98(6H,s), 4.25(2H,s), 4.83(2H,s), 5.92(1H,s), 7.03-7.22(2H,m), 10.52(1H,br)
14-33	3.97(6H,s), 4.26(2H,s), 5.94(1H,s), 6.59(1H,t), 7.05-7.13(1H,m), 7.16-7.23(2H,m), 11.14(1H,br)
14-34	4.05(6H,s), 4.22(2H,s), 6.56(1H,t), 7.07-7.27(3H), 10.16(1H,s)
14-35	3.94(6H,s), 4.30(2H,s), 5.92(1H,s), 6.74(1H,t), 7.18-7.21(1H,m), 7.33-7.38(2H,m), 11.09(1H,br)
14-36	4.02(6H,s), 4.34(2H,s), 6.68(1H,t), 7.22(1H), 7.32(1H), 7.41(1H), 9.98(1H,br)
14-37	2.48(3H,s), 3.95(6H,s), 4.26(2H,s), 5.90(1H,s), 6.37(1H,t), 7.15-7.26(4H), 10.97(1H,s)
14-40	3.33(3H, s), 3.94(6H, s), 4.27(2H, s), 4.68(2H, s), 5.92(1H, s), 6.75(1H, t, J = 54 Hz), 7.02(1H, dd, J = 9.0, 9.0 Hz), 7.37(1H, dd, J = 9.0, 6.0 Hz).
18-20	4.00(6H,s), 5.97(1H,s), 6.00(1H,s), 7.28-7.35(2H,m), 7.57-7.60(1H,m), 7.71-7.74(1H,m), 11.28(1H,br)
18-26	3.99(6H, s), 4.99(1H, br), 5.99(1H, s), 6.24 (1H, s), 6.76(1H, t), 7.27-7.30(1H, m), 7.39-7.42(1H, m), 7.64-7.67(1H, m), 10.62(1H, br)
18-53	2.49(3H,s) 3.98(6H,s) 4.97(1H,d) 5.40(1H,s) 5.97(1H,s) 6.42(1H,t) 7.20-7.27(2H) 7.54(1H) 10.33(1H,s)

[0876] 试验实施例 1 : 叶片施用控制稻瘟病梨孢霉 (*Pyricularia oryzae*) 的效果试验。

[0877] 制备试验化合物

[0878] 活性化合物 :5 重量份

[0879] 有机溶剂 :142.5 重量份的丙酮

[0880] 乳化剂 :7.5 重量份的聚氧乙烯烷基苯基醚

[0881] 将上述活性化合物、丙酮和乳化剂相混合,用水稀释至指定浓度,并且用于试验。

[0882] 试验方法

[0883] 将水稻(品种:KOSHIHIKARI)种植于 4cm 直径的塑料盆中。在其 1.5 至 2 叶期,将预先制得的指定浓度的活性化合物稀释液以每 3 盆 6ml 的量喷雾。喷雾 1 天后,通过喷雾(1 次)接种人工培养的稻瘟病梨孢霉孢子悬浮液,并且保持在 25℃和 100%相对湿度下进行侵染。接种 7 天后,将收缩率(contraction rate)/盆进行分级,并进行评价以获得控制值(%)。同时还研究植物毒性。该试验是 1 组 3 盆结果的平均值。

[0884] 收缩率的评价和控制值的计算方法如下:

[0885] 收缩率 枯斑面积比率(%)

[0886] 0 0

[0887] 0.5 低于 2

[0888] 1 2- 低于 5

[0889] 2 5- 低于 10

[0890] 3 10- 低于 20

[0891] 4 20- 低于 40

[0892] 5 大于 40

[0893] 控制值(%) = (1 - { 处理组的收缩率 ÷ 未处理组的收缩率 }) × 100

[0894] 试验结果

[0895] 在活性组分浓度为 500ppm 下,作为具体实例的化合物号 2-31,2-32,2-61,2-62,2-125,2-190,2-191,2-193,3-22,4-130,4-184,5-2,12-127,12-131,12-137,14-37,18-2,18-6,18-10,18-21,18-24 和 18-53 的化合物显示超过 80%的控制值。未观察到植物毒性。

[0896] 生物试验实施例 2:叶片施用控制灰色葡萄孢(Botrytis cinerea)的效果试验。

[0897] 试验方法

[0898] 将黄瓜(品种:SAGAMI HANPAKU)种植于 4cm 直径的塑料盆中。以每 2 盆 6ml 的量,将以上述试验实施例 1 的类似方法制得的指定浓度的活性化合物稀释液喷雾至伸出子叶的秧苗。喷雾 1 天后,通过将人工培养的灰色葡萄孢的孢子悬浮液和琼脂凝胶(2×10⁴ 孢子/ml 凝胶)相混合制得的接种体置于子叶上以进行接种,并且在保持 20℃的湿度箱中进行侵染。接种 4 天后,将收缩率/子叶进行分级,并根据如下标准进行评价以获得控制值(%)。同时还研究植物毒性。该试验是 2 组 4 盆结果的平均值。

[0899] 收缩率的评价和控制值的计算方法如下:

[0900] 收缩率 枯斑面积比率(%)

[0901] 0 0

[0902] 0.5 低于 2

[0903] 1 2- 低于 5

[0904] 2 5- 低于 10

[0905] 3 10- 低于 20

[0906] 4 20- 低于 40

[0907] 5 大于 40

[0908] 控制值 (%) = (1 - { 处理组的收缩率 ÷ 未处理组的收缩率 }) × 100

[0909] 试验结果

[0910] 在活性组分浓度为 500ppm 下, 作为具体实例的化合物号 1-14, 2-1, 2-18, 2-31, 2-110, 2-138, 2-191, 2-192, 3-31, 4-107, 4-130, 4-186, 4-187, 9-25, 9-26, 9-48, 12-136, 13-8, 14-2, 14-8, 14-20, 14-22, 14-35, 14-37, 14-40, 18-6, 18-10, 18-20, 18-24, 18-25, 18-26 和 18-51 的化合物显示超过 80% 的控制值。未观察到植物毒性。

[0911] 制剂实施例 1 (颗粒剂)

[0912] 向本发明化合物 No. 14-33 (10 份)、膨润土 (蒙脱石) (30 份)、滑石 (58 份) 和木质素磺酸盐 (2 份) 的混合物中加入水 (25 份), 进行充分捏合, 通过挤出造粒机制成 10-40 目的颗粒, 并且在 40-50℃ 下进行干燥以获得颗粒剂。

[0913] 制剂实施例 2 (颗粒剂)

[0914] 将具有粒径分布范围为 0. 2-2mm 的粘土矿物颗粒 (95 份) 置于旋转混合器中。在旋转的同时, 将本发明化合物 No. 18-24 (5 份) 与液体稀释剂一起喷雾, 均匀湿润, 并且在 40-50℃ 下进行干燥以获得颗粒剂。

[0915] 制剂实施例 3 (乳油)

[0916] 将本发明化合物 No. 18-6 (30 份)、二甲苯 (55 份)、聚氧乙烯烷基苯基醚 (8 份) 和烷基苯磺酸钙 (7 份) 相混合, 并且进行搅拌以获得乳油。

[0917] 制剂实施例 4 (可湿性粉剂)

[0918] 将本发明化合物 No. 14-35 (15 份)、白炭 (含水无定形氧化硅细粉) 和粉末状粘土 (1 : 5) 的混合物 (80 份)、烷基苯磺酸钠 (2 份) 和烷基钠磺酸钠 - 甲醛水的缩合物 (3 份) 进行粉碎并相混合以制得可湿性粉剂。

[0919] 制剂实施例 5 (水分散粒剂)

[0920] 将本发明化合物 No. 18-51 (20 份)、木质素磺酸钠 (30 份)、膨润土 (15 份) 和煅烧的硅藻土粉末 (35 份) 充分混合, 加入水, 用 0. 3mm 的筛网进行挤出, 并进行干燥以获得水分散粒剂。