

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07D231/20

C07D213/68

A01N 43/56

A01N 43/40



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 02825048.6

[43] 公开日 2005年4月6日

[11] 公开号 CN 1604894A

[22] 申请日 2002.11.25 [21] 申请号 02825048.6

[30] 优先权

[32] 2001.12.15 [33] DE [31] 10161765.8

[86] 国际申请 PCT/EP2002/013231 2002.11.25

[87] 国际公布 WO2003/051846 德 2003.6.26

[85] 进入国家阶段日期 2004.6.14

[71] 申请人 拜尔作物科学有限公司

地址 德国法兰克福

[72] 发明人 H·黑尔姆克 M·G·霍夫曼

K·哈夫 L·维尔姆斯 T·奥勒

H·比林格尔 H·梅内

[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

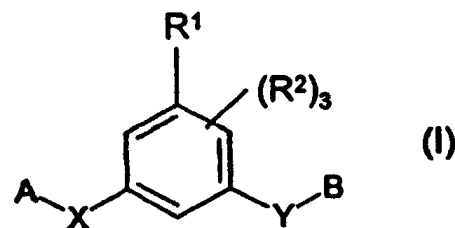
代理人 吴亦华

权利要求书8页 说明书91页

[54] 发明名称 经取代的苯基衍生物

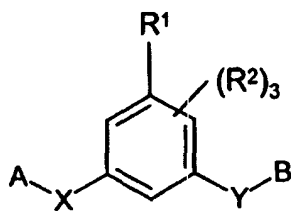
[57] 摘要

本发明涉及一种式(I)的化合物和/或其盐如右式其中 R¹、R²、A、B、X 及 Y 是如权利要求 1 所定义的。本发明的化合物适于作为除草剂和植物生长调节剂。



ISSN 1008-4274

1. 一种式 (I) 的化合物和/或其盐



式 (I)

其中

A 为苯基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳族基团, 该基团在与键结有 X 的环原子成间位的两环原子之一上, 该基团具有选自下组的取代基: CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、OCH₃、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃ 及 CN, 以及任选第二种取代基, 选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈) 烷硫基所组成的组, 其中所述的最后三个基团未经取代或经一或多个选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈) 烷硫基所组成的组的基团所取代,

X 为 O、S 或 CH₂,

R¹ 为羟基、卤素、CN、NC、CHO、烷基是未经取代或经取代的 CO(C₁-C₈)-烷基、CONH₂、CSNH₂、硝基、SF₅、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、(C₂-C₈)-炔基、(C₁-C₈)-烷氧基、[(C₁-C₈)-烷基]-羰基或 (C₁-C₈)-烷基磺酰基, 其中最后所述的 6 个基团是未经取代的或取代的, 或为

S(O)_p-R³, 其中

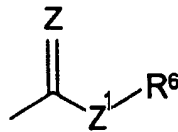
p 为 0、1 或 2 并且

R³ 为 (C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-卤烷基或 NR⁴R⁵, 其中

R⁴、R⁵ 分别为相同或不同的基团 H、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、(C₇-C₁₀)-芳烷基、(C₇-C₁₀)-烷芳基或 (C₆-C₁₀)-芳基, 其中所述的最后五种基团是未经取代或经取代的,

或为 NR⁴R⁵, 其中 R⁴、R⁵ 分别为相同或不同的基团 H、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、(C₇-C₁₀)-芳烷基、(C₇-C₁₀)-烷芳基或 (C₆-C₁₀)-芳基, 其中所述的最后五种基团是未经取代或经取代的,

或 R^1 为下式基团



其中 R^6 为未经取代或经取代的 (C_1-C_8) -烷基,

$Z=O$ 或 S , 并且

$Z'=O$ 或 S ,

R^2 是相同或不同的基团 H 、卤素、 CN 或未经取代或经取代的 (C_1-C_8) -烷基,

Y 为 $O-(CR^8R^9)_q$ 、 $S(O)_q$ 、 NH 、 $CO(CR^8R^9)_q$ 或 CR^8R^9 , 并且如果 B 是未经取代或经取代的芳基、未经取代或经取代的杂环基、卤素或 CN , 则 Y 也可为一键结,

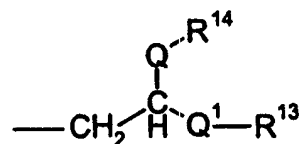
其中 R^8 和 R^9 是相同或不同的基团 H 、羟基、卤素、 CN 、 (C_1-C_8) -烷氧基或 (C_1-C_8) -烷基, 其中所述的最后两种基团是未经取代或经取代的, 并且

q 为 0 、 1 或 2 , 并且

B 为未经取代或经取代的芳基、未经取代或经取代的杂环基、 H 、 OH 、卤素、 CN 、硝基、 SF_5 、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_8) -链烯基或 (C_2-C_8) -炔基, 其中所述的最后三种基团是未经取代或经取代的, 或酰基, 或 $NR^{11}R^{12}$, 其中

R^{11} , R^{12} 分别为相同或不同的基团 H 、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_8) -链烯基、 (C_7-C_{10}) -芳烷基、 (C_7-C_{10}) -烷芳基、 (C_6-C_{10}) -芳基或杂芳基, 其中所述的最后六种基团是未经取代或经取代的, 或酰基, 或

B 为下式基团



其中 R^{13} 为未经取代或经取代的 (C_1-C_8) -烷基,

R^{14} 为未经取代或经取代的 (C_1-C_8) -烷基,

或 R^{13} 和 R^{14} 一起形成环,

Q = O 或 S 以及

Q¹ = O 或 S。

2. 根据权利要求 1 的式 (I) 化合物和/或其盐, 其特征在于

A 为苯基或具有 5 或 6 个环原子的含 N-或含 S-杂芳族基团, 该基团在与键结有 X 的环原子成间位的两环原子之一上, 该基团具有选自下组的取代基: CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、OCH₃、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃ 及 CN, 以及任选第二种取代基, 选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈)-烷硫基所组成的组, 其中所述的最后三个基团未经取代或经一或多个选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代,

X 为 O、S 或 CH₂,

R¹ 为羟基、卤素、CN、NC、CHO、CO (C₁-C₈)-烷基、COO (C₁-C₈-烷基), 其中烷基是未经取代或经取代的, CONH₂、CSNH₂、硝基、SF₅、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基或 (C₁-C₈)-烷氧基, 其中最后所述的 3 个基团是未经取代的或取代的, 或

R² 是相同或不同的基团 H、卤素、CN 或未经取代或经取代的 (C₁-C₈)-烷基,

Y 为 O-(CR⁸R⁹)_q、S(O)_q、NH、CO (CR⁸R⁹)_q 或 CR⁸R⁹, 并且如果 B 是未经取代或经取代的芳基、未经取代或经取代的杂环基、卤素或 CN, 则 Y 也可为一键结,

其中 R⁸ 及 R⁹ 是相同或不同的基团 H、羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基或 (C₁-C₈)-烷基, 其中所述的最后两种基团是未经取代或经取代的, 并且 q=0、1 或 2, 且

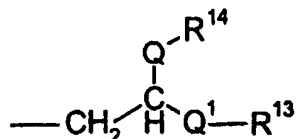
B 为芳基或 5 或 6 元杂环基, 其中所述的两基团是未经取代或经一或多个选自下组的基团所取代: 羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-烷氧基、卤代-(C₁-C₈)-烷基、卤代-(C₁-C₈)-烷氧基、卤代-(C₁-C₈)-烷硫基和 (C₁-C₈)-烷氧基-(C₁-C₈)-烷氧基, 或

H、OH、卤素、CN、硝基、SF₅、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基或 (C₂-C₈)-炔基, 其中所述的最后三种基团是未经取代或经取代的, 或

NR¹¹R¹², 其中

R¹¹, R¹²分别为相同或不同的基团 H、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、(C₇-C₁₀)-芳烷基、(C₇-C₁₀)-烷芳基、(C₆-C₁₀)-芳基或杂芳基, 其中所述的最后六种基团是未经取代或经取代的, 或

B 为下式基团



其中 R¹³ 为未经取代或经取代的 (C₁-C₈)-烷基,

R¹⁴ 为未经取代或经取代的 (C₁-C₈)-烷基,

或 R¹³ 与 R¹⁴ 一起形成环,

Q=O 或 S, 且

Q¹=O 或 S。

3. 根据权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物和/或其盐, 其特征在于

A 为通式 (A') 的基团



其中 R¹⁵ 是选自由 CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、OCH₃、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃ 及 CN 所组成的组的基团,

R^{15'} 为卤素、CN、(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-烷氧基或 (C₁-C₈)-烷硫基, 其中所述的最后三种基团各自是未经取代或经一或多个选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代,

I 为零或 1,

V 为 CH 或 N(C₁-C₈)-烷基,

W 为 N、S、N-CH 或 CH-CH,

X 为 O、S 或 CH₂,

R¹ 为羟基、卤素、CN、NC、CHO、CONH₂、CSNH₂、硝基、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、CO(C₁-C₈)-烷基、COO(C₁-C₈)-烷基或 (C₁-C₈)-烷氧基, 其

中所述的最后五种基团是未经取代或经一或多个选自羟基、卤素、CN、 (C_1-C_8) -烷氧基及 (C_1-C_8) -烷硫基所组成的组的基团所取代，

R^2 是相同或不同的基团 H、卤素、或 CN，

Y 为 $O-(CR^8R^9)_q$ 、 $S(O)_q$ 、NH、 $CO(CR^8R^9)_q$ 或 CR^8R^9 ，并且如果 B 是未经取代或经取代的芳基、未经取代或经取代的杂环基、卤素或 CN，则 Y 亦可为一健结，

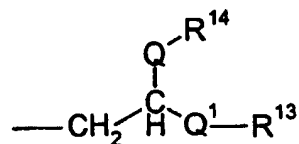
其中 R^8 和 R^9 是相同或不同的基团 H、羟基、卤素、CN、 (C_1-C_8) -烷氧基或 (C_1-C_8) -烷基，其中所述的最后两种基团是未经取代或经取代的，且 $q=0$ 、1 或 2，且

B 为芳基或 5 或 6 元杂环基，其中所述基团是未经取代或经一或多个选自下组的基团所取代的：羟基、卤素、CN、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -烷氧基、卤代- (C_1-C_8) -烷基、卤代- (C_1-C_8) -烷氧基、卤代- (C_1-C_8) -烷硫基和 (C_1-C_8) -烷氧基- (C_1-C_8) -烷氧基，

H、OH、卤素、CN、硝基、 SF_5 、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_8) -链烯基或 (C_2-C_8) -炔基，其中所述的最后三种基团是未经取代或经取代的，或酰基，或 $NR^{11}R^{12}$ ，其中

R^{12} 为 H、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_8) -链烯基、 (C_7-C_{10}) -芳烷基、 (C_7-C_{10}) -烷芳基、 (C_6-C_{10}) -芳基或杂芳基，其中所述的最后六种基团是未经取代或经取代的，或酰基，或

B 为下式基团



其中 R^{13} 为未经取代或经取代的 (C_1-C_8) -烷基，

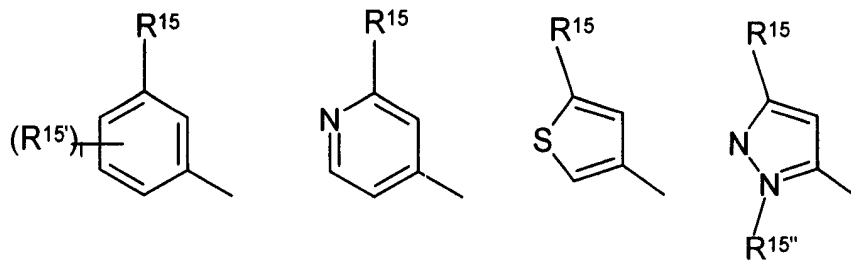
R^{14} 为未经取代或经取代的 (C_1-C_8) -烷基，

或 R^{13} 和 R^{14} 一起形成环，

$Q=O$ 或 S，且

$Q^1=O$ 或 S。

4. 根据权利要求 1 至 3 一项或多项的式 (I) 化合物和/或其盐，其特征在于 A 为下式经取代的苯基、吡啶基、噻吩基或吡唑基



其中

R^{15} 为 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 OCH_3 、 OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 或 CN ,

$R^{15'}$ 为 (C_1-C_8) -烷基、卤素或 CN ,

$R^{15''}$ 为 (C_1-C_8) -烷基, 且

I 为零或 1。

5. 一种除草或植物生长调节组合物, 包含 a) 至少一种权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 化合物和/或其盐, 和 b) 在植物保护中常用的助剂。

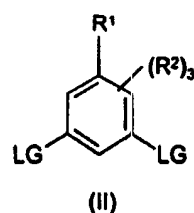
6. 一种控制有害植物或调节作物生长的方法, 其包含将有效量的至少一种权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 化合物和/或其盐施于植物、植物种子、或其生长区域。

7. 至少一种权利要求 1 至 4 任一项的式 (I) 化合物和/或其盐作为除草剂或植物生长调节剂的用途。

8. 根据权利要求 7 的用途, 其特征在于, 将式 (I) 化合物和/或其盐用于控制有害植物或调节作物生长。

9. 根据权利要求 8 的用途, 其特征在于, 作物是转基因作物。

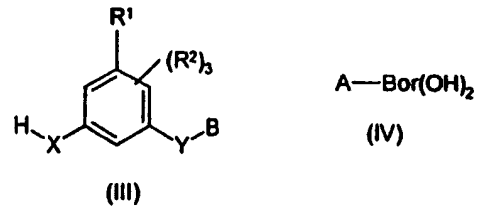
10. 一种制备权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 化合物和/或其盐的方法, 其特征在于, 包括
a) 将通式 (II) 的化合物



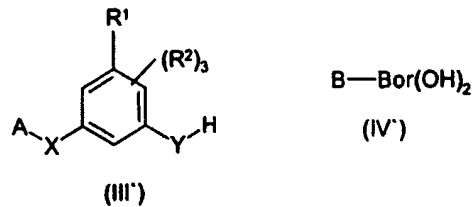
其中 R^1 及 R^2 是如权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 的定义, 并且 LG 是相同或不同的离去基团, 与通式 $A-X-H$ 及 $B-Y-H$ 亲核剂进行反应,

其中 A、B、X 及 Y 是如权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 所定义的；
或

b) 将通式 (III) 化合物与通式 (IV) 化合物反应

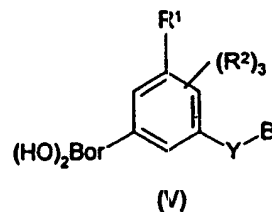


或将通式 (III') 化合物与通式 (IV') 化合物反应

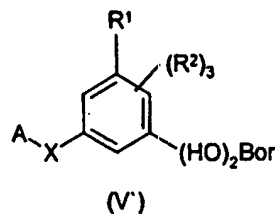


其中通式 (III)、(III')、(IV) 及 (IV') 中的 R^1 、 R^2 、A、B、X 及 Y 是如权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 所定义的；或

c) 将通式 (V) 的化合物与通式 A-X-H 的化合物反应

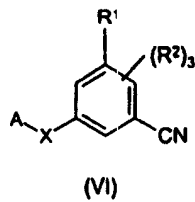


或将通式 (V') 的化合物与通式 B-Y-H 的化合物反应



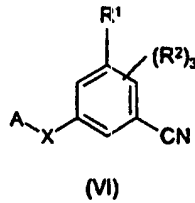
其中通式 (V)、(V')、A-X-H 及 B-Y-H 中的 R^1 、 R^2 、A、B、X 及 Y 是如权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 所定义的；或

d) 将通式 (VI) 的化合物还原及酰化



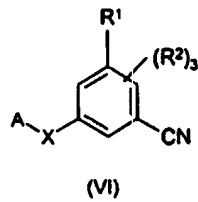
其中通式 (VI) 中的 R^1 、 R^2 、A 及 X 是如权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 所定义的；或

e) 皂化通式 (VI) 的化合物，且使其与通式 NH_2-R^{12} 的胺进行反应



其中通式 (VI) 和 NH_2-R^{12} 中的 R^1 、 R^2 、 R^{12} 、A 及 X 是如权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 所定义的；或

f) 将通式 (VI) 化合物与有机金属化合物反应



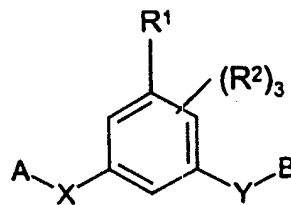
其中通式 (VI) 中的 R^1 、 R^2 、A 及 X 是如权利要求 1 至 4 一项或多项的式 (I) 所定义的。

经取代的苯基衍生物

已知经取代的苯基衍生物可能具有除草及植物生长调节性质(比较例如 DE 3602-379-A, JP 10007657, US 5698495, US 5786392, WO 9718196)。然而, 在应用中这种化合物经常具有例如持久性长、对于重要的有用植物的选择性不足或缺乏控制有害植物的活性的缺点。

本发明现在提供一种以特别方式取代的苯基衍生物, 其可有利地用作除草剂及植物生长调节剂。

因此, 本发明提供一种式(I)的化合物和/或其盐



式 I

其中

A 为苯基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳族基团, 如吡啶基、吡唑基或噻吩基, 在与键结有 X 的环原子成间位的两环原子之一上, 该基团具有选自下组的取代基: CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、OCH₃、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃ 及 CN, 优选选自由 CH₂F、CHF₂、CF₃、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃ 和 CN 所组成的组, 以及任选第二种取代基, 选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈) 烷硫基所组成的组, 其中所述的最后三个基团未经取代或经一或多个选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈) 烷硫基所组成的组的基团所取代, 例如 (C₁-C₈)-卤烷基、(C₁-C₈)-卤烷氧基、(C₁-C₈) 卤烷硫基或 (C₁-C₈)-烷氧基-(C₁-C₈)-烷氧基,

X 为 O、S 或 CH₂,

R¹ 为羟基、卤素、CN、NC、CHO 或 CO(C₁-C₈)-烷基, 基中该烷基未经取

代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基及[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基所组成的组的基团取代，或为CONH₂、CSNH、硝基、SF₅、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基或(C₂-C₈)-炔基，其中所述的最后三种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基和[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基所组成的组的基团取代，或(C₁-C₈)-烷氧基、[(C₁-C₈)-烷基]羰基或(C₁-C₈)-烷基磺酰基，其中该基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代，或

S(O)_p-R³，其中

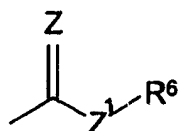
P为0、1或2并且

R³为(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-卤烷基或NR⁴R⁵，其中

R⁴、R⁵各自为相同或不同的基团H、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、(C₇-C₁₀)-芳烷基、(C₇-C₁₀)-烷芳基或(C₆-C₁₀)-芳基，其中所述的最后五种基团各自未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代，

或为NR⁴R⁵，其中R⁴、R⁵各自为相同或不同的基团H、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、(C₇-C₁₀)-芳烷基、(C₇-C₁₀)-烷芳基或(C₆-C₁₀)-芳基，其中所述的最后五种基团各自未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代，

或R¹为下式基团



其中R⁶为(C₁-C₈)-烷基，其是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代，且

Z=O或S，并且

Z¹=O或S，

R²是相同或不同的基团H、卤素、CN或(C₁-C₈)-烷基，其是未经取代或

经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代，

Y 为 O-(CR⁸R⁹)_q, S(O)_q, NH, CO(CR⁸R⁹)_q 或 CR⁸R⁹, 并且如果 B 是未经取代或经取代的芳基、未经取代或经取代的杂环基、卤素或 CN, 则 Y 也可为一键结,

其中 R⁸ 和 R⁹ 是相同或不同的基团 H、羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基或(C₁-C₈)-烷基, 其中所述的最后两种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代, 且

q 为 0、1 或 2, 并且

B 为未经取代或经取代的芳基, 例如未经取代或经取代的苯基, 或未经取代或经取代的杂环基, 如未经取代或经取代的吡啶基、吡唑基或噻吩基,

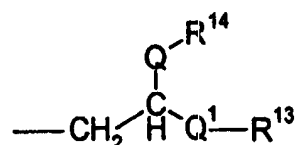
H、OH、卤素、CN、硝基、SF₅、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基或(C₂-C₈)-炔基, 其中所述的最后三种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基、[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基、(C₁-C₈)-卤烷氧基、(C₁-C₈)-卤烷硫基和(C₁-C₈)-烷氧基-(C₁-C₈)-烷氧基所组成的组的基团所取代, 或酰基, 例如[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基, 如直链或支链[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基或[(C₃-C₆)-环烷基]-羰基、(C₆-C₁₄)-芳基羰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基或(C₆-C₁₄)-芳基磺酰基, 其中所述基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基、[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基、(C₁-C₈)-卤烷氧基、(C₁-C₈)-卤烷硫基和 CN 所组成的组的基团所取代, 或

NR¹¹R¹², 其中

R¹¹, R¹² 各自是相同或不同的基团 H、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、(C₇-C₁₀)-芳烷基、(C₇-C₁₀)-烷芳基、(C₆-C₁₀)-芳基或杂芳基, 其中所述的最后六种基团各自未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基和(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代, 或酰基, 例

如 [(C₁-C₈)-烷基]羰基如直链或支链 [(C₁-C₈)-烷基]羰基或 [(C₃-C₆)-环烷基]羰基、(C₆-C₁₄)-芳基羰基、(C₆-C₁₄)-芳基-(C₁-C₈)-烷基羰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基或 (C₆-C₁₄)-芳基磺酰基, 其中所述基团各自未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基、[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基、(C₁-C₈)-卤烷氧基、(C₁-C₈)-卤烷硫基和 CN 所组成的组的基团所取代, 或

B 为下式基团



其中 R¹³ 为 (C₁-C₈)-烷基, 其未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代,

R¹⁴ 为 (C₁-C₈)-烷基, 其未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代,

或 R¹³ 与 R¹⁴ 一起形成环,

Q 为 O 或 S, 并且

Q¹ 为 O 或 S。

式 (I) 及下文中, 含碳的基团如烷基、烷氧基、卤烷基、烷氨基和烷硫基, 以及相应的不饱和和/或经取代的基团的碳主链可为直链或支链, 或当碳数是 3 以上时, 也可为环状。除非另有陈述, 优选低级碳主链, 例如具有 1 至 6 个碳原子, 或若为不饱和基团, 则具有 2 至 6 个碳原子。烷基, 包括复合意义, 例如烷氧基、卤烷基等, 如甲基、乙基、正-、异-或环-丙基、正-、异-、叔-、2-或环-丁基、戊基、己基如正己基、异己基及 1, 3-二甲基丁基、庚基如正庚基、1-甲基己基及 1, 4-二甲基戊基; 烯基及炔基具有对应于烷基的可能不饱和基团的意义; 烯基为例如烯丙基、1-甲基丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、1-甲基丁-3-烯-1 基和 1-甲基丁-2-烯-1-基; 炔基为例如炔丙基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、1-甲基丁-3-炔-1-基。

卤素为例如氟、氯、溴或碘。卤烷基、-链烯基及-炔基分别为烷基、链烯基及炔基, 它们是部分或完全经卤素所取代, 优选氟、氯和/或溴,

尤其是氟或氯，例如 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CF_3CF_2 、 CH_2FCHCl 、 CCl_3 、 CHCl_2 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；卤烷氧基为例如 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ 、 OCH_2CF_3 和 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；这相应地应用于卤烯基和其它经卤素取代的基团。

含烃的基团为直链、支链或环状、饱和或不饱和、脂肪族或芳族基团，其具有烃单元，例如烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烯基或芳基；在此芳基为单-、二-或多环芳族系统，例如苯基、萘基、四氢萘基、茚基、氢茚基、并环戊二烯基、茛基等，优选苯基；烃基优选具有多至 12 个碳原子的烷基、链烯基或炔基或具有 3、4、5、6 或 7 个环原子的环烷基或苯基。

芳基或芳基团为单-、二-或多环、未经取代或经取代芳族系统，例如苯基、萘基、茚基、氢茚基或并环戊二烯基、茛基，优选苯基，其可经例如一或多个（优选 1、2 或 3 个）选自由卤素如 F、Cl、Br、I（优选 F、Cl 及 Br）及烷基、卤烷基、烷氧基、卤烷氧基、羟基、氨基、硝基、氰基、烷氧羰基、烷羰基、甲酰基、氨基甲酰基、单-和二烷氨基羰基、单-和二烷氨基、烷基亚磺酰基和烷基磺酰基所组成的组的基团所取代，其中，就具有碳原子的基团而言，优选具有 1 至 4 个碳原子的基团，尤其是 1 或 2 个。在此，优选取代基通常是选自由卤素如氟和氯、 C_1 - C_4 烷基（优选甲基或乙基）、 C_1 - C_4 卤烷基（优选三氟甲基）、 C_1 - C_4 烷氧基（优选甲氧基或乙氧基）、 C_1 - C_4 卤烷氧基、硝基及氰基所组成的组。

杂环基团或环（杂环基）可以是饱和的、不饱和的或杂芳族的，以及未经取代或经取代的，其也可是稠合的；该杂环基团优选在环中含有一或多个杂原子，优选选自由 N、O 及 S 所组成的组；该杂环基团优选是具有 3 至 7 个环原子的饱和或不饱和杂环基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳族基团并且含有 1、2 或 3 个杂原子。该杂环基可以为例如杂芳族基团或环（杂芳基），例如单-、二-或多环芳族环系统，其中至少 1 环含有一或多个杂原子，如 N、O 及 S，或是部分或完全氢化的基团，例如吡咯基、哌啶基、吡唑基、吗啉基、吲哚基、喹啉基、嘧啶基、三唑基、噁唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、噻唑基、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、异噻唑基、咪唑基及苯并噁唑基。适用于经取代的杂

环基团的取代基是下述取代基，也包括氧基。该氧基也可以不同的氧化态位于杂原子上，例如 N 及 S。

经取代的基团如经取代的含烃基团，例如经取代的烷基、链烯基、炔基、芳基、苯基或经取代的杂环基或杂芳基，意指从未取代的主链衍生的经取代的基团，其中该取代基为例如一或多个（优选 1、2 或 3 个）选自由卤素、烷氧基、卤烷氧基、烷硫基、羧基、氨基、硝基、羧基、氰基、叠氮基、烷氧羰基、烷羰基、甲酰基、氨基甲酰基、单-和二烷氧羰基、经取代的氨基如酰氨基、单-和二烷基氨基、和烷基亚磺酰基、卤烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤烷基磺酰基以及若为环状基团，也为烷基及卤烷基、以及对应于所述的饱和含烃基团的不饱和脂肪族基团如链烯基、炔基、烯氧基、炔氧基等所组成的组。若为具有碳原子的基团，则优选具有 1 至 4 个碳原子的取代基，尤其是 1 或 2 个碳原子。优选取代基通常选自由卤素例如氟及氯、 (C_1-C_4) -烷基（优选甲基或乙基）、 (C_1-C_4) -卤烷基（优选三氟甲基）、 (C_1-C_4) -烷氧基（优选甲氧基或乙氧基）、 (C_1-C_4) -卤烷氧基、硝基及氰基所组成的组。在此特别优选的取代基为甲基、甲氧基、氰基和氯。

未经取代或经取代的苯基优选未经取代或经选自下组的相同或不同取代基单或多取代（优选多至三取代）的苯基：卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤烷基、 (C_1-C_4) -卤烷氧基、氰基和硝基，例如邻-、间-和对-甲苯基、二甲基苯基、2-、3-和 4-氟苯基、2-、3-和 4-三氟-和-三氟苯基、2,4-、3,5-、2,5-及 2,3-二氟苯基、邻-、间-及对-氰基苯基。

酰基为有机酸的基团，其形式上是通过从有机酸消去 OH 基团而形成，例如羧酸的基团和从其中衍生的酸如硫代羧酸、未经取代或 N-取代的亚胺羧酸的基团或碳酸单酯、未经取代或 N-取代的氨基甲酸、磺酸、亚磺酸、膦酸、次膦酸的基团。

酰基优选甲酰基或选自下组的脂族酰基： $CO-R^x$ 、 $CS-R^x$ 、 $CO-OR^x$ 、 $CS-OR^x$ 、 $CS-SR^x$ 、 SOR^y 和 SO_2R^y ，其中 R^x 及 R^y 各自为未经取代或经取代的 C_1-C_{10} -烃基、或氧羰基或胺磺酰基，其中所述的最后两种基团是未经取代、

N-单取代或 N, N-二取代的。

酰基例如甲酰基、卤烷羰基、烷羰基如 (C₁-C₄)-烷羰基、苯羰基 (其中该苯环可被如上所述的针对苯基的基团取代)、或烷氧羰基、苯氧羰基、苯甲氧羰基、烷磺酰基、烷基亚磺酰基、N-烷基-1-亚胺烷基及其它有机酸的基团。

本发明还提供式 (I) 所涵盖的所有立体异构物及其混合物。该式 (I) 化合物是含有一或多个不对称碳原子或双键, 这在通式 (I) 中没有特别提及。由特定空间形式定义的可能立体异构物如对映异构体、非对映异构体、Z 及 E 异构体均被式 (I) 所涵盖, 并且可通过常规方法从立体异构体的混合物获得或也可通过与使用立体化学纯净的起始物质结合的立体选择性反应制备。

式 (I) 化合物可形成盐类, 例如那些其中的一个杂原子 (如 N、O 或 S) 以质子化形式存在。这种盐类为例如无机酸如盐酸、氢溴酸及硫酸的盐类, 或为有机酸如甲酸、乙酸、草酸、柠檬酸或芳族羧酸如苯酸的盐类。

如果 Y 为结构元件 O-(CR^bR^b)_q 或 CO (CR^bR^b)_q, 则基团 B 可键结于 O 或 CO 或键结于 (CR^bR^b)_q; 优选 B 键结于 (CR^bR^b)_q。

优选式 (I) 化合物和/或其盐, 其中

A 为苯基或具有 5 或 6 个环原子的含有 N 或 S 的杂芳族基团, 在与键结有 X 的环原子成间位的两环原子之一上, 该基团具有选自下组的取代基: CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、OCH₃、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃ 及 CN、优选选自由 CH₂F、CHF₂、CF₃、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃ 及 CN 所组成的组, 尤其优选的是选自由 CF₃、OCF₃ 及 CN 所组成的组, 以及任选第二个取代基, 选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈) 烷硫基所组成的组, 其中所述的最后三个基团各自为未经取代或经一或多个选自由卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈) 烷硫基所组成的组的基团所取代, 例如 (C₁-C₈)-卤烷基、(C₁-C₈)-卤烷氧基、(C₁-C₈) 卤烷硫基或 (C₁-C₈)-烷氧基-(C₁-C₈)-烷氧基,

X 为 O、S 或 CH₂,

R^1 为羟基、卤素、CN、NC、CHO、CO(C₁-C₈)-烷基或 COO(C₁-C₈)-烷基，其中该烷基未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基及 [(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基所组成的组的基团取代，或为 CONH₂、CSNH₂、硝基、SF₅、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基或 (C₁-C₈)-烷氧基，其中所述的最后三种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团取代，

R^2 是相同或不同的基团 H、卤素、CN 或 (C₁-C₈)-烷基，其是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代，

Y 为 O-(CR⁸R⁹)_q、S(O)_q、NH、CO(CR⁸R⁹)_q 或 CR⁸R⁹，并且如果 B 是未经取代或经取代的芳基、未经取代或经取代的杂环基、卤素或 CN，则 Y 也可为一键结，

其中 R⁸ 及 R⁹ 是相同或不同的基团 H、羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基或 (C₁-C₈)-烷基，其中所述的最后两种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及 (C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代，且

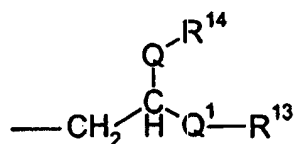
q=0、1 或 2，并且

B 为芳基（例如苯基）或 5 或 6 元杂环基，例如 5 元或 6 元含 N 或含 S 的杂芳族基团，其中所述的基团是未经取代或经一或多个选自下组的基团所取代：羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-烷氧基、卤代-(C₁-C₈)-烷基、卤代-(C₁-C₈)-烷氧基、卤代-(C₁-C₈)-烷硫基和 (C₁-C₈)-烷氧基-(C₁-C₈)-烷氧基，或 H、OH、卤素、CN、硝基、SF₅、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基或 (C₂-C₈)-炔基，其中所述的最后三种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基、[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基和 (C₁-C₈)-烷氧基-(C₁-C₈)-烷氧基所组成的组的基团所取代，或

酰基，例如 [(C₁-C₈)-烷基]-羰基如直链或支链 [(C₁-C₈)-烷基]-羰基或

[(C₃-C₈)-环烷基]羰基、(C₆-C₁₄)-芳基羰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基或(C₆-C₁₄)-芳基磺酰基,其中所述基团各自是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基、[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基、(C₁-C₈)-卤烷氧基和(C₁-C₈)-卤烷硫基所组成的组的基团所取代,或NR¹¹R¹²,其中

R¹¹, R¹²分别是相同或不同的基团H、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-链烯基、(C₇-C₁₀)-芳烷基、(C₇-C₁₀)-烷芳基、(C₆-C₁₀)-芳基或杂芳基,其中所述的最后六种基团各未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基和(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代,或酰基,例如[(C₁-C₈)-烷基]-羰基,如直链或支链[(C₁-C₈)-烷基]羰基或[(C₃-C₆)-环烷基]羰基、(C₆-C₁₄)-芳基羰基、(C₆-C₁₄)-芳基-(C₁-C₈)-烷基羰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基或(C₆-C₁₄)-芳基磺酰基,其中每个所述基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、(C₁-C₈)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₈)-烷基磺酰基、[(C₁-C₈)-烷氧基]-羰基、(C₁-C₈)-卤烷氧基、(C₁-C₈)-卤烷硫基和CN所组成的组的基团所取代,或B为下式基团



其中R¹³为(C₁-C₈)-烷基,其是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代,

R¹⁴为(C₁-C₈)-烷基,其是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、(C₁-C₈)-烷氧基及(C₁-C₈)-烷硫基所组成的组的基团所取代,或R¹³与R¹⁴一起形成环,

Q为O或S,且

Q¹为O或S。

特别优选的式(I)化合物和/或其盐是其中

A为式(A')的基团



其中 R^{15} 是选自由 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 OCH_3 、 OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 和 CN 所组成的组，优选由 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 和 CN 所组成的组，尤其优选的是由 CF_3 、 OCF_3 和 CN 所组成的组，

R^{15} 为卤素、 CN 、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -烷氧基或 (C_1-C_8) -烷硫基，其中所述的最后三种基团是未经取代或经一或多个选自由卤素、 CN 、 (C_1-C_8) -烷氧基及 (C_1-C_8) -烷硫基所组成的组的基团所取代，例如 (C_1-C_8) -卤烷基、 (C_1-C_8) -卤烷氧基、 (C_1-C_8) -卤烷硫基或 (C_1-C_8) -烷氧基- (C_1-C_8) -烷氧基，

I 为零或 1，

V 为 CH 或 $N(C_1-C_8)$ -烷基，

W 为 N 、 S 、 $N-CH$ 或 $CH-CH$ ，

X 为 O 、 S 或 CH_2 ，

R^1 为羟基、卤素（优选氟、氯、溴或碘）、 CN 、 NC 、 CHO 、 $CONH_2$ 、 $CSNH_2$ 、硝基、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_8) -链烯基、 $CO(C_1-C_8)$ -烷基、 $COO(C_1-C_8)$ -烷基或 (C_1-C_8) -烷氧基，其中所述的最后五种基团是未经取代或经一或多个选自由羟基、卤素、 CN 、 (C_1-C_8) -烷氧基及 (C_1-C_8) -烷硫基所组成的组的基团所取代，

R^2 是相同或不同的基团 H 、卤素（优选氟或氯）、或 CN ，

Y 为 $O-(CR^8R^9)_q$ 、 $S(O)_q$ 、 NH 、 $CO(CR^8R^9)_q$ 或 CR^8R^9 ，并且如果 B 是未经取代或经取代的芳基、未经取代或经取代的杂环基、卤素或 CN ，则 Y 也可为一键结，

其中 R^8 及 R^9 是相同或不同的基团 H 、羟基、卤素、 CN 、 (C_1-C_8) -烷氧基或 (C_1-C_8) -烷基，其中所述的最后两种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、 CN 、 (C_1-C_8) -烷氧基及 (C_1-C_8) -烷硫基所组成的组的基团所取代，并且

q 为 0、1 或 2，并且

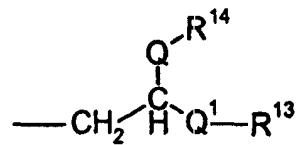
B 为芳基(例如苯基)或5或6元杂环基,例如5元或6元含N或含S的杂芳族基团,其中所述的基团是未经取代或经一或多个选自由下列基团组成的组的基团所取代:羟基、卤素、CN、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -烷氧基、卤代- (C_1-C_8) -烷基、卤代- (C_1-C_8) -烷氧基、卤代- (C_1-C_8) -烷硫基和 (C_1-C_8) -烷氧基- (C_1-C_8) -烷氧基,

H、OH、卤素、CN、硝基、 SF_5 、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_8) -链烯基或 (C_2-C_8) -炔基,其中所述的最后三种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、 (C_1-C_8) -烷氧基、 (C_1-C_8) -烷硫基、 (C_1-C_8) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_8) -烷基磺酰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]-羰基、 (C_1-C_8) -卤烷氧基、 (C_1-C_8) -卤烷硫基及 (C_1-C_8) -烷氧基- (C_1-C_8) -烷氧基所组成的组的基团所取代,或酰基,例如 $[(C_1-C_8)$ -烷基]羰基,如直链或支链 $[(C_1-C_8)$ -烷基]羰基或 $[(C_3-C_6)$ -环烷基]羰基、 (C_6-C_{14}) -芳基羰基、 (C_1-C_8) -烷基磺酰基或 (C_6-C_{14}) -芳基磺酰基,其中所述基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、 (C_1-C_8) -烷氧基、 (C_1-C_8) -烷硫基、 (C_1-C_8) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_8) -烷基磺酰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]-羰基、 (C_1-C_8) -卤烷氧基及 (C_1-C_8) -卤烷硫基所组成的组的基团所取代,或

NHR^{12} , 其中

R^{12} 为H、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_8) -链烯基、 (C_7-C_{10}) -芳烷基、 (C_7-C_{10}) -烷芳基、 (C_6-C_{10}) -芳基或杂芳基,其中所述的最后六种基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、 (C_1-C_8) -烷氧基及 (C_1-C_8) -烷硫基所组成的组的基团所取代,或酰基,例如 $[(C_1-C_8)$ -烷基]-羰基,如直链或支链 $[(C_1-C_8)$ -烷基]羰基或 $[(C_3-C_6)$ -环烷基]羰基、 (C_6-C_{14}) -芳基羰基、 (C_6-C_{14}) -芳基- (C_1-C_8) -烷基羰基、 (C_1-C_8) -烷基磺酰基或 (C_6-C_{14}) -芳基磺酰基,其中每个所述基团是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、 (C_1-C_8) -烷氧基、 (C_1-C_8) -烷硫基、 (C_1-C_8) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_8) -烷基磺酰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]-羰基、 (C_1-C_8) -卤烷氧基、 (C_1-C_8) -卤烷硫基和CN所组成的组的基团所取代,或

B为下式基团



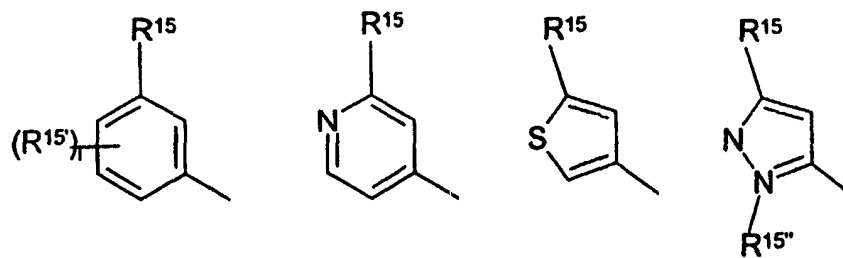
其中 R^{13} 为 (C_1-C_8) -烷基，其是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、 (C_1-C_8) -烷氧基及 (C_1-C_8) -烷硫基所组成的组的基团所取代，

R^{14} 为 (C_1-C_8) -烷基，其是未经取代或经例如一或多个选自由羟基、卤素、CN、 (C_1-C_8) -烷氧基及 (C_1-C_8) -烷硫基所组成的组的基团所取代，
或 R^{13} 与 R^{14} 一起形成环，

Q 为 O 或 S，且

Q^1 为 O 或 S。

特别优选的式 (I) 化合物和/或其盐是其中 A 为具有以下通式的经取代的苯基、吡啶基、噻吩基或吡唑基

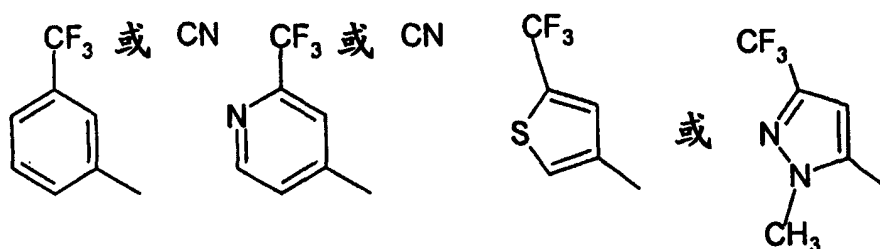


其中 R^{15} 是选自由 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 OCH_3 、 OCH_2F 、 OCHF_2 、 OCF_3 和 CN 所组成的组的基团，优选由 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 OCH_2F 、 OCHF_2 、 OCF_3 和 CN 所组成的组的基团，尤其优选是由 CF_3 、 OCF_3 及 CN 所组成的组，而 CF_3 或 CN 是特别优选的，

$\text{R}^{15'}$ 为 (C_1-C_8) -烷基，如甲基、卤素或 CN，

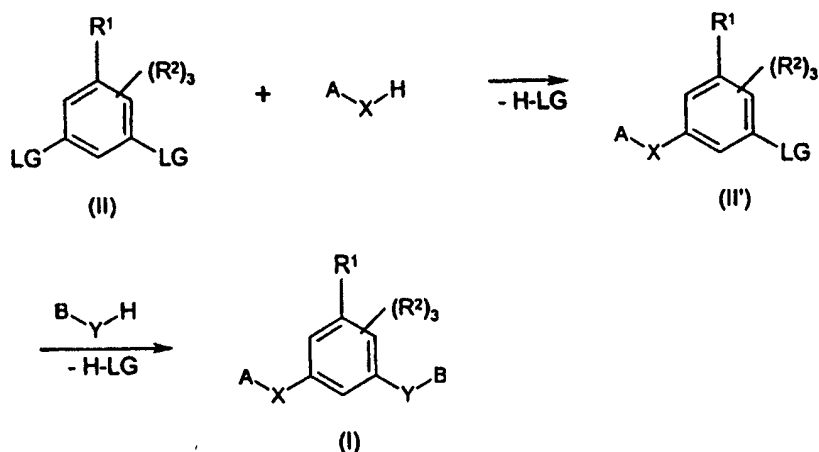
$\text{R}^{15''}$ 为 (C_1-C_8) -烷基，如甲基，且

I 为零或 1，A 优选是下式的基团



本发明还提供一种制备通式 (I) 化合物和/或其盐的方法。本发明式 (I) 化合物可采用已知方法制备。特别有益的是例如下列合成法:

若例如式 (II) 化合物与 A-X-H 型亲核剂及与 B-Y-H 型亲核剂反应, 则本发明方法 (a1) 的反应过程可通过下述反应方程式描述:

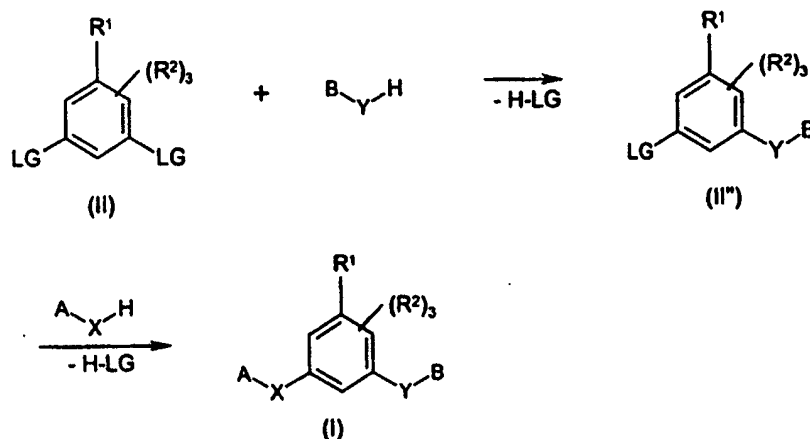


式 (II) 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (a1) 中作为起始物质使用的苯基衍生物提供一般定义。通式 (II) 中, R^1 及 R^2 是如前述式 (I) 的定义, 包括所示的优选范围, 并且 LG 是相同或不同的离去基团, 如卤素或拟卤素, 例如 CN。通式 A-X-H 和 B-Y-H 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (a1) 中作为起始物质使用的亲核剂提供一般定义, 其中 A、X、B 及 Y 具有上述本发明式 (I) 化合物所描述的相关定义, 包括所示的优选范围, 且 H 为氢。

通式 (II) 的起始物质、通式 A-X-H 和通式 B-Y-H 是已知和/或商购可得 (参照例如 Chem. Het. Compounds 33, 1997, 995-996; Synthesis (2000) 1078-1080 页)。转化成式 (I) 化合物可根据已知方法进行 (参照例如 J. Med. Chem. 29 (1986) 887-889; J. Med. Chem. 39 (1996) 347-349)。该反应可在存在或不存在促进该反应或至少对于该反应无负面影响的溶剂下进行。优选为极性、非质子溶剂或质子溶剂, 如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砷、环丁砷、乙腈、甲基乙基酮或醚类如二噁烷或四氢呋喃、或醇类或水或所述溶剂的混合物。该反应在介于室温与反应混合物回流温度之间进行, 优选在高温下, 尤其是回流温度。该反应可在碱如碱金属氢氧化物、碱土金属氢氧化物、

炔氧基碱金属、碱金属卤化物、碱金属氢化物或有机碱存在下进行，例如氢氧化钾、氢氧化钠、乙醇钠、甲醇钠、氟化铯、三乙胺及氢化钠。该反应可以单罐反应或分步骤进行。

例如，若式 (II) 化合物与 B-Y-H 型亲核剂并且与 A-X-H 型亲核剂进行反应，则本发明方法 (a2) 的反应过程可通过以下反应方程式描述：

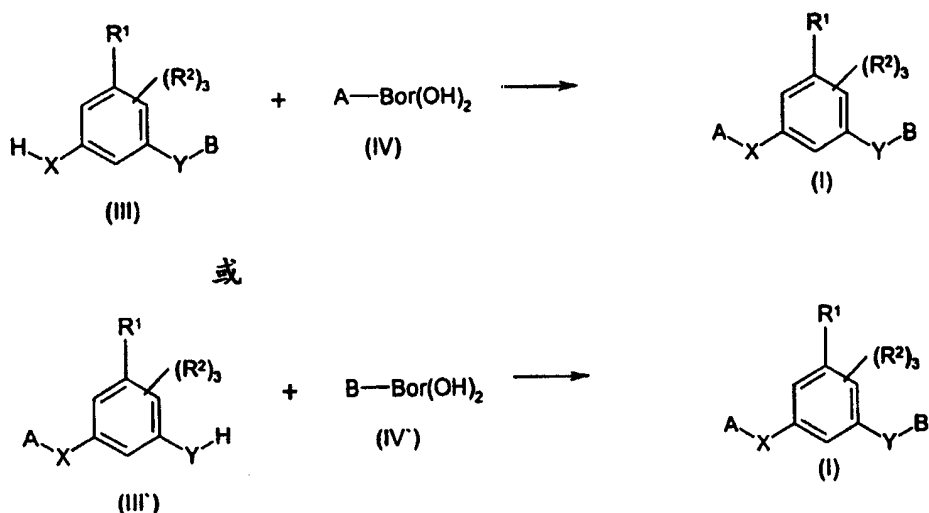


式 (II) 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (a2) 中作为起始物质使用的苯基衍生物提供一般定义。式 (II) 中，R¹ 及 R² 是如前述式 (I) 的定义，包括所示优选范围，并且 LG 是相同或不同的离去基团，如卤素或拟卤素，例如 CN。

通式 A-X-H 和 B-Y-H 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (a2) 中作为起始物质使用的亲核剂提供一般定义，其中 A、X、B 及 Y 优选地具有上述本发明式 (I) 化合物所描述的相关定义，包括所示的优选范围，并且 H 为氢。通式 (II) 的起始物质，式 A-X-H 和通式 B-Y-H 是已知的和/或商购可得 (参照例如 Chem. Het. Compounds 33, 1997, 995-996; Synthesis (2000) 1078-1080 页)。转化成式 (I) 化合物可根据已知方法进行 (参照例如 J. Med. Chem. 29 (1986) 887-889; J. Med. Chem. 39 (1996) 347-349)。该反应可在存在或不在于用于促进该反应或至少对于该反应无负面影响的溶剂下进行。优选为极性、非质子溶剂或质子溶剂，如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜、环丁砜、乙腈、甲基乙基酮或醚类如二噁烷或四氢呋喃、或醇类或水或所述溶剂的混合物。该反应在介于室温与反应混合物回流温度之间进行，优选在高温下，尤其是回流温度。该反应可在碱如碱金属氢氧化物、碱土金属

氢氧化物、烃氧基碱金属、碱金属卤化物、碱金属氢化物或有机碱存在下进行，例如氢氧化钾、氢氧化钠、乙醇钠、甲醇钠、氟化铯、三乙胺及氯化钠。该反应可以单罐反应或分步骤进行。

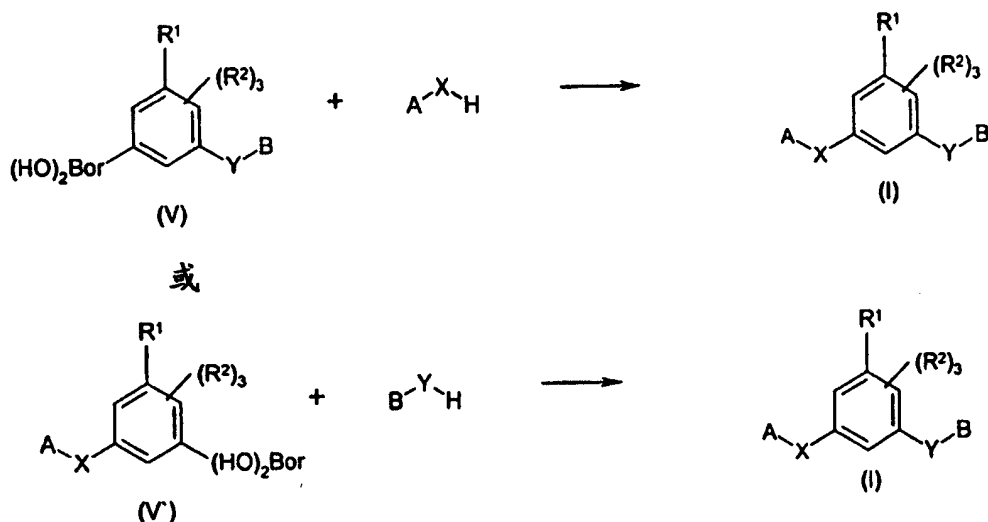
例如，若通式 (III) 或 (III') 的化合物与 (IV) 或 (IV') 型硼酸衍生物反应，则本发明方法 (b) 的反应过程可通过以下偶联反应的反应方程式描述：



式 (III) 和 (III') 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (b) 中作为起始物质使用的苯基衍生物提供一般定义。式 (III) 和 (III') 中， R^1 、 R^2 、X、Y、A 及 B 是如前述式 (I) 中的定义，包括所示优选范围。在本发明制备式 (I) 化合物的方法 (b) 中作为起始物质使用的式 (IV) 和 (IV') 硼酸衍生物分别以式 $\text{A}-\text{Bor}(\text{OH})_2$ 及 $\text{B}-\text{Bor}(\text{OH})_2$ 为特征，其中 A 和 B 具有上述本发明式 (I) 化合物所描述的相关定义，包括所示的优选范围。该偶联反应通常是在过渡金属络合物存在下进行，例如 Tetrahedron Letters 39 (1998) 2933 ff. 中所述。优选过渡金属为 Cu、Pd 或 Ni。该反应可在不存在或存在促进该反应或至少对该反应无负面影响的溶剂下进行。通式 (III) 及 (III') 及通式 (IV) 及 (IV') 的起始物质是已知和/或商购可得和/或可通过已知方法制备 (参照例如 J. Organomet. Chem. 309 (1986) 241-246; J. Amer. Chem. Soc. 112 (1990) 8024-8034; EP 1108720)。该反应可在不存在或存在促进该反应或至少

对该反应无负面影响的溶剂下进行。优选溶剂为极性或非极性、非质子溶剂或质子溶剂，如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砷、环丁砷、二氯甲烷、二氯乙烷、乙腈或醚类如二噁烷或四氢呋喃、或所述溶剂的混合物。该反应是在介于室温与反应混合物回流温度之间进行的，优选在高温下，尤其是回流温度。该反应可在无机或有机碱存在下进行，例如三乙胺、吡啶或氢氧化铯。该反应可于分子筛的存在或不存在下进行。

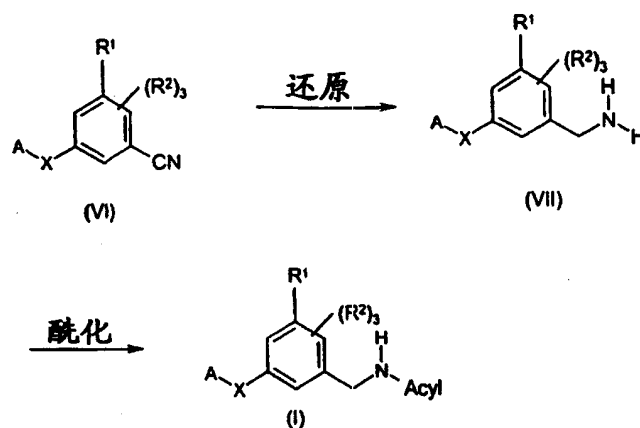
例如，若通式 (V) 或 (V') 的硼酸衍生物与 A-X-H 或 B-Y-H 型亲核剂反应，则本发明方法 (c) 的反应过程可使用以下偶联反应的反应方程式描述：



式 (V) 及 (V') 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (c) 中作为起始物质使用的苯基衍生物提供一般定义。式 (V) 及 (V') 中，R¹、R²、X、Y、A 及 B 具有如前述式 (I) 的定义，包括所示优选范围。本发明制备式 (I) 化合物的方法 (c) 中作为起始物质使用的通式 A-X-H 及 B-Y-H 化合物是已知和/或商购可得，其中 A、X、B 及 Y 具有上述本发明式 (I) 化合物所描述的相关定义，包括所示的优选范围，并且 H 为氢。该反应通常是在过渡金属络合物存在下进行，例如 Tetrahedron Letters 39 (1998) 2933 ff. 中所述。优选过渡金属为 Cu, Pd 或 Ni。该反应可于不存在或存在促进该反应或至少对该反应无负面影响的溶剂下进行。通式 (V) 及 (V') 的起始物质是已知和/或商购可得和/或可通过已知方法制

备（参照例如 EP1108720 及 J. Organomet. Chem. 309 (1986) 241-246）。该反应可在不存在或存在促进该反应或至少对该反应无负面影响的溶剂下进行。优选溶剂为极性或非极性、非质子溶剂或质子溶剂，如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜、环丁砜、二氯甲烷、二氯乙烷、乙腈或醚类如二噁烷或四氢呋喃、或所述溶剂的混合物。该反应是在介于室温与反应混合物回流温度之间进行，优选在高温下，尤其是回流温度。该反应可在无机或有机碱存在下进行，例如三乙胺、吡啶或氢氧化铯。该反应可于分子筛存在或不存在下进行。

例如，若还原并酰化式 (VI) 化合物，则根据本发明方法 (d) 产生式 (I) 化合物（其中 $Y=CH_2$ 且 $B=NH$ -酰基）的反应过程可通过以下反应方程式描述：

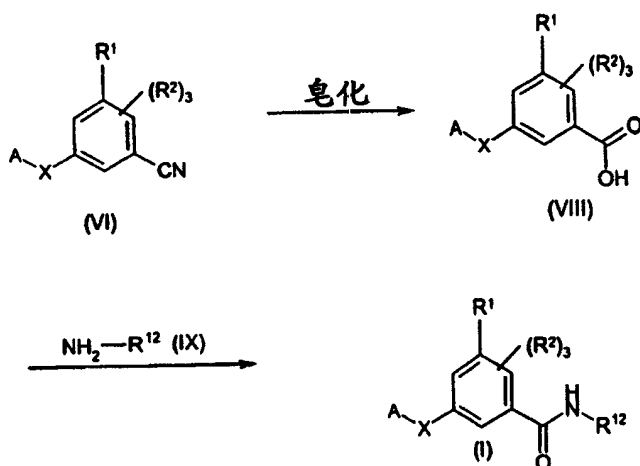


式 (VI) 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (d) 中作为起始物质使用的苜腈衍生物提供一般定义。通式 (VI) 中， R^1 、 R^2 、A 及 X 具有前述式 (I) 所示的定义，包括所示的优选范围。通式 (VI) 的起始物质是已知和/或商购可得和/或可通过已知方法制备（参照例如 Russ. J. Org. Chem. 32 (1996) 1505-1509）。腈类还原成胺类的过程已在文献中充分地描述（参照例如 Eugen Müller, Methoden der organischen Chemie (Houben-Weyl) Band XI/1, Stickstoffverbindung II, 343 页及其后, Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1957）。还有可考虑贵金属催化的氢化作用，其中钯及铂催化反应特别有益，然而，也可以使用阮内镍的还原反应。此外可采用复合氢化物试剂如氢化锂铝、硼烷-THF-复合物、过

氢化物或二硼烷进行还原。该还原可在 0 至 250℃ 的温度及 1 至 100 巴的压力下进行。

通式 (VII) 化合物可通过与酰化剂如酰基卤、异氰酸酯、氨基甲酰氯、氯甲酸酯、磺酰氯、氨磺酰氯、氧硫基氯、异硫氰酸酯反应，转化成通式 (I) 的化合物，其中 $Y=CH_2$ 且 $B=NH$ -酰基，且 A、X、 R^1 及 R^2 具有式 (I) 所示的意义。酰化的常规和特别的化学方法描述于例如：Jerry March, *Advanced Organic Chemistry (Reaction, Mechanisms and Structure)* 4th Edition, John Wiley & Sons, New York, 1992。

例如，若使通式 (VI) 化合物皂化且与胺 NH_2-R^{12} 反应，则在本发明方法 (e) 中产生式 (I) 化合物（其中 $Y=CO$ 且 $B=NHR^{12}$ ）的反应过程可通过下述反应方程式描述：



通式 (VI) 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (e) 中作为起始物质使用的苜腈衍生物提供一般定义。通式 (VI) 中， R^1 、 R^2 、A 及 X 具有前述式 (I) 所示的定义，包括所示的优选范围。通式 (VI) 的化合物可通过已知方法制备（参照例如 *Russ. J. Org. Chem.* 32, 1996, 1505-1509 页）。腈类皂化成羧酸的过程已充分地描述于文献中（参照例如 *J. Am. Chem. Soc.* 107 (1985) 796 ff. *J. Am. Chem. Soc.* 78 (1956) 450ff., *J. Org. Chem.* 51 (1986) 4169ff., *Org. Synth. Collect. Vol.* 1-4）。

式 (VIII) 及 (IX) 的化合物的反应优选在惰性有机溶剂如四氢呋喃 (THF)、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿或二甲基甲酰胺中，在介于 -10℃ 和溶剂沸点间的温度下（优选从 0℃ 至 60℃）进行，其中在第一个反应步骤中通式 (VIII) 的羧酸转化成相应的酰基卤。该酰基卤是根据

文献已知的方法制备，在用于卤化的催化量或等摩尔量的二甲基甲酰胺存在下，使用例如草酰氯、亚硫酰氯、五氯化磷、磷酰氯或三溴化磷进行反应。随后，该产物与 R^{12} 是如式 (I) 所定义的通式 (IX) 的胺反应，优选在碱或碱性催化剂存在下。适当的碱或碱性催化剂是碱金属碳酸盐、碱金属醇盐、碱土金属碳酸盐、碱土金属醇盐或有机碱如三乙胺、1,8-二氮杂二环 [5.4.0] 十一碳-7-烯 (DBU) 或 4-二甲基氨基吡啶 (DMAP)。所述的碱用量分别例如以式 (III) 的化合物计由 0.1 至 3 摩尔当量的范围内使用。通式 (IX) 的化合物以式 (VIII) 化合物计可例如等摩尔量或过量最高达 2 摩尔当量使用。对应的方法基本上是从文献得知 (比较: Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1988, Jerry March, Advanced Organic Chemistry (Reaction, Mechanisms and Structure) 4th Edition, John Wiley & Sons, New York, 1992。

例如，若式 (VI) 化合物与有机金属化合物 (例如格氏试剂、有机锌化合物或有机锂化合物) 反应，则本发明方法 (f) 中产生 Y 为 CO 的式 (I) 化合物的过程可使用以下反应方程式描述:



通式 (VI) 为本发明制备式 (I) 化合物的方法 (e) 中作为起始物质使用的苜腈衍生物提供一般定义。通式 (VI) 中， R^1 、 R^2 、A 及 X 具有前述式 (I) 所示的定义，包括所示的优选范围。所使用的例如通式 B-Mg-Br、B-Li 或 B-Zn-Cl 的有机金属化合物是商购可得的和/或可通过已知方法获得的 (参照例如 M. Schlosser: Organometallics in Synthesis, John Wiley & Sons 1994)。式 (VI) 化合物可通过已知方法制备 (参照例如 Russ. J. Org. Chem. 32, 1996, 1505-1509 页)。苜腈转化成例如二苯基甲酮衍生物的过程是充分描述于文献中 (参照例如 Tetrahedron Lett. 2000, 41(6), 937-939; J. Org. Chem. 2000, 65(12), 3861-3863; Synth. Commun. 1998, 28(21), 4067-4075; J. med. Chem. 1998, 41(22), 4400-4407; Synth. Commun. 1996, 26(4), 721-727;

Synthesis (1991) 1, 56-58; Angew. Chem., Int. Ed. Engl. 1965, 4, 1077; J. Am. Chem. Soc. 1970, 92, 336)。式 (VI) 化合物与有机金属化合物的反应优选在惰性有机溶剂如四氢呋喃 (THF)、二噁烷、二乙醚或二异丙醚中, 在介于-78℃及溶剂沸点间的温度下 (优选从 0℃至 120℃) 进行, 该反应可在催化剂如 LiI、CuI 或 CuBr 的存在或不存在下进行。

可通过前述流程图合成的式 (I) 化合物及其盐类集合也可于并行方式下制备, 并且可手动或半自动或全自动地进行。在此, 例如使反应操作、产物或中间体的加工或纯化自动化时可能的。总而言之在此理解为如同例如 S. H. DeWitt in "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Band 1, Verlag Escom 1997, 69~77 页所描述的方法。

一系列商购可得的装置, 例如 Stem Corporation 公司, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, UK, H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Deutschland 或 Radleys 公司, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB-II: 3AZ, England 所提供的, 可用于并行的反应操作和加工。通式 (I) 化合物及其盐或在制备期间所获得的中间体的并行纯化尤其可使用层析装置, 例如购自公司 ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA 的装置。

所述的装置产生各工序步骤自动化的模式化程序方式, 但手动操作必需在工序步骤之间进行。这可通过采用半整合或完全整合的自动化系统避免, 其中所述的自动化模组通过例如自动机械操作。这种自动化系统可从例如 Zymark Corporation 公司, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA 获得。

除了此处所描述之外, 式 (I) 化合物和/或其盐可部分或完全通过固相支持的方法制备。针对此目的, 合成的个别中间步骤或所有中间步骤, 或适用于所述方法的合成均与合成树脂密切相关。该固相支持合成方法充分描述于专业文献中, 例如 Barry A. Bunin 的 "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998。固相支持合成法的应用可使一系列文献已知的方法手动或自动地进行。例如, 使 "茶包法" 半自动

化 (Houghten, US 4, 631, 211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135), 其中采用购自 IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA 的产品。固相支持并行合成法的自动化能例如通过使用 Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA 或 MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Deutschland 的装置顺利地进行。

此处所述的制备方法提供以集合物质(称之为“库”)形式的式(I)化合物和/或其盐。本发明还涉及包含至少两种式(I)化合物和/或其盐的库。

本发明式(I)化合物和/或其盐, 以下总称为本发明的化合物, 对于宽谱的经济重要的有害植物如单子叶和双子叶有害植物具有优越的除草活性。即使对于难以控制的由地下茎、根茎或其它多年生器官产生出的多年生杂草, 也能被本发明的化合物良好地控制。就此, 本发明的化合物可在播种前、发芽前或发芽后施于植物、植物种籽、或植物生长区域。个别例举采用本发明的化合物控制的单子叶及双子叶杂草植物群的一些代表性实例, 而非通过例举限制于特定种类。

在单子叶类的实例中, 有一年生的燕麦、毒麦、看麦娘、草芦、稗、马唐、粟以及雀麦和莎草, 及多年生的小麦草、狗牙根、白茅、高粱和多年生的莎草。

在双子叶杂草类实例中, 作用谱扩大到如一年生的猪殃殃、董菜、婆婆纳、野芝麻、繁缕、苋、白芥、牵牛花、母菊、苘麻、黄花稔, 及多年生的旋花、蓟、酸模、蒿。

本发明活性成份对于发生于特定的稻米生长条件下的有害植物如例如稗、慈姑、泽泻、荸荠、蔗草及莎草也能有效地控制。

如果在发芽前将本发明的化合物施加于土壤表面, 则完全防止杂草植物发芽, 或杂草生长至子叶期就停止生长, 最后在经过三至四周之后就完全死亡。

如果在芽后将本发明的化合物施加至植物的绿色部分, 同样在处理之后的极短时间内生长急剧停止, 杂草植物停留在施药时的发育期, 或

在特定时间之后完全死亡，从而以这种方式在早期并且持续地消除对作物有害的杂草竞争。

尽管本发明的化合物对于单子叶和双子叶杂草具有优越的除草活性，但具有经济重要意义的作物则完全不受损害，或仅有可忽略程度的损害，例如双子叶如大豆、棉花、油菜、甜菜，尤其是大豆，或禾本科作物如小麦、大麦、燕麦、黑麦、稻或玉米。因此，本发明的化合物特别适用于在农业或观赏作物上选择性地控制不需要的植物生长（例如有害植物）。

此外，本发明物质对于作物具有优越的生长调节性。它们以调节性地参与植物新陈代谢，因此可通过例如引发脱水及生长充实而有目标地影响植物成份并且促进收获。此外，也适于一般性调节并且抑制不期望的植物生长，在该过程中不伤害该植物。由于可减少或完全预防作物倒伏，植物生长的抑制在许多单子叶及双子叶作物中扮演着重要的角色。

因为其除草和植物生长调节性质，本发明活性物质也可以用于控制已知或发展中的转基因植物作物中的有害植物。转基因植物表现有特别优越的性质，例如对某些农药的抗性，尤其是特定除草剂、对植物病害或植物病害病原体，如某些昆虫或微生物如真菌、细菌或病毒的抗性。其它的特殊性质涉及例如收成产物的数量、质量、储藏性能、组分和特定成分。因此，转基因植物以经提高的淀粉含量或经改良的淀粉品质或那些具有不同的脂肪酸组分的收成产物而著称。

优选将本发明的化合物用于具有经济重要性的转基因作物和观赏植物例如谷类如小麦、大麦、黑麦、燕麦、粟、稻、木薯（manioke）和玉米，或其它作物甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、西红柿、豌豆和其它植物。

本发明的化合物作为除草剂优选用于对抗或通过基因工程改变成对抗除草剂毒性作用的有益作物中。

传统的培育比已知植物具有改良性质的新颖植物的方式包括例如经典的培育方法和突变种的制造。可替换的是，借助基因工程方法产生具有改良性质的新颖植物（参照例如 EP-A 0221 044、EP-A 0 131 624）。

例如，下列的几项描述

- 用基因技术改变植物用于改良植物中合成的淀粉（例如 WO 92/11376、WO 92/14817 及 WO 91/19806），
- 对抗草铵膦型（比较例如 EP-A 0 242 236、EP-A 0 242 246）或草甘膦型（WO 92/00377）或磺酰脲型（EP-A 0 257 993、US-A 5013659）的特定除草剂的转基因作物植物。
- 具有产生苏云金芽孢杆菌毒素（Bt 毒素）能力的转基因作物，例如棉花，使该植物对抗特定害虫（EP-A0 142 924，EP-A0 193 259）。
- 具有改良脂肪酸组成的转基因作物（WO 91/13972）。

大量可制备具有改进性质的新颖转基因植物的分子生物技术基本上是已知的；参照例如，Sambrook 等，1989，Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; 或 Winnacker “Geneund Klone” [Genes and Clones], VCH Weinheim, 2nd edition 1996, 或 Christou, “Trends in Plant Science” 1 (1996) 423-431)。

为了进行此类的遗传改造可以将核酸分子导入质粒中，其可通过 DNA 序列的重组令序列发生诱变或改变。使用上述提到的标准方法，可以例如调换碱基、部份序列去除或加入天然序列或合成序列。为了使 DNA 片段彼此连结可以将连接物或联结子与片段连结。

具有降低活性的植物细胞的基因产物可以例如通过下列方式制备：表达至少一种相应的反义 RNA，有义 RNA 达到协同抑制效果，或表现至少一种相应的经构筑的核糖酶，其特异性切割上述提到的基因产物的转录本。

对此即可以使用一种 DNA 分子，其含有基因产物的全部的编码序列（包括可能存在的两侧翼序列），也可以使用一种 DNA 分子，其只含有部分的编码序列，该序列部份必须足够长以引起细胞的反义效果。也可以使用 DNA 序列，其具有与基因产物的编码序列高度的同源性，但不是完全地相同。

在植物中表达核酸分子时，经合成的蛋白质可定位于植物细胞的任

意室腔内。然而，要达到定位于某一特定室腔，可以例如使编码区与确保特定室腔定位的 DNA 序列连结。此类序列是本领域技术人员所熟悉的（参见例如，Braun 等，EMBO J. 11 (1992)，3219-3227；Wolter 等，Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988)，846-850；Sonnewald 等，Plant J. 1 (1991)，95-106）。

使用已知的技术可以使转基因植物细胞再生成整株植物。该转基因植物基本上可以是任意一种植物种类的植物，即包括单子叶植物又包括双子叶植物。

如此获得的转基因植物，通过同源的（=天然的）基因或基因序列的过度表达，遏抑或抑制，或通过异源的（=外来的）基因或基因序列的表达得到具有经改变的性质。

本发明的化合物可优选地用于对选自磺酰脲、草甘膦铵或草甘膦异丙铵及类似的活性物质的除草剂有抗性的转基因作物。

当本发明活性物质用于转基因作物时，除了在其它作物上可被观察到的抗有害植物的效果之外，经常对于个别转基因作物的应有具有特别效果，例如改变的或特别扩展的可被控制的杂草谱，改变的施用率（优选与转基因作物有抗性的除草剂有良好的可综合性），及对转基因作物的生长和产率上的影响。

因此本发明还提供一种本发明的化合物作为除草剂的用途，用于控制转基因作物中的有害植物。

本发明的化合物可以各种常用制剂形式施加，例如可湿性粉剂、乳油、可喷洒溶液、喷粉剂或颗粒剂。本发明因此还提供一种包含本发明的化合物的除草和植物生长调节组合物。

分别视其生物和/或物理化学参数而定可以各种方式配制本发明的化合物。适合的制剂是，例如可湿性粉剂（WP）、水溶性粉剂（SP）、水溶性浓缩物、乳油（EC）、乳液（EW）如水包油及油包水乳液、可喷洒溶液、悬浮浓缩物（SC）、油或水基的分散剂、油可溶混的溶液、胶囊悬浮液（CS）、粉剂（DP）、浸种组合物、播散及土壤施用粒剂、微粒形式的颗粒（GR）、喷洒颗粒、涂覆颗粒及吸附颗粒、水分散颗粒（WG）、

水溶性颗粒 (SG)、ULV 制剂、微型胶囊类和蜡类。

所述各种制剂类型基本上是已知的, 并例如在: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie (化学技术)", 第 7 册, C. Hauser Verlag München, 第四版, 1986; Wade van Falkenberg, "Pesticides Formulations (农药制剂)", Marcel Dekker N. Y., 1973; K. Martens, "喷雾干燥手册 (Spray Drying Handbook)", 第三版, 1979, G. Goodwin Ltd. London 中有描述。

所述必要的助剂, 如惰性材料、表面活性剂、溶剂及其它的添加剂同样是已知的并例如在: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carrier (杀虫粉尘稀释液和载体手册)", 第二版, Darland Books, Caldwell N. J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry (粘土胶体化学入门)", 第二版, J. Wiley & Sons, N. Y.; Marsden, "Solvents Guide (溶剂指南)", 第二版, Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of surface Active Agents (表面活性剂百科全书)", Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxid- addukte (表面活性的环氧乙烷加成物)", Wiss Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", 第 7 册, C. Hauser Verlag München, 第四版, 1986 中有描述。

以这些制剂为基础, 以即刻可使用形式或者桶混合形式制备具有其它农药活性物质如除草剂、杀真菌剂、杀虫剂以及安全剂、肥料和/或生长调节剂的组合物。

可湿性粉剂是均匀分散在水中的制剂, 其在活性物质以外除了稀释剂或惰性物质, 还含有离子型和/或非离子型表面活性剂 (润湿剂、分散剂), 例如: 聚氧乙基化的烷基酚类、聚乙氧基化的脂肪醇类或脂肪胺类、脂肪醇聚二醇醚硫酸酯、烷磺酸酯类或烷基苯磺酸酯类、木质磺酸钠、2,2'-二萘甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰甲基牛磺酸钠。制备可湿性粉剂时, 除草活性物质在常用装置如锤磨机、鼓

风磨机和喷气磨机中磨细，同时或随后与助剂混合。

乳油是通过将活性物质溶解在有机溶剂中，如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或还有沸点较高的芳族或烃或添加一个或多个离子型 and/或非离子型表面活性剂（乳化剂）的有机溶剂混合物。可以使用的乳化剂的实例是：烷芳基磺酸的钙盐（如十二烷基苯磺酸钙）或非离子型乳化剂，如脂肪酸聚乙二醇酯、烷芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、环氧丙烷-环氧乙烷-缩合产物、烷基聚醚、山梨糖醇酯例如山梨糖醇脂肪酸酯或聚氧乙烯山梨糖醇酯，例如聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯。

粉剂是将活性物质与磨成细粉状的固体物质加以磨碎而得，所述固体物质例如：滑石、天然粘土（如高岭土、膨润土和叶蜡石）或硅藻土。

悬浮液浓缩物可为水基或油基。例如，该制剂在添加或不添加上述其它剂型实例中的表面活性剂下，可通过利用商购可得常用球磨机湿磨制得。

乳液例如水包油乳液（EW）可以利用含水的有机溶剂，使用搅拌器、胶体研磨器和/或静态混合器，如果需要的话，可加入例如上述其它制剂类型实例中的表面活性剂。

粒剂的制备可以通过将活性物质喷洒在吸附性粒状的惰性物质上，或将活性物质浓缩物借助粘合剂（如聚乙烯醇，聚丙烯酸钠或矿物油）涂敷在载体（如砂、高岭土或粒状惰性物质）的表面上。适宜的活性物质也可以使用制造肥粒料常规方法并视需要与肥料的混合物一同粒化。

水分散性粒剂通常是利用常规方法如喷雾式干燥法、流体化床式制粒法、碟式制粒法、用高速搅拌器混合法混合和无固体惰性物质的挤压制备而成。

关于碟式、流化床、挤压机和喷撒颗粒剂的制备方法，参见下述工艺，例如“喷雾干燥手册”第3版，1979年，G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “团聚作用”，化学和工程 1967, pages 147 et seq.;

“Perry’s 化学工程师手册”，第 5 版，McGraw-Hill, New York 1973, 第 8-57 页。

对于更详细的作物保护剂制剂参见，例如 G.C. Klingman, “杂草控制科学”，John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 第 81-96 页和 J.D. Freyer, S.A. Evans, “杂草控制手册”，第 5 版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 第 101-103 页。

该农业化学制剂通常含有 0.1~99 重量%，尤其是 0.1~95 重量%的式 (I) 活性物质和/或其盐。

就可湿性粉剂而言，活性物质的浓度约为 10~90 重量%，至 100 重量%的剩余部分由常规制剂组分构成。就乳油而言，活性物质的浓度可以例如是 1~90，优选 5~80 重量%。粉状制剂含有 1~30 重量%的活性物质，通常优选 5~20 重量%的活性物质，而可喷雾型溶液含有约 0.05~80 重量%，优选 2~50 重量%的活性物质。就水分散性粒剂而言，活性物质的含量部分取决于活性物质是否是液态或固态，所使用的粒化助剂、填料等。水分散性粒剂的活性物质含量介于 1~95 重量%之间，优选介于 10~80 重量%之间。

此外，所述的活性物质制剂可包含分别为常用的胶粘剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂、溶剂、填料、载体、着色剂、消泡剂、蒸发抑制剂、pH 调节剂和粘度调节剂。

以混合制剂或桶混物形式与本发明活性物质结合的适宜活性物质例如为已知的活性物质，如除草剂、杀虫剂、杀菌剂或安全剂，如例如 Weed Research 26, (1986) 441-445, 或 “The Pesticide Manual”, 12th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc., of Chemistry, 2000 及其中所列的文献所述。例如，可提及下列活性物质作为除草剂，它们是已知的并且可与本发明的化合物结合（注：这些化合物根据国际标准化组织 (ISO) 以“通用名”表示或视需要以常用编码的化学名称表示）：乙草胺；三氟羧草醚；苯草醚；AKH 7088, 即 [[1-[5-[2-C1-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝基苯基]-2-甲氧基亚乙基]氨基]氧基]乙酸及其甲酯；甲草胺；禾草灭；莠灭净；酰嘧磺隆；杀草

强; AMS, 即氨基磺酸铵; 莎稗磷; 磺草灵; 莠去津; 唑啶炔草; 四唑嘧磺隆 (DPX-A8947); 叠氮津; 燕麦灵; BAS 516H, 即 5-F-2-苯基-4H-3, 1-苯噁嗪-4-酮; 酰肼草; BAS65400H; BAY FOE 5043; 草除灵; 氟草胺; 吡草黄; 苄嘧磺隆; 地散磷; 噻草平; 吡草酮; 氟磺胺草; 新燕灵; 噻草隆; 双丙氨酰膦; 治草醚; 双嘧苯甲酸钠; 除草定; 溴丁酰草胺; 杀草全; 溴苯腈; bromuron; 特克草; 羟草酮; 丁草胺; 抑草膦; 丁烯草胺; 草噻咪; 地乐胺; 丁氧环酮; 苏达灭; 唑酰草胺 (CH-900); 酰肼草 (caloxydim); 双酰草胺; cafentrazone-ethyl; CDAA, 即 2-Cl-N,N-二-2-丙烯基乙酰胺; CDEC, 即二乙基二硫代氨基甲酸 2-氯烯丙酯; 氯硝醚; 草灭平; 炔禾灵; 氯溴隆; 氯草灵; 伐草克; 氯甲丹; 杀草敏; 氯嘧黄隆; 草枯醚; 绿麦隆; 枯草隆; 氯苯胺灵; chloraulfuron; 敌草索; 草克乐; 环庚草醚; 醚黄隆; 烯草酮; 炔草酯及其酯衍生物 (例如炔草酯-烯丙基; 异恶草酮; 稗草胺; 环己烯草酮; 二氯皮考啉酸; 唑嘧磺胺盐; cumyluron (JC 940); 草净津; 草灭特; 环丙黄隆 (AC 104); 噻草酮; 环莠隆; cyhalofop 及其酯衍生物 (例如丁酯, 丁酯草醚 (DEH-112)); 莎草快; 环草津; 环唑草胺; 香草隆; 2,4-DB; 茅草枯; 甜菜安; 敌草净; 燕麦敌; 麦草畏; 敌草腈; 2,4-滴丙酸; 禾草灵及其酯如甲酯; 唑嘧磺胺, 即 N-(2,6-二氯苯基)-5-乙氧基-7-F-[1,2,4]三唑[1,5-c]-嘧啶-2-磺酰胺; 安塔; 枯莠隆; 野燕枯; 吡氟酰草胺; 二氟吡隆 (BAS 654 00H); 恶唑隆; 二甲草胺; 异戊乙净; 噻吩草胺 (SAN-582H); 敌米达松; 异恶草酮; 噻节因; dimetrasulfuron; 敌乐胺; 地乐酚; 特乐酚; 草乃敌; 杀草净; 敌草快; 氟硫草定; 敌草隆; DNOC; 草止津; EL77, 即 5-氟基-1-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺; 草藻灭; EPTC; 禾草畏; 丁氟消草; 胺苯黄隆; 噻二唑隆; 嗪丁草; 乙吡草黄; F5231, 即 N-[2-Cl-4-F-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧基-1H-四唑-1-基]-苯基]乙磺酰胺; ethoxyfen 及其酯 (例如乙酯, NH-252); 乙苯酰草 (HW 52); 2,4,5-涕丙酸; fenoxan; 噁唑禾草灵及高噁唑禾草灵及其酯, 例如高噁唑禾草灵乙酯及噁唑禾草灵乙酯; fenoxymid; 非草隆; 甲氟燕灵; 啶嘧黄隆; 吡氟禾草灵和精吡氟禾草灵及其酯例如吡氟禾草灵丁酯和精

吡氟禾草灵丁酯; 氟消草; 氟唑啉草; flumeturon; 酰亚胺苯氧乙酸及其酯 (例如酰亚胺苯氧乙酸戊酯, S-23031); 氟噁啉酮 (S-482); flumipropyn; 胺草唑 (KNW-739), 消草醚; 乙羧氟草醚; flupropacil (UBIC-4243); 氟啶黄隆; 氟草同; flurochloridone; 氟草烟; 吡草酮; 达草氟; 氟黄胺草醚; foramsulfuron 及其盐如钠盐; 膦胺素; 氟吡草醚; 草胺膦; 草甘膦; 氟硝磺酰胺; 吡氟黄隆及其酯 (例如甲酯, NC-319); 吡氟氟禾灵及其酯; 吡氟氟禾灵-P (即精吡氟氟禾灵) 及其酯; 六嗪同; 咪草酯; 咪草啉酸; 灭草烟; 灭草啉及盐类如铵盐; imazethamethapyr; 咪草烟; 啉咪黄隆; 环氧酮草 (MK-243); 碘黄隆及其盐, 如钠盐; 碘苯腈; 丁环隆; 异乐灵; 异丙隆; 异恶隆; 异恶草胺; 异噁氟草; 恶草醚; 卡草灵; 乳氟禾草灵; 环草定; 利谷隆; 2 甲 4 氟 (MCPA); 2 甲 4 氟丁酸 (MCPB); 2 甲 4 氟丙酸; 苯噻草胺; 氟草磺; 叠磺隆及其盐如钠盐; 苯噻草; 吡草胺; 噻啉隆; 威百亩; 灭草定; 去草酮; 苯丙隆; 色满隆; 秀谷隆; 异丙甲草胺; 啉草磺胺 (XRD 511); 甲氧隆; 赛克津; 甲黄隆; MH; 草达灭; 杀草利; 单脲硫酸二氢酯; 绿谷隆; 灭草隆; MT 128, 即 6-C1-N-(3-C1-2-丙烯基)-5-甲基-N-苯基-3-吡啶胺; MT 5950, 即 N-[3-C1-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺; 萘草胺; 草萘胺; 抑草止; NC 310, 即 4-(2, 4-二氟苯甲酰基)-1-甲基-5-苄基氧基吡啉; 草不隆; 烟嘧黄隆; nipyraclorfen; 磺乐灵; 除草醚; 硝氟草醚; 达草灭; 坪草丹; 黄草消; 炔丙噁啉草 (RP-020630); 恶草灵; 环丙氧黄隆; 氟恶嗪草 (MY-100); 氟硝草醚; 对草快; 克草猛; 胺硝草; 戊噁啉草 (KPP-314); 氟草磺胺; 敌草克; 苯敌草; 毒莠定; 派草磷; piributicarb; pirifenop-butyl; 丙草胺; 氟嘧黄隆; 环氟津; 氨基丙氟灵; 卡乐施; 丙草止津; 扑灭通; 扑草净; 扑草胺; 敌稗; 啉草酯及其酯类; 扑灭津; 苯胺灵; 异丙草胺; 拿草特; 磺亚胺草; 苄草丹; 氟丙黄隆 (CGA-152005); 广草胺; 氟啉草酯; 吡啉特; 杀草敏; 吡嘧黄隆; 苄草啉; 嘧苯草脞 (LGC-40836); 稗草畏; 达草止; 脞啉草; 嘧硫苯甲酸 (KIH-2031); pyroxofop 及其酯 (例如炔丙酯); 二氟喹啉酸; 喹草酸; quinofop 及其酯衍生物、喹禾灵和精喹禾灵及其酯衍生物例如喹禾灵乙

酯;精喹禾灵四氢糠基酯和精喹禾灵乙酯; renriduron; 玉嘧黄隆 (DPX-E 9636); S 275, 即 2-[4-C1-2-F-5-(2-丙炔氧基)苯基]-4, 5, 6, 7-四氢-2H-吡唑; 密草通; 稀禾定; 环草隆; 西玛津; 西草净; SN 106279, 即 2-[[7-[2-C1-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-萘基]氧基]丙酸及其甲酯; 磺草酮; 磺胺草唑 (FMC-97285); sulfazurone; 嘧黄隆; 草甘膦 (ICI-A0224); 磺基沙弗荣; TCA; 丙戊草胺 (GCP-5544); 丁唑隆; 特草定; 芽根灵; 猛杀草; 甲氧去草净; 特丁津; 去草净; THF 450, 即, N,N-二乙基-3-[(2-乙基-6-甲基苯基)磺酰基]-1H-1, 2, 4-三唑-1-羧酰胺; 噻醚草胺 (NSK-850); 赛唑隆; 噻氟啶草 (Mon-13200); 噻二唑胺 (SN-24085); 噻黄隆; 杀草丹; 丁草威; 脞草酮; 野麦畏; 醚苯黄隆; 苯氧丙胺津; triazofenamide; 苯黄隆; 定草酯; 灭草环; 草达津; 氟乐灵; 氟胺黄隆及酯 (例如甲酯, DPX-66037); 三甲隆; tsitodef; 灭草猛; WL 110547, 即 5-苯氧基-1-[3-(三氟甲基)苯基]-1H-四唑; 壬酸 (JTC-101); UBH-509; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KH-9201; ET-751; KIH-6127 和 KIH-2023。

本发明的化合物也可与一或多种作为安全剂的化合物结合使用。将商购常用的形式存在的制剂视需要以常用的方式稀释以备使用, 例如, 就可湿性粉剂、乳油、分散剂和水可分散性粒剂而言用水稀释。粉剂、土壤及播散施用粒剂以及可喷雾型溶液在使用前通常不再用惰性物质稀释。

本发明的化合物的施用量需根据外在条件如温度、湿度、所用除草剂的性质而变化。该施用量可大幅变化, 例如, 在 0.001 及 10.0 公斤/公顷之间或更多的活性物质, 但优选介于 0.005 及 5 公斤/公顷之间。

实施例

A. 化学实施例

缩写: 百分比及比例是以重量计, 除非有更详细的具体陈述。

i. Vak. = 在减压下

h = 小时

1. 3,5-双-(1-甲基-3-三氟甲基吡唑-5-基氧基)-苜蓿

氮气下,将2.00克(14.4毫摩尔)的3,5-二氟苜蓿预先置于15毫升环丁砜中,并且在室温下逐次少量地加入4.77克(34.5毫摩尔)碳酸钾。随后添加5.25克(31.60毫摩尔)1-甲基-3-(三氟甲基)-2-吡唑-2-酮,混合物于150℃下加热10小时,冷却至室温,将水和乙酸乙酯加入反应溶液中,溶液搅拌数分钟。分相,并且用水重复洗涤有机相,随后用氢氧化钠溶液洗涤,最后用饱和氯化钠溶液洗涤,以硫酸镁干燥,过滤并浓缩。柱层析粗产物得到3,5-双-(1-甲基-3-三氟甲基吡唑-5-基氧基)-苜蓿的白色结晶。

产率:1.19克(理论值的19%);熔点:139℃。

2. 3-氟-5-(1-甲基-3-三氟甲基吡唑-5-基氧基)-苜蓿

氮气下,将5.00克(35.9毫摩尔)的3,5-二氟苜蓿预先置于60毫升N,N-二甲基甲酰胺中,在室温下加入6.46克(46.7毫摩尔)碳酸钾和6.57克(39.5毫摩尔)的1-甲基-3-(三氟甲基)-2-吡唑-2-酮。混合物于150℃下加热2小时,冷却至室温,添加水于该反应溶液中。以庚烷/乙酸乙酯(1:1)萃取该溶液两次,并且以乙酸乙酯萃取两次。合并的相以水洗涤,随后用硫酸镁干燥,过滤且浓缩。柱层析粗产物得到3-氟-5-(1-甲基-3-三氟甲基吡唑-5-基氧基)苜蓿的白色结晶,及副产物2.8克的3,5-双-(1-甲基-3-三氟甲基-吡唑-5-基氧基)-苜蓿的白色结晶。

产率:4.19克(理论值的39%);熔点:84℃。

3. 3,5-双-(2-三氟甲基吡啶-4-基氧基)-苜蓿

氮气下,将0.556克(4.0毫摩尔)的3,5-二氟苜蓿预先置于10毫升N,N-二甲基乙酰胺中,于室温下逐次少量地加入1.22克(8.8毫摩尔)碳酸钾。随后添加1.305克(8.00毫摩尔)2-(三氟甲基)-吡啶-4-醇,混合物于150℃下加热30小时,冷却至室温,添加水及乙酸乙酯(1:1)于反应溶液中,溶液搅拌数分钟。分相,有机相重复以水洗涤,最后以饱和氯化钠溶液洗涤,以硫酸镁干燥,过滤且浓缩。粗产物进行HPLC得到3,5-双-(2-三氟甲基吡啶-4-基氧基)-苜蓿的白色结晶。

产率: 0.153 克 (理论值的 9%): $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3/TMS): δ (ppm) = 7.08 (dd, 2H, 吡啶 C-H), 7.13 (t, 1H, 苯基 C-H), 7.30 (d, 2H, 吡啶 C-H), 7.34 (d, 2H, 苯基 C-H), 8.70 (d, 2H, 吡啶 C-H)。

4. 3,5-双-(1-甲基-3-三氟甲基吡啶-5-基氧基)-苯基-1-羧酰胺

氮气下, 将 500 克 (1.16 毫摩尔) 的 3,5 双-(1-甲基-3-三氟甲基吡啶-5-基氧基)-苄腈预先置于 1.5 毫升二噁烷中, 在室温下加入 64 mg (0.5 毫摩尔) 碳酸钾。随后在 10 至 15 $^{\circ}\text{C}$ 下加入 0.5 毫升 30% 强度的过氧化氢水溶液, 在室温下搅拌混合物 1.5 小时。加工时, 加入 10 毫升水, 滤出形成的沉淀物。干燥该沉淀物, 产生白色结晶形式的 3,5-双-(1-甲基-3-三氟甲基吡啶-5-基氧基) 苯基-1-羧酰胺。

产率: 532 mg (理论值的 97%): 熔点: 203 $^{\circ}\text{C}$ 。

5. 3-(1-甲基-3-三氟甲基吡啶-5-基氧基)-5-(3-三氟甲基吡啶-1-基)-苄腈

氮气下, 将 0.131 克 (0.96 毫摩尔) 3-三氟甲基吡啶预先置于 5 毫升二甲基乙酰胺中, 在 0 $^{\circ}\text{C}$ 下加入 0.033 克 (1.1 毫摩尔) 氯化钠 (80%)。该混合物热至室温, 加入 0.250 克 (0.88 毫摩尔) 3-F-5-(1-甲基-3-三氟甲基吡啶-5-基氧基) 苄腈, 混合物于 140 $^{\circ}\text{C}$ 下加热 8 小时, 冷却至室温, 添加水于该反应溶液中, 溶液搅拌数分钟。混合物使用庚烷/乙酸乙酯 (1:1) 萃取两次, 以乙酸乙酯萃取两次。用水洗涤合并相, 随后以硫酸镁干燥, 过滤且浓缩。柱层析粗产物得到 0.240 克 3-(1-甲基-3-三氟甲基吡啶-5-基氧基)-5-(3-三氟甲基吡啶-1-基) 苄腈的白色结晶, 熔点: 116 至 117 $^{\circ}\text{C}$ 。

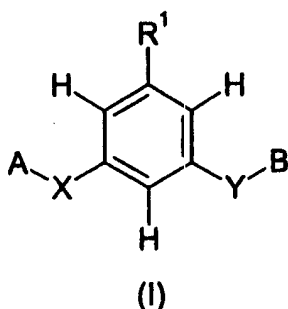
6. 5-腈-3-(1-甲基-3-三氟甲基吡啶-5-基氧基)-苄腈

氮气下, 先将 2.00 克 (13.7 毫摩尔) 5-腈-3-氟苄腈加入 25 毫升二甲基甲酰胺, 于室温下逐次少量地添加 2.27 克 (16.4 毫摩尔) 碳酸钾, 随后添加 2.50 克 (15.1 毫摩尔) 的 1-甲基-3-(三氟甲基)-2-吡啶-2-酮, 混合物于 150 $^{\circ}\text{C}$ 下加热 2 小时, 冷却至室温, 添加水及乙酸乙酯于反应溶液中, 溶液搅拌数分钟。分相, 有机相重复以水及氯化钠溶液洗涤, 随之后硫酸镁干燥, 过滤且浓缩。柱层析粗产物得到 5-腈-3-(1-甲基-3-

三氟甲基吡唑-5-基氧基)-苄腈的白色结晶。

产率: 2.49 克(理论值的 62%); $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS})$: δ (ppm) = 3.80 (s, 3H, 甲基-H), 6.54 (s, 1H, 吡唑基 C-H), 8.20 (d, 2H, 苯基 C-H), 8.38 (t, 1H, 苯基 C-H)。

下表 1 中所列的式 (Ia)、(Ib)、(Ic) 和 (Id) 的化合物可类似于上述实施例制得。式 (Ia)、(Ib)、(Ic) 和 (Id) 的化合物是具有下述不同 A-X 基团的式 (I) 化合物:



化合物 通式	(Ia)	(Ib)	(Ic)	(Id)
A-X				

表 1 中, 使用以下缩写: Me = 甲基, Et = 乙基, nPr = 正丙基, iPr = 异丙基, cPr = 环丙基, nBu = 正丁基, iBu = 异丁基, cBu = 环丁基, t-Bu = 叔丁基, cPenyl = 环戊基, cHexyl = 环己基, Ph = 苯基, Bn = 苄基。

因此在表 1 中, 当 $\text{Y} = \text{O}-\text{CH}_2$ 时, 基团 B 键结于 CH_2 基团。

表 1:

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1. a-d	苯基	O	CN				
2. a-d	萘-1-基	O	CN				
3. a-d	萘-2-基	O	CN				
4. a-d	吡啶-2-基	O	CN				
5. a-d	吡啶-3-基	O	CN				
6. a-d	吡啶-4-基	O	CN				
7. a-d	2-F-苯基	O	CN				
8. a-d	3-F-苯基	O	CN	无色树脂			
9. a-d	4-F-苯基	O	CN				
10. a-d	2,3-F ₂ -苯基	O	CN				
11. a-d	2,4-F ₂ -苯基	O	CN				
12. a-d	2,5-F ₂ -苯基	O	CN				
13. a-d	2,6-F ₂ -苯基	O	CN				
14. a-d	3,4-F ₂ -苯基	O	CN	黄色树脂			
15. a-d	3,5-F ₂ -苯基	O	CN	黄色树脂			
16. a-d	2,4,6-F ₃ -苯基	O	CN				
17. a-d	2,3,4-F ₃ -苯基	O	CN				
18. a-d	2-Cl-苯基	O	CN				
19. a-d	3-Cl-苯基	O	CN				
20. a-d	4-Cl-苯基	O	CN				
21. a-d	2,3-Cl ₂ -苯基	O	CN				
22. a-d	2,4-Cl ₂ -苯基	O	CN				
23. a-d	2,5-Cl ₂ -苯基	O	CN				
24. a-d	2,6-Cl ₂ -苯基	O	CN				
25. a-d	3,4-Cl ₂ -苯基	O	CN	黄色树脂			
26. a-d	3,5-Cl ₂ -苯基	O	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
27. a-d	2,4,6-Cl ₃ -苯基	O	CN				
28. a-d	2,3,4-Cl ₃ -苯基	O	CN				
29. a-d	3,4,5-Cl ₃ -苯基	O	CN				
30. a-d	2-F-4-Cl-苯基	O	CN	黄色树脂			
31. a-d	2-Cl-4-F-苯基	O	CN				
32. a-d	2-F-3-Cl-苯基	O	CN				
33. a-d	2-Cl-3-F-苯基	O	CN				
34. a-d	2-F-5-Cl-苯基	O	CN				
35. a-d	2-Cl-5-F-苯基	O	CN				
36. a-d	2-Cl-6-F-苯基	O	CN				
37. a-d	2-Br-苯基	O	CN				
38. a-d	3-Br-苯基	O	CN				
39. a-d	4-Br-苯基	O	CN				
40. a-d	2,3-Br ₂ -苯基	O	CN				
41. a-d	2,4-Br ₂ -苯基	O	CN				
42. a-d	2,5-Br ₂ -苯基	O	CN				
43. a-d	2-I-苯基	O	CN				
44. a-d	3-I-苯基	O	CN				
45. a-d	4-I-苯基	O	CN				
46. a-d	2-F-4-MeO-苯基	O	CN				
47. a-d	2-F-5-MeO-苯基	O	CN				
48. a-d	2-MeO-苯基	O	CN				
49. a-d	3-MeO-苯基	O	CN				
50. a-d	4-MeO-苯基	O	CN				
51. a-d	2,4-(MeO) ₂ -苯基	O	CN				
52. a-d	2,3-(MeO) ₂ -苯基	O	CN				
53. a-d	2,5-(MeO) ₂ -苯基	O	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
54. a-d	2-Me-苯基	O	CN				
55. a-d	3-Me-苯基	O	CN				
56. a-d	4-Me-苯基	O	CN				
57. a-d	2,4-(Me) ₂ -苯基	O	CN				
58. a-d	2,3-(Me) ₂ -苯基	O	CN				
59. a-d	2,5-(Me) ₂ -苯基	O	CN				
60. a-d	2,6-(Me) ₂ -苯基	O	CN				
61. a-d	2-CF ₃ -苯基	O	CN				
62. a-d	3-CF ₃ -苯基	O	CN	黄色蜡	77		
63. a-d	4-CF ₃ -苯基	O	CN				
64. a-d	2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	CN				
65. a-d	2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	CN				
66. a-d	2-CF ₃ O-苯基	O	CN				
67. a-d	3-CF ₃ O-苯基	O	CN				
68. a-d	4-CF ₃ O-苯基	O	CN				
69. a-d	5-F-吡啶-2-基	O	CN				
70. a-d	5-Cl-吡啶-2-基	O	CN				
71. a-d	5-F-吡啶-4-基	O	CN				
72. a-d	5-Cl-吡啶-4-基	O	CN				
73. a-d	2-CF ₃ -吡啶-4-基	O	CN				参见实例 3
74. a-d	2-CF ₃ -苯硫-4-基	O	CN			棕色蜡	
75. a-d	1-CH ₃ -5-CF ₃ -吡唑-3-基	O	CN	黄色油			
76. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	CN	参见实例 1		黄色树脂	黄色油
77. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	CONH ₂	参见实例 4			
78. a-d	2-CF ₃ -叠重氮-5-基	O	CN				
79. a-d	2-CN-苯基	O	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
80. a-d	3-CN-苯基	O	CN	121 - 122			
81. a-d	4-CN-苯基	O	CN				
82. a-d	3,5-(CN) ₂ -苯基	O	CN				
83. a-d	2-CN-4-F-苯基	O	CN				
84. a-d	4-CN-2-F-苯基	O	CN				
85. a-d	2-CF ₃ -噁二唑-5-基	O	CN				
86. a-d	苯基	O	Me				
87. a-d	萘-1-基	O	Me				
88. a-d	吡啶-2-基	O	Me				
89. a-d	吡啶-3-基	O	Me				
90. a-d	吡啶-4-基	O	Me				
91. a-d	2-F-苯基	O	Me				
92. a-d	3-F-苯基	O	Me				
93. a-d	4-F-苯基	O	Me				
94. a-d	2,3-F ₂ -苯基	O	Me				
95. a-d	2,4-F ₂ -苯基	O	Me				
96. a-d	2,5-F ₂ -苯基	O	Me				
97. a-d	2,6-F ₂ -苯基	O	Me				
98. a-d	3,4-F ₂ -苯基	O	Me				
99. a-d	3,5-F ₂ -苯基	O	Me				
100. a-d	2,4,6-F ₃ -苯基	O	Me				
101. a-d	2,3,4-F ₃ -苯基	O	Me				
102. a-d	3,4,5-F ₃ -苯基	O	Me				
103. a-d	2-Cl-苯基	O	Me				
104. a-d	3-Cl-苯基	O	Me				
105. a-d	4-Cl-苯基	O	Me				
106. a-d	2,3-Cl ₂ -苯基	O	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
107. a-d	2,4-Cl ₂ -苯基	O	Me				
108. a-d	2,5-Cl ₂ -苯基	O	Me				
109. a-d	2,6-Cl ₂ -苯基	O	Me				
110. a-d	3,4-Cl ₂ -苯基	O	Me				
111. a-d	3,5-Cl ₂ -苯基	O	Me				
112. a-d	2,4,6-Cl ₃ -苯基	O	Me				
113. a-d	2,3,4-Cl ₃ -苯基	O	Me				
114. a-d	2,3,6-Cl ₃ -苯基	O	Me				
115. a-d	2-F-4-Cl-苯基	O	Me				
116. a-d	2-Cl-4-F-苯基	O	Me				
117. a-d	2-F-3-Cl-苯基	O	Me				
118. a-d	2-Cl-3-F-苯基	O	Me				
119. a-d	2-F-5-Cl-苯基	O	Me				
120. a-d	2-Cl-5-F-苯基	O	Me				
121. a-d	2-Cl-6-F-苯基	O	Me				
122. a-d	2-Br-苯基	O	Me				
123. a-d	3-Br-苯基	O	Me				
124. a-d	4-Br-苯基	O	Me				
125. a-d	2,3-Br ₂ -苯基	O	Me				
126. a-d	2,4-Br ₂ -苯基	O	Me				
127. a-d	2,5-Br ₂ -苯基	O	Me				
128. a-d	2-I-苯基	O	Me				
129. a-d	3-I-苯基	O	Me				
130. a-d	4-I-苯基	O	Me				
131. a-d	2-F-4-MeO-苯基	O	Me				
132. a-d	2-F-5-MeO-苯基	O	Me				
133. a-d	2-MeO-苯基	O	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
134. a-d	3-MeO-苯基	O	Me				
135. a-d	4-MeO-苯基	O	Me				
136. a-d	2,4-(MeO) ₂ -苯基	O	Me				
137. a-d	2,3-(MeO) ₂ -苯基	O	Me				
138. a-d	2,5-(MeO) ₂ -苯基	O	Me				
139. a-d	2-Me-苯基	O	Me				
140. a-d	3-Me-苯基	O	Me				
141. a-d	4-Me-苯基	O	Me				
142. a-d	2,4-(Me) ₂ -苯基	O	Me				
143. a-d	2,3-(Me) ₂ -苯基	O	Me				
144. a-d	2,5-(Me) ₂ -苯基	O	Me				
145. a-d	2-CF ₃ -苯基	O	Me				
146. a-d	3-CF ₃ -苯基	O	Me				
147. a-d	4-CF ₃ -苯基	O	Me				
148. a-d	2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	Me				
149. a-d	2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	Me				
150. a-d	2-CF ₃ O-苯基	O	Me				
151. a-d	3-CF ₃ O-苯基	O	Me				
152. a-d	4-CF ₃ O-苯基	O	Me				
153. a-d	5-F-吡啶-2-基	O	Me				
154. a-d	5-Cl-吡啶-2-基	O	Me				
155. a-d	5-F-吡啶-4-基	O	Me				
156. a-d	5-Cl-吡啶-4-基	O	Me				
157. a-d	2-CF ₃ -吡啶-4-基	O	Me				
158. a-d	1-CH ₃ -5-CF ₃ -吡唑-3-基	O	Me				
159. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	Me				
160. a-d	2-CF ₃ -苯硫-4-基	O	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
161. a-d	2-CF ₃ -叠重氮-5-基	O	Me				
162. a-d	2-CN-苯基	O	Me				
163. a-d	3-CN-苯基	O	Me				
164. a-d	4-CN-苯基	O	Me				
165. a-d	3,5-(CN) ₂ -苯基	O	Me				
166. a-d	2-CN-4-F-苯基	O	Me				
167. a-d	4-CN-2-F-苯基	O	Me				
168. a-d	2-CF ₃ -噁二唑-5-基	O	Me				
169. a-d	苯基	O	MeO				
170. a-d	萘-1-基	O	MeO				
171. a-d	吡啶-2-基	O	MeO				
172. a-d	吡啶-3-基	O	MeO				
173. a-d	吡啶-4-基	O	MeO				
174. a-d	2-F-苯基	O	MeO				
175. a-d	3-F-苯基	O	MeO				
176. a-d	4-F-苯基	O	MeO				
177. a-d	2,3-F ₂ -苯基	O	MeO				
178. a-d	2,4-F ₂ -苯基	O	MeO				
179. a-d	2,5-F ₂ -苯基	O	MeO				
180. a-d	2,6-F ₂ -苯基	O	MeO				
181. a-d	3,4-F ₂ -苯基	O	MeO				
182. a-d	3,5-F ₂ -苯基	O	MeO				
183. a-d	2,4,6-F ₃ -苯基	O	MeO				
184. a-d	2,3,4-F ₃ -苯基	O	MeO				
185. a-d	3,4,5-F ₃ -苯基	O	MeO				
186. a-d	2-Cl-苯基	O	MeO				
187. a-d	3-Cl-苯基	O	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
188. a-d	4-Cl-苯基	O	MeO				
189. a-d	2,3-Cl ₂ -苯基	O	MeO				
190. a-d	2,4-Cl ₂ -苯基	O	MeO				
191. a-d	2,5-Cl ₂ -苯基	O	MeO				
192. a-d	2,6-Cl ₂ -苯基	O	MeO				
193. a-d	3,4-Cl ₂ -苯基	O	MeO				
194. a-d	3,5-Cl ₂ -苯基	O	MeO				
195. a-d	2,4,6-Cl ₃ -苯基	O	MeO				
196. a-d	2,3,4-Cl ₃ -苯基	O	MeO				
197. a-d	2-F-4-Cl-苯基	O	MeO				
198. a-d	2-Cl-4-F-苯基	O	MeO				
199. a-d	2-F-3-Cl-苯基	O	MeO				
200. a-d	2-Cl-3-F-苯基	O	MeO				
201. a-d	2-F-5-Cl-苯基	O	MeO				
202. a-d	2-Cl-5-F-苯基	O	MeO				
203. a-d	2-Cl-6-F-苯基	O	MeO				
204. a-d	2-Br-苯基	O	MeO				
205. a-d	3-Br-苯基	O	MeO				
206. a-d	4-Br-苯基	O	MeO				
207. a-d	2,4-Br ₂ -苯基	O	MeO				
208. a-d	2,5-Br ₂ -苯基	O	MeO				
209. a-d	2-I-苯基	O	MeO				
210. a-d	3-I-苯基	O	MeO				
211. a-d	4-I-苯基	O	MeO				
212. a-d	2-F-4-MeO-苯基	O	MeO				
213. a-d	2-F-5-MeO-苯基	O	MeO				
214. a-d	2-MeO-苯基	O	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
215. a-d	3-MeO-苯基	O	MeO				
216. a-d	4-MeO-苯基	O	MeO				
217. a-d	2,4-(MeO) ₂ -苯基	O	MeO				
218. a-d	3,4-(MeO) ₂ -苯基	O	MeO				
219. a-d	2-Me-苯基	O	MeO				
220. a-d	3-Me-苯基	O	MeO				
221. a-d	4-Me-苯基	O	MeO				
222. a-d	2,4-(Me) ₂ -苯基	O	MeO				
223. a-d	2-CF ₃ -苯基	O	MeO				
224. a-d	3-CF ₃ -苯基	O	MeO				
225. a-d	4-CF ₃ -苯基	O	MeO				
226. a-d	2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	MeO				
227. a-d	2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	MeO				
228. a-d	2-CF ₃ O-苯基	O	MeO				
229. a-d	3-CF ₃ O-苯基	O	MeO				
230. a-d	4-CF ₃ O-苯基	O	MeO				
231. a-d	5-F-吡啶-2-基	O	MeO				
232. a-d	5-Cl-吡啶-2-基	O	MeO				
233. a-d	5-F-吡啶-4-基	O	MeO				
234. a-d	5-Cl-吡啶-4-基	O	MeO				
235. a-d	2-CF ₃ -吡啶-4-基	O	MeO				
236. a-d	2-CF ₃ -苯硫-4-基	O	MeO				
237. a-d	1-CH ₃ -5-CF ₃ -吡唑-3-基	O	MeO				
238. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	MeO				
239. a-d	2-CF ₃ -叠重氮-5-基	O	MeO				
240. a-d	2-CN-苯基	O	MeO				
241. a-d	3-CN-苯基	O	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
242. a-d	4-CN-苯基	O	MeO				
243. a-d	3,5-(CN) ₂ -苯基	O	MeO				
244. a-d	2-CN-4-F-苯基	O	MeO				
245. a-d	4-CN-2-F-苯基	O	MeO				
246. a-d	2-CF ₃ -噁二唑-5-基	O	MeO				
247. a-d	苯基	O	CHO				
248. a-d	萘-1-基	O	CHO				
249. a-d	吡啶-2-基	O	CHO				
250. a-d	吡啶-3-基	O	CHO				
251. a-d	吡啶-4-基	O	CHO				
252. a-d	2-F-苯基	O	CHO				
253. a-d	3-F-苯基	O	CHO				
254. a-d	4-F-苯基	O	CHO				
255. a-d	2,3-F ₂ -苯基	O	CHO				
256. a-d	2,4-F ₂ -苯基	O	CHO				
257. a-d	2,5-F ₂ -苯基	O	CHO				
258. a-d	2,6-F ₂ -苯基	O	CHO				
259. a-d	3,4-F ₂ -苯基	O	CHO				
260. a-d	3,5-F ₂ -苯基	O	CHO				
261. a-d	2,4,6-F ₃ -苯基	O	CHO				
262. a-d	2,3,4-F ₃ -苯基	O	CHO				
263. a-d	2-Cl-苯基	O	CHO				
264. a-d	3-Cl-苯基	O	CHO				
265. a-d	4-Cl-苯基	O	CHO				
266. a-d	2,3-Cl ₂ -苯基	O	CHO				
267. a-d	2,4-Cl ₂ -苯基	O	CHO				
268. a-d	2,5-Cl ₂ -苯基	O	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
269. a-d	2,6-Cl ₂ -苯基	O	CHO				
270. a-d	3,4-Cl ₂ -苯基	O	CHO				
271. a-d	3,5-Cl ₂ -苯基	O	CHO				
272. a-d	2,3,4-Cl ₃ -苯基	O	CHO				
273. a-d	2-F-4-Cl-苯基	O	CHO				
274. a-d	2-Cl-4-F-苯基	O	CHO				
275. a-d	2-F-3-Cl-苯基	O	CHO				
276. a-d	2-Cl-3-F-苯基	O	CHO				
277. a-d	2-F-5-Cl-苯基	O	CHO				
278. a-d	2-Cl-5-F-苯基	O	CHO				
279. a-d	2-Cl-6-F-苯基	O	CHO				
280. a-d	2-Br-苯基	O	CHO				
281. a-d	3-Br-苯基	O	CHO				
282. a-d	4-Br-苯基	O	CHO				
283. a-d	2,3-Br ₂ -苯基	O	CHO				
284. a-d	2,5-Br ₂ -苯基	O	CHO				
285. a-d	2-I-苯基	O	CHO				
286. a-d	3-I-苯基	O	CHO				
287. a-d	4-I-苯基	O	CHO				
288. a-d	2-F-4-MeO-苯基	O	CHO				
289. a-d	2-F-5-MeO-苯基	O	CHO				
290. a-d	2-MeO-苯基	O	CHO				
291. a-d	3-MeO-苯基	O	CHO				
292. a-d	4-MeO-苯基	O	CHO				
293. a-d	2,4-(MeO) ₂ -苯基	O	CHO				
294. a-d	2,3-(MeO) ₂ -苯基	O	CHO				
295. a-d	2-Me-苯基	O	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
296. a-d	3-Me-苯基	O	CHO				
297. a-d	4-Me-苯基	O	CHO				
298. a-d	2,4-(Me) ₂ -苯基	O	CHO				
299. a-d	2,3-(Me) ₂ -苯基	O	CHO				
300. a-d	2,5-(Me) ₂ -苯基	O	CHO				
301. a-d	2-CF ₃ -苯基	O	CHO				
302. a-d	3-CF ₃ -苯基	O	CHO				
303. a-d	4-CF ₃ -苯基	O	CHO				
304. a-d	2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	CHO				
305. a-d	2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	CHO				
306. a-d	2-CF ₃ O-苯基	O	CHO				
307. a-d	3-CF ₃ O-苯基	O	CHO				
308. a-d	4-CF ₃ O-苯基	O	CHO				
309. a-d	5-F-吡啶-2-基	O	CHO				
310. a-d	5-Cl-吡啶-2-基	O	CHO				
311. a-d	5-F-吡啶-4-基	O	CHO				
312. a-d	5-Cl-吡啶-4-基	O	CHO				
313. a-d	2-CF ₃ -吡啶-4-基	O	CHO				
314. a-d	2-CF ₃ -苯硫-4-基	O	CHO				
315. a-d	1-CH ₃ -5-CF ₃ -吡唑-3-基	O	CHO				
316. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	CHO				
317. a-d	2-CF ₃ -叠重氮-5-基	O	CHO				
318. a-d	2-CN-苯基	O	CHO				
319. a-d	3-CN-苯基	O	CHO				
320. a-d	4-CN-苯基	O	CHO				
321. a-d	3,5-(CN) ₂ -苯基	O	CHO				
322. a-d	2-CN-4-F-苯基	O	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
323. a-d	4-CN-2-F-苯基	O	CHO				
324. a-d	2-CF ₃ -噁二唑-5-基	O	CHO				
325. a-d	苯基	O	NO ₂				
326. a-d	萘-1-基	O	NO ₂				
327. a-d	吡啶-2-基	O	NO ₂				
328. a-d	吡啶-3-基	O	NO ₂				
329. a-d	吡啶-4-基	O	NO ₂				
330. a-d	2-F-苯基	O	NO ₂				
331. a-d	3-F-苯基	O	NO ₂				
332. a-d	4-F-苯基	O	NO ₂				
333. a-d	2,3-F ₂ -苯基	O	NO ₂				
334. a-d	2,4-F ₂ -苯基	O	NO ₂				
335. a-d	2,5-F ₂ -苯基	O	NO ₂				
336. a-d	2,6-F ₂ -苯基	O	NO ₂				
337. a-d	3,4-F ₂ -苯基	O	NO ₂				
338. a-d	3,5-F ₂ -苯基	O	NO ₂				
339. a-d	2,4,6-F ₃ -苯基	O	NO ₂				
340. a-d	2,3,5-F ₃ -苯基	O	NO ₂				
341. a-d	3,4,5-F ₃ -苯基	O	NO ₂				
342. a-d	2-Cl-苯基	O	NO ₂				
343. a-d	3-Cl-苯基	O	NO ₂				
344. a-d	4-Cl-苯基	O	NO ₂				
345. a-d	2,3-Cl ₂ -苯基	O	NO ₂				
346. a-d	2,4-Cl ₂ -苯基	O	NO ₂				
347. a-d	2,5-Cl ₂ -苯基	O	NO ₂				
348. a-d	2,6-Cl ₂ -苯基	O	NO ₂				
349. a-d	3,4-Cl ₂ -苯基	O	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
350. a-d	3,5-Cl ₂ -苯基	O	NO ₂				
351. a-d	2,4,6-Cl ₃ -苯基	O	NO ₂				
352. a-d	2,3,4-Cl ₃ -苯基	O	NO ₂				
353. a-d	3,4,5-Cl ₃ -苯基	O	NO ₂				
354. a-d	2-F-4-Cl-苯基	O	NO ₂				
355. a-d	2-Cl-4-F-苯基	O	NO ₂				
356. a-d	2-F-3-Cl-苯基	O	NO ₂				
357. a-d	2-Cl-3-F-苯基	O	NO ₂				
358. a-d	2-F-5-Cl-苯基	O	NO ₂				
359. a-d	2-Cl-5-F-苯基	O	NO ₂				
360. a-d	2-Cl-6-F-苯基	O	NO ₂				
361. a-d	2-Br-苯基	O	NO ₂				
362. a-d	3-Br-苯基	O	NO ₂				
363. a-d	4-Br-苯基	O	NO ₂				
364. a-d	2,3-Br ₂ -苯基	O	NO ₂				
365. a-d	2,4-Br ₂ -苯基	O	NO ₂				
366. a-d	2,5-Br ₂ -苯基	O	NO ₂				
367. a-d	2-I-苯基	O	NO ₂				
368. a-d	3-I-苯基	O	NO ₂				
369. a-d	4-I-苯基	O	NO ₂				
370. a-d	2-F-4-MeO-苯基	O	NO ₂				
371. a-d	2-F-5-MeO-苯基	O	NO ₂				
372. a-d	2-MeO-苯基	O	NO ₂				
373. a-d	3-MeO-苯基	O	NO ₂				
374. a-d	4-MeO-苯基	O	NO ₂				
375. a-d	2,4-(MeO) ₂ -苯基	O	NO ₂				
376. a-d	2,5-(MeO) ₂ -苯基	O	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
377. a-d	2-Me-苯基	O	NO ₂				
378. a-d	3-Me-苯基	O	NO ₂				
379. a-d	4-Me-苯基	O	NO ₂				
380. a-d	2,4-(Me) ₂ -苯基	O	NO ₂				
381. a-d	2,5-(Me) ₂ -苯基	O	NO ₂				
382. a-d	2-CF ₃ -苯基	O	NO ₂				
383. a-d	3-CF ₃ -苯基	O	NO ₂				
384. a-d	4-CF ₃ -苯基	O	NO ₂				
385. a-d	2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	NO ₂				
386. a-d	2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	O	NO ₂				
387. a-d	2-CF ₃ O-苯基	O	NO ₂				
388. a-d	3-CF ₃ O-苯基	O	NO ₂				
389. a-d	4-CF ₃ O-苯基	O	NO ₂				
390. a-d	5-F-吡啶-2-基	O	NO ₂				
391. a-d	5-Cl-吡啶-2-基	O	NO ₂				
392. a-d	5-F-吡啶-4-基	O	NO ₂				
393. a-d	5-Cl-吡啶-4-基	O	NO ₂				
394. a-d	2-CF ₃ -吡啶-4-基	O	NO ₂				
395. a-d	2-CF ₃ -苯硫-4-基	O	NO ₂				
396. a-d	1-CH ₃ -5-CF ₃ -吡唑-3-基	O	NO ₂	浅红色油			
397. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	NO ₂	135			
398. a-d	2-CF ₃ -叠重氮-5-基	O	NO ₂				
399. a-d	2-CN-苯基	O	NO ₂				
400. a-d	3-CN-苯基	O	NO ₂				
401. a-d	4-CN-苯基	O	NO ₂				
402. a-d	3,5-(CN) ₂ -苯基	O	NO ₂				
403. a-d	2-CN-4-F-苯基	O	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
404. a-d	4-CN-2-F-苯基	O	NO ₂				
405. a-d	2-CF ₃ -噁二唑-5-基	O	NO ₂				
406. a-d	NH-苯基	CO	CN				
407. a-d	NH-萘-1-基	CO	CN				
408. a-d	NH-吡啶-2-基	CO	CN				
409. a-d	NH-吡啶-3-基	CO	CN				
410. a-d	NH-吡啶-4-基	CO	CN				
411. a-d	NH-2-F-苯基	CO	CN				
412. a-d	NH-3-F-苯基	CO	CN				
413. a-d	NH-4-F-苯基	CO	CN				
414. a-d	NH-2,3-F ₂ -苯基	CO	CN				
415. a-d	NH-2,4-F ₂ -苯基	CO	CN				
416. a-d	NH-2,5-F ₂ -苯基	CO	CN				
417. a-d	NH-2,6-F ₂ -苯基	CO	CN				
418. a-d	NH-3,4-F ₂ -苯基	CO	CN				
419. a-d	NH-3,5-F ₂ -苯基	CO	CN				
420. a-d	NH-2,4,6-F ₃ -苯基	CO	CN				
421. a-d	NH-2,3,4-F ₃ -苯基	CO	CN				
422. a-d	NH-2-Cl-苯基	CO	CN				
423. a-d	NH-3-Cl-苯基	CO	CN				
424. a-d	NH-4-Cl-苯基	CO	CN				
425. a-d	NH-2,3-Cl ₂ -苯基	CO	CN				
426. a-d	NH-2,4-Cl ₂ -苯基	CO	CN				
427. a-d	NH-2,5-Cl ₂ -苯基	CO	CN				
428. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -苯基	CO	CN				
429. a-d	NH-3,4-Cl ₂ -苯基	CO	CN				
430. a-d	NH-3,5-Cl ₂ -苯基	CO	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
431. a-d	NH-2,4,6-Cl ₃ -苯基	CO	CN				
432. a-d	NH-2,3,4-Cl ₃ -苯基	CO	CN				
433. a-d	NH-3,4,5-Cl ₃ -苯基	CO	CN				
434. a-d	NH-2-F-4-Cl-苯基	CO	CN				
435. a-d	NH-2-Cl-4-F-苯基	CO	CN				
436. a-d	NH-2-F-3-Cl-苯基	CO	CN				
437. a-d	NH-2-Cl-3-F-苯基	CO	CN				
438. a-d	NH-2-F-5-Cl-苯基	CO	CN				
439. a-d	NH-2-Cl-5-F-苯基	CO	CN				
440. a-d	NH-2-Cl-6-F-苯基	CO	CN				
441. a-d	NH-2-Br-苯基	CO	CN				
442. a-d	NH-3-Br-苯基	CO	CN				
443. a-d	NH-4-Br-苯基	CO	CN				
444. a-d	NH-2,3-Br ₂ -苯基	CO	CN				
445. a-d	NH-2,4-Br ₂ -苯基	CO	CN				
446. a-d	NH-2,5-Br ₂ -苯基	CO	CN				
447. a-d	NH-2-I-苯基	CO	CN				
448. a-d	NH-3-I-苯基	CO	CN				
449. a-d	NH-4-I-苯基	CO	CN				
450. a-d	NH-2-F-4-MeO-苯基	CO	CN				
451. a-d	NH-2-F-5-MeO-苯基	CO	CN				
452. a-d	NH-2-MeO-苯基	CO	CN				
453. a-d	NH-3-MeO-苯基	CO	CN				
454. a-d	NH-4-MeO-苯基	CO	CN				
455. a-d	NH-2,4-(MeO) ₂ -苯基	CO	CN				
456. a-d	NH-2,3-(MeO) ₂ -苯基	CO	CN				
457. a-d	NH-2,5-(MeO) ₂ -苯基	CO	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
458. a-d	NH-2-Me-苯基	CO	CN				
459. a-d	NH-3-Me-苯基	CO	CN				
460. a-d	NH-4-Me-苯基	CO	CN				
461. a-d	NH-2,4-(Me) ₂ -苯基	CO	CN				
462. a-d	NH-2,5-(Me) ₂ -苯基	CO	CN				
463. a-d	NH-2-CF ₃ -苯基	CO	CN				
464. a-d	NH-3-CF ₃ -苯基	CO	CN				
465. a-d	NH-4-CF ₃ -苯基	CO	CN				
466. a-d	NH-2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	CN				
467. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	CN				
468. a-d	NH-2-CF ₃ O-苯基	CO	CN				
469. a-d	NH-3-CF ₃ O-苯基	CO	CN				
470. a-d	NH-4-CF ₃ O-苯基	CO	CN				
471. a-d	NH-5-F-吡啶-2-基	CO	CN				
472. a-d	NH-5-Cl-吡啶-2-基	CO	CN				
473. a-d	NH-5-F-吡啶-4-基	CO	CN				
474. a-d	NH-5-Cl-吡啶-4-基	CO	CN				
475. a-d	NH-2-CN-苯基	CO	CN				
476. a-d	NH-3-CN-苯基	CO	CN				
477. a-d	NH-4-CN-苯基	CO	CN				
478. a-d	NH-3,5-(CN) ₂ -苯基	CO	CN				
479. a-d	NH-2-CN-4-F-苯基	CO	CN				
480. a-d	NH-4-CN-2-F-苯基	CO	CN				
481. a-d	NH-苯基	CO	Me				
482. a-d	NH-萘-1-基	CO	Me				
483. a-d	NH-吡啶-2-基	CO	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
484. a-d	NH-吡啶-3-基	CO	Me				
485. a-d	NH-吡啶-4-基	CO	Me				
486. a-d	NH-2-F-苯基	CO	Me				
487. a-d	NH-3-F-苯基	CO	Me				
488. a-d	NH-4-F-苯基	CO	Me				
489. a-d	NH-2,3-F ₂ -苯基	CO	Me				
490. a-d	NH-2,4-F ₂ -苯基	CO	Me				
491. a-d	NH-2,5-F ₂ -苯基	CO	Me				
492. a-d	NH-2,6-F ₂ -苯基	CO	Me				
493. a-d	NH-3,4-F ₂ -苯基	CO	Me				
494. a-d	NH-3,5-F ₂ -苯基	CO	Me				
495. a-d	NH-2,4,6-F ₃ -苯基	CO	Me				
496. a-d	NH-2,3,4-F ₃ -苯基	CO	Me				
497. a-d	NH-2-Cl-苯基	CO	Me				
498. a-d	NH-3-Cl-苯基	CO	Me				
499. a-d	NH-4-Cl-苯基	CO	Me				
500. a-d	NH-2,3-Cl ₂ -苯基	CO	Me				
501. a-d	NH-2,4-Cl ₂ -苯基	CO	Me				
502. a-d	NH-2,5-Cl ₂ -苯基	CO	Me				
503. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -苯基	CO	Me				
504. a-d	NH-3,4-Cl ₂ -苯基	CO	Me				
505. a-d	NH-3,5-Cl ₂ -苯基	CO	Me				
506. a-d	NH-2,4,6-Cl ₃ -苯基	CO	Me				
507. a-d	NH-2,3,4-Cl ₃ -苯基	CO	Me				
508. a-d	NH-3,4,5-Cl ₃ -苯基	CO	Me				
509. a-d	NH-2-F-4-Cl-苯基	CO	Me				
510. a-d	NH-2-Cl-4-F-苯基	CO	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
511. a-d	NH-2-F-3-Cl-苯基	CO	Me				
512. a-d	NH-2-Cl-3-F-苯基	CO	Me				
513. a-d	NH-2-F-5-Cl-苯基	CO	Me				
514. a-d	NH-2-Cl-5-F-苯基	CO	Me				
515. a-d	NH-2-Cl-6-F-苯基	CO	Me				
516. a-d	NH-2-Br-苯基	CO	Me				
517. a-d	NH-3-Br-苯基	CO	Me				
518. a-d	NH-4-Br-苯基	CO	Me				
519. a-d	NH-2,3-Br ₂ -苯基	CO	Me				
520. a-d	NH-2,4-Br ₂ -苯基	CO	Me				
521. a-d	NH-2,5-Br ₂ -苯基	CO	Me				
522. a-d	NH-2-I-苯基	CO	Me				
523. a-d	NH-3-I-苯基	CO	Me				
524. a-d	NH-4-I-苯基	CO	Me				
525. a-d	NH-2-F-4-MeO-苯基	CO	Me				
526. a-d	NH-2-F-5-MeO-苯基	CO	Me				
527. a-d	NH-2-MeO-苯基	CO	Me				
528. a-d	NH-3-MeO-苯基	CO	Me				
529. a-d	NH-4-MeO-苯基	CO	Me				
530. a-d	NH-2,4-(MeO) ₂ -苯基	CO	Me				
531. a-d	NH-2,3-(MeO) ₂ -苯基	CO	Me				
532. a-d	NH-2,5-(MeO) ₂ -苯基	CO	Me				
533. a-d	NH-2-Me-苯基	CO	Me				
534. a-d	NH-3-Me-苯基	CO	Me				
535. a-d	NH-4-Me-苯基	CO	Me				
536. a-d	NH-2,4-(Me) ₂ -苯基	CO	Me				
537. a-d	NH-2,5-(Me) ₂ -苯基	CO	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
538. a-d	NH-2-CF ₃ -苯基	CO	Me				
539. a-d	NH-3-CF ₃ -苯基	CO	Me				
540. a-d	NH-4-CF ₃ -苯基	CO	Me				
541. a-d	NH-2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	Me				
542. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	Me				
543. a-d	NH-2-CF ₃ O-苯基	CO	Me				
544. a-d	NH-3-CF ₃ O-苯基	CO	Me				
545. a-d	NH-4-CF ₃ O-苯基	CO	Me				
546. a-d	NH-5-F-吡啶-2-基	CO	Me				
547. a-d	NH-5-Cl-吡啶-2-基	CO	Me				
548. a-d	NH-5-F-吡啶-4-基	CO	Me				
549. a-d	NH-5-Cl-吡啶-4-基	CO	Me				
550. a-d	NH-2-CN-苯基	CO	Me				
551. a-d	NH-3-CN-苯基	CO	Me				
552. a-d	NH-4-CN-苯基	CO	Me				
553. a-d	NH-3,5-(CN) ₂ -苯基	CO	Me				
554. a-d	NH-2-CN-4-F-苯基	CO	Me				
555. a-d	NH-4-CN-2-F-苯基	CO	Me				
556. a-d	NH-苯基	CO	MeO				
557. a-d	NH-萘-1-基	CO	MeO				
558. a-d	NH-吡啶-2-基	CO	MeO				
559. a-d	NH-吡啶-3-基	CO	MeO				
560. a-d	NH-吡啶-4-基	CO	MeO				
561. a-d	NH-2-F-苯基	CO	MeO				
562. a-d	NH-3-F-苯基	CO	MeO				
563. a-d	NH-4-F-苯基	CO	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
564. a-d	NH-2,3-F ₂ -苯基	CO	MeO				
565. a-d	NH-2,4-F ₂ -苯基	CO	MeO				
566. a-d	NH-2,5-F ₂ -苯基	CO	MeO				
567. a-d	NH-2,6-F ₂ -苯基	CO	MeO				
568. a-d	NH-3,4-F ₂ -苯基	CO	MeO				
569. a-d	NH-3,5-F ₂ -苯基	CO	MeO				
570. a-d	NH-2,4,6-F ₃ -苯基	CO	MeO				
571. a-d	NH-2,3,4-F ₃ -苯基	CO	MeO				
572. a-d	NH-2-Cl-苯基	CO	MeO				
573. a-d	NH-3-Cl-苯基	CO	MeO				
574. a-d	NH-4-Cl-苯基	CO	MeO				
575. a-d	NH-2,3-Cl ₂ -苯基	CO	MeO				
576. a-d	NH-2,4-Cl ₂ -苯基	CO	MeO				
577. a-d	NH-2,5-Cl ₂ -苯基	CO	MeO				
578. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -苯基	CO	MeO				
579. a-d	NH-3,4-Cl ₂ -苯基	CO	MeO				
580. a-d	NH-3,5-Cl ₂ -苯基	CO	MeO				
581. a-d	NH-2,4,6-Cl ₃ -苯基	CO	MeO				
582. a-d	NH-2,3,4-Cl ₃ -苯基	CO	MeO				
583. a-d	NH-3,4,5-Cl ₃ -苯基	CO	MeO				
584. a-d	NH-2-F-4-Cl-苯基	CO	MeO				
585. a-d	NH-2-Cl-4-F-苯基	CO	MeO				
586. a-d	NH-2-F-3-Cl-苯基	CO	MeO				
587. a-d	NH-2-Cl-3-F-苯基	CO	MeO				
588. a-d	NH-2-F-5-Cl-苯基	CO	MeO				
589. a-d	NH-2-Cl-5-F-苯基	CO	MeO				
590. a-d	NH-2-Cl-6-F-苯基	CO	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
591. a-d	NH-2-Br-苯基	CO	MeO				
592. a-d	NH-3-Br-苯基	CO	MeO				
593. a-d	NH-4-Br-苯基	CO	MeO				
594. a-d	NH-2,3-Br ₂ -苯基	CO	MeO				
595. a-d	NH-2,4-Br ₂ -苯基	CO	MeO				
596. a-d	NH-2,5-Br ₂ -苯基	CO	MeO				
597. a-d	NH-2-I-苯基	CO	MeO				
598. a-d	NH-3-I-苯基	CO	MeO				
599. a-d	NH-4-I-苯基	CO	MeO				
600. a-d	NH-2-F-4-MeO-苯基	CO	MeO				
601. a-d	NH-2-F-5-MeO-苯基	CO	MeO				
602. a-d	NH-2-MeO-苯基	CO	MeO				
603. a-d	NH-3-MeO-苯基	CO	MeO				
604. a-d	NH-4-MeO-苯基	CO	MeO				
605. a-d	NH-2,4-(MeO) ₂ -苯基	CO	MeO				
606. a-d	NH-2,3-(MeO) ₂ -苯基	CO	MeO				
607. a-d	NH-2,5-(MeO) ₂ -苯基	CO	MeO				
608. a-d	NH-2-Me-苯基	CO	MeO				
609. a-d	NH-3-Me-苯基	CO	MeO				
610. a-d	NH-4-Me-苯基	CO	MeO				
611. a-d	NH-2,4-(Me) ₂ -苯基	CO	MeO				
612. a-d	NH-2,5-(Me) ₂ -苯基	CO	MeO				
613. a-d	NH-2-CF ₃ -苯基	CO	MeO				
614. a-d	NH-3-CF ₃ -苯基	CO	MeO				
615. a-d	NH-4-CF ₃ -苯基	CO	MeO				
616. a-d	NH-2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	MeO				
617. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯	CO	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
	基						
618. a-d	NH-2-CF ₃ O-苯基	CO	MeO				
619. a-d	NH-3-CF ₃ O-苯基	CO	MeO				
620. a-d	NH-4-CF ₃ O-苯基	CO	MeO				
621. a-d	NH-5-F-吡啶-2-基	CO	MeO				
622. a-d	NH-5-Cl-吡啶-2-基	CO	MeO				
623. a-d	NH-5-F-吡啶-4-基	CO	MeO				
624. a-d	NH-5-Cl-吡啶-4-基	CO	MeO				
625. a-d	NH-2-CN-苯基	CO	MeO				
626. a-d	NH-3-CN-苯基	CO	MeO				
627. a-d	NH-4-CN-苯基	CO	MeO				
628. a-d	NH-3,5-(CN) ₂ -苯基	CO	MeO				
629. a-d	NH-2-CN-4-F-苯基	CO	MeO				
630. a-d	NH-4-CN-2-F-苯基	CO	MeO				
631. a-d	NH-苯基	CO	CHO				
632. a-d	NH-萘-1-基	CO	CHO				
633. a-d	NH-吡啶-2-基	CO	CHO				
634. a-d	NH-吡啶-3-基	CO	CHO				
635. a-d	NH-吡啶-4-基	CO	CHO				
636. a-d	NH-2-F-苯基	CO	CHO				
637. a-d	NH-3-F-苯基	CO	CHO				
638. a-d	NH-4-F-苯基	CO	CHO				
639. a-d	NH-2,3-F ₂ -苯基	CO	CHO				
640. a-d	NH-2,4-F ₂ -苯基	CO	CHO				
641. a-d	NH-2,5-F ₂ -苯基	CO	CHO				
642. a-d	NH-2,6-F ₂ -苯基	CO	CHO				
643. a-d	NH-3,4-F ₂ -苯基	CO	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
644. a-d	NH-3,5-F ₂ -苯基	CO	CHO				
645. a-d	NH-2,4,6-F ₃ -苯基	CO	CHO				
646. a-d	NH-2,3,4-F ₃ -苯基	CO	CHO				
647. a-d	NH-2-Cl-苯基	CO	CHO				
648. a-d	NH-3-Cl-苯基	CO	CHO				
649. a-d	NH-4-Cl-苯基	CO	CHO				
650. a-d	NH-2,3-Cl ₂ -苯基	CO	CHO				
651. a-d	NH-2,4-Cl ₂ -苯基	CO	CHO				
652. a-d	NH-2,5-Cl ₂ -苯基	CO	CHO				
653. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -苯基	CO	CHO				
654. a-d	NH-3,4-Cl ₂ -苯基	CO	CHO				
655. a-d	NH-3,5-Cl ₂ -苯基	CO	CHO				
656. a-d	NH-2,4,6-Cl ₃ -苯基	CO	CHO				
657. a-d	NH-2,3,4-Cl ₃ -苯基	CO	CHO				
658. a-d	NH-3,4,5-Cl ₃ -苯基	CO	CHO				
659. a-d	NH-2-F-4-Cl-苯基	CO	CHO				
660. a-d	NH-2-Cl-4-F-苯基	CO	CHO				
661. a-d	NH-2-F-3-Cl-苯基	CO	CHO				
662. a-d	NH-2-Cl-3-F-苯基	CO	CHO				
663. a-d	NH-2-F-5-Cl-苯基	CO	CHO				
664. a-d	NH-2-Cl-5-F-苯基	CO	CHO				
665. a-d	NH-2-Cl-6-F-苯基	CO	CHO				
666. a-d	NH-2-Br-苯基	CO	CHO				
667. a-d	NH-3-Br-苯基	CO	CHO				
668. a-d	NH-4-Br-苯基	CO	CHO				
669. a-d	NH-2,3-Br ₂ -苯基	CO	CHO				
670. a-d	NH-2,4-Br ₂ -苯基	CO	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
671. a-d	NH-2,5-Br ₂ -苯基	CO	CHO				
672. a-d	NH-2-I-苯基	CO	CHO				
673. a-d	NH-3-I-苯基	CO	CHO				
674. a-d	NH-4-I-苯基	CO	CHO				
675. a-d	NH-2-F-4-MeO-苯基	CO	CHO				
676. a-d	NH-2-F-5-MeO-苯基	CO	CHO				
677. a-d	NH-2-MeO-苯基	CO	CHO				
678. a-d	NH-3-MeO-苯基	CO	CHO				
679. a-d	NH-4-MeO-苯基	CO	CHO				
680. a-d	NH-2,4-(MeO) ₂ -苯基	CO	CHO				
681. a-d	NH-2,3-(MeO) ₂ -苯基	CO	CHO				
682. a-d	NH-2,5-(MeO) ₂ -苯基	CO	CHO				
683. a-d	NH-2-Me-苯基	CO	CHO				
684. a-d	NH-3-Me-苯基	CO	CHO				
685. a-d	NH-4-Me-苯基	CO	CHO				
686. a-d	NH-2,4-(Me) ₂ -苯基	CO	CHO				
687. a-d	NH-2,5-(Me) ₂ -苯基	CO	CHO				
688. a-d	NH-2-CF ₃ -苯基	CO	CHO				
689. a-d	NH-3-CF ₃ -苯基	CO	CHO				
690. a-d	NH-4-CF ₃ -苯基	CO	CHO				
691. a-d	NH-2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	CHO				
692. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	CHO				
693. a-d	NH-2-CF ₃ O-苯基	CO	CHO				
694. a-d	NH-3-CF ₃ O-苯基	CO	CHO				
695. a-d	NH-4-CF ₃ O-苯基	CO	CHO				
696. a-d	NH-5-F-吡啶-2-基	CO	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
697. a-d	NH-5-Cl-吡啶-2-基	CO	CHO				
698. a-d	NH-5-F-吡啶-4-基	CO	CHO				
699. a-d	NH-5-Cl-吡啶-4-基	CO	CHO				
700. a-d	NH-2-CN-苯基	CO	CHO				
701. a-d	NH-3-CN-苯基	CO	CHO				
702. a-d	NH-4-CN-苯基	CO	CHO				
703. a-d	NH-3,5-(CN) ₂ -苯基	CO	CHO				
704. a-d	NH-2-CN-4-F-苯基	CO	CHO				
705. a-d	NH-4-CN-2-F-苯基	CO	CHO				
706. a-d	NH-苯基	CO	NO ₂				
707. a-d	NH-萘-1-基	CO	NO ₂				
708. a-d	NH-吡啶-2-基	CO	NO ₂				
709. a-d	NH-吡啶-3-基	CO	NO ₂				
710. a-d	NH-吡啶-4-基	CO	NO ₂				
711. a-d	NH-2-F-苯基	CO	NO ₂				
712. a-d	NH-3-F-苯基	CO	NO ₂				
713. a-d	NH-4-F-苯基	CO	NO ₂				
714. a-d	NH-2,3-F ₂ -苯基	CO	NO ₂				
715. a-d	NH-2,4-F ₂ -苯基	CO	NO ₂				
716. a-d	NH-2,5-F ₂ -苯基	CO	NO ₂				
717. a-d	NH-2,6-F ₂ -苯基	CO	NO ₂				
718. a-d	NH-3,4-F ₂ -苯基	CO	NO ₂				
719. a-d	NH-3,5-F ₂ -苯基	CO	NO ₂				
720. a-d	NH-2,4,6-F ₃ -苯基	CO	NO ₂				
721. a-d	NH-2,3,4-F ₃ -苯基	CO	NO ₂				
722. a-d	NH-2-Cl-苯基	CO	NO ₂				
723. a-d	NH-3-Cl-苯基	CO	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
724. a-d	NH-4-Cl-苯基	CO	NO ₂				
725. a-d	NH-2,3-Cl ₂ -苯基	CO	NO ₂				
726. a-d	NH-2,4-Cl ₂ -苯基	CO	NO ₂				
727. a-d	NH-2,5-Cl ₂ -苯基	CO	NO ₂				
728. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -苯基	CO	NO ₂				
729. a-d	NH-3,4-Cl ₂ -苯基	CO	NO ₂				
730. a-d	NH-3,5-Cl ₂ -苯基	CO	NO ₂				
731. a-d	NH-2,4,6-Cl ₃ -苯基	CO	NO ₂				
732. a-d	NH-2,3,4-Cl ₃ -苯基	CO	NO ₂				
733. a-d	NH-3,4,5-Cl ₃ -苯基	CO	NO ₂				
734. a-d	NH-2-F-4-Cl-苯基	CO	NO ₂				
735. a-d	NH-2-Cl-4-F-苯基	CO	NO ₂				
736. a-d	NH-2-F-3-Cl-苯基	CO	NO ₂				
737. a-d	NH-2-Cl-3-F-苯基	CO	NO ₂				
738. a-d	NH-2-F-5-Cl-苯基	CO	NO ₂				
739. a-d	NH-2-Cl-5-F-苯基	CO	NO ₂				
740. a-d	NH-2-Cl-6-F-苯基	CO	NO ₂				
741. a-d	NH-2-Br-苯基	CO	NO ₂				
742. a-d	NH-3-Br-苯基	CO	NO ₂				
743. a-d	NH-4-Br-苯基	CO	NO ₂				
744. a-d	NH-2,3-Br ₂ -苯基	CO	NO ₂				
745. a-d	NH-2,4-Br ₂ -苯基	CO	NO ₂				
746. a-d	NH-2,5-Br ₂ -苯基	CO	NO ₂				
747. a-d	NH-2-I-苯基	CO	NO ₂				
748. a-d	NH-3-I-苯基	CO	NO ₂				
749. a-d	NH-4-I-苯基	CO	NO ₂				
750. a-d	NH-2-F-4-MeO-苯基	CO	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
751. a-d	NH-2-F-5-MeO-苯基	CO	NO ₂				
752. a-d	NH-2-MeO-苯基	CO	NO ₂				
753. a-d	NH-3-MeO-苯基	CO	NO ₂				
754. a-d	NH-4-MeO-苯基	CO	NO ₂				
755. a-d	NH-2,4-(MeO) ₂ -苯基	CO	NO ₂				
756. a-d	NH-2,3-(MeO) ₂ -苯基	CO	NO ₂				
757. a-d	NH-2,5-(MeO) ₂ -苯基	CO	NO ₂				
758. a-d	NH-2-Me-苯基	CO	NO ₂				
759. a-d	NH-3-Me-苯基	CO	NO ₂				
760. a-d	NH-4-Me-苯基	CO	NO ₂				
761. a-d	NH-2,4-(Me) ₂ -苯基	CO	NO ₂				
762. a-d	NH-2,5-(Me) ₂ -苯基	CO	NO ₂				
763. a-d	NH-2-CF ₃ -苯基	CO	NO ₂				
764. a-d	NH-3-CF ₃ -苯基	CO	NO ₂				
765. a-d	NH-4-CF ₃ -苯基	CO	NO ₂				
766. a-d	NH-2,4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	NO ₂				
767. a-d	NH-2,6-Cl ₂ -4-(CF ₃) ₂ -苯基	CO	NO ₂				
768. a-d	NH-2-CF ₃ O-苯基	CO	NO ₂				
769. a-d	NH-3-CF ₃ O-苯基	CO	NO ₂				
770. a-d	NH-4-CF ₃ O-苯基	CO	NO ₂				
771. a-d	NH-5-F-吡啶-2-基	CO	NO ₂				
772. a-d	NH-5-Cl-吡啶-2-基	CO	NO ₂				
773. a-d	NH-5-F-吡啶-4-基	CO	NO ₂				
774. a-d	NH-5-Cl-吡啶-4-基	CO	NO ₂				
775. a-d	NH-2-CN-苯基	CO	NO ₂				
776. a-d	NH-3-CN-苯基	CO	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
777. a-d	NH-4-CN-苯基	CO	NO ₂				
778. a-d	NH-3,5-(CN) ₂ -苯基	CO	NO ₂				
779. a-d	NH-2-CN-4-F-苯基	CO	NO ₂				
780. a-d	NH-4-CN-2-F-苯基	CO	NO ₂				
781. a-d	NH ₂	CH ₂	CN				
782. a-d	NH ₂	CH ₂	Me				
783. a-d	NH ₂	CH ₂	MeO	黄色树脂			
784. a-d	NH ₂	CH ₂	CHO				
785. a-d	NH ₂	CH ₂	NO ₂				
786. a-d	NH-COMe	CH ₂	CN				
787. a-d	NH-COEt	CH ₂	CN				
788. a-d	NH-CO _n Pr	CH ₂	CN				
789. a-d	NH-CO _i Pr	CH ₂	CN				
790. a-d	NH-COcPr	CH ₂	CN				
791. a-d	NH-CO _n Bu	CH ₂	CN				
792. a-d	NH-CO _i Bu	CH ₂	CN				
793. a-d	NH-COcBu	CH ₂	CN				
794. a-d	NH-COcPentyl	CH ₂	CN				
795. a-d	NH-COcHexyl	CH ₂	CN				
796. a-d	NH-COCF ₃	CH ₂	CN				
797. a-d	NH-COCHF ₂	CH ₂	CN				
798. a-d	NH-COCH ₂ F	CH ₂	CN				
799. a-d	NH-COCCl ₃	CH ₂	CN				
800. a-d	NH-COCHCl ₂	CH ₂	CN				
801. a-d	NH-COCH ₂ Cl	CH ₂	CN				
802. a-d	NH-COCH ₂ OMe	CH ₂	CN				
803. a-d	NH-COCH(OMe) ₂	CH ₂	CN				
804. a-d	NH-COCH ₂ OEt	CH ₂	CN				
805. a-d	NH-COCH(OEt) ₂	CH ₂	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
806. a-d	NH-COPh	CH ₂	CN				
807. a-d	NH-CO(2-F-Ph)	CH ₂	CN				
808. a-d	NH-CO(3-F-Ph)	CH ₂	CN				
809. a-d	NH-CO(4-F-Ph)	CH ₂	CN				
810. a-d	NH-CO(2,4-F ₂ -Ph)	CH ₂	CN				
811. a-d	NH-CO(2,4,6-F ₃ -Ph)	CH ₂	CN				
812. a-d	NH-CO(2-Cl-Ph)	CH ₂	CN				
813. a-d	NH-CO(3-Cl-Ph)	CH ₂	CN				
814. a-d	NH-CO(4-Cl-Ph)	CH ₂	CN				
815. a-d	NH-CO(2,4-Cl ₂ -Ph)	CH ₂	CN				
816. a-d	NH-CO(2,4,6-Cl ₃ -Ph)	CH ₂	CN				
817. a-d	NH-COBn	CH ₂	CN				
818. a-d	NH-CO(2-F-4-Cl-Ph)	CH ₂	CN				
819. a-d	NH-CO(2-Cl-4-F-Ph)	CH ₂	CN				
820. a-d	NH-CO(2-Me-Ph)	CH ₂	CN				
821. a-d	NH-CO(3-Me-Ph)	CH ₂	CN				
822. a-d	NH-CO(4-Me-Ph)	CH ₂	CN				
823. a-d	NH-CO(2-CF ₃ -Ph)	CH ₂	CN				
824. a-d	NH-CO(3-CF ₃ -Ph)	CH ₂	CN				
825. a-d	NH-CO(4-CF ₃ -Ph)	CH ₂	CN				
826. a-d	NH-COMe	CH ₂	Me				
827. a-d	NH-COEt	CH ₂	Me				
828. a-d	NH-CO <i>n</i> Pr	CH ₂	Me				
829. a-d	NH-CO <i>i</i> Pr	CH ₂	Me				
830. a-d	NH-COcPr	CH ₂	Me				
831. a-d	NH-CO <i>n</i> Bu	CH ₂	Me				
832. a-d	NH-CO <i>i</i> Bu	CH ₂	Me				
833. a-d	NH-COcBu	CH ₂	Me				
834. a-d	NH-COcPentyl	CH ₂	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
835. a-d	NH-COCHexyl	CH ₂	Me				
836. a-d	NH-COCF ₃	CH ₂	Me				
837. a-d	NH-COCHF ₂	CH ₂	Me				
838. a-d	NH-COCH ₂ F	CH ₂	Me				
839. a-d	NH-COCCl ₃	CH ₂	Me				
840. a-d	NH-COCHCl ₂	CH ₂	Me				
841. a-d	NH-COCH ₂ Cl	CH ₂	Me				
842. a-d	NH-COCH ₂ OMe	CH ₂	Me				
843. a-d	NH-COCH(OMe) ₂	CH ₂	Me				
844. a-d	NH-COCH ₂ OEt	CH ₂	Me				
845. a-d	NH-COCH(OEt) ₂	CH ₂	Me				
846. a-d	NH-COPh	CH ₂	Me				
847. a-d	NH-CO(2-F-Ph)	CH ₂	Me				
848. a-d	NH-CO(3-F-Ph)	CH ₂	Me				
849. a-d	NH-CO(4-F-Ph)	CH ₂	Me				
850. a-d	NH-CO(2,4-F ₂ -Ph)	CH ₂	Me				
851. a-d	NH-CO(2,4,6-F ₃ -Ph)	CH ₂	Me				
852. a-d	NH-CO(2-Cl-Ph)	CH ₂	Me				
853. a-d	NH-CO(3-Cl-Ph)	CH ₂	Me				
854. a-d	NH-CO(4-Cl-Ph)	CH ₂	Me				
855. a-d	NH-CO(2,4-Cl ₂ -Ph)	CH ₂	Me				
856. a-d	NH-CO(2,4,6-Cl ₃ -Ph)	CH ₂	Me				
857. a-d	NH-COBn	CH ₂	Me				
858. a-d	NH-CO(2-F-4-Cl-Ph)	CH ₂	Me				
859. a-d	NH-CO(2-Cl-4-F-Ph)	CH ₂	Me				
860. a-d	NH-CO(2-Me-Ph)	CH ₂	Me				
861. a-d	NH-CO(3-Me-Ph)	CH ₂	Me				
862. a-d	NH-CO(4-Me-Ph)	CH ₂	Me				
863. a-d	NH-CO(2-CF ₃ -Ph)	CH ₂	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
864. a-d	NH-CO(3-CF ₃ -Ph)	CH ₂	Me				
865. a-d	NH-CO(4-CF ₃ -Ph)	CH ₂	Me				
866. a-d	NH-COMe	CH ₂	MeO				
867. a-d	NH-COEt	CH ₂	MeO				
868. a-d	NH-CO <i>n</i> Pr	CH ₂	MeO				
869. a-d	NH-CO <i>i</i> Pr	CH ₂	MeO	86			
870. a-d	NH-CO <i>c</i> Pr	CH ₂	MeO	86			
871. a-d	NH-CO <i>n</i> Bu	CH ₂	MeO				
872. a-d	NH-CO <i>i</i> Bu	CH ₂	MeO				
873. a-d	NH-CO <i>c</i> Bu	CH ₂	MeO				
874. a-d	NH-CO <i>c</i> Pentyl	CH ₂	MeO				
875. a-d	NH-CO <i>c</i> Hexyl	CH ₂	MeO				
876. a-d	NH-COCF ₃	CH ₂	MeO	棕色半结 晶固体			
877. a-d	NH-COCHF ₂	CH ₂	MeO				
878. a-d	NH-COCH ₂ F	CH ₂	MeO				
879. a-d	NH-COCCl ₃	CH ₂	MeO				
880. a-d	NH-COCHCl ₂	CH ₂	MeO				
881. a-d	NH-COCH ₂ Cl	CH ₂	MeO				
882. a-d	NH-COCH ₂ OMe	CH ₂	MeO				
883. a-d	NH-COCH(OMe) ₂	CH ₂	MeO				
884. a-d	NH-COCH ₂ OEt	CH ₂	MeO				
885. a-d	NH-COCH(OEt) ₂	CH ₂	MeO				
886. a-d	NH-COPh	CH ₂	MeO				
887. a-d	NH-CO(2-F-Ph)	CH ₂	MeO				
888. a-d	NH-CO(3-F-Ph)	CH ₂	MeO				
889. a-d	NH-CO(4-F-Ph)	CH ₂	MeO				
890. a-d	NH-CO(2,4-F ₂ -Ph)	CH ₂	MeO				
891. a-d	NH-CO(2,4,6-F ₃ -Ph)	CH ₂	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
892. a-d	NH-CO(2-Cl-Ph)	CH ₂	MeO				
893. a-d	NH-CO(3-Cl-Ph)	CH ₂	MeO				
894. a-d	NH-CO(4-Cl-Ph)	CH ₂	MeO				
895. a-d	NH-CO(2,4-Cl ₂ -Ph)	CH ₂	MeO				
896. a-d	NH-CO(2,4,6-Cl ₃ -Ph)	CH ₂	MeO				
897. a-d	NH-COBn	CH ₂	MeO				
898. a-d	NH-CO(2-F-4-Cl-Ph)	CH ₂	MeO				
899. a-d	NH-CO(2-Cl-4-F-Ph)	CH ₂	MeO				
900. a-d	NH-CO(2-Me-Ph)	CH ₂	MeO				
901. a-d	NH-CO(3-Me-Ph)	CH ₂	MeO				
902. a-d	NH-CO(4-Me-Ph)	CH ₂	MeO				
903. a-d	NH-CO(2-CF ₃ -Ph)	CH ₂	MeO				
904. a-d	NH-CO(3-CF ₃ -Ph)	CH ₂	MeO				
905. a-d	NH-CO(4-CF ₃ -Ph-CO)	CH ₂	MeO				
906. a-d	NH-COMe	CH ₂	CHO				
907. a-d	NH-COEt	CH ₂	CHO				
908. a-d	NH-CO <i>n</i> Pr	CH ₂	CHO				
909. a-d	NH-CO <i>i</i> Pr	CH ₂	CHO				
910. a-d	NH-CO <i>c</i> Pr	CH ₂	CHO				
911. a-d	NH-CO <i>n</i> Bu	CH ₂	CHO				
912. a-d	NH-CO <i>i</i> Bu	CH ₂	CHO				
913. a-d	NH-CO <i>c</i> Bu	CH ₂	CHO				
914. a-d	NH-CO <i>c</i> Pentyl	CH ₂	CHO				
915. a-d	NH-CO <i>c</i> Hexyl	CH ₂	CHO				
916. a-d	NH-COCF ₃	CH ₂	CHO				
917. a-d	NH-COCHF ₂	CH ₂	CHO				
918. a-d	NH-COCH ₂ F	CH ₂	CHO				
919. a-d	NH-COCCl ₃	CH ₂	CHO				
920. a-d	NH-COCHCl ₂	CH ₂	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
921. a-d	NH-COCH ₂ Cl	CH ₂	CHO				
922. a-d	NH-COCH ₂ OMe	CH ₂	CHO				
923. a-d	NH-COCH(OMe) ₂	CH ₂	CHO				
924. a-d	NH-COCH ₂ OEt	CH ₂	CHO				
925. a-d	NH-COCH(OEt) ₂	CH ₂	CHO				
926. a-d	NH-COPh	CH ₂	CHO				
927. a-d	NH-CO(2-F-Ph)	CH ₂	CHO				
928. a-d	NH-CO(3-F-Ph)	CH ₂	CHO				
929. a-d	NH-CO(4-F-Ph)	CH ₂	CHO				
930. a-d	NH-CO(2,4-F ₂ -Ph)	CH ₂	CHO				
931. a-d	NH-CO(2,4,6-F ₃ -Ph)	CH ₂	CHO				
932. a-d	NH-CO(2-Cl-Ph)	CH ₂	CHO				
933. a-d	NH-CO(3-Cl-Ph)	CH ₂	CHO				
934. a-d	NH-CO(4-Cl-Ph)	CH ₂	CHO				
935. a-d	NH-CO(2,4-Cl ₂ -Ph)	CH ₂	CHO				
936. a-d	NH-CO(2,4,6-Cl ₃ -Ph)	CH ₂	CHO				
937. a-d	NH-COBn	CH ₂	CHO				
938. a-d	NH-CO(2-F-4-Cl-Ph)	CH ₂	CHO				
939. a-d	NH-CO(2-Cl-4-F-Ph)	CH ₂	CHO				
940. a-d	NH-CO(2-Me-Ph)	CH ₂	CHO				
941. a-d	NH-CO(3-Me-Ph)	CH ₂	CHO				
942. a-d	NH-CO(4-Me-Ph)	CH ₂	CHO				
943. a-d	NH-CO(2-CF ₃ -Ph)	CH ₂	CHO				
944. a-d	NH-CO(3-CF ₃ -Ph)	CH ₂	CHO				
945. a-d	NH-CO(4-CF ₃ -Ph)	CH ₂	CHO				
946. a-d	NH-COMe	CH ₂	NO ₂				
947. a-d	NH-COEt	CH ₂	NO ₂				
948. a-d	NH-CO <i>n</i> Pr	CH ₂	NO ₂				
949. a-d	NH-CO <i>i</i> Pr	CH ₂	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
950. a-d	NH-COcPr	CH ₂	NO ₂				
951. a-d	NH-COnBu	CH ₂	NO ₂				
952. a-d	NH-CO/Bu	CH ₂	NO ₂				
953. a-d	NH-COcBu	CH ₂	NO ₂				
954. a-d	NH-COcPentyl	CH ₂	NO ₂				
955. a-d	NH-COcHexyl	CH ₂	NO ₂				
956. a-d	NH-COCF ₃	CH ₂	NO ₂				
957. a-d	NH-COCHF ₂	CH ₂	NO ₂				
958. a-d	NH-COCH ₂ F	CH ₂	NO ₂				
959. a-d	NH-COCCL ₃	CH ₂	NO ₂				
960. a-d	NH-COCHCl ₂	CH ₂	NO ₂				
961. a-d	NH-COCH ₂ Cl	CH ₂	NO ₂				
962. a-d	NH-COCH ₂ OMe	CH ₂	NO ₂				
963. a-d	NH-COCH(OMe) ₂	CH ₂	NO ₂				
964. a-d	NH-COCH ₂ OEt	CH ₂	NO ₂				
965. a-d	NH-COCH(OEt) ₂	CH ₂	NO ₂				
966. a-d	NH-COPh	CH ₂	NO ₂				
967. a-d	NH-CO(2-F-Ph)	CH ₂	NO ₂				
968. a-d	NH-CO(3-F-Ph)	CH ₂	NO ₂				
969. a-d	NH-CO(4-F-Ph)	CH ₂	NO ₂				
970. a-d	NH-CO(2,4-F ₂ -Ph)	CH ₂	NO ₂				
971. a-d	NH-CO(2,4,6-F ₃ -Ph)	CH ₂	NO ₂				
972. a-d	NH-CO(2-Cl-Ph)	CH ₂	NO ₂				
973. a-d	NH-CO(3-Cl-Ph)	CH ₂	NO ₂				
974. a-d	NH-CO(4-Cl-Ph)	CH ₂	NO ₂				
975. a-d	NH-CO(2,4-Cl ₂ -Ph)	CH ₂	NO ₂				
976. a-d	NH-CO(2,4,6-Cl ₃ -Ph)	CH ₂	NO ₂				
977. a-d	NH-COBn	CH ₂	NO ₂				
978. a-d	NH-CO(2-F-4-Cl-Ph)	CH ₂	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
979. a-d	NH-CO(2-Cl-4-F-Ph)	CH ₂	NO ₂				
980. a-d	NH-CO(2-Me-Ph)	CH ₂	NO ₂				
981. a-d	NH-CO(3-Me-Ph)	CH ₂	NO ₂				
982. a-d	NH-CO(4-Me-Ph)	CH ₂	NO ₂				
983. a-d	NH-CO(2-CF ₃ -Ph)	CH ₂	NO ₂				
984. a-d	NH-CO(3-CF ₃ -Ph)	CH ₂	NO ₂				
985. a-d	NH-CO(4-CF ₃ -Ph)	CH ₂	NO ₂				
986. a-d	NH-Me	CO	CN				
987. a-d	NH-Me	CO	Me				
988. a-d	NH-Me	CO	MeO				
989. a-d	NH-Me	CO	CHO				
990. a-d	NH-Me	CO	NO ₂				
991. a-d	NH-Et	CO	CN				
992. a-d	NH-Et	CO	Me				
993. a-d	NH-Et	CO	MeO				
994. a-d	NH-Et	CO	CHO				
995. a-d	NH-Et	CO	NO ₂				
996. a-d	NH-CH ₂ CHF ₂	CO	CN				
997. a-d	NH-CH ₂ CHF ₂	CO	Me				
998. a-d	NH-CH ₂ CHF ₂	CO	MeO				
999. a-d	NH-CH ₂ CHF ₂	CO	CHO				
1000. a-d	NH-CH ₂ CHF ₂	CO	NO ₂				
1001. a-d	NH-CH ₂ CH ₂ CF ₃	CO	CN				
1002. a-d	NH-CH ₂ CH ₂ CF ₃	CO	Me				
1003. a-d	NH-CH ₂ CH ₂ CF ₃	CO	MeO				
1004. a-d	NH-CH ₂ CH ₂ CF ₃	CO	CHO				
1005. a-d	NH-CH ₂ CH ₂ CF ₃	CO	NO ₂				
1006. a-d	NH-CH ₂ CF ₃	CO	CN				
1007. a-d	NH-CH ₂ CF ₃	CO	Me				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1008. a-d	NH-CH ₂ CF ₃	CO	MeO				
1009. a-d	NH-CH ₂ CF ₃	CO	CHO				
1010. a-d	NH-CH ₂ CF ₃	CO	NO ₂				
1011. a-d	NH-Bn	CO	CN				
1012. a-d	NH-Bn	CO	Me				
1013. a-d	NH-Bn	CO	MeO				
1014. a-d	NH-Bn	CO	CHO				
1015. a-d	NH-Bn	CO	NO ₂				
1016. a-d	NH-cHexyl	CO	CN				
1017. a-d	NH-cHexyl	CO	Me				
1018. a-d	NH-cHexyl	CO	MeO				
1019. a-d	NH-cHexyl	CO	CHO				
1020. a-d	NH-cHexyl	CO	NO ₂				
1021. a-d	NH-cPentyl	CO	CN				
1022. a-d	NH-cPentyl	CO	Me				
1023. a-d	NH-cPentyl	CO	MeO				
1024. a-d	NH-cPentyl	CO	CHO				
1025. a-d	NH-cPentyl	CO	NO ₂				
1026. a-d	NH-cBu	CO	CN				
1027. a-d	NH-cBu	CO	Me				
1028. a-d	NH-cBu	CO	MeO				
1029. a-d	NH-cBu	CO	CHO				
1030. a-d	NH-cBu	CO	NO ₂				
1031. a-d	NH-nBu	CO	CN				
1032. a-d	NH-nBu	CO	Me				
1033. a-d	NH-nBu	CO	MeO				
1034. a-d	NH-nBu	CO	CHO				
1035. a-d	NH-nBu	CO	NO ₂				
1036. a-d	NH-nPr	CO	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1037. a-d	NH- <i>n</i> Pr	CO	Me				
1038. a-d	NH- <i>n</i> Pr	CO	MeO				
1039. a-d	NH- <i>n</i> Pr	CO	CHO				
1040. a-d	NH- <i>n</i> Pr	CO	NO ₂				
1041. a-d	NH- <i>c</i> Pr	CO	CN				
1042. a-d	NH- <i>c</i> Pr	CO	Me				
1043. a-d	NH- <i>c</i> Pr	CO	MeO				
1044. a-d	NH- <i>c</i> Pr	CO	CHO				
1045. a-d	NH- <i>c</i> Pr	CO	NO ₂				
1046. a-d	NH- <i>i</i> Pr	CO	CN				
1047. a-d	NH- <i>i</i> Pr	CO	Me				
1048. a-d	NH- <i>i</i> Pr	CO	MeO				
1049. a-d	NH- <i>i</i> Pr	CO	CHO				
1050. a-d	NH- <i>i</i> Pr	CO	NO ₂				
1051. a-d	NH-CH ₂ CH=CH ₂	CO	CN				
1052. a-d	NH-CH ₂ CH=CH ₂	CO	Me				
1053. a-d	NH-CH ₂ CH=CH ₂	CO	MeO				
1054. a-d	NH-CH ₂ CH=CH ₂	CO	CHO				
1055. a-d	NH-CH ₂ CH=CH ₂	CO	NO ₂				
1056. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	O	CN	黄色油			
1057. a-d	CH ₂ CH=CHMe	O	CN				
1058. a-d	CH ₂ CH=CMe ₂	O	CN	橙色油			
1059. a-d	(E)-CH ₂ CH=CH-CF ₃	O	CN	115			
1060. a-d	CH ₂ CCl=CH ₂	O	CN	83			
1061. a-d	CH ₂ CBr=CHBr	O	CN				
1062. a-d	(Z)-CH ₂ CH=CClMe	O	CN	无色半晶体			
1063. a-d	CH ₂ CH=CH-CH ₂ OEt	O	CN				
1064. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₂ Br	O	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1065. a-d	CH ₂ CH=CHBr	O	CN				
1066. a-d	CH ₂ CH=CHPh	O	CN	黄色树脂			
1067. a-d	CH ₂ CH=CHEt	O	CN				
1068. a-d	CH ₂ CMe=CH ₂	O	CN	棕色树脂			
1069. a-d	CH ₂ CCl=CH-CF ₃	O	CN				
1070. a-d	(Z)-CH ₂ CH=CCl-CF ₃	O	CN	无色树脂			
1071. a-d	CH ₂ CH=CCl ₂	O	CN	淡棕色树脂		棕色半结晶	
1072. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	O	Me				
1073. a-d	(E)-CH ₂ CH=CHMe	O	Me	无色油			
1074. a-d	CH ₂ CH=CMe ₂	O	Me				
1075. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₃	O	Me				
1076. a-d	CH ₂ CCl=CH ₂	O	Me				
1077. a-d	CH ₂ CBr=CHBr	O	Me				
1078. a-d	CH ₂ CH=CClMe	O	Me				
1079. a-d	CH ₂ CH=CH-CH ₂ OEt	O	Me				
1080. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₂ Br	O	Me				
1081. a-d	CH ₂ CH=CHBr	O	Me				
1082. a-d	CH ₂ CH=CHPh	O	Me				
1083. a-d	CH ₂ CH=CHEt	O	Me				
1084. a-d	CH ₂ CMe=CH ₂	O	Me				
1085. a-d	CH ₂ Cl=CH-CF ₃	O	Me				
1086. a-d	CH ₂ CH=CCl-CF ₃	O	Me				
1087. a-d	CH ₂ CH=CCl ₂	O	Me				
1088. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	O	MeO				
1089. a-d	CH ₂ CH=CHMe	O	MeO				
1090. a-d	CH ₂ CH=CMe ₂	O	MeO				
1091. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₃	O	MeO				
1092. a-d	CH ₂ CCl=CH ₂	O	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1093. a-d	CH ₂ CBr=CHBr	O	MeO				
1094. a-d	CH ₂ CH=CClMe	O	MeO				
1095. a-d	CH ₂ CH=CH-CH ₂ OEt	O	MeO				
1096. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₂ Br	O	MeO				
1097. a-d	CH ₂ CH=CHBr	O	MeO				
1098. a-d	CH ₂ CH=CHPh	O	MeO				
1099. a-d	CH ₂ CH=CHEt	O	MeO				
1100. a-d	CH ₂ CMe=CH ₂	O	MeO				
1101. a-d	CH ₂ Cl=CH-CF ₃	O	MeO				
1102. a-d	CH ₂ CH=CCl-CF ₃	O	MeO				
1103. a-d	CH ₂ CH=CCl ₂	O	MeO				
1104. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	O	CHO				
1105. a-d	CH ₂ CH=CHMe	O	CHO				
1106. a-d	CH ₂ CH=CMe ₂	O	CHO				
1107. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₃	O	CHO				
1108. a-d	CH ₂ CCl=CH ₂	O	CHO				
1109. a-d	CH ₂ CBr=CHBr	O	CHO				
1110. a-d	CH ₂ CH=CClMe	O	CHO				
1111. a-d	CH ₂ CH=CH-CH ₂ OEt	O	CHO				
1112. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₂ Br	O	CHO				
1113. a-d	CH ₂ CH=CHBr	O	CHO				
1114. a-d	CH ₂ CH=CHPh	O	CHO				
1115. a-d	CH ₂ CH=CHEt	O	CHO				
1116. a-d	CH ₂ CMe=CH ₂	O	CHO				
1117. a-d	CH ₂ Cl=CH-CF ₃	O	CHO				
1118. a-d	CH ₂ CH=CCl-CF ₃	O	CHO				
1119. a-d	CH ₂ CH=CCl ₂	O	CHO				
1120. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	O	NO ₂				
1121. a-d	CH ₂ CH=CHMe	O	NO ₂				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1122. a-d	CH ₂ CH=CMe ₂	O	NO ₂				
1123. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₃	O	NO ₂				
1124. a-d	CH ₂ CCl=CH ₂	O	NO ₂				
1125. a-d	CH ₂ CBr=CHBr	O	NO ₂				
1126. a-d	CH ₂ CH=CClMe	O	NO ₂				
1127. a-d	CH ₂ CH=CH-CH ₂ OEt	O	NO ₂				
1128. a-d	CH ₂ CH=CH-CF ₂ Br	O	NO ₂				
1129. a-d	CH ₂ CH=CHBr	O	NO ₂				
1130. a-d	CH ₂ CH=CHPh	O	NO ₂				
1131. a-d	CH ₂ CH=CHEt	O	NO ₂				
1132. a-d	CH ₂ CMe=CH ₂	O	NO ₂				
1133. a-d	CH ₂ Cl=CH-CF ₃	O	NO ₂				
1134. a-d	CH ₂ CH=CCl-CF ₃	O	NO ₂				
1135. a-d	CH ₂ CH=CCl ₂	O	NO ₂				
1136. a-d	F	键结	CN	参见实例 2		黄色油	
1137. a-d	Cl	键结	CN				
1138. a-d	Br	键结	CN				
1139. a-d	I	键结	CN				
1140. a-d	CN	键结	CN	参见实例 6		棕色蜡	131
1141. a-d	F	键结	Me				
1142. a-d	Cl	键结	Me				
1143. a-d	Br	键结	Me				
1144. a-d	I	键结	Me				
1145. a-d	CN	键结	Me	92			
1146. a-d	F	键结	MeO				
1147. a-d	Cl	键结	MeO				
1148. a-d	Br	键结	MeO				
1149. a-d	I	键结	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1150. a-d	CN	键结	MeO				
1151. a-d	F	键结	CHO				
1152. a-d	Cl	键结	CHO				
1153. a-d	Br	键结	CHO				
1154. a-d	I	键结	CHO				
1155. a-d	CN	键结	CHO				
1156. a-d	F	键结	NO ₂	78			
1157. a-d	Cl	键结	NO ₂				
1158. a-d	Br	键结	NO ₂				
1159. a-d	I	键结	NO ₂				
1160. a-d	CN	键结	NO ₂				
1161. a-d	3-CF ₃ -吡唑-1-基	键结	CN	参见实例 5		110	
1162. a-d	3-CF ₃ -吡唑-1-基	键结	Me				
1163. a-d	3-CF ₃ -吡唑-1-基	键结	MeO				
1164. a-d	3-CF ₃ -吡唑-1-基	键结	CHO				
1165. a-d	3-CF ₃ -吡唑-1-基	键结	NO ₂	128			
1166. a-d	CH ₂ CH ₂ OMe	O	CN	72			
1167. a-d	CH ₂ CH ₂ OEt	O	CN	无色油			
1168. a-d	CH ₂ CH ₂ OnPr	O	CN				
1169. a-d	CH ₂ CH ₂ O <i>i</i> Pr	O	CN	无色蜡		46	
1170. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	CN				
1171. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OEt	O	CN	无色油			
1172. a-d	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	CN	无色油			
1173. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	CN				
1174. a-d	CH ₂ CH(OEt) ₂	O	CN	黄色油		淡黄色树脂	
1175. a-d	CH ₂ CH(OMe) ₂	O	CN	84			
1176. a-d	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	CN				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1177. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	O	CN				
1178. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	O	CN				
1179. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	CN				
1180. a-d	四氢呋喃-2-基	O-CH ₂	CN	无色油			
1181. a-d	四氢吡喃-2-基	O-CH ₂	CN	无色油			
1182. a-d	2,2-二甲基-1,3-二氧戊 环-4-基	O-CH ₂	CN	无色油		88	
1183. a-d	CH ₂ CH ₂ OMe	O	Me				
1184. a-d	CH ₂ CH ₂ OEt	O	Me				
1185. a-d	CH ₂ CH ₂ O <i>n</i> Pr	O	Me				
1186. a-d	CH ₂ CH ₂ O <i>i</i> Pr	O	Me				
1187. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	Me				
1188. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OEt	O	Me				
1189. a-d	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	Me				
1190. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	Me				
1191. a-d	CH ₂ CH(OEt) ₂	O	Me				
1192. a-d	CH ₂ CH(OMe) ₂	O	Me				
1193. a-d	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	Me				
1194. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	O	Me				
1195. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	O	Me				
1196. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	Me				
1197. a-d	四氢呋喃-2-基	O-CH ₂	Me				
1198. a-d	四氢吡喃-2-基	O-CH ₂	Me				
1199. a-d	2,2-二甲基-1,3-二氧戊 环-4-基	O-CH ₂	Me				
1200. a-d	CH ₂ CH ₂ OMe	O	MeO				
1201. a-d	CH ₂ CH ₂ OEt	O	MeO				
1202. a-d	CH ₂ CH ₂ O <i>n</i> Pr	O	MeO				
1203. a-d	CH ₂ CH ₂ O <i>i</i> Pr	O	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1204. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	MeO				
1205. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OEt	O	MeO				
1206. a-d	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	MeO				
1207. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	MeO				
1208. a-d	CH ₂ CH(OEt) ₂	O	MeO				
1209. a-d	CH ₂ CH(OMe) ₂	O	MeO				
1210. a-d	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	MeO				
1211. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	O	MeO				
1212. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	O	MeO				
1213. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	MeO				
1214. a-d	四氢呋喃-2-基	O-CH ₂	MeO				
1215. a-d	四氢吡喃-2-基	O-CH ₂	MeO				
1216. a-d	2,2-二甲基-1,3-二氧戊 环-4-基	O-CH ₂	MeO				
1217. a-d	CH ₂ CH ₂ OMe	O	CHO				
1218. a-d	CH ₂ CH ₂ OEt	O	CHO				
1219. a-d	CH ₂ CH ₂ O <i>n</i> Pr	O	CHO				
1220. a-d	CH ₂ CH ₂ O <i>i</i> Pr	O	CHO				
1221. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	CHO				
1222. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OEt	O	CHO				
1223. a-d	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	CHO				
1224. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	CHO				
1225. a-d	CH ₂ CH(OEt) ₂	O	CHO				
1226. a-d	CH ₂ CH(OMe) ₂	O	CHO				
1227. a-d	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	CHO				
1228. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	O	CHO				
1229. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	O	CHO				
1230. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	CHO				
1231. a-d	四氢呋喃-2-基	O-CH ₂	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1232. a-d	四氢吡喃-2-基	O-CH ₂	CHO				
1233. a-d	2,2-二甲基-1,3-二氧戊环-4-基	O-CH ₂	CHO				
1234. a-d	CH ₂ CH ₂ OMe	O	NO ₂				
1235. a-d	CH ₂ CH ₂ OEt	O	NO ₂				
1236. a-d	CH ₂ CH ₂ O _n Pr	O	NO ₂				
1237. a-d	CH ₂ CH ₂ O/Pr	O	NO ₂	淡黄色油			
1238. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	NO ₂				
1239. a-d	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OEt	O	NO ₂				
1240. a-d	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	NO ₂				
1241. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCF ₃	O	NO ₂				
1242. a-d	CH ₂ CH(OEt) ₂	O	NO ₂	淡黄色油			
1243. a-d	CH ₂ CH(OMe) ₂	O	NO ₂	淡黄色油			
1244. a-d	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	NO ₂				
1245. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	O	NO ₂				
1246. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	O	NO ₂				
1247. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCF ₃	O	NO ₂				
1248. a-d	四氢呋喃-2-基	O-CH ₂	NO ₂	99			
1249. a-d	四氢吡喃-2-基	O-CH ₂	NO ₂				
1250. a-d	2,2-二甲基-1,3-二氧戊环-4-基	O-CH ₂	NO ₂	淡黄色树脂			
1251. a-d	NH ₂	CO	CONH ₂	271 272			291
1252. a-d	Me	O	CN	60		橙色油	
1253. a-d	Me	O	Me				
1254. a-d	Me	O	MeO				
1255. a-d	Me	O	CHO				
1256. a-d	Me	O	NO ₂				
1257. a-d	Et	O	CN	白色树脂			


	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1258. a-d	Et	O	Me				
1259. a-d	Et	O	MeO				
1260. a-d	Et	O	CHO				
1261. a-d	Et	O	NO ₂				
1262. a-d	<i>i</i> Pr	O	CN				
1263. a-d	<i>i</i> Pr	O	Me				
1264. a-d	<i>i</i> Pr	O	MeO				
1265. a-d	<i>i</i> Pr	O	CHO				
1266. a-d	<i>i</i> Pr	O	NO ₂				
1267. a-d	<i>n</i> Pr	O	CN				
1268. a-d	<i>n</i> Pr	O	Me				
1269. a-d	<i>n</i> Pr	O	MeO				
1270. a-d	<i>n</i> Pr	O	CHO				
1271. a-d	<i>n</i> Pr	O	NO ₂				
1272. a-d	<i>n</i> Bu	O	CN				
1273. a-d	<i>n</i> Bu	O	Me				
1274. a-d	<i>n</i> Bu	O	MeO				
1275. a-d	<i>n</i> Bu	O	CHO				
1276. a-d	<i>n</i> Bu	O	NO ₂				
1277. a-d	CH ₂ CF ₃	O	CN				
1278. a-d	CH ₂ CF ₃	O	Me				
1279. a-d	CH ₂ CF ₃	O	MeO				
1280. a-d	CH ₂ CF ₃	O	CHO				
1281. a-d	CH ₂ CF ₃	O	NO ₂				
1282. a-d	CH ₂ CF ₂ CF ₃	O	CN	78			
1283. a-d	CH ₂ CF ₂ CF ₃	O	Me				
1284. a-d	CH ₂ CF ₂ CF ₃	O	MeO				
1285. a-d	CH ₂ CF ₂ CF ₃	O	CHO				
1286. a-d	CH ₂ CF ₂ CF ₃	O	NO ₂				



	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1287. a-d	CH ₂ CH ₂ CF ₃	O	CN	无色树脂			
1288. a-d	CH ₂ CH ₂ CF ₃	O	Me				
1289. a-d	CH ₂ CH ₂ CF ₃	O	MeO				
1290. a-d	CH ₂ CH ₂ CF ₃	O	CHO				
1291. a-d	CH ₂ CH ₂ CF ₃	O	NO ₂				
1292. a-d	CH ₂ CH ₂ Cl	O	CN				
1293. a-d	CH ₂ CH ₂ Cl	O	Me				
1294. a-d	CH ₂ CH ₂ Cl	O	MeO				
1295. a-d	CH ₂ CH ₂ Cl	O	CHO				
1296. a-d	CH ₂ CH ₂ Cl	O	NO ₂				
1297. a-d	CH ₂ CH ₂ SMe	O	CN				
1298. a-d	CH ₂ CH ₂ SMe	O	Me				
1299. a-d	CH ₂ CH ₂ SMe	O	MeO				
1300. a-d	CH ₂ CH ₂ SMe	O	CHO				
1301. a-d	CH ₂ CH ₂ SMe	O	NO ₂				
1302. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	O	CN				
1303. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	O	Me				
1304. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	O	MeO				
1305. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	O	CHO				
1306. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	O	NO ₂				
1307. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	CO	CN				
1308. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	CO	Me				
1309. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	CO	MeO				
1310. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	CO	CHO				
1311. a-d	CH ₂ CH=CH ₂	CO	NO ₂				
1312. a-d	Me	CO	CN				
1313. a-d	Me	CO	Me				
1314. a-d	Me	CO	MeO				
1315. a-d	Me	CO	CHO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1316. a-d	Me	CO	NO ₂				
1317. a-d	Et	CO	CN				
1318. a-d	Et	CO	Me				
1319. a-d	Et	CO	MeO				
1320. a-d	Et	CO	CHO				
1321. a-d	Et	CO	NO ₂				
1322. a-d	CH ₂ CH ₂ CHMe ₂	CO	CN				
1323. a-d	CH ₂ CH ₂ CHMe ₂	CO	Me				
1324. a-d	CH ₂ CH ₂ CHMe ₂	CO	MeO				
1325. a-d	CH ₂ CH ₂ CHMe ₂	CO	CHO				
1326. a-d	CH ₂ CH ₂ CHMe ₂	CO	NO ₂				
1327. a-d	Ph	CO-CH ₂	CN				
1328. a-d	Ph	CO-CH ₂	Me				
1329. a-d	Ph	CO-CH ₂	MeO				
1330. a-d	Ph	CO-CH ₂	CHO				
1331. a-d	Ph	CO-CH ₂	NO ₂				
1332. a-d	c-Pentyl	CO	CN	无色树脂			
1333. a-d	c-Pentyl	CO	Me				
1334. a-d	c-Pentyl	CO	MeO				
1335. a-d	c-Pentyl	CO	CHO				
1336. a-d	c-Pentyl	CO	NO ₂				
1337. a-d	iPr	CO	CN	无色树脂			
1338. a-d	iPr	CO	Me				
1339. a-d	iPr	CO	MeO				
1340. a-d	iPr	CO	CHO				
1341. a-d	iPr	CO	NO ₂				
1342. a-d	cPr	CO	CN				
1343. a-d	cPr	CO	Me				
1344. a-d	cPr	CO	MeO				

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1345. a-d	cPr	CO	CHO				
1346. a-d	cPr	CO	NO ₂				
1347. a-d	cBu	CO	CN				
1348. a-d	cBu	CO	Me				
1349. a-d	cBu	CO	MeO				
1350. a-d	cBu	CO	CHO				
1351. a-d	cBu	CO	NO ₂				
1352. a-d	nPr	CO	CN				
1353. a-d	nPr	CO	Me				
1354. a-d	nPr	CO	MeO				
1355. a-d	nPr	CO	CHO				
1356. a-d	nPr	CO	NO ₂				
1357. a-d	nBu	CO	CN				
1358. a-d	nBu	CO	Me				
1359. a-d	nBu	CO	MeO				
1360. a-d	nBu	CO	CHO				
1361. a-d	nBu	CO	NO ₂				
1362. a-d	Ph	CO	CN				
1363. a-d	Ph	CO	Me				
1364. a-d	Ph	CO	MeO				
1365. a-d	Ph	CO	CHO				
1366. a-d	Ph	CO	NO ₂				
1367. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	COOMe	无色蜡			
1368. a-d	Ph	O-CH ₂	CN	淡黄色树脂			
1369. a-d	Ph	O-CH ₂	Me				
1370. a-d	Ph	O-CH ₂	MeO				
1371. a-d	Ph	O-CH ₂	CHO				
1372. a-d	Ph	O-CH ₂	NO ₂				
1373. a-d	4-F-Ph	O-CH ₂	CN	无色油			

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1374. a-d	4-F-Ph	O-CH ₂	Me				
1375. a-d	4-F-Ph	O-CH ₂	MeO				
1376. a-d	4-F-Ph	O-CH ₂	CHO				
1377. a-d	4-F-Ph	O-CH ₂	NO ₂				
1378. a-d	2,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	CN	黄色油			
1379. a-d	2,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	Me				
1380. a-d	2,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	MeO				
1381. a-d	2,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	CHO				
1382. a-d	2,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	NO ₂				
1383. a-d	3,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	CN	无色油			
1384. a-d	3,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	Me				
1385. a-d	3,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	MeO				
1386. a-d	3,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	CHO				
1387. a-d	3,4-F ₂ -Ph	O-CH ₂	NO ₂				
1388. a-d	2-Me-Ph	O-CH ₂	CN	113			
1389. a-d	2-Me-Ph	O-CH ₂	Me				
1390. a-d	2-Me-Ph	O-CH ₂	MeO				
1391. a-d	2-Me-Ph	O-CH ₂	CHO				
1392. a-d	2-Me-Ph	O-CH ₂	NO ₂				
1393. a-d	3-CF ₃ -Ph	O-CH ₂	CN	无色油			
1394. a-d	3-CF ₃ -Ph	O-CH ₂	Me				
1395. a-d	3-CF ₃ -Ph	O-CH ₂	MeO				
1396. a-d	3-CF ₃ -Ph	O-CH ₂	CHO				
1397. a-d	3-CF ₃ -Ph	O-CH ₂	NO ₂				
1398. a-d	3-CF ₃ -苯基	O	CONH ₂	155	白色树脂		
1399. a-d	3-Cl-4-F-苯基	O	CN	黄色树脂			
1400. a-d	3-CF ₃ -4-F-苯基	O	CN	黄色树脂			
1401. a-d	3-CF ₃ -4-Cl-苯基	O	CN	黄色蜡状			

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1402. a-d	3,4-Me ₂ -苯基	O	CN	黄色树脂			
1403. a-d	3,4,5-Me ₃ -苯基	O	CN	黄色树脂			
1404. a-d	1-CH ₃ -3-CHF ₂ -吡唑-5-基	O	CN	淡黄色树脂			
1405. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	COOMe	无色油			
1406. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	Cl	淡黄色油			
1407. a-d	1-CH ₂ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	NH ₂	117			
1408. a-d	4,5-Cl ₂ -咪唑-1-基	键结	CN	无色油			
1409. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	COOH	黄色树脂			
1410. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	COMe	116			
1411. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	F	73			
1412. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	C(=CH ₂)Me	白色半结晶			
1413. a-d	1-CH ₃ -3-CF ₃ -吡唑-5-基	O	CSNH ₂	159			
1414. a-d	1-CH ₃ -3-t-Bu-吡唑-5-基	O	CN	无色油			
1415. a-d	NH-4-F-Ph	CO	F	白色晶体			
1416. a-d	NH-2,4-F ₂ -苯基	CO	F	白色晶体			
1417. a-d	NH ₂	CH ₂	F	白色晶体			
1418. a-d	NH ₂	CH ₂	CF ₃	淡黄色树脂			
1419. a-d	NH-CO-  Me	CH ₂	F	无色油			
1420. a-d	NH-CO-tBu	CH ₂	F	黄色油			
1421. a-d	NH-CO-Et	CH ₂	F	75			
1422. a-d	NH-COOMe	CH ₂	F	黄色油			
1423. a-d	NH-CO-CF ₃	CH ₂	F	黄色油			
1424. a-d	NH-CO-iPr	CH ₂	F	102			
1425. a-d	NH-CO-cPr	CH ₂	F	104			
1426. a-d	NH-COOMe	CH ₂	CF ₃	78			

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1427. a-d	NH-CO-CF ₃	CH ₂	CF ₃	黄色树脂			
1428. a-d	NH-CO-  Me	CH ₂	CF ₃	137			
1429. a-d	NH-COiPr	CH ₂	CF ₃	123			
1430. a-d	NH-COcPr	CH ₂	CF ₃	118			
1431. a-d	NH-COOMe	CH ₂	OMe	无色树脂			
1432. a-d	NH-CO-  Me	CH ₂	OMe	89			
1433. a-d	NH-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CO	F	132			
1434. a-d	NH ₂	CO	CN	240		135	
1435. a-d	NH ₂	CO	F	186			
1436. a-d	(E)-CH ₂ CH=CH-CH ₂ Cl	O	CN	无色油			
1437. a-d	(Z)-CH ₂ CH=CH-CH ₂ Cl	O	CN	无色半结晶			
1438. a-d	(E)-CH ₂ CH=CHCl	O	CN			棕色树脂	
1439. a-d	CH ₂ -C(OCH ₂ OMe)= CH ₂	O	CN	无色油			
1440. a-d	H	O	CN	155			
1441. a-d	SO ₂ CF ₃	O	CN	淡			
1442. a-d	(E)-CH ₂ CH=CHCl	O	CN	黄色树脂			
1443. a-d	(Z)-CH ₂ CH=CHCl	O	CN	黄色树脂			
1444. a-d	(E)-CH ₂ CH=CClMe	O	CN	无色树脂			
1445. a-d	(Z)-CH ₂ CCl=CHCl	O	CN	米色树脂			
1446. a-d	(E)-CH ₂ CCl=CHCl	O	CN	棕色树脂			
1447. a-d	CF ₃	键结	CN	86			
1448. a-d	F	键结	Cl	淡黄色油			
1449. a-d	F	键结	Br	黄色油			
1450. a-d	F	键结	F	无色油			
1451. a-d	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	CN	无色树脂			

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1452. a-d	CH ₂ Ph	O	CN	88			
1453. a-d	Cl-NO ₂ -咪唑-1-基	键结	CN	220			
1454. a-d	4-CF ₃ -咪唑-1-基	键结	CN	无色油			
1455. a-d	4-CF ₃ -吡唑-1-基	键结	CN	130		112	
1456. a-d	4-CF ₃ -吡唑-1-基	键结	CONH ₂	无色油			
1457. a-d	吡咯基	键结	CN	橙色油			
1458. a-d	咪唑基	键结	CN	无色油			
1459. a-d	4-Me-咪唑-1-基	键结	CN	无色油			
1460. a-d	4-Br-吡唑-1-基	键结	CN	白色半结晶			
1461. a-d	吡唑-1-基	键结	CN	无色油			
1462. a-d	1,2,4-三唑-1-基	键结	CN	161			
1463. a-d	4-Br-3,5-二甲基-吡唑-1-基	键结	CN	90			
1464. a-d	3-MeOOC-咪唑-1-基	键结	CN	214			
1465. a-d	CH ₂ CH ₂ OPh	O	CN	无色树脂			
1466. a-d	CH ₂ CH ₂ CH(Me) (OMe)	O	CN	淡黄色油			
1467. a-d	CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂	O	CN	无色树脂			
1468. a-d	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	O	CN	淡棕色油			
1469. a-d	CH ₂ CH ₂ SMe	O	CN	无色树脂			
1470. a-d	1,3-二氧戊环-4-基	O-CH ₂	CN	棕色树脂			
1471. a-d	CH ₂ CH(OEt) ₂	O	COMe	棕色油			
1472. a-d	Me	S	CN	100			
1473. a-d	Me	SO	CN	116			
1474. a-d	Me	SO ₂	CN	140			
1475. a-d	CH ₂ CHO	O	CN	黄色油			
1476. a-d	1,3-二氧戊环-2-基	O-CH ₂	CN	无色树脂			
1477. a-d	4-乙基-1,3-二氧戊环-2-基	O-CH ₂	CN	88			

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1478. a-d	1,3-二噁烷-2-基	O-CH ₂	CN	137			
1479. a-d	反-5-甲氧基-1,3-二噁烷-2-基	O-CH ₂	CN	165			
1480. a-d	顺-5-甲氧基-1,3-二噁烷-2-基	O-CH ₂	CN	109			
1481. a-d	4-氟甲基-1,3-二氧戊环-2-基	O-CH ₂	CN	白色树脂			
1482. a-d	1,3-dioxopen-2-基	O-CH ₂	CN	无色树脂			
1483. a-d	顺-4,6-二甲基-1,3-二噁烷-2-基	O-CH ₂	CN	124			
1484. a-d	反-4,6-二甲基-1,3-二噁烷-2-基	O-CH ₂	CN	118			
1485. a-d	5,5-二甲基-1,3-二噁烷-2-基	O-CH ₂	CN	122			
1486. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	O	CN	无色树脂			
1487. a-d	CH ₂ CH(OMe) ₂	O	F	淡黄色油			
1488. a-d	四氢呋喃-2-基	O-CH ₂	F	黄色树脂			
1489. a-d	2,2-二甲基-1,3-二氧戊环-4-基	O-CH ₂	F	无色油			
1490. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	O	NO ₂	淡黄色油			
1491. a-d	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	O	F	淡黄色油			
1492. a-d	CH ₂ CH ₂ -cPr	O	CN	无色半结晶			
1493. a-d	Me	CO	F	60			
1494. a-d	CH ₂ CH(OEt) ₂	O	CSNH ₂	92			
1495. a-d	Me	O	CSNH ₂	121			
1496. a-d	3-CF ₃ -pyrazole	键结	CSNH ₂	101			
1497. a-d	(E)-CH ₂ CH=CClMe	O	CSNH ₂	123			
1498. a-d	(E)-CH ₂ CH=CCl(CF ₃)	O	CSNH ₂	109			
1499. a-d	(E)-CH ₂ CH=CHCF ₃	O	CSNH ₂	109			

	B	Y	R ¹	熔点 [°C]			
				a	b	c	d
1500. a-d	3-Me-4-F-苯基	键结	CN	123			
1501. a-d	4-CF ₃ O-苯基	键结	CN	74			
1502. a-d	4-MeO-苯基	键结	CN	131			
1503. a-d	3,4-(MeO) ₂ 苯基	键结	CN	132			
1504. a-d	CH=CH-(4-F-苯基)	键结	CN	124			
1505. a-d	4-CH ₃ -苯基	键结	CN	82			
1506. a-d	4-CN-苯基	键结	CN	131			
1507. a-d	4-F-苯基	键结	CN	96			
1508. a-d	4-Cl-苯基	键结	CN	104			
1509. a-d	3,4-F ₂ -苯基	键结	CN	109			
1510. a-d	3-Cl,4-F-苯基	键结	CN	120			
1511. a-d	3,4-Cl ₂ -苯基	键结	CN	棕色半结晶			
1512. a-d	4-CF ₃ -苯基	键结	CN	无色油			

B. 制剂实施例

a) 粉剂的制备是将 10 重量份的式 (I) 化合物与 90 重量份的滑石 (作为惰性物质) 加以混合, 将该混合物在锤磨机中粉碎。

b) 在水中易于分散的可湿性粉剂的制备是将 25 重量份的式 (I) 化合物, 64 重量份的含高岭土的石英 (作为惰性物质), 10 重量份的木质磺酸钾和 1 重量份的油酰甲基牛磺酸钠 (作为润湿剂和分散剂) 加以混合, 将该混合物在栓型碟式磨粉机上研磨该混合物。

c) 在水中易于分散的分散性浓缩物的制备是将 20 重量份的式 (I) 化合物、6 重量份的烷基酚聚乙二醇醚 (Triton[®] X 207)、3 重量份的异十三烷醇聚乙二醇醚 (8 EO) 和 71 重量份的链烷烃矿物油 (沸点范围约 255 ~ 277°C) 加以混合, 并且在球磨机上研磨该混合物至小于 5 微米的细度。

d) 乳油是由下列物质组成: 15 重量份的式 (I) 化合物, 75 重量

份的环己酮作为溶剂和 10 重量份的氧乙基化的壬酚作为乳化剂。

e) 水分散颗粒剂, 其利用下列方式制得: 将

75 重量份的式 (I) 化合物,

10 重量份的木质磺酸钙,

5 重量份的月桂硫酸钠,

3 重量份的聚乙烯醇和

7 重量份的高岭土

加以混合, 将该混合物在栓型碟式磨粉机中磨成细粉, 将粉末在流体化床中通过喷洒作为粒化液体的水以使之粒化。

f) 水分散颗粒剂, 其也可通过于胶体磨上将下列物质均质化且预先粉碎

25 重量份的式 (I) 化合物,

5 重量份的 2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠,

2 重量份的油酰甲基牛磺酸钠,

1 重量份的聚乙烯醇,

17 重量份的碳酸钙和

50 重量%的水,

随后将该混合物在球磨机中磨成细粉, 在喷雾塔中利用单物质喷嘴将如此得到的悬浮体加以雾化和干燥。

C. 生物实施例

1. 对于杂草的芽前效果

将单子叶和双子叶杂草种子或地下茎放置于硬纸盆中的砂壤土中并覆上土壤。随后在 660~800 公升水/公顷 (经换算) 的施用量下, 将以可湿性粉剂或乳油形式配制的本发明的化合物, 以不同用量的水悬浮液或乳液形式施加至土壤表面。

处理之后, 将盆放置于温室中并保持适于杂草的良好生长条件下。试验植物萌芽之后, 3 至 4 周的试验周期后, 与未处理的对照组比较, 目测对植物的损害或对萌芽的不利影响。如试验结果所示, 本发明的化

合物对于广谱的禾本科杂草和阔叶杂草具有良好芽前除草活性。例如，在每公顷 2 公斤及更少的活性物质施用量下，实施例编号 62a、62b、73d、74c、75a、76a、77a、397a、1136a、1136c、1140a、1140c、1140d、1156a、1161a、1169a、1171a、1177a、1180a、1182a 的化合物和表 1 的其它化合物对于下列有害植物具有极佳的芽前除草活性，如白芥、南苘蒿、燕麦、繁缕、稗子、多花黑麦草、天蓝草属、苘麻、反枝苋和野生稷。

2. 对于杂草的芽后效果

将单子叶和双子叶杂草的种子或地下茎块置入塑料盆中的砂壤土中，并覆上土壤，在温室中良好的生长条件下生长。播种三周后，在三叶期处理试验植物。在 600~800 公升水/公顷（经换算）的施用量下，以各种剂量，将配制成可湿性粉剂或乳油的本发明的化合物喷洒至植物的绿色部分上。理想生长条件下，试验植物保持在温室中约 3 至 4 周后，与未处理的对照组比较，目测制剂效果。本发明的药剂对于广谱的经济重要性禾本科杂草和阔叶杂草也具有良好的芽后除草活性。例如，在每公顷 2 公斤及更少的活性物质施用量下，实施例编号 62a、62b、73d、74c、75a、76a、77a、397a、1136a、1136c、1140a、1140c、1140d、1156a、1161a、1169a、1171a、1177a、1180a、1182a 和表 1 的其它化合物对于下列有害植物具有极佳的芽后除草活性，如白芥、稗子、多花黑麦草、南苘蒿、燕麦、繁缕、天蓝草属、苘麻、反枝苋和野生稷。

3. 作物的耐受性

在进一步的温室实验中，将一定量的作物和杂草种子放置于砂壤土中，并覆上土壤。如第 1 部分所述地立即处理一部分盆，而其余盆则放置于温室中，直至植物发育至两个至三片真叶，随后喷洒各种剂量的本发明的化合物，如第 2 部分所述。施药四至五周后并且在温室中植物已经显现后，目测结果表明采用芽前或芽后方法本发明的化合物对下述作物无损害：双子叶作物如大豆、棉花、油菜、甜菜或马铃薯，即使在高剂量活性成份下亦然。此外，部分物质还可有助于禾本科作物如大麦、小麦、黑麦、高粱、玉米或稻子。部分本发明的化合物具有高选择性，因此适用于农作物中控制不期望的植物。