

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 03822965. X

[51] Int. Cl.

C07C 311/46 (2006.01)

C07C 311/48 (2006.01)

C07C 311/49 (2006.01)

C07C 311/50 (2006.01)

C07C 317/28 (2006.01)

C07C 323/49 (2006.01)

[45] 授权公告日 2007 年 4 月 18 日

[11] 授权公告号 CN 1310882C

[51] Int. Cl. (续)

C07D 213/75 (2006.01)

C07D 213/42 (2006.01)

C07D 279/12 (2006.01)

A01N 41/06 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

A01N 47/02 (2006.01)

[22] 申请日 2003.8.26 [21] 申请号 03822965. X

[30] 优先权

[32] 2002. 8. 26 [33] JP [31] 245264/2002

[86] 国际申请 PCT/JP2003/010774 2003. 8. 26

[87] 国际公布 WO2004/018415 日 2004. 3. 4

[85] 进入国家阶段日期 2005. 3. 25

[73] 专利权人 日本农药株式会社

地址 日本东京都

[72] 发明人 山口实 中尾勇美 后藤诚

森本雅之 藤冈伸祐 远西正范

[56] 参考文献

JP 2001 - 240580 A 2001. 9. 4

审查员 韩 平

[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

代理人 张 敏

权利要求书 2 页 说明书 49 页

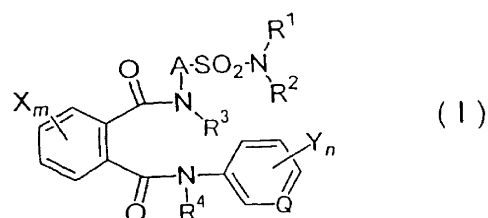
[54] 发明名称

磺酰胺衍生物、农业与园艺用杀虫剂及其施用方法

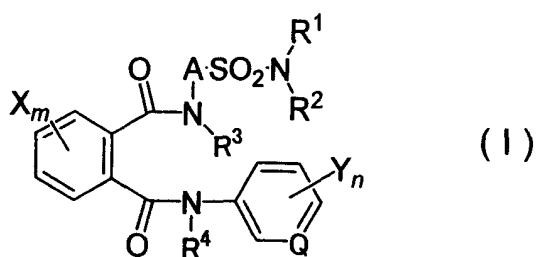
[57] 摘要

通式(I)表示的磺酰胺衍生物或其盐;含有它们作为活性成分的农业与园艺杀虫剂及其施用方法:

(1) [其中 A 为任选取代的 $C_1 - C_6$ 亚烷基, $C_3 - C_6$ 亚烯基等; R^1 为 H, 任选取代的 $C_1 - C_6$ 烷基, $C_3 - C_6$ 链烯基, $C_3 - C_6$ 环烷基等; R^2 、 R^3 和 R^4 各自为 H, $C_1 - C_6$ 烷基, $C_3 - C_6$ 链烯基等;或者 R^2 与 A 或 R^2 与 R^1 可形成三至八元环, 所述环可被 1 - 3 个选自 O、S 和 N 的原子间断; Q 为 C 或 N; X 和 Y 各自为卤素, CN, NO_2 , $C_1 - C_6$ 烷基, $C_2 - C_6$ 链烯基等; m 为 0 - 2; n 为 0 - 3; 并且芳环上两个相邻的 Xs 或 Ys 可结合在一起形成稠环]。这些化合物对现有杀虫剂具有抗药性的害虫显示出优越的杀虫活性, 甚至在低于类似杀虫剂的施用剂量下亦如此。



1. 通式 (I) 所示磺酰胺衍生物或其盐:



其中

A 为 (C₁-C₆) 亚烷基;

R¹ 为:

· 氢原子;

· (C₁-C₆) 烷基;

· 带有一个或多个取代基的取代 (C₁-C₆) 烷基, 所述取代基可以相同或者不同并且选自

· 卤原子,

· 羟基,

· (C₁-C₆) 烷氧基,

· (C₁-C₆) 烷硫基,

· (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基,

· (C₁-C₆) 烷基磺酰基,

· (C₁-C₆) 烷基氨基羰基,

· (C₁-C₆) 烷基羧基,

· 苯硫基,

· 苯基,

· 带有一个或多个取代基的取代苯基, 所述的取代基可以相同或者不同并且选自

· 卤原子,

- · 氰基,
- · 硝基,
- · (C₁-C₆) 烷基,
- · (C₁-C₆) 烷氧基,
- · 卤代 (C₁-C₆) 烷硫基, 和
- 吡啶基;
- (C₃-C₆) 链烯基;
- (C₃-C₆) 炔基;
- (C₃-C₆) 环烷基; 和
- (C₁-C₆) 烷氧基;

R² 为氢原子或 (C₁-C₆) 烷基, 和当 R² 为 (C₁-C₆) 烷基时, R² 能与 A 或 R¹ 键合形成三-至八元环, 所述环可以包含 1-3 个相同或者不同的选自氧原子、硫原子和氮原子的原子, 且该环可带有一个或多个选自卤原子、(C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的相同或者不同的取代基;

R³ 和 R⁴ 各自为氢原子;

Q 为碳原子或氮原子;

X 为卤原子; m 为 0-1 的整数;

每个 Y 可以相同或者不同, 为卤原子; (C₁-C₆) 烷基; 卤代 (C₁-C₆) 烷基; 或卤代 (C₁-C₆) 烷氧基; 并且 n 为 1-3 的整数。

2. 一种农业与园艺杀虫剂, 其特征在于含有权利要求 1 的通式(I) 磺酰胺衍生物或其盐作为活性成分。

3. 一种施用农业与园艺杀虫剂的方法, 其特征在于为了保护有用植物抵抗虫害, 使用有效量的权利要求 2 的农业与园艺杀虫剂处理要保护的作物、土壤或稻田。

磺酰胺衍生物、农业与园艺用杀虫剂及其施用方法

技术领域

本发明涉及磺酰胺衍生物或其盐,含有所述化合物作为活性成分的农业与园艺用杀虫剂及其用途。

背景技术

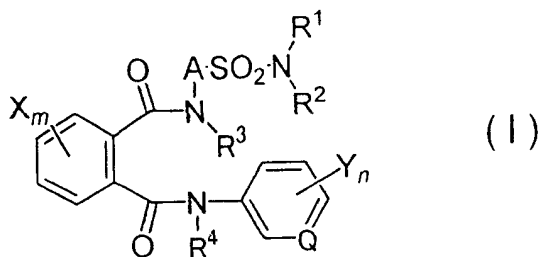
已知与本发明磺酰胺类似的化合物可用作农业与园艺杀虫剂(参见 JP-A-11-240857 或 JP-A-2001-131141)。但这些文献没有记载本发明通式 (I) 表示的化合物的实施例、物理性质等内容。

农业和园艺作物等的生产至今仍然受到有害昆虫等害虫的严重损害,而且由于例如有害昆虫对现有化学品产生耐药性,因而需要开发新的农业与园艺用杀虫剂。另外,由于老龄化农民人口增加等因素,也需要各种节省劳力的施药方法并且需要开发具有适合于这些施药方法之性质的农业与园艺杀虫剂。

发明内容

为了开发新的农业与园艺用杀虫剂,本发明人进行了认真研究,结果发现由本发明的通式 (I) 代表的磺酰胺衍生物或其盐是任何文献中都未知的新化合物,它们是优良的农业与园艺杀虫剂,而且与上述现有技术文献中公开的类似化合物相比,它们在低剂量下也是有效的,由此完成了本发明。

亦即,本发明涉及通式 (I) 代表的磺酰胺衍生物或其盐;含有所述化合物作为活性成分的农业与园艺杀虫剂,以及使用它的方法:



其中 A 为 (C₁-C₆) 亚烷基; 带有一个或多个取代基的取代 (C₁-C₆) 亚烷基, 所述取代基可以相同或者不同并且选自卤原子, 氰基, 硝基, (C₁-C₆) 烷氧基, 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基, (C₁-C₆) 烷硫基, 卤代 (C₁-C₆) 烷硫基, (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 单 (C₁-C₆) 烷基氨基和其中的 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (C₁-C₆) 烷基氨基; (C₃-C₆) 亚烯基; 带有一个或多个取代基的取代 (C₃-C₆) 亚烯基, 所述取代基可以相同或者不同并且选自卤原子, 氰基, 硝基, (C₁-C₆) 烷氧基, 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基, (C₁-C₆) 烷硫基, 卤代 (C₁-C₆) 烷硫基, (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 单 (C₁-C₆) 烷基氨基和其中的 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (C₁-C₆) 烷基氨基; (C₃-C₆) 亚炔基; 或带有一个或多个取代基的取代 (C₃-C₆) 亚炔基, 所述取代基可以相同或者不同并且选自卤原子, 氰基, 硝基, (C₁-C₆) 烷氧基, 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基, (C₁-C₆) 烷硫基, 卤代 (C₁-C₆) 烷硫基, (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 单 (C₁-C₆) 烷基氨基和其中的 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (C₁-C₆) 烷基氨基; 所述 (C₁-C₆) 亚烷基、取代的 (C₁-C₆) 亚烷基、(C₃-C₆) 亚烯基、取代的 (C₃-C₆) 亚烯基、(C₃-C₆) 亚炔基或取代的 (C₃-C₆) 亚炔基中的任何饱和碳原子可以被 (C₂-C₅) 亚烷基取代, 从而形成 (C₃-C₆) 环烷烃环, 并且所述 (C₂-C₆) 亚烷基、取代的 (C₂-C₆) 亚烷基、(C₃-C₆) 亚烯基或取代的 (C₃-C₆) 亚烯基中的任何两个碳原子可与亚烷基或亚烯基一起结合形成 (C₃-C₆) 环烷烃环或 (C₃-C₆) 环烯烃环;

R¹ 为氢原子; (C₁-C₆) 烷基; 带有一个或多个取代基的取代 (C₁-C₆) 烷基, 所述取代基可以相同或者不同并且选自卤原子, 氰基, 硝基, 羟基, (C₁-C₆) 烷氧基, 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基, (C₁-C₆) 烷硫基, 卤代 (C₁-C₆) 烷硫基, (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 单 (C₁-C₆) 烷基氨基, 单 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基, 其中的 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (C₁-C₆) 烷基氨基, 其中的卤代 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基, (C₁-C₆) 烷氧基羰基, (C₁-C₆) 烷基氨基羰基, (C₁-C₆) 烷基羧基, 苯氧基, 带有一个或多个取代基的取代苯氧基

基(其中的取代基可以相同或者不同,并且选自卤原子, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, (C_1-C_6) 烷基磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基和 (C_1-C_6) 烷氧基羰基), 苯硫基, 带有一个或多个取代基的取代苯硫基(其中的取代基可以相同或者不同,并且选自卤原子, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, (C_1-C_6) 烷基磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基和 (C_1-C_6) 烷氧基羰基), 苯基, 带有一个或多个取代基的取代苯基(其中的取代基可以相同或者不同,并且选自卤原子, 氰基, 硝基, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, 单 (C_1-C_6) 烷基氨基, 其中的 (C_1-C_6) 烷基可以相同或不同的二 (C_1-C_6) 烷基氨基, (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, (C_1-C_6) 烷基磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基和 (C_1-C_6) 烷氧基羰基), 吡啶基, 和带有一个或多个取代基的取代吡啶基(其中的取代基可以相同或者不同,并且选自卤原子, 氰基, 硝基, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, 单 (C_1-C_6) 烷基氨基, 其中的 (C_1-C_6) 烷基可以相同或不同的二 (C_1-C_6) 烷基氨基, (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, (C_1-C_6) 烷基磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基和 (C_1-C_6) 烷氧基羰基); (C_3-C_6) 链烯基; 卤代 (C_3-C_6) 链烯基; (C_3-C_6) 炔基; 卤代 (C_3-C_6) 炔基; (C_3-C_6) 环烷基; 羟基; (C_1-C_6) 烷氧基; 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基; 氨基; 单 (C_1-C_6) 烷基氨基; 单(卤代 (C_1-C_6) 烷基)氨基; 其中的 (C_1-C_6) 烷基可以相同或不同的二 (C_1-C_6) 烷基氨基; 其中的卤代 (C_1-C_6) 烷基可以相同或不同的二(卤代 (C_1-C_6) 烷基)氨基; (C_1-C_6) 烷基羰基氨基; 苯基氨基; 环上带有一个或多个取代基的取代苯氨基, 所述取代基可以相同或者不同,并且选自卤原子, 氰基, 硝基, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, (C_1-C_6) 烷基磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基, 单 (C_1-C_6) 烷基氨基, 单(卤代 (C_1-C_6) 烷基)

氨基, 其中的(C₁-C₆)烷基可以相同或不同的二(C₁-C₆)烷基氨基, 其中的卤代(C₁-C₆)烷基可以相同或不同的二(卤代(C₁-C₆)烷基)氨基, (C₁-C₆)烷氧基羰基和(C₁-C₆)烷基氨基羰基; 苯甲酰基氨基; 环上带有一个或多个取代基的取代苯甲酰基氨基, 所述取代基可以相同或者不同, 并且选自卤原子、氰基、硝基, (C₁-C₆)烷基, 卤代(C₁-C₆)烷基, (C₁-C₆)烷氧基, 卤代(C₁-C₆)烷氧基, (C₁-C₆)烷硫基, 卤代(C₁-C₆)烷硫基, (C₁-C₆)烷基亚磺酰基, 卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基, (C₁-C₆)烷基磺酰基, 卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基, 单(C₁-C₆)烷基氨基, 单(卤代(C₁-C₆)烷基)氨基, 其中的(C₁-C₆)烷基可以相同或不同的二(C₁-C₆)烷基氨基, 其中的卤代(C₁-C₆)烷基可以相同或不同的二(卤代(C₁-C₆)烷基)氨基, (C₁-C₆)烷氧基羰基和(C₁-C₆)烷基氨基羰基; -N=C(T¹)T² (其中T¹和T²可以相同或者不同, 各自为氢原子, (C₁-C₆)烷基, 卤代(C₁-C₆)烷基, 苯基或带有一个或多个取代基的取代苯基, 所述取代基可以相同或者不同, 并且选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、单(卤代(C₁-C₆)烷基)氨基、其中的(C₁-C₆)烷基可以相同或不同的二(C₁-C₆)烷基氨基、其中的卤代(C₁-C₆)烷基可以相同或不同的二(卤代(C₁-C₆)烷基)氨基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和(C₁-C₆)烷基氨基羰基); 苯基; 带有一个或多个取代基的取代苯基, 所述取代基可以相同或者不同, 并且选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、单(卤代(C₁-C₆)烷基)氨基、其中的(C₁-C₆)烷基可以相同或不同的二(C₁-C₆)烷基氨基、其中的卤代(C₁-C₆)烷基可以相同或不同的二(卤代(C₁-C₆)烷基)氨基、(C₁-C₆)烷氧基羰基和(C₁-C₆)烷基氨基羰基); 吡啶基; 或带有一个或多个取代基的取代吡啶基, 所述取代基可以相同或者不同, 并且选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代

(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基、单 (C₁-C₆) 烷基氨基、单 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基、其中的 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (C₁-C₆) 烷基氨基、其中的卤代 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基和 (C₁-C₆) 烷氧基羰基;

R²、R³和 R⁴可以相同或不同,各自为氢原子, (C₁-C₆) 烷基, (C₃-C₆) 链烯基, (C₃-C₆) 炔基, (C₁-C₄) 烷氧基 (C₁-C₄) 烷基或 (C₁-C₄) 烷硫基 (C₁-C₄) 烷基, R²能够与 A 或与 R¹键合形成三-至八元环,所述环可以包含 1-3 个相同或者不同的选自氧原子、硫原子和氮原子的原子,且该环可带有一个或多个选自卤原子、(C₁-C₆) 烷基和 (C₁-C₆) 烷氧基的相同或者不同取代基,并且 R²能够与 R¹一起表示=C(T³)T⁴ (其中 T³和 T⁴可以相同或者不同,各自为氢原子, (C₁-C₆) 烷基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基, (C₁-C₆) 烷氧基, 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基, 氨基, 单 (C₁-C₆) 烷基氨基, 其中的 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (C₁-C₆) 烷基氨基, 单 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基, 其中的卤代 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基, 苯基或带有一个或多个取代基的取代苯基, 所述取代基可以相同或者不同, 并且选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆) 烷基、卤代 (C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、卤代 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、卤代 (C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基、单 (C₁-C₆) 烷基氨基、单 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基、其中的 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (C₁-C₆) 烷基氨基、其中的卤代 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同的二 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基和 (C₁-C₆) 烷基氨基羰基);

Q 为碳原子或氮原子;

每个 Xs 可以相同或者不同, 为卤原子, 氰基, 硝基, 氨基, (C₁-C₆) 烷基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基, (C₂-C₆) 链烯基, 卤代 (C₂-C₆) 链烯基, (C₂-C₆) 炔基, 卤代 (C₃-C₆) 炔基, (C₁-C₆) 烷氧基, 卤代 (C₁-C₆) 烷氧基, (C₁-C₆) 烷基羰氧基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基羰氧基, (C₁-C₆) 烷硫基, 卤代 (C₁-C₆) 烷硫基, (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基亚磺酰基, (C₁-C₆) 烷基磺酰基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰基, (C₁-C₆) 烷基磺酰氧基, 卤代 (C₁-C₆) 烷基磺酰氧基, 单 (C₁-C₆) 烷基氨基, 单 (卤代 (C₁-C₆) 烷基) 氨基, 其中的 (C₁-C₆) 烷基可以相同或不同

的二(C_1-C_6)烷基氨基, 其中的卤代(C_1-C_6)烷基可以相同或不同的二(卤代(C_1-C_6)烷基)氨基, (C_1-C_6)烷基羰基氨基, 卤代(C_1-C_6)烷基羰基氨基, (C_1-C_6)烷基磺酰基氨基或卤代(C_1-C_6)烷基磺酰基氨基,

进一步地, 芳环上两个相邻的 X_s 可一起连接成稠合环, 该稠合环可带有一个或多个相同或者不同的取代基, 并且所述取代基选自卤原子, 硝基, 氰基, (C_1-C_6)烷基, 卤代(C_1-C_6)烷基, (C_1-C_6)烷氧基, 卤代(C_1-C_6)烷氧基, (C_1-C_6)烷基硫基, 卤代(C_1-C_6)烷基硫基, (C_1-C_6)烷基亚磺酰基, 卤代(C_1-C_6)烷基亚磺酰基, (C_1-C_6)烷基磺酰基, 卤代(C_1-C_6)烷基磺酰基, 单(C_1-C_6)烷基氨基, 单(卤代(C_1-C_6)烷基)氨基, 其中的(C_1-C_6)烷基可以相同或不同的二(C_1-C_6)烷基氨基, 以及其中的卤代(C_1-C_6)烷基可以相同或不同的二(卤代(C_1-C_6)烷基)氨基, m 为 0-2 的整数;

每个 Y_s 可以相同或者不同, 并且为卤原子; 氰基; 硝基; 羧基; 甲酰基; (C_1-C_6)烷基; 羧基(C_1-C_6)烷基; (C_1-C_6)烷氧基(C_1-C_6)烷基; 卤代(C_1-C_6)烷氧基(C_1-C_6)烷基; 卤代(C_1-C_6)烷基; 羧基卤代(C_1-C_6)烷基; (C_1-C_6)烷氧基卤代(C_1-C_6)烷基; 卤代(C_1-C_6)烷氧基卤代(C_1-C_6)烷基; (C_1-C_6)烷氧基; 卤代(C_1-C_6)烷氧基; 卤代(C_1-C_6)烷氧基卤代(C_1-C_6)烷氧基; (C_1-C_6)烷基硫基; 卤代(C_1-C_6)烷基硫基; (C_1-C_6)烷基亚磺酰基; 卤代(C_1-C_6)烷基亚磺酰基; (C_1-C_6)烷基磺酰基; 卤代(C_1-C_6)烷基磺酰基; 卤代(C_1-C_6)烷氧基卤代(C_1-C_6)烷基硫基; 卤代(C_1-C_6)烷氧基卤代(C_1-C_6)烷基亚磺酰基; 卤代(C_1-C_6)烷氧基卤代(C_1-C_6)烷基磺酰基; 苯氧基; 带有一个或多个取代基的取代苯氧基, 所述取代基可以相同或者不同, 并且选自卤原子, 氰基, 硝基, (C_1-C_6)烷基, 卤代(C_1-C_6)烷基, (C_1-C_6)烷氧基, 卤代(C_1-C_6)烷氧基, (C_1-C_6)烷基硫基, 卤代(C_1-C_6)烷基硫基, (C_1-C_6)烷基亚磺酰基, 卤代(C_1-C_6)烷基亚磺酰基, (C_1-C_6)烷基磺酰基和卤代(C_1-C_6)烷基磺酰基; 苯硫基; 带有一个或多个取代基的取代苯硫基, 所述取代基可以相同或者不同, 并且选自卤原子, 氰基, 硝基, (C_1-C_6)烷基, 卤代(C_1-C_6)烷基, (C_1-C_6)烷氧基, 卤代(C_1-C_6)烷氧基, (C_1-C_6)烷基硫基, 卤代(C_1-C_6)烷基硫基, (C_1-C_6)烷基亚磺酰基, 卤代(C_1-C_6)烷基亚磺酰基, (C_1-C_6)烷基磺酰基和卤代(C_1-C_6)烷基磺酰基; 吡啶氧基; 或带有一个或多个取代基的取代吡啶氧基, 所述取代基可以相同或

者不同,并且选自卤原子,氰基,硝基, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, (C_1-C_6) 烷基硫基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基硫基, (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, (C_1-C_6) 烷基磺酰基和卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基,

进一步地,芳环上两个相邻的 Y_s 可一起连接成稠合环,该稠合环可带有一个或多个相同或者不同的取代基,并且所述取代基选自卤原子,硝基,氰基, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, (C_1-C_6) 烷基硫基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基硫基, (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基, (C_1-C_6) 烷基磺酰基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基, 单 (C_1-C_6) 烷基氨基, 单(卤代 (C_1-C_6) 烷基)氨基, 其中的 (C_1-C_6) 烷基可以相同或不同的二 (C_1-C_6) 烷基氨基, 以及其中的卤代 (C_1-C_6) 烷基可以相同或不同的二(卤代 (C_1-C_6) 烷基)氨基, 并且 n 为 0-3 的整数。

实施发明的方式

在表示本发明磺酰胺衍生物的通式(I)的定义中,术语“卤原子”表示氟原子,溴原子,碘原子或氯原子。术语“ (C_1-C_6) 烷基”表示具有 1-6 个碳原子的直链或支链烷基,例如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、正戊基、正己基等。术语“卤代 (C_1-C_6) 烷基烷基”表示取代的 1 至 6 个碳原子的直链或支链烷基,它具有一个或多个相同或者不同的卤原子作为取代基。术语“ (C_3-C_6) 环烷基”表示具有 3-6 个碳原子的环状烷基,例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基等。术语“ (C_1-C_6) 亚烷基”表示具有 1-6 个碳原子的直链或支链亚烷基,例如亚甲基,亚乙基,1,2-亚丙基,三亚甲基,二甲基亚甲基,四亚甲基,异亚丁基,二甲基亚乙基等。术语“ (C_2-C_6) 亚烯基”表示具有 2-6 个碳原子的直链或支链亚烯基。术语“ (C_2-C_6) 亚炔基”表示具有 2-6 个碳原子的直链或支链亚炔基。

“稠合环”包括,例如,萘环,四氢化萘环,茚环,2,3-二氢化茚环,喹啉环,喹啉环,苯并二氢吡喃环,异苯并二氢吡喃环,吲哚环,二氢吲哚环,苯并二噁烷环,苯并间二氧杂环戊烯环,苯并呋喃环,二氢苯并呋喃环,苯并噻吩环,二氢苯并噻吩环,苯并噻唑环,苯并噻唑环,苯并

咪唑环和吡唑环。

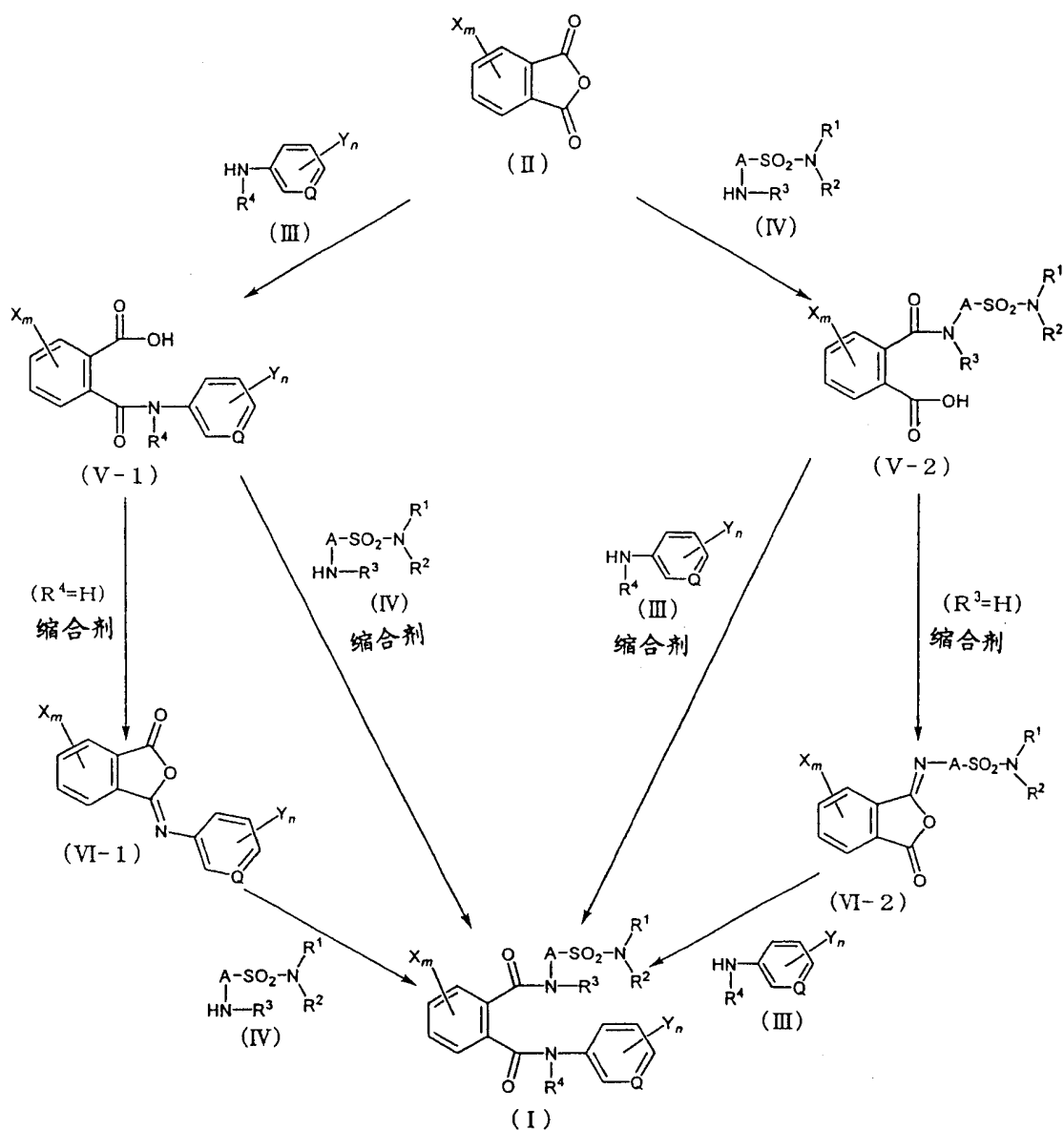
本发明通式(I)所示磺酰胺衍生物的盐例如包括无机酸盐, 譬如盐酸盐、硫酸盐、硝酸盐、磷酸盐等; 有机酸盐, 譬如乙酸盐、富马酸盐、马来酸盐、草酸盐、甲磺酸盐、苯磺酸盐、对甲苯磺酸盐等; 以及带有钠离子、钾离子、钙离子等的盐。

本发明通式(I)的磺酰胺衍生物在一些情形下在其结构式中含有一个或多个不对称碳原子或不对称中心, 并且在某些情形下具有两种或更多种旋光异构体和非对映体。本发明也包括所有单一的旋光异构体以及这些异构体按任何比例组成的混合物。在有些情况下, 本发明通式(I)的磺酰胺衍生物由于其结构式中的一个或多个碳-碳双键或碳-氮双键而具有两种或者更多种几何异构体。本发明也包括所有单一的几何异构体以及这些异构体按任何比例组成的混合物。

在本发明的通式(I)磺酰胺衍生物中, A 特别优选为 (C_1-C_6) 亚烷基; R^1 优选为氢原子, (C_1-C_6) 烷基, 取代的 (C_1-C_6) 烷基, (C_3-C_6) 链烯基, (C_3-C_6) 炔基, 苯基或取代苯基, 并且特别优选为 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷硫基 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 烷基磺酰基 (C_1-C_6) 烷基; R^2 、 R^3 和 R^4 各自优选为氢原子或 (C_1-C_6) 烷基; Q 优选为碳原子或氮原子, 特别优选为碳原子; X 优选为卤原子, 硝基, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, (C_1-C_6) 烷基羰氧基, (C_1-C_6) 烷基磺酰氧基或卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰氧基, 并且特别优选为卤原子; m 优选为 1 或 2, 特别优选为 1; Y 优选为卤原子, (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷基, 羟基卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基卤代 (C_1-C_6) 烷基, 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基卤代 (C_1-C_6) 烷基, (C_1-C_6) 烷氧基或卤代 (C_1-C_6) 烷氧基, 并且特别优选为 (C_1-C_6) 烷基或卤代 (C_1-C_6) 烷基; 且 n 优选为 1-3 的整数, 特别优选为 2。

本发明的通式(I)磺酰胺衍生物例如可以用任一种下文图示的制备方法制备, 但这些方法无论任何不得认为是对本发明范围的限制。

制备方法



其中 A, R^1 - R^4 , X, Y, n, m 和 Q 如上定义。

所述制备可以按照 J. Med. Chem., 10, 982 (1967), JP-A-11-240857, JP-A-2001-131141 等文献中公开的方法通过上述反应进行。也就是说, 在惰性溶剂的存在下, 在有或没有碱或酸催化剂的存在下, 使通式 (II) 的邻苯二甲酸酐与通式 (III) 的胺反应, 得到通式 (V-1) 的邻苯二甲酰胺。当

邻苯二酰胺(V-1)中的 R^4 为氢原子时, 在分离出邻苯二酰胺(V-1)之后或者在不分离的情形下, 通过在缩合剂和惰性溶剂的存在下并在有或没有碱存在的情形下进行缩合, 使邻苯二酰胺(V-1)转化为通式(VI-1)的异酰亚胺(isoimide)衍生物, 在分离出异酰亚胺(VI-1)之后或者在不进行分离的情形下, 使异酰亚胺衍生物(VI-1)与通式(IV)的氨基磺酰胺在惰性溶剂中有或无碱或酸催化剂的存在下进行反应, 从而可以得到通式(I)的磺酰胺衍生物。当邻苯二酰胺(V-1)中的 R^4 为除氢原子之外的取代基时, 可以在分离邻苯二酰胺(V-1)之后或者在不进行分离的情形下, 通过在缩合剂和惰性溶剂存在下, 并且在有或无碱存在下缩合邻苯二酰胺(V-1)与通式(IV)的氨基磺酰胺, 可以制得通式(I)的磺酰胺衍生物。

另外, 在惰性溶剂中, 在有或没有碱或酸催化剂的存在下, 使通式(II)的邻苯二甲酸酐与通式(IV)的氨基磺酰胺反应, 得到通式(V-2)的邻苯二酰胺。当邻苯二酰胺(V-2)中的 R^3 为氢原子时, 在分离出邻苯二酰胺(V-2)之后或者在不进行分离的情形下, 通过在缩合剂和惰性溶剂的存在下并在有或没有碱存在的情形下进行缩合, 使邻苯二酰胺(V-2)转化为通式(VI-2)的异酰亚胺(isoimide)衍生物, 在分离出异酰亚胺(VI-2)之后或者在不进行分离的情形下, 使异酰亚胺衍生物(VI-2)与通式(III)的胺在惰性溶剂中有或无碱或酸催化剂的存在下进行反应, 从而可以得到通式(I)的磺酰胺衍生物。当邻苯二酰胺(V-2)中的 R^3 为除氢原子之外的取代基时, 可以在分离邻苯二酰胺(V-2)之后或者在不进行分离的情形下, 通过在缩合剂和惰性溶剂存在下, 并且在有或无碱存在下缩合邻苯二酰胺(V-2)与通式(III)胺, 可以制得通式(I)的磺酰胺衍生物。

1. 通式(II) $\rightarrow$ 通式(V-1)或通式(V-2)

可用于该反应中的酸例如包括有机酸, 譬如乙酸、三氟乙酸等; 以及无机酸, 譬如盐酸、硫酸等。至于所用酸的量, 酸的用量可以在催化量至过量摩尔量(相对于每摩尔通式(II)邻苯二甲酸酐)的范围内适当选择。所述碱包括例如有机碱, 譬如三乙胺、吡啶等; 以及无机碱, 譬如碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸钠、氢氧化钠等。至于所用碱的量, 碱的用量可以在催化量至过量摩尔量(相对于每摩尔通式(II)邻苯二甲酸酐)的范围内适当选

择。

作为该反应使用的惰性溶剂，可以使用任何惰性溶剂，只要它不明显抑制反应的进程即可。可以列举的惰性溶剂例如包括芳烃，譬如苯、甲苯、二甲苯等；卤代烃，譬如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等；卤代芳烃，譬如氯苯、二氯苯等；无环或环状醚，譬如乙醚、二噁烷、四氢呋喃等；酯，譬如乙酸乙酯等；酰胺，譬如二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺等；酸，譬如乙酸等；二甲亚砜；和 1,3-二甲基-2-咪唑烷酮。这些惰性溶剂可以单独使用或者两种或两种以上混合使用。

由于该反应是等摩尔反应，使用等摩尔量的反应物就足以，但也可以使用过量的任一种反应物。

至于反应温度，反应可以在室温至所用惰性溶剂的沸点下进行。尽管反应时间随反应规模和反应温度而异，不过可以将反应进行若干分钟至 48 小时。

反应完成后，所需化合物可以在借助常规方法从含有所需化合物的反应体系中分离出之后或者在不进行分离的情形下用于后续的反应。

通式 (II) 的邻苯二甲酸酐可以用下述文献中记载的方法制备：J. Org. Chem., 52, 129 (1987), J. Am. Chem. Soc., 51, 1865 (1929), J. Am. Chem. Soc., 63, 1542 (1941) 等。

2. 通式 (V-1) 或通式 (V-2) → 通式 (I)

作为该反应使用的惰性溶剂，可以使用任何惰性溶剂，只要它不明显抑制反应的进程即可。可以列举的惰性溶剂例如包括卤代烃，譬如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等；无环或环状醚，譬如乙醚、二噁烷、四氢呋喃等；以及腈类如乙腈等。这些惰性溶剂可以单独使用或者两种或两种以上混合使用。

作为该反应使用的缩合剂，可以使用常规酰胺制备中使用的任何缩合剂。例如，所述缩合剂包括三氟乙酸酐，氯碳酸酯，Mukaiyama 试剂(碘化 2-氯-N-甲基吡啶鎓)，DCC (1,3-二环己基碳二亚胺)，CDI (羰基二咪唑) 和 DEPC (氰基膦酸二乙酯)。至于所用缩合剂的量，其用量可以在 1 摩尔量至过量摩尔量(相对于每摩尔通式 (V-1) 或 (V-2) 的邻苯二甲酰胺而言)

的范围内适当选择。

可用于该反应中的碱例如包括有机碱，譬如三乙胺、吡啶等；以及无机碱如碳酸钾等。至于所用碱的量，其用量可以在 1 摩尔量至过量摩尔量（相对于每摩尔通式 (V-1) 或 (V-2) 的邻苯二酰胺而言）的范围内适当选择。

至于反应温度，反应可以在 0℃ 至所用惰性溶剂的沸点下进行。尽管反应时间随反应规模和反应温度而异，但可以将反应进行若干分钟至 48 小时。

反应完成后，按照常规方法从含有所需化合物的反应体系中分离所需化合物，视需要通过重结晶、柱色谱等方式纯化，由此可以制备所需化合物。

3. 通式 (V-1) → 通式 (VI-1)，或通式 (V-2) → 通式 (VI-2)

在该反应情况下，所需化合物可以按照例如 J. Med. Chem., 10, 982 (1967) 中描述的方法制备。

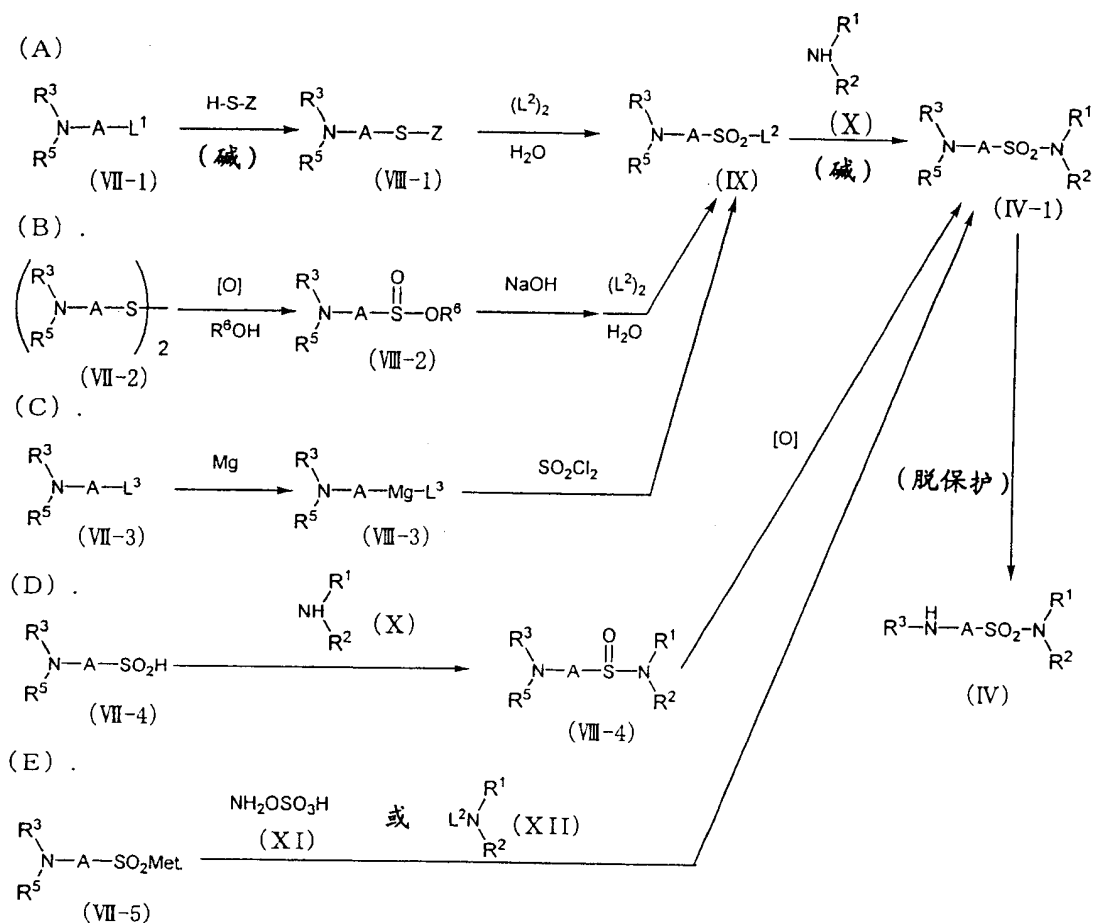
反应完成后，所需化合物可以在借助常规方法从含有所需化合物的反应体系中分离出之后或者在不进行分离的情形下用于后续的反应。

4. 通式 (VI-1) 或通式 (VI-2) → 通式 (I)

在该反应情况下，所需化合物可以按照第 1 项所述的相同方法制备。

反应完成后，按照常规方法从含有所需化合物的反应体系中分离所需化合物，视需要通过重结晶、柱色谱等方式纯化，由此可以制备所需化合物。

起始原料氨基磺酰胺 (IV) 例如可以按照文献中已知的以及下图所示的任一种方法制备。



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 和 A 如上定义， R^5 为保护基，譬如苄氧基羰基、叔丁氧羰基或烷基甲硅烷基等， R^6 为 (C_1-C_6) 烷基， L^1 、 L^2 和 L^3 各自为离去基团如卤原子， Met 为金属原子，譬如钠或钾，且 Z 为氢原子， (C_1-C_6) 烷基或苄基。

(A) 通式(VII-1) → 通式(IV)

按照 J. Am. Chem. Soc., 58, 1348 (1936), J. Am. Chem. Soc., 60, 1486 (1938) 等文献中记载的方法，使通式(VII-1)的胺衍生物与硫醇反应得到烷硫基胺衍生物(VIII-1)。在分离之后或不进行分离的情形下使烷硫基胺衍生物与卤素反应，得到通式(IX)的磺酰卤衍生物。按照 Synthesis, 1970, 545, J. Organic Chem., 21, 667 (1956) 等文献所述方法，使上述磺酰卤衍生物与通式(X)的胺反应，得到通式(IV-1)的磺酰胺衍生物。按照常规方法将磺酰胺衍生物进行脱保护反应，由此可制备通式(IV)的氨基磺酰

胺。

(B) 通式(VII-2) → 通式(IV)

按照 Synth. Commun., 27, 1321 (1997), Synthesis, 1988, 252 等文献中描述的方法, 将通式(VII-2)的二硫化物衍生物转化为次磺酸酯衍生物(VIII-2)。在分离之后或者不进行分离的情形下水解这种次磺酸衍生物, 然后按照 J. Am. Chem. Soc., 45, 1068 (1923)等文献中描述的方法使水解物与卤素反应, 得到通式(IX)的磺酰卤衍生物。随后, 可以按照(A)中所述的相同方法制备通式(IV)的氨基磺酰胺。

(C) 通式(VII-3) → 通式(IV)

按照 J. Org. Chem., 20, 1159 (1955)等文献中记载的方法, 将通式(VII-3)的胺衍生物转化为格利雅试剂(VIII-3), 再将格利雅试剂(VIII-3)与磺酰氯反应, 得到通式(IX)的磺酰卤衍生物。然后可以按照(A)中所述的相同方法制得通式(IV)的氨基磺酰胺。

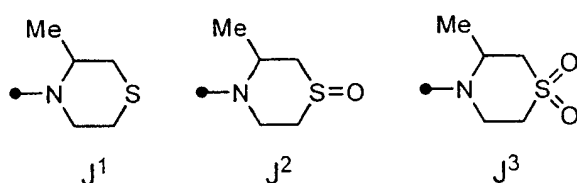
(D) 通式(VII-4) → 通式(IV)

通式(VIII-4)的亚磺酰胺衍生物是按照 J. Am. Chem. Soc., 57, 2172 (1935), Chem. Lett., 1976, 149 等文献中记载的方法由通式(VII-4)的次磺酸衍生物和通式(X)的胺衍生物制得。按照 J. Org. Chem., 31, 2357 (1966)等文献中记载的方法将亚磺酰胺衍生物转化为通式(IV-1)的磺酰胺衍生物。然后按照与(A)相同的方法将磺酰胺衍生物进行脱保护, 从而可以制得通式(IV)的氨基磺酰胺。

(E) 通式(VII-5) → 通式(IV)

作为通式(IV)的氨基磺酰胺, 其中 R^1 和 R^2 各自为氢原子的氨基磺酰胺可以制备如下: 先按照 Synthesis, 1985, 1032 中描述的方法, 由通式(VII-5)的次磺酸酯衍生物和羟胺-O-磺酸(XI)制备通式(IV-1)的磺酰胺衍生物, 然后按照与(A)相同的方式将磺酰胺衍生物进行脱保护。这种通式(IV)的氨基磺酰胺也可以如下制备, 即先按照 J. Org. Chem., 46, 5077 (1981)中描述的方法由通式(VII-5)的次磺酸酯衍生物和通式(XII)的 N-卤代胺制备通式(IV-1)的亚磺酰胺衍生物, 然后再按照和(A)相同的方法将磺酰胺衍生物进行脱保护。

作为通式(I)磺酰胺衍生物的典型化合物列于下表1和表2中,但它们并不以任何方式构成对本发明范围的限制。在下列各表中,“n”是表示“正”的前缀,“s”是表示“仲”的前缀,“t”是表示“叔”的前缀,“i”是标准“异”的前缀,“c”是表示“环状”的前缀,且“Me”表示甲基,“Et”表示乙基,“Pr”表示丙基,“Bu”表示丁基,“Pen”表示戊基,“Hex”表示己基,“Ph”表示苯基,“Py”表示吡啶基,以及“C*”表示不对称碳原子。另外,“J¹”、“J²”和“J³”表示以下取代基:



通式(I-1)

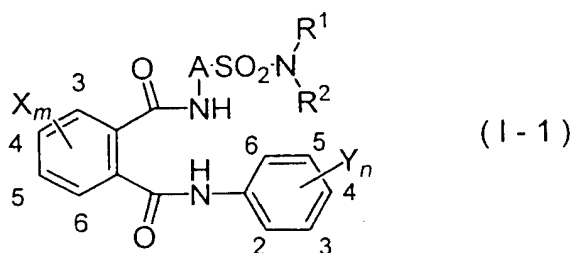


表 1

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-1	CHMeCH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	217-219
1-2	CHMeCH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	186-188
1-3	CHMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	122-125
1-4	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	170-172
1-5	CHMeCH ₂ SO ₂ N(Me)Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-6	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	116
1-7	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	147-150
1-8	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	204-206
1-9	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-10	CHMeCH ₂ SO ₂ N(n-Pr) ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-11	CHMeCH ₂ SO ₂ N(i-Pr) ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-12	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	178-181
1-13	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-s-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-14	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-t-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	195-197
1-15	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-16	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-17	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Pen	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-18	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Hex	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-19	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -c-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-20	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	109-113
1-21	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C≡CH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	111-113
1-22	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	200-202
1-23	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	195-198
1-24	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-Cl-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	193-196
1-25	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-Br-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	189-192
1-26	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-Me-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-27	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-OMe-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	180-183

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-28	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-NO ₂ -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	173-177
1-29	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(3-OMe-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	196-198
1-30	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(3-NO ₂ -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	155-160
1-31	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(3-CN-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	147-150
1-32	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2, 6-(OMe) ₂ -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	210-213
1-33	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-Cl-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-34	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-Me-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-35	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	176-179
1-36	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-NO ₂ -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-187
1-37	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-CN-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	169-171
1-38	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-SCF ₃ -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	201-204
1-39	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	228-231
1-40	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	144-147
1-41	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -4-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	166-168
1-42	CHMeCH ₂ SO ₂ N(Me)CH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	186-189
1-43	CHMeCH ₂ SO ₂ N(Et)CH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	184-186
1-44	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH(Me)Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	173-175
1-45	CHMeCH ₂ SO ₂ NHC [*] H(Me)Ph R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	168-170
1-46	CHMeCH ₂ SO ₂ NHC [*] H(Me)Ph S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	159-161
1-47	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	203-206
1-48	CHMeCH ₂ SO ₂ NHC(Me) ₂ CH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	197-198
1-49	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-50	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₃	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-51	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₄	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-52	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₅	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-53	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₆	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-54	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	204-207
1-55	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ S	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	191-194
1-56	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	195-198
1-57	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	237-240
1-58	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ S	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	164-165
1-59	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	167-168
1-60	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	166-167
1-61	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ J ¹	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	207-208
1-62	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ J ²	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
1-63	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ J ³	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	157-159
1-64	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ NH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-65	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ NMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-66	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ NOOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	196-198
1-67	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ C=O	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	209-211
1-68	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CF ₃	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-69	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH(Me)CF ₃	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-70	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CCl ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-71	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ Cl	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	90-95
1-72	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	171-174
1-73	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	142-144
1-74	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-75	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	156-158
1-76	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	132-134
1-77	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	186-189
1-78	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	150-151
1-79	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	167-168
1-80	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	181-182

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-81	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	161-162
1-82	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	154-155
1-83	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	151-152
1-84	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	166-167
1-85	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SOEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	144-145
1-86	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	168-169
1-87	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	155-156
1-88	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SOPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	151-153
1-89	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	170-172
1-90	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-91	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	190-193
1-92	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	130-133
1-93	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	150-154
1-94	CHMeCH ₂ SO ₂ NCMe ₂ CH ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	157-160
1-95	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₃ OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-96	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₃ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-97	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₃ SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-98	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₃ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-99	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CN	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-100	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-101	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CO ₂ Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-102	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-103	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCONH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	228-230
1-104	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCONHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	176-177
1-105	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CCNEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	172-174
1-106	CHMeCH ₂ SO ₂ NHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	232-234
1-107	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(2-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	211-212

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-108	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(2-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	101-106
1-109	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(3-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	235-236
1-110	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	228-233
1-111	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	143-147
1-112	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-MeS-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	165-170
1-113	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-114	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-115	CHMeCH ₂ SO ₂ NHOH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-116	CHMeCH ₂ SO ₂ NHOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	200-205
1-117	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-118	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-119	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeNH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-120	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeNHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-121	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	161-166
1-122	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-123	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-124	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHCOPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-125	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=CMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-126	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=CHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-127	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=C(Me)Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-128	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-129	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-130	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CH-i-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-131	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-132	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-133	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-134	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物理性质 熔点℃
1-135	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NH ₂ R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-136	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NH ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-137	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHMe R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-138	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-139	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂ R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-140	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-141	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHEt R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-142	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHEt S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	105-107
1-143	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂ R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-144	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	159-163
1-145	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-146	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	158-159
1-147	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHC [*] HMeCH ₂ SMe S, S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
1-148	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHC [*] HMeCH ₂ SOMe S, S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	115-120
1-149	C [*] HMeCH ₂ SO ₂ NHC [*] HMeCH ₂ SO ₂ Me S, S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
1-150	CHMeSO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-151	CHMeSO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-152	CHMeSO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-153	CHMeSO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-154	CHMeSO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-155	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-156	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-157	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-158	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点 °C
1-159	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-160	C [*] HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NH ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-161	C [*] HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-162	C [*] HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NMe ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-163	C [*] HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-164	C [*] HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NEt ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-165	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-166	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-167	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-168	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-169	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-170	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-171	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-172	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-173	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-174	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-175	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
1-176	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
1-177	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	151-152
1-178	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
1-179	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
1-180	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-186
1-181	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₄	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	129-130
1-182	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-183	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C≡CH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-184	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	152-153

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-185	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-186	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH-2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-187	CMe ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-188	CMe ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-189	CMe ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-190	CMe ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-191	CMe ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-192	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-193	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-194	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-195	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-196	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-197	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-198	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-199	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-200	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-186
1-201	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	142-145
1-202	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-203	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-204	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-205	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-206	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-207	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	120-121
1-208	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	93-94
1-209	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-F	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-210	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-211	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	103-108

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-212	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	136-138
1-213	CHMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	107-110
1-214	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	112-115
1-215	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	159-161
1-216	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-187
1-217	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	179-181
1-218	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	139-141
1-219	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	169-170
1-220	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3,4-Cl ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-221	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3,4-Br ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-222	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-223	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-224	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-225	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NO ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-226	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NH ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-227	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-N(CH ₃) ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-228	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NHCOOCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-229	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NHCOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-230	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NHSO ₂ CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-231	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NHSO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-232	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-233	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-234	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-235	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-236	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCOCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-237	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-238	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-SCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-239	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-SOCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-240	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-SO ₂ CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-241	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-SCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-242	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-SOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-243	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-SO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-244	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-OSO ₂ CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-245	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-OSO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-246	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-C≡CH	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-247	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-C≡CCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-248	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-CN	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-249	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-CHCHCHCH-4	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-250	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-OCF ₂ O-4	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-251	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-252	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-F	
1-253	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-Cl	
1-254	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-Br	
1-255	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-I	
1-256	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-3-F-4-Cl	
1-257	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-3-Cl-4-F	
1-258	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-3,4-Cl ₂	
1-259	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-3-Cl-4-Br	
1-260	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-3-Cl-4-I	
1-261	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2,4-Cl ₂	
1-262	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Cl-4-Br	
1-263	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Cl-4-I	
1-264	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2,4-Br ₂	
1-265	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Br-4-I	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物理性质 熔点℃
1-266	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2,3,4-Cl ₃	无定形
1-267	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2,3,4-Cl ₃	114-118
1-268	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2,3,4-Cl ₃	164-166
1-269	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-F	
1-270	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-Br	
1-271	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-I	
1-272	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2,4-Cl ₂ -3-Br	
1-273	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2,4-Cl ₂ -3-F	
1-274	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-OCHF ₂	
1-275	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-OCF ₃	181-182
1-276	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-OCF ₃	无定形
1-277	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-OCF ₃	无定形
1-278	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	
1-279	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	
1-280	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	
1-281	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
1-282	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOC ₃ F ₇ -n	
1-283	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Cl-4-OCHF ₂	
1-284	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Cl-4-OCF ₃	
1-285	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Cl-4-OCF ₃	100-103
1-286	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Cl-4-OCF ₃	141-142
1-287	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CF ₃	
1-288	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CHF ₂	
1-289	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	
1-290	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
1-291	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CHFOC ₃ F ₇ -n	
1-292	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₃	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-293	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	
1-294	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHFCE ₃	
1-295	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
1-296	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHFOC ₃ F ₇ -n	
1-297	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	4-CF ₂ CF ₂ CF ₃	
1-298	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	4-CF(CF ₃) ₂	
1-299	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-CF ₃	
1-300	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-301	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	118-120
1-302	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	无定形
1-303	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	153-154
1-304	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	164-166
1-305	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SOMe	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	150-152
1-306	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	139-142
1-307	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SEt	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	159-160
1-308	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SOEt	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	198-199
1-309	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	133-134
1-310	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SPh	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	144-145
1-311	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃	
1-312	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Cl-4-CF ₃	
1-313	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-F-4-CF ₂ CF ₃	
1-314	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
1-315	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Cl-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃	
1-316	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-317	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
1-318	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂	
1-319	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-I-4-CF(CF ₃) ₂	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	Xm	Yn	物理性质 熔点℃
1-320	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-321	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF ₃) ₂	
1-322	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-i-Pr-4-CF(CF ₃) ₂	
1-323	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-t-Bu-4-CF(CF ₃) ₂	
1-324	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Ph-4-CF(CF ₃) ₂	
1-325	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-CH ₂ OH-4-CF(CF ₃) ₂	
1-326	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-CH ₂ OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-327	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-328	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-SMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-329	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-N(Me) ₂ -4-CF(CF ₃) ₂	
1-330	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-NO ₂ -4-CF(CF ₃) ₂	
1-331	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-CF ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	
1-332	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-CHO-4-CF(CF ₃) ₂	
1-333	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-CN-4-CF(CF ₃) ₂	
1-334	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-COMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-335	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2,3-(Me) ₂ -4-CF(CF ₃) ₂	
1-336	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-337	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-3-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
1-338	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-3-OH-4-CF(CF ₃) ₂	
1-339	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-3-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-340	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-341	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-5-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
1-342	CHMeCH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	214-216
1-343	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	232-234
1-344	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	无定形
1-345	OMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₄	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	无定形
1-346	CHMeCH ₂ SO ₂ NHt	3-I	2-Me-4-C(OH)(CF ₃) ₂	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物理性质 熔点℃
1-347	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-C(OMe)(CF ₃) ₂	
1-348	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-C(OEt)(CF ₃) ₂	
1-349	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-OCF ₂ O-3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-350	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-OCH ₂ O-3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-351	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-(CH ₂) ₃ -3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-352	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-(CH ₂) ₄ -3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-353	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	

通式 (I-2):

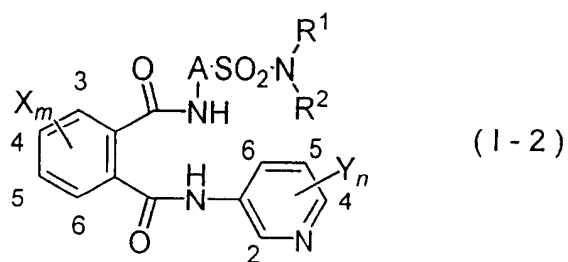


表 2

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物理性质 熔点℃
2-1	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	4-CF(CF ₃) ₂	无定形
2-2	CHMeCH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-3	CHMeCH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-4	CHMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-5	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-6	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-7	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
2-8	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
2-9	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
2-10	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SMe-4-CF(CF ₃) ₂	
2-11	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SOMe-4-CF(CF ₃) ₂	
2-12	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SO ₂ Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-13	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	无定形
2-14	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF ₃) ₂	
2-15	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	4-CH(CF ₃) ₂	
2-16	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
2-17	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-CH(CF ₃) ₂	
2-18	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-OMe-4-CH(CF ₃) ₂	
2-19	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SMe-4-CH(CF ₃) ₂	
2-20	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SOMe-4-CH(CF ₃) ₂	

No.	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物理性质 熔点℃
2-21	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-SO ₂ Me-4-CH(CF ₃) ₂	
2-22	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	
2-23	CHMeCH ₂ SO ₂ NHET	3-I	2-n-Pr-4-CH(CF ₃) ₂	

表 3 示出具有表 1 和表 2 中以词语“无定形”表示的物理性质之化合物的 ¹H-NMR 数据。

表 3

No.	NMR 数据 ¹ H-NMR[CDCl ₃ (或 DMSO-d ₆)/TMS, δ 值 (ppm)]
1-62 (CDCl ₃)	1.30(d, 3H), 1.60(s, 6H), 2.38(s, 3H), 2.80(m, 2H), 3.30(m, 3H), 3.43(s, 2H), 4.00(m, 1H), 4.50(m, 1H), 6.45(br, 1H), 7.25(m, 1H), 7.48(m, 2H), 7.76(d, 1H), 7.98(d, 1H), 8.29(d, 1H), 8.40(br, 1H)
1-147 (CDCl ₃)	1.09(d, 3H), 1.44(d, 3H), 2.05(s, 3H), 2.37(s, 3H), 2.43(m, 2H), 3.32(m, 2H), 3.63(m, 1H), 4.63(m, 1H), 5.46(br, 1H), 6.70(br, 1H), 7.21(t, 1H), 7.36(d, 1H), 7.44(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.90(m, 2H), 8.64(br, 1H)
1-149 (CDCl ₃)	1.19(d, 3H), 1.37(d, 3H), 2.33(s, 3H), 2.83(s, 3H), 3.52(m, 2H), 3.27(d, 2H), 3.98(m, 1H), 4.55(m, 1H), 5.98(br, 1H), 6.88(br, 1H), 7.11(t, 1H), 7.33(d, 1H), 7.42(s, 1H), 7.60(m, 1H), 7.83(m, 2H), 8.89(br, 1H)
1-175 (DMSO-d ₆)	1.49(s, 6H), 2.35(s, 3H), 3.65(s, 2H), 6.91(br, 2H), 7.25(m, 1H), 7.51(d, 1H), 7.52(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.99(d, 1H), 8.29(s, 1H), 9.87(br, 1H)
1-176 (CDCl ₃)	1.63(s, 6H), 2.39(s, 3H), 2.56(d, 3H), 3.41(s, 2H), 4.21(br, 1H), 6.48(br, 1H), 7.20(m, 1H), 7.47(m, 2H), 7.74(d, 1H), 7.99(d, 1H), 8.30(br, 1H), 8.32(d, 1H)
1-178 (CDCl ₃)	1.01(t, 3H), 1.61(s, 6H), 2.38(s, 3H), 2.98(q, 2H), 3.40(s, 2H), 4.52(br, 1H), 6.63(br, 1H), 7.19(m, 1H), 7.43(m, 2H), 7.71(d, 1H), 7.95(d, 1H), 8.21(d, 1H), 8.46(br, 1H)

1-179 (CDCl ₃)	1.08 (t, 6H), 1.61 (s, 6H), 2.34 (s, 3H), 3.12 (q, 4H), 3.21 (s, 2H), 6.75 (br, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.75 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 8.37 (d, 1H), 8.50 (br, 1H)
1-266 (DMSO-d ₆)	1.00 (t, 3H), 1.28 (d, 3H), 2.84 (m, 4H), 4.27 (m, 1H), 7.14 (br, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.67 (m, 3H), 8.03 (d, 1H), 8.52 (d, 1H), 10.14 (br, 1H)
1-276 (CDCl ₃)	1.10 (t, 6H), 1.46 (d, 3H), 2.31 (s, 3H), 3.15 (m, 5H), 3.67 (m, 1H), 4.60 (m, 1H), 6.80 (br, 1H), 7.04 (s, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 8.26 (br, 1H)
1-277 (CDCl ₃)	1.11 (t, 6H), 1.63 (s, 6H), 2.33 (s, 3H), 3.14 (q, 4H), 3.20 (s, 2H), 6.67 (br, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.21 (m, 2H), 7.77 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.30 (br, 1H)
1-302 (CDCl ₃)	1.10 (t, 6H), 1.62 (s, 6H), 2.38 (s, 3H), 3.12 (q, 4H), 3.16 (s, 2H), 6.68 (br, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.79 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 8.43 (br, 1H), 8.45 (d, 1H)
1-344 (CDCl ₃)	1.09 (t, 6H), 1.62 (s, 6H), 2.35 (s, 3H), 3.13 (q, 4H), 3.20 (s, 2H), 3.99 (m, 1H), 6.63 (br, 1H), 7.26 (m, 3H), 7.78 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.35 (br, 1H)
1-345 (CDCl ₃)	1.63 (s, 6H), 1.78 (m, 4H), 2.35 (s, 3H), 3.19 (m, 4H), 3.26 (s, 2H), 3.99 (m, 1H), 6.68 (br, 1H), 7.23 (m, 3H), 7.77 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 8.31 (d, 1H), 8.33 (br, 1H)
2-5 (CDCl ₃)	1.05 (t, 3H), 1.47 (d, 3H), 2.59 (s, 3H), 3.05 (m, 2H), 3.25 (d, 2H), 4.50 (m, 1H), 5.05 (br, 1H), 6.65 (br, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.63 (br, 1H)
2-7 (CDCl ₃)	1.08 (t, 6H), 1.63 (s, 6H), 2.62 (s, 3H), 3.12 (q, 4H), 3.18 (s, 2H), 6.79 (br, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 8.73 (d, 1H), 8.78 (br, 1H)
2-16 (CDCl ₃)	1.01 (t, 3H), 1.46 (d, 3H), 2.55 (s, 3H), 3.03 (m, 2H), 3.24 (d, 2H), 4.40 (m, 2H), 5.10 (br, 1H), 6.65 (br, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.71 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.74 (br, 1H)

实施例

下面描述本发明的典型实施例，但它们不得认作是本发明范围的限制。

实施例 1

N^2 -(2-乙基氨基磺酰基-1-甲基乙基)-3-碘- N^1 -(2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基)邻苯二酰胺(化合物 No. 1-4)的制备

(1-1) 在四氢呋喃(500 ml)中溶解 22.53g (300 mmol) 2-氨基丙醇，然后在冰冷却下向其中缓慢滴加 155.1g (300 mmol) 30%的苄氧羰基氯甲苯溶液和 36.43g (360 mmol) 三乙胺的四氢呋喃溶液。室温搅拌所得混合物 3 小时后，减压过滤析出的三乙胺盐酸盐，用乙酸乙酯洗涤。减压浓缩滤液，向其中加入稀盐酸，接着用乙酸乙酯提取三次。有机层先后用饱和碳酸氢钠水溶液、饱和氯化钠水溶液洗涤，无水硫酸钠干燥，然后蒸馏除去溶剂，由此得到 49.8g (收率 79%) (2-羟基-1-甲基乙基)氨基甲酸苄酯。

(1-2) 在四氢呋喃(400 ml)中溶解 46.5g (222 mmol) (2-羟基-1-甲基乙基)氨基甲酸苄酯和 26.96g (266 mmol) 三乙胺，然后在 0℃下向其中缓慢滴加 27.96g (244 mmol) 甲磺酰氯的四氢呋喃溶液。室温搅拌所得混合物 5 小时后，减压过滤析出的三乙胺盐酸盐，用乙酸乙酯洗涤。减压浓缩滤液，向其中加入水，接着用乙酸乙酯萃取三次。萃取液先后用饱和碳酸氢钠水溶液、饱和氯化钠水溶液洗涤，无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂，将如此获得的结晶粗品用溶剂(己烷: 乙酸乙酯=4:1)洗涤两次，得到 49.5g (收率 78%) 甲磺酸 2-(苄氧基羰基氨基)丙基酯。

(1-3) 在乙醇(120 ml)中溶解 34.9g (120 mmol) 甲磺酸 2-(苄氧基羰基氨基)丙基酯，接着逐滴加入由 14.42g (120 mmol) 巯基乙酸和乙醇钠(120 mmol)乙醇溶液独立制备的硫醇盐。室温反应 30 分钟，然后于 50℃反应 2 小时，之后蒸除溶剂，向残留物中加入水，继而用乙酸乙酯萃取三次。萃取液先后用饱和碳酸氢钠水溶液和饱和氯化钠水溶液洗涤，无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂，所得残留物经硅胶柱色谱纯化(己烷: 乙酸乙酯=4:1)，得到 34.5g (收率 92%) 2-(苄氧基羰基氨基)丙巯基乙酸。

(1-4) 在乙酸乙酯(150ml)中溶解 34.5g (110 mmol) 2-(苄氧基羰基

基氨基)丙硫基乙酸, 于 0℃缓慢滴加 23.9g (110 mmol) 间氯过苯甲酸的乙酸乙酯溶液(50ml)。室温反应 3 小时后, 将反应溶液倒入饱和碳酸氢钠水溶液中, 继而用乙酸乙酯萃取。萃取液用饱和碳酸氢钠水溶液洗涤三次, 进而再用饱和氯化钠水溶液洗涤一次, 用无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂, 并将如此获得的粗制结晶用溶剂(己烷: 乙酸乙酯=2: 1)洗涤两次, 得到 30.38g (收率 84%) 2-(苄氧基羰基氨基)丙基亚磺酰基乙酸。

(1-5) 在甲醇(300ml)中悬浮 30.38g (93 mmol) 2-(苄氧基羰基氨基)丙基亚磺酰基乙酸, 接着加入 19.04g (75 mmol) 碘, 回流反应 5 小时。向反应混合物中加入亚硫酸氢钠水溶液以分解过量的碘, 之后将如此获得的溶液用饱和碳酸氢钠水溶液和碳酸氢钠调节成弱碱性, 蒸除甲醇。向残留物中加入水, 接着用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用饱和氯化钠水溶液洗涤, 无水硫酸钠干燥。

蒸除溶剂, 将如此获得的双[2-(苄氧基羰基氨基)丙基]-二硫化物粗品(29mmol, 根据 $^1\text{H-NMR}$ 积分比估算)悬浮在乙醇(150ml)中, 接着少量多批加入 15.66g (88 mmol) N-溴代琥珀酰亚胺。反应在室温下进行 3 小时, 之后用饱和碳酸氢钠水溶液和碳酸氢钠调节反应溶液呈弱碱性, 蒸除乙醇。向残留物中加入水, 进而用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用水洗涤三次, 然后再用饱和氯化钠水溶液洗涤一次, 无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂, 所得残留物经硅胶柱色谱(己烷: 乙酸乙酯=2: 1)纯化, 得到 16.0g(收率 60%) 2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-亚磺酸乙酯。

(1-6) 在乙醇(7ml)中溶解 2.2g (7.4mmol) 2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-亚磺酸乙酯, 在冰冷却下向其中缓慢滴加 3.2g (8mmol) 10%氢氧化钠水溶液。室温反应 1 小时, 之后蒸除乙醇, 向残留物中加入水, 接着用甲基叔丁基醚萃取两次。水层用浓盐酸酸化, 继而用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用饱和氯化钠水溶液洗涤, 无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂, 并将由此获得的粗结晶用溶剂(己烷: 乙酸乙酯=4: 1)洗涤两次, 得到 1.73g (收率 91%) 2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-亚磺酸。

(1-7) 在水(10ml)中溶解 0.52g (3.8mmol) 碳酸钾, 向其中加入 1.73g (6.7 mmol) 2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-亚磺酸, 之后再逐滴加入

1.07g (6.7mmol) 溴(由于滴加过程中析出结晶使得搅拌困难,故要适当地加入些水)。室温搅拌 30 分钟后,过滤结晶,然后用水洗涤,得到 2.30g(定量)2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-磺酰溴。

(1-8) 冰冷却下,将 1.44g (3.3mmol) 2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-磺酰溴的四氢呋喃溶液(5ml)逐滴加到 70%乙胺水溶液(10ml)中。室温反应 1 小时,之后将反应混合物倒入稀盐酸中,接着用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用饱和氯化钠水溶液洗涤,无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂,得到粗制 N-乙基-2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-磺酰胺,并且该粗产物无需进一步纯化而直接用于后续反应。

(1-9) 在加压氢化瓶中(其中的惰性气氛已经被氩气替换)放入 0.07g 10% Pd-C,并且一次性加入乙醇(10ml)进行悬浮。然后加入(1-8)中获得的粗制 N-乙基-2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-磺酰胺的乙醇溶液(20ml),在加压下(氢气压: $4\text{kg}/\text{cm}^2$)反应 10 小时(反应过程中,为减少产生的一氧化碳的分压将压力降低,然后再增加压力)。反应溶液通过 Celite 过滤,用乙醇洗涤,减压浓缩滤液。将如此获得的结晶用溶剂(己烷:乙酸乙酯 = 2:1)洗涤两次,得到 0.27g {按 2-(苄氧基羰基氨基)丙烷-1-磺酰溴计算的产率为 50%} N-乙基-2-氨基丙烷-1-磺酰胺。

(1-10) 在乙腈(100ml)中溶解 5.5g (20 mmol) 3-碘代邻苯二甲酸酐,向其中缓慢滴加 5.5g (20mmol) 2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺的乙腈溶液(20ml)。室温搅拌所得混合物 3 小时后,减压蒸除 2/3 的乙腈,过滤析出的结晶,然后用乙腈洗涤,得到 5.6g (收率 51%) 6-碘代-N-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}邻氨基酞苯甲酸。

(1-11) 在甲基叔丁基醚(60ml)中悬浮 5.47g (10mmol) 6-碘代-N-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}邻氨基酞苯甲酸,向其中缓慢滴加 3.15g (15mmol) 三氟乙酸酐的甲基叔丁基醚溶液。室温搅拌所得混合物 3 小时,然后倒入冰水中,进而用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用饱和碳酸氢钠水溶液洗涤两次,再用饱和氯化钠水溶液洗涤一次,然后以无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂,将由此获得的结晶粗品用溶剂(己

烷: 乙酸乙酯=4: 1) 洗涤两次, 得到 5.0g (收率 94%) 1, 3-二氢-7-碘-3-{2-甲基-4-[1, 2, 2, 2-四氟-1-(三氟甲基) 乙基] 苯基亚氨基}-2-苯并呋喃-1-酮。

(1-12) 在乙腈(10ml)中溶解 0.42g (0.8 mmol) 1, 3-二氢-7-碘代-3-{2-甲基-4-[1, 2, 2, 2-四氟-1-(三氟甲基) 乙基] 苯基亚氨基}-2-苯并呋喃-1-酮, 接着加入 0.13g (0.8mmol) (1-9) 中得到的 N-乙基-2-氨基丙烷-1-磺酰胺, 室温反应 10 小时。蒸除溶剂, 过滤析出的结晶, 先后用乙腈和混合溶剂(己烷: 乙酸乙酯=4: 1) 洗涤, 得到 0.45g (收率 81%) N^2 -(2-乙基氨基磺酰基-1-甲基乙基)-3-碘代- N^1 -(2-甲基-4-[1, 2, 2, 2-四氟-1-(三氟甲基) 乙基] 苯基) 邻苯二酰胺。

熔点: 170-172℃。

实施例 2

3-碘代- N^1 -(2-甲基-4-[1, 2, 2, 2-四氟-1-(三氟甲基) 乙基] 苯基)- N^2 -(2-氨基磺酰基-1, 1-二甲基乙基) 邻苯二酰胺(化合物 No. 1-175) 的制备

(2-1) 在四氢呋喃(300ml)中溶解 23.86g (200mmol) 1, 1-二甲基-2-(甲硫基) 乙胺, 在冰冷却下向其中缓慢地顺序加入 103.4g (200mmol) 30% 的苯甲氧甲酰氯的甲苯溶液和 24.29g (240 mmol) 三乙胺的四氢呋喃溶液。室温搅拌所得混合物 3 小时后, 减压过滤析出的三乙胺盐酸盐, 用乙酸乙酯洗涤。减压浓缩滤液, 将残留物通过硅胶柱色谱(己烷: 乙酸乙酯=4: 1) 纯化, 得到 36.35g (收率 72%) 1, 1-二甲基-2-(甲硫基) 乙基氨基甲酸苄酯。

(2-2) 搅拌下, 向 45.4g (179 mmol) 1, 1-二甲基-2-(甲硫基) 乙基氨基甲酸苄酯在含水甲醇(通过向 150ml 甲醇中加入 5.22g (290 mmol) 水获得) 中的溶液内少量多批加入 33.46g (188 mmol) N-溴代琥珀酰亚胺。室温反应 2 小时, 之后用饱和碳酸氢钠水溶液调节反应溶液呈弱碱性, 然后蒸除甲醇。向残留物中加入水, 接着用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用水洗涤三次, 再用饱和氯化钠水溶液洗涤一次, 无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂,

将由此获得的 1,1-二甲基-2-(甲基亚磺酰基)乙基氨基甲酸苄酯粗品溶于乙醚(150ml)中,回流反应 4 小时。减压蒸除过量的乙醚和乙酸,得到含有乙酸[2-(苄氧基羰基氨基)-2-甲基丙基]硫代甲基酯粗品的残留物。将该残留物溶于甲醇(300ml),接着向其中加入 19.54g (77 mmol)碘,并且回流反应 5 小时。冷却反应混合物到室温后,加入亚硫酸氢钠水溶液以分解过量的碘。反应溶液用饱和碳酸氢钠水溶液调节成弱碱性,之后蒸除甲醇。向残留物中加入水,用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用饱和氯化钠水溶液洗涤,无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂,将所得残留物通过硅胶柱色谱(己烷:乙酸乙酯=4:1)纯化,得到 10.0g(收率 23%)双[2-(苄氧基羰基氨基)-2-甲基丙基]二硫化物。

(2-3) 在乙醇(150ml)中溶解 10.0g (21 mmol)双[2-(苄氧基羰基氨基)-2-甲基丙基]二硫化物,于搅拌下少量多批加入 11.21g (63mmol) N-溴代琥珀酰亚胺。室温反应 2 小时,之后将反应溶液用碳酸氢钠饱和水溶液调成弱碱性,蒸除乙醇。向残留物中加入水,接着用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用水洗涤三次,再用氯化钠饱和水溶液洗涤一次,无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂,所得残留物通过硅胶柱色谱[己烷:乙酸乙酯=2:1]纯化,得到 10.45g(产率 83%)2-(苄氧基羰基氨基)-2-甲基丙烷-1-亚磺酸乙酯。

(2-4) 在乙醇(10ml)中溶解 0.60g (2mmol) 2-(苄氧基羰基氨基)-2-甲基丙烷-1-亚磺酸乙酯,在冰冷却下向其中缓慢滴加 0.9g (2.2mmol) 10%氢氧化钠水溶液。室温反应 1 小时,然后蒸除乙醇。向残留物中加入水(10ml)、0.18g (2.2 mmol)乙酸钠和 0.25g (2.2mmol)羟胺-O-磺酸,并在室温下反应 1 小时。将反应混合物倒入水中,用乙酸乙酯萃取三次。萃取液用碳酸氢钠饱和水溶液、氯化钠饱和水溶液先后洗涤,无水硫酸钠干燥。蒸除溶剂,如此得到的 0.49g(收率 86%)2-(苄氧基羰基氨基)-2-甲基丙烷-1-磺酰胺粗品无需进一步纯化而直接用于后续反应。

(2-5) 在加压氢化瓶中(其中的惰性气氛已经替换成氩气)放入 0.20g 10% Pd-C,并且一次性加入乙酸(5ml)进行悬浮。然后加入(2-4)中获得的 2-(苄氧基羰基氨基)-2-甲基丙烷-1-磺酰胺的乙酸溶液

(10ml), 加压(氢气压: $4\text{kg}/\text{cm}^2$)反应 10 小时(反应过程中, 为减少产生的一氧化碳的分压将压力降低, 然后再增加压力)。反应溶液通过 Celite 过滤, 用乙醇洗涤, 然后减压浓缩滤液, 残留物(2-氨基-2-甲基丙烷-1-磺酰胺乙酸盐粗品)无需进一步纯化直接用于后续反应。

(2-6) 在乙腈(10ml)中溶解 0.8g (1.5mmol) 1,3-二氢-7-碘代-3-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基亚氨基}-2-苯并呋喃-1-酮, 接着加入(2-5)中得到的 2-氨基-2-甲基丙烷-1-磺酰胺乙酸盐粗品和 0.17g (1.7 mmol) 三乙胺, 并且在室温下反应 30 小时。蒸除溶剂, 将所得残留物通过硅胶柱色谱(己烷: 乙酸乙酯=1:1)纯化, 得到 0.05g (收率 9%) 3-碘代- N^1 -{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}- N^2 -(2-氨基磺酰基-1,1-二甲基乙基)邻苯二酰胺, 为无定形物。

$^1\text{H-NMR}$ [$\text{DMSO-d}_6/\text{TMS}$, δ 值(ppm)]

1.49 (s, 6H), 2.35 (s, 3H), 3.65 (s, 2H), 6.91 (br, 2H), 7.25 (m, 1H), 7.51 (d, 1H); 7.52 (s, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 8.29 (s, 1H), 9.87 (br, 1H)。

含有本发明的通式(I)磺酰胺衍生物或其盐作为活性成分的农艺杀虫剂适合于防治各种害虫, 例如农艺害虫、储存谷物害虫、卫生害虫、线虫等, 这些害虫对稻谷、果树、蔬菜、其它农作物、花卉、观赏植物等是有害的。它们具有显著的杀虫作用, 例如对鳞翅目, 包括棉褐带卷蛾(*Adoxophyes orana fasciata*)、茶小卷叶蛾(*Adoxophyes* sp.)、苹小食心虫(*Grapholitha inopinata*)、梨小食心虫(*Grapholitha molesta*)、大豆食心虫(*Leguminovora glycinivorella*)、桑小卷蛾(*Olethreutes mori*)、茶细蛾(*Caloptilia theivora*)、猛花细蛾(*Caloptilia zachrysa*)、金纹小潜细蛾(*Phyllonorycter ringoniella*)、梨潜皮细蛾(*Spulerina astaurota*)、菜粉蝶日本亚种(*Pieris rapae crucivora*)、烟芽夜蛾(*Heliothis* sp.)、苹果皮小卷蛾(*Laspeyresia pomonella*)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、苹果银蛾(*Argyresthia conjugella*)、桃柱果蛾(*Carposina niponensis*)、二化螟(*Chilo*

suppressalis)、稻纵卷叶野螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、烟草粉斑螟(*Ephesia elutella*)、桑绢野螟(*Glyphodes pyloalis*)、三化螟(*Scirpophaga incertulas*)、直纹稻弄蝶(*Parnara guttata*)、粘虫(*Pseudaletia separata*)、稻蛀茎夜蛾(*Sesamia inferens*)、斜纹贪夜蛾(*Spodoptera litura*)、贪夜蛾(*Spodoptera exigua*)等; 半翅目, 包括二点叶蝉(*Macrosteles fascifrons*)、黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、白背飞虱(*Sogatella furcifera*)、橘木虱(*Diaphorina citri*)、日本葡萄粉虱(*Aleurolobus taenabae*)、甘薯粉虱(*Bemisia tabaci*)、温室粉虱(*Trialetodes vaporariorum*)、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、角蜡蚧(*Ceroplastes ceriferus*)、橘绵蚧(*Pulvinaria aurantii*)、樟网盾蚧(*Pseudaulnucius duplex*)、圣琼斯康盾蚧(*Comstockaspis perniciosus*)、矢尖盾蚧(*Unaspis yanonensis*)等; 蛱蝶科, 包括多色异丽金龟(*Anomala rufocuprea*)、日本弧丽金龟(*Popillia japonica*)、烟草窃蠹(*Lasioderma serricornis*)、褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)、马铃薯瓢虫(*Epilachna vigintioctopunctata*)、绿豆象(*Callosobruchus chinensis*)、蔬菜象(*Listroderes costirostris*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*)、棉铃象(*Anthonomus grandis grandis*)、稻水象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、黄守瓜(*Aulacophora femoralis*)、水稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、黄曲条菜跳甲(*Phyllotreta striolata*)、纵坑切梢小蠹(*Tomicus piniperda*)、马铃薯叶甲(*Leptinotarsa decemlineata*)、墨西哥大豆瓢虫(*Epilachna varivestis*)、玉米根叶甲(*Diabrotica* sp.)等; 双翅目, 包括瓜寡鬃实蝇(*Dacus (Zeugodacus) cucurbitae*)、橘果实蝇(*Dacus (Bactrocera) dorsalis*)、大麦毛眼水蝇(*Agnomyza oryzae*)、葱地种蝇(*Delia antiqua*)、灰地种蝇(*Delia platura*)、瘿蚊(*Asphondylia* sp.)、家蝇(*Musca domestica*)、尖音库蚊(*Culex pipiens pipiens*)等; 和蛱蝶科, 包括短体线虫(*Pratylenchus* sp.)、咖啡短体线虫(*Pratylenchus coffeae*)、马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*)、根结线虫

(*Meloidogyne* sp.)、半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*)、燕麦真滑刃线虫(*Aphelenchus avenae*)、菊叶芽滑刃线虫(*Aphelenchoides ritzemabosi*)等;和螨目,包括柑橘全爪螨(*Panonychus citri*)、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*)、朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、神泽氏叶螨(*Tetranychus Kanzawai* Kishida)、二斑叶螨(*Tetranychus urticae* Koch)、茶尖叶瘿螨(*Acaphylla theae*)、橘刺皮瘿螨(*Aculops pelekassi*)、龙首丽瘿螨(*Calacarus carinatus*)、梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*)等。

含有本发明的通式(I)磺酰胺衍生物或其盐作为活性成分的农艺杀虫剂对上面列举的害虫具有显著的杀虫效果,这些害虫对稻田作物、旱地作物、果树、蔬菜、其它作物、花卉和观赏植物等是有害的。因此,在害虫预期出现的季节、在它们出现之前或者在确认它们出现之时,将农艺杀虫剂施用于种子、稻田水、果树的茎与叶、蔬菜、其它作物、花卉和观赏植物、土壤等,可以获得本发明农艺杀虫剂的需要效果。

通常是按照制备农药用的常规方法将本发明的农艺杀虫剂制成常用的剂型。

也就是说,将通式(I)的磺酰胺衍生物或其盐以及任选的助剂按适当比例与合适的惰性载体一起掺合,通过溶解、分散、悬浮、混合、浸渍、吸附或附着作用,制成适当剂型,例如混悬剂、乳油、可溶性浓缩物、可湿性粉剂、颗粒剂、粉剂、片剂、药包等剂型。

可用在本发明中的惰性载体可以是固体也可以是液体。作为可用作固体载体的材料,可以列举大豆粉、谷粉、木粉、树皮粉、锯屑、烟草茎粉、胡桃壳粉、糠、纤维素粉、植物的提取残渣、合成聚合物或树脂粉末、粘土(例如高岭土、膨润土、和酸性粘土)、滑石(例如滑石和叶蜡石)、二氧化硅粉或薄片(例如硅藻土、硅沙、云母和白碳(合成的高分散性硅酸,也称微细粉碎的水合二氧化硅或水合硅酸,有些市售产品包含有硅酸钙作为主要组分)、活性炭、硫粉、浮石、煅烧硅藻土、磨碎的砖、飞灰、沙子、碳酸钙、磷酸钙和其它无机或矿物粉末、塑料载体(例如聚乙烯、聚丙烯和聚偏二氯乙烯),化学肥料(例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素和氯化

铵)，以及堆肥。这些材料可以单独使用或者两种或两种以上混合使用。

可用作液体载体的材料选自这类材料，它们本身具有溶解性，或者它们不具这种溶解性但却能借助助剂分散作为活性成分的化合物。下面是液体载体的典型实例，它们可以单独使用或者两种或两种以上混合使用：水；醇（例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇和乙二醇），酮（例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮、二异丁酮和环己酮），醚（例如乙醚、二噁烷、溶纤剂、二丙醚和四氢呋喃），脂族烃（例如煤油和矿物油），芳烃（例如苯、甲苯、二甲苯、溶剂汽油和烷基萘），卤代烃（例如二氯乙烷、氯仿、四氯化碳和氯苯），酯（例如乙酸乙酯、邻苯二甲酸二异丙酯、邻苯二甲酸二丁酯和邻苯二甲酸二辛酯），酰胺（例如二甲基甲酰胺、二乙基甲酰胺和二甲基乙酰胺），腈（例如乙腈），和二甲亚砷。

下面是助剂的典型实例，它们是根据所要目的而选用的，并且可以单独使用或者一些情况下组合使用，或者根本不需使用。

为了乳化、分散、溶解和/或湿润作为活性成分的化合物，使用表面活性剂。作为表面活性剂，可以列举聚氧乙烯烷基醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯高级脂肪酸酯、聚氧乙烯树脂酸酯、聚氧乙烯脱水山梨醇一月桂酸酯、聚氧乙烯脱水山梨醇一油酸酯、烷基芳基磺酸酯、萘磺酸缩合产物、木素磺酸盐和高级醇硫酸酯。

进一步地，为了稳定作为活性成分的化合物的分散作用、增粘它们和/或与它们的粘合，也可以使用下文列举的助剂，亦即还可以使用诸如酪蛋白、明胶、淀粉、甲基纤维素、羧甲基纤维素、阿拉伯胶、聚乙烯醇、松节油、糠油、膨润土和木素磺酸盐之类的助剂。

为了改善固体产品的可流动性，也可以使用下列助剂，亦即可以使用诸如蜡、硬脂酸酯、磷酸烷基酯等助剂。

诸如萘磺酸缩合产物和磷酸酯的缩聚物之类助剂可用作可分散产品的胶溶剂。

诸如硅油之类助剂也可以用作消泡剂。

进而，如果必要的话，也可以加入功能扩展剂、活性增强剂例如代谢分解抑制剂（象胡椒基丁醚）、防冻剂如丙二醇、抗氧剂如BHT、紫外线吸

收剂等。

活性成分化合物的含量因需要而异,但可以在每 100 份重量农艺杀虫剂 0.01-90 份重量的范围内适当选择。例如,在粉剂或颗粒剂中,活性成分化合物的适宜含量为 0.01-50 份重量。在乳油或可流动粉剂中,含量也是 0.01-50 份重量。

本发明的农艺杀虫剂以下述方式用于防治各种害虫:将其本身或用水等适当稀释或悬浮后,施药于预期出现害虫的农作物,或施药于不希望有害虫出现或生长的场所,其用量对害虫的防治是有效的。

本发明农艺杀虫剂的施用剂量因各种因素而异,例如目的、要防治的害虫、植物生长期、害虫出现的趋势、天气、环境条件、剂型、施药方法、施药场所和施药时间。根据目的可以在每 10 公亩 0.001g-10kg,优选 0.01g-1kg (以活性成分化合物计) 的范围内适当选择。

本发明的农艺杀虫剂可以与其它农艺杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生物农药等混合使用,目的是用于拓宽可防治害虫种类的范围、延长可能的有效施药时间或用于减少剂量。此外,随施用情形的不同本发明的农艺杀虫剂也可以与除草剂、植物生长调节剂、肥料等混用。

下面描述本发明的典型制剂例和试验例,但它们不得认定为是对本发明范围的限制。

制剂例中使用的术语“份”和“份数”均以重量计。

制剂例 1

表 1 或 2 所列各化合物	10 份
二甲苯	70 份
N-甲基吡咯烷酮	10 份
聚氧乙烯壬基苯基醚与烷基苯磺酸钙 的混合物	10 份

均匀混合上述各成分进行溶解,制成乳油。

制剂例 2

表 1 或 2 所列各化合物	3 份
粘土粉	82 份

硅藻土粉 15 份

均匀混合并研磨上述各成分，制成粉剂。

制剂例 3

表 1 或 2 所列各化合物 5 份

膨润土与粘土的混合粉末 90 份

木素磺酸钙 5 份

均匀混合上述各成分，将所得混合物与适当量的水一起捏合，然后造粒并干燥，制成颗粒剂。

制剂例 4

表 1 或 2 所列各化合物 20 份

高岭土与合成高分散性硅酸的混合物 75 份

聚氧乙烯壬基苯基醚与烷基苯磺酸钙的混合物 5 份

将上述成分均匀混合并进行研磨，制得可湿性粉剂。

试验例 1: 对小菜蛾 (*Plutella xylostella*) 的杀虫效果

释放成年小菜蛾，使其在中国卷心菜幼苗上产卵。释放后两天，将沉积有卵的幼苗浸入液体化学品达约 30 秒钟，其中所述液体化学品是通过稀释含有表 1 或 2 所列各化合物作为活性成分的制剂，调节浓度至 50ppm 所制得的。风干后，放置在 25℃ 的恒温室内。

浸渍后六天，计数孵化的昆虫。按照下述方程计算死亡率，并根据下述标准判断杀虫效果。试验重复进行三组，每组 10 只昆虫。

$$\text{校正死亡率 (\%)} = \frac{\text{未处理组孵化昆虫数量} - \text{处理组孵化昆虫数量}}{\text{未处理组孵化昆虫数量}} \times 100$$

判断标准:

A --- 死亡率 100%

B --- 死亡率 99-90%

C --- 死亡率 89-80%

D --- 死亡率 79-50%

E --- 死亡率低于 50%

上述试验的结果见下表 4 所示。

试验例 2: 对斜纹贪夜蛾 (*Spodoptera litura*) 的杀虫效果

将一片卷心菜叶(栽培品种: Shikidori)浸入液体化学药品中约 30 秒钟, 其中所述液体化学药品是通过稀释含有表 1 或 2 所列各化合物作为活性成分的制剂, 调节浓度至 50ppm 所制得的。风干后, 放置在直径 9cm 的塑料陪替氏培养皿中, 接种二龄期斜纹贪夜蛾幼虫, 然后盖上培养皿, 放置在 25℃ 的恒温室内。接种后八天, 计数死亡的和存活的数量。按照下述方程计算死亡率, 并且根据试验例 1 所示标准判断杀虫效果。试验重复进行三组, 每组 10 只昆虫。

$$\text{校正死亡率 (\%)} = \frac{\text{未处理组存活昆虫数量} - \text{处理组存活昆虫数量}}{\text{未处理组存活昆虫数量}} \times 100$$

上述试验的结果见下表 4 所示。

试验例 3: 对茶小卷叶蛾 (*Adoxophyes sp.*) 的杀虫效果

将茶叶浸入液体化学药品中约 30 秒钟, 其中所述液体化学药品是通过稀释含有表 1 或 2 所列各化合物作为活性成分的制剂, 调节浓度至 50ppm 所制得的。风干后, 将茶叶放置在直径 9cm 的塑料陪替氏培养皿中, 接种茶小卷叶蛾幼虫, 然后将培养皿放置在 25℃ 恒温和 70%湿度的室内。接种后八天, 计数死亡的和存活的幼虫数量, 并且根据试验例 1 所示标准判断杀虫效果。试验重复进行三组, 每组 10 只昆虫。

上述试验的结果见下表 4 所示。

表 4

No	试验例 1	试验例 2	试验例 3
1-1	A	A	A
1-2	A	A	A
1-3	A	A	A
1-4	A	A	A
1-6	A	A	A
1-7	A	A	A
1-8	A	A	A
1-12	A	A	A
1-14	A	A	A
1-20	A	A	A
1-21	A	A	A
1-22	A	A	A
1-23	A	A	A
1-24	A	A	A
1-25	A	A	A
1-27	A	A	A
1-28	A	A	A
1-29	A	A	A
1-30	A	A	A
1-31	A	A	A
1-32	A	A	A
1-35	A	A	A
1-36	A	A	A
1-37	A	A	A
1-38	A	A	A
1-39	A	A	A

N o	试验例 1	试验例 2	试验例 3
1-40	A	A	A
1-41	A	A	A
1-42	A	A	A
1-43	A	A	A
1-44	A	A	A
1-45	A	A	A
1-46	A	A	A
1-47	A	A	A
1-48	A	C	A
1-54	A	A	A
1-55	A	A	A
1-56	A	A	A
1-57	A	A	A
1-58	A	A	E
1-59	A	A	E
1-60	A	A	E
1-61	A	A	A
1-62	A	A	A
1-63	A	A	A
1-66	A	A	A
1-67	A	E	E
1-71	A	A	A
1-72	A	A	A
1-73	A	A	A
1-75	A	A	A
1-76	A	A	A
1-77	A	A	A

N o	试验例 1	试验例 2	试验例 3
1-78	A	E	A
1-79	A	A	A
1-80	A	A	A
1-81	A	A	A
1-82	A	A	A
1-83	A	A	A
1-84	A	A	A
1-85	A	A	A
1-86	A	A	A
1-87	A	A	A
1-88	A	A	A
1-89	A	A	A
1-91	A	A	A
1-92	A	A	A
1-93	A	A	A
1-94	A	A	A
1-103	A	A	A
1-104	A	A	A
1-105	A	A	E
1-106	A	E	E
1-107	A	C	A
1-108	A	A	A
1-109	A	E	A
1-110	A	E	E
1-111	A	E	E
1-112	A	E	E
1-116	A	D	A

No	试验例 1	试验例 2	试验例 3
1-121	A	E	E
1-142	A	A	A
1-144	A	A	A
1-146	A	A	A
1-147	A	A	A
1-148	A	A	A
1-149	A	A	A
1-175	A	A	A
1-176	A	A	A
1-177	A	A	A
1-178	A	A	A
1-179	A	A	A
1-180	A	C	A
1-181	A	A	A
1-184	A	A	A
1-200	A	A	A
1-201	A	A	A
1-207	A	A	E
1-208	A	E	A
1-211	A	A	A
1-212	A	A	A
1-213	A	A	A
1-214	A	A	A
1-215	A	A	A
1-216	A	A	A
1-217	A	A	A
1-218	A	A	A

N o	试验例 1	试验例 2	试验例 3
1-219	A	A	A
1-266	A	C	E
1-267	A	C	E
1-268	A	A	A
1-275	A	E	E
1-276	A	E	E
1-277	A	A	A
1-285	A	C	B
1-286	A	A	E
1-301	A	A	A
1-302	A	A	A
1-303	A	A	A
1-304	A	A	A
1-305	A	A	A
1-306	A	A	A
1-307	A	A	A
1-308	A	A	A
1-309	A	A	A
1-310	A	A	A
1-342	A	A	A
1-343	A	A	A
1-344	A	A	A
1-345	A	A	A
2-5	A	A	A
2-7	A	A	A
2-16	A	E	A