[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl[7]
C07D487/04
A01N 43/90

[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 02809176.0

[43] 公开日 2004 年 6 月 16 日

[11] 公开号 CN 1505632A

[22] 申请日 2002.4.18 [21] 申请号 02809176.0
[30] 优先权
[32] 2001. 4.30 [33] DE [31] 10121162.7
[86] 国际申请 PCT/EP2002/004287 2002.4.18
[87] 国际公布 WO2002/088126 德 2002.11.7
[85] 进入国家阶段日期 2003.10.30
[71] 申请人 拜尔农作物科学股份公司
地址 德国蒙海姆
[72] 发明人 O·格鲍尔 J·N·格罗伊尔
U·海涅曼 H·L·埃尔贝
B·W·克吕格尔 F·毛雷尔
R·敦克尔 A·弗尔斯特
R·埃伯特 U·瓦亨多夫-纽曼
北川芳则 A·毛勒-马赫尼克
K·H·库克

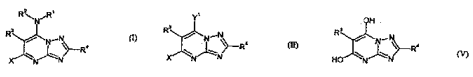
[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司
代理人 张元忠 徐雁漪

权利要求书 8 页 说明书 100 页

[54] 发明名称 三唑并嘧啶化合物

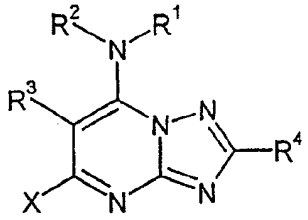
[57] 摘要

本发明涉及新的式(I)三唑并嘧啶化合物，其中 R^1、R^2、R^3、R^4 和 X 具有说明书中给出的含义。本发明还涉及制备所述新化合物的多种方法，和所述化合物在抗不需要的微生物中的应用，新的式(II)、(V)中间体产物及其制备方法，以及具有说明书所示的式的新的胺和氨基甲酸酯化合物及其制备方法。


(I) (II) (V)

ISSN1008-4274

1. 式(I)三唑并嘧啶



(I),

其中

R^1 代表氨基、羟基、代表任选取代的烷基、任选取代的链烯基、任选取代的炔基、任选取代的环烷基、任选取代的烷氧基、任选取代的链烯氧基、任选取代的炔氧基、任选取代的环烷氧基、任选取代的烷基氨基、任选取代的二烷基氨基、任选取代的链烯基氨基、任选取代的炔基氨基、任选取代的环烷基氨基、任选取代的 N-环烷基-N-烷基氨基、任选取代的亚烷基氨基、任选取代的苯基、任选取代的杂环基或代表式-S-R^5 所示的基团，其中

R^5 代表任选取代的烷基、任选取代的链烯基、任选取代的炔基或任选取代的环烷基，

R^2 代表氢、任选取代的烷基、任选取代的链烯基、任选取代的炔基或任选取代的环烷基，

或者

R^1 和 R^2 与它们所连接的氮原子一起代表任选取代的杂环，

R^3 代表任选单取代至四取代的芳基，

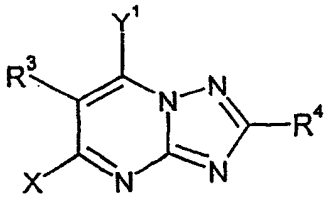
R^4 代表任选取代的烷基或代表任选取代的环烷基，且

X 代表卤素，

以及其中R^1代表氨基的式(I)化合物的酸加成盐。

2. 制备权利要求 1 的式(I)三唑并嘧啶的方法，其特征在于，

a) 将式(II)二卤代三唑并嘧啶



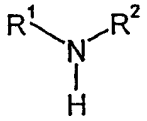
(II)

其中

R^3、R^4和X具有上文给出的含义，且

Y^1代表卤素

与式(III)胺反应，



(III)

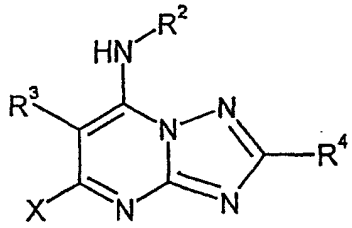
其中

R^1和R^2具有上文给出的含义，

任选地在稀释剂存在下和任选地在酸受体存在下进行所述反应，

或者

b) 将式(Ia)三唑并嘧啶



(Ia)

其中

R^2、R^3、R^4和X具有上文给出的含义，

与式(IV)硫基卤反应，

$$Y^2\text{-}S\text{-}R^5 \qquad \text{(IV)},$$

其中

R^5具有上文给出的含义，且

Y^2代表卤素，

任选地在稀释剂存在下和任选地在酸受体存在下进行所述反应，

和任选地将酸加到其中R^1代表氨基的所得式(I)化合物上。

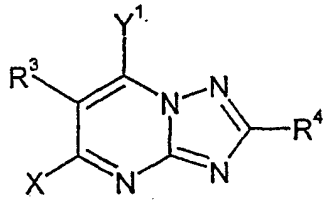
3. 用于控制不需要的微生物的组合物，其特征在于，所述组合物除增容剂和/或表面活性剂外还包含至少一种权利要求1的式(I)三唑并嘧啶或其酸加成盐。

4. 权利要求1的式(I)三唑并嘧啶或其酸加成盐在控制不需要的微生物中的应用。

5. 控制不需要的微生物的方法，其特征在于，将权利要求1的式(I)三唑并嘧啶或其酸加成盐施加给不需要的微生物和/或它们的栖息地。

6. 制备用于控制不需要的微生物的组合物的方法，其特征在于，将权利要求1的式(I)三唑并嘧啶或其酸加成盐与增容剂和/或表面活性剂混合。

7. 式(II)二卤代三唑并嘧啶



(II)

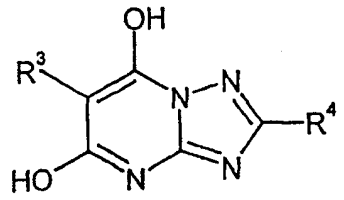
其中

R^3、R^4和X具有上文给出的含义，且

Y^1代表卤素。

8. 制备权利要求7的式(II)二卤代三唑并嘧啶的方法，其特征在于

c) 将式(V)二羟基三唑并嘧啶



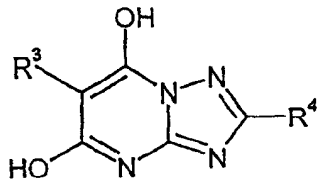
(V)

其中

R^3和R^4具有上文给出的含义，

与卤化剂反应，任选地在稀释剂存在下进行该反应。

9. 式(V)二羟基三唑并嘧啶



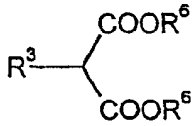
(V)

其中

R^3和R^4具有上文给出的含义。

10. 制备权利要求9的式(V)二羟基三唑并嘧啶的方法，其特征在于，

d) 将式(VI)芳基丙二酸酯



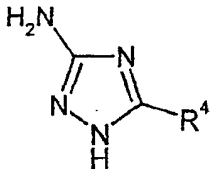
(VI)

其中

R^3具有上文给出的含义，且

R^6代表具有1－4个碳原子的烷基，

与式(VII)氨基三唑化合物反应



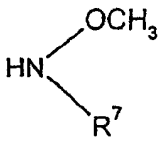
(VII)

其中

R^4具有上文给出的含义，

任选地在稀释剂存在下和任选地在酸结合剂存在下进行该反应。

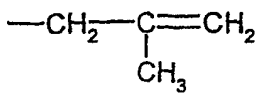
11. 式(IIIa)胺，



(IIIa)

其中

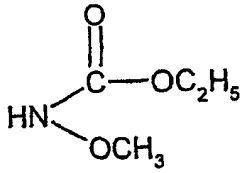
R^7代表异丁基、2-甲氧基乙基或代表



。

12. 制备权利要求11的式(IIIa)胺的方法，其特征在于，

e) 在第一个步骤中，将式(VIII) N-甲氧基氨基甲酸乙酯



(VIII)

与式(IX)卤素化合物反应，

$$R^7—X^1 \qquad (IX)$$

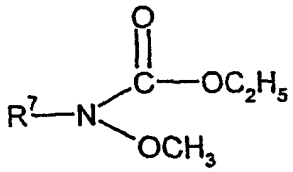
其中

R^7具有上文给出的含义，且

X^1代表溴或碘，

该反应在碱存在下和在稀释剂存在下进行，

和在第二个步骤中，将所得式(X)氨基甲酸酯



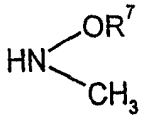
(X)

其中

R^7具有上文给出的含义，

与氢氧化钾在乙醇和水存在下反应。

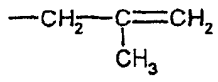
13. 式(IIIb)胺，



(IIIb)

其中

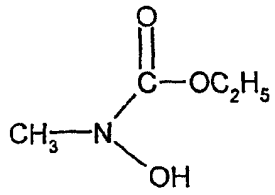
R^7代表异丁基、2-甲氧基乙基或代表



。

14. 制备权利要求 13 的式(IIIb)胺的方法，其特征在于，

f) 在第一个步骤中，将式(XI) N-羟基-N-甲基氨基甲酸乙酯



(XI)

与式(IX)卤素化合物反应，

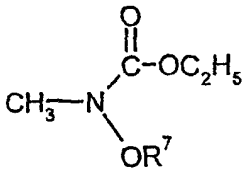
$$R^7—X^1 \qquad (IX)$$

其中

R^7 和 X^1 具有上文给出的含义，

该反应在碱存在下和在稀释剂存在下进行，

和在第二个步骤中，将所得式(XII)氨基甲酸酯



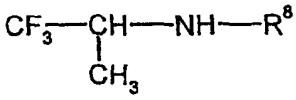
(XII)

其中

R^7 具有上文给出的含义，

与氢氧化钾在乙醇和水存在下反应。

15. 式(IIIc)三氟异丙基胺，



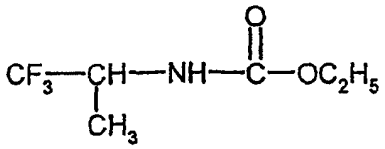
(IIIc)

其中

R^8 代表甲基、乙基或丙基。

16. 制备权利要求 15 的式(IIIc)三氟异丙基胺的方法，其特征在于，

g) 在第一个步骤中，将式(XIII) N-三氟异丙基氨基甲酸乙酯



(XIII)

与式(XIV)卤素化合物反应，

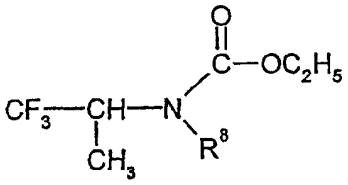
$$R^8—X^1 \qquad (XIV)$$

其中

R^8和X^1具有上文给出的含义，

该反应在碱存在下和在稀释剂存在下进行，

和在第二个步骤中，将所得式(XV)氨基甲酸酯



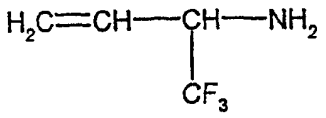
(XV)

其中

R^8具有上文给出的含义，

与氢氧化钾在乙醇和水存在下反应。

17. 式(III-4) 3-三氟甲基-3-氨基丙烯，

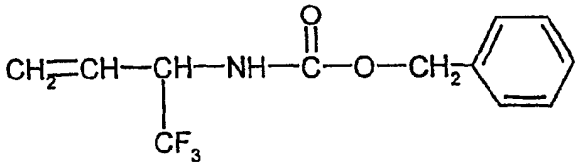


(III-4)

。

18. 制备权利要求 17 的式(III4) 3-三氟甲基-3-氨基丙烯的方法，其特征在于，

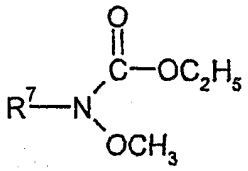
h) 将式(XVI)氨基甲酸酯



(XVI)

与盐酸反应。

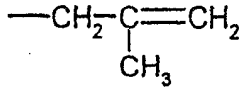
19. 式(X)氨基甲酸酯，



(X)

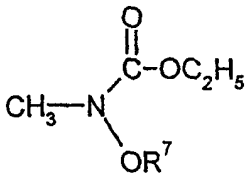
其中

R^7代表异丁基、2-甲氧基乙基或代表



。

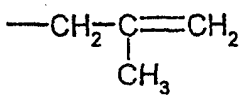
20. 式(XII)氨基甲酸酯，



(XII)

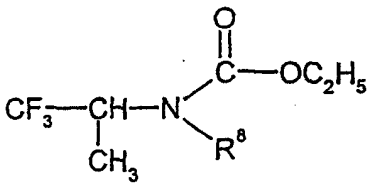
其中

R^7代表异丁基、2-甲氧基乙基或代表



。

21. 式(XIII)氨基甲酸酯，



(XIII)

其中

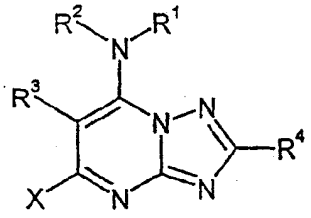
R^8代表甲基、乙基或丙基。

三唑并嘧啶化合物

本发明涉及新的三唑并嘧啶化合物，制备所述化合物的多种方法，以及所述化合物在控制不需要的微生物中的应用。本发明还涉及新的中间体及其制备方法。

已知一些三唑并嘧啶化合物具有杀真菌性质（参见 EP-A 0550113、WO 94-20501、EP-A 0613900、US-A 5612345、EP-A 0834513、WO 98-46607 和 WO 98-46608）。这些物质的活性是良好的；然而，在低的施用量下，它们的活性有时不令人满意。

因此，本发明提供了新的式(I)三唑并嘧啶化合物



(I),

其中

R^1 代表氨基、羟基、代表任选取代的烷基、任选取代的链烯基、任选取代的炔基、任选取代的环烷基、任选取代的烷氧基、任选取代的链烯氧基、任选取代的炔氧基、任选取代的环烷氧基、任选取代的烷基氨基、任选取代的二烷基氨基、任选取代的链烯基氨基、任选取代的炔基氨基、任选取代的环烷基氨基、任选取代的 N-环烷基-N-烷基氨基、任选取代的亚烷基氨基（Alkylidenamino）、任选取代的苯基、任选取代的杂环基或代表式-S-R^5 所示的基团，其中

R^5 代表任选取代的烷基、任选取代的链烯基、任选取代的炔基或任选取代的环烷基，

R^2 代表氢、任选取代的烷基、任选取代的链烯基、任选取代的炔基或任选取代的环烷基，

或者

R^1 和 R^2 与它们所连接的氮原子一起代表任选取代的杂环，

R^3 代表任选单取代至四取代的芳基，

R^4代表任选取代的烷基或代表任选取代的环烷基，且

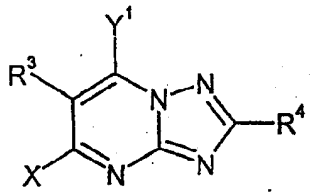
X代表卤素，

以及其中R^1代表氨基的式(I)化合物的酸加成盐。

根据取代方式，本发明化合物可任选作为不同的可能的异构体形式，特别是立体异构体，例如E和Z异构体，苏型和赤型异构体，和旋光异构体，以及任选互变异构体的混合物存在。如果R^3在在与键合位点相邻的两个原子上被不同地取代，则化合物可以特别以立体异构体，即阻转异构体的形式存在。

此外，已经发现，式(I)三唑并嘧啶化合物可以通过下述方法制得：

a) 将式(II)二卤代三唑并嘧啶化合物



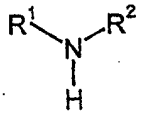
(II)

其中

R^3、R^4和X具有上文给出的含义，且

Y^1代表卤素

与式(III)胺反应，



(III)

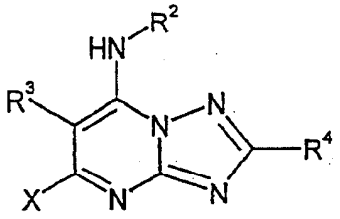
其中

R^1和R^2具有上文给出的含义，

任选地在稀释剂存在下和任选地在酸受体存在下进行所述反应，

或者

b) 将式(Ia)三唑并嘧啶化合物



(Ia)

其中

R^2、R^3、R^4和X具有上文给出的含义，

与式(IV)硫基卤（Sulfensäurehalogenide）反应，

$$Y^2\text{-}S\text{-}R^5 \qquad (IV),$$

其中

R^5具有上文给出的含义，且

Y^2代表卤素，

任选地在稀释剂存在下和任选地在酸受体存在下进行所述反应，

和任选地，将酸加到其中R^1代表氨基的所得式(I)化合物上。

最后，已经发现，新的式(I)三唑并嘧啶化合物及其酸加成盐非常适于控制不需要的微生物。特别是，它们具有强的杀真菌活性，并且既可以用于农作物保护，也可以用于材料保护。

令人惊奇的是，与具有相同作用方向的在结构上最类似的现有技术中的化合物相比，本发明式(I)三唑并嘧啶化合物的杀微生物活性要好得多。

R^1优选代表羟基、氨基，代表任选被下列基团取代的具有1－6个碳原子的烷基：卤素、氰基、羟基、氨基、苯基、杂环基、具有1－4个碳原子的烷氧基、具有1－4个碳原子的烷氧基羰基、具有1－4个碳原子的烷基氨基、具有2－8个碳原子的二烷基氨基、具有3－6个碳原子的环烷基、具有3－6个碳原子和1－5个卤素原子的卤代环烷基、具有1－4个碳原子的烷硫基、氧代基（Oxo）、羟亚氨基和/或具有1－4个碳原子的烷氧基亚氨基，

代表任选被下列基团取代的具有2－6个碳原子的链烯基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有2－6个碳原子的炔基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 3－7 个碳原子的环烷基：卤素、环烷基、氰基、具有 1－2 个碳原子和 1－5 个卤素原子的卤代烷基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 1－7 个碳原子的烷氧基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 2－6 个碳原子的链烯氧基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 2－6 个碳原子的炔氧基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 3－7 个碳原子的环烷氧基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 1－7 个碳原子的烷基氨基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的在烷基中分别具有 1－7 个碳原子的二烷基氨基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 2－6 个碳原子的链烯基氨基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 2－6 个碳原子的炔基氨基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被卤素、氰基、苯基和/或杂环基取代的、在烷基部分中具有 1－6 个碳原子且在链烯基部分中具有 2－6 个碳原子的 N-烷基-N-链烯基氨基，

代表任选被下列基团取代的具有 3－7 个碳原子的环烷基氨基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基取代的、在环烷基部分中具有 3－7 个碳原子且在烷基部分中具有 1－7 个碳原子的 N-环烷基-N-烷基氨基，

代表任选被下列基团取代的具有 2－6 个碳原子的亚烷基氨基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的苯基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的 5 或 6 元杂环基：卤素、烷基、环烷基、

氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的 5 或 6 元杂环基氧基：卤素、烷基、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表-SR^5，其中

R^5代表任选被下列基团取代的具有 1－6 个碳原子的烷基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 2－6 个碳原子的链烯基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

代表任选被下列基团取代的具有 2－6 个碳原子的炔基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，或

代表任选被下列基团取代的具有 3-7 个碳原子的环烷基：卤素、环烷基、氰基、苯基和/或杂环基，

其中上述杂环基可被相同或不同的选自下列的取代基单取代至三取代：卤素、羟基、苯基、1,2-二氧亚乙基、具有 1-4 个碳原子的烷基、具有 1 或 2 个碳原子和 1-5 个卤素原子的卤代烷基、具有 1-4 个碳原子的烷氧基、具有 1-4 个碳原子的烷硫基、具有 1 或 2 个碳原子和 1-5 个卤素原子的卤代烷氧基、具有 1 或 2 个碳原子和 1-5 个卤素原子的卤代烷硫基并且其中上述杂环基是饱和或部分不饱和的，

和其中上述苯基可被相同或不同的选自下列的取代基单取代至三取代：

卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、甲酰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基；

分别是直链或支链且分别具有 1－6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基；

分别是直链或支链且分别具有 2－6 个碳原子的链烯基或链烯氧基；

分别是直链或支链且分别具有 1－6 个碳原子和 1－13 个相同或不同的卤素原子的卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、卤代烷基亚磺酰基或卤代烷基磺酰基；

分别是直链或支链且分别具有 2－6 个碳原子和 1－13 个相同或不同的卤素原子的卤代链烯基或卤代链烯氧基；

分别是直链或支链且分别在各烷基部分中具有 1－6 个碳原子的烷基氨基、二烷基氨基、烷基羰基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基、烷基磺酰

基氧基、羟亚氨基烷基或烷氧亚氨基烷基；

具有 3－6 个碳原子的环烷基，

连接在 2,3-位的 1,3-丙二基、1,4-丁二基、亚甲二氧基（-O-CH_2-O-）或 1,2-亚乙二氧基（-O-CH_2-CH_2-O-），其中所述这些基团可被相同或不同的选自下列的取代基单取代或多取代：卤素、具有 1－4 个碳原子的烷基和/或具有 1－4 个碳原子和 1－9 个相同或不同的卤素原子的卤代烷基。

R^2 优选代表氢，

代表任选被下列基团取代的具有 1－4 个碳原子的烷基：卤素、具有 3－6 个碳原子的环烷基、具有 1－4 个碳原子的烷氧基、具有 1－4 个碳原子的烷硫基、氧代基、羟亚氨基和/或具有 1－4 个碳原子的烷氧亚氨基，

代表任选被卤素和/或具有 3－6 个碳原子的环烷基取代的具有 2－4 个碳原子的链烯基，

代表任选被卤素和/或具有 3－6 个碳原子的环烷基取代的具有 2－4 个碳原子的炔基，

代表任选被卤素和/或具有 3－6 个碳原子的环烷基取代的具有 3－6 个碳原子的环烷基。

R^1 和 R^2 优选与它们所连接的氮原子一起代表 3－6 元杂环，所述杂环是饱和或部分饱和的，并且除了已提及的氮原子以外，还含有选自氮、氧和硫的另外的杂原子，所述杂环可被相同或不同的选自下列的取代基取代一至三次：

卤素、羟基、氰基、吗啉基、氨基、稠合的苯环或亚甲基或亚乙基桥，

具有 1－4 个碳原子的烷基，

具有 1－4 个碳原子和 1－9 个相同或不同的卤素原子的卤代烷基，

具有 1－4 个碳原子的烷基羰基氨基（Alkylcarbonalamino），

具有 2-8 个碳原子的二烷基氨基，

具有 1-4 个碳原子的烷氧基羰基氨基，

具有 2－8 个碳原子的二(烷氧基羰基)氨基，

具有 1－4 个碳原子的羟基烷基，

具有 1－4 个碳原子的烷氧基羰基和/或

具有 1－4 个碳原子的烷基羰基。

R^3 优选代表苯基，其中所述苯基可被相同或不同的选自下列的取代基单取代至四取代:

卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、甲酰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基;

分别是直链或支链且分别具有 1－6 个碳原子的烷基、烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基;

分别是直链或支链且分别具有 2－6 个碳原子的链烯基或链烯氧基;

分别是直链或支链且分别具有 1－6 个碳原子和 1－13 个相同或不同的卤素原子的卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、卤代烷基亚磺酰基或卤代烷基磺酰基;

分别是直链或支链且分别具有 2－6 个碳原子和 1－11 个相同或不同的卤素原子的卤代链烯基或卤代链烯氧基;

分别是直链或支链且分别在各烷基部分中具有 1－6 个碳原子的烷基氨基、二烷基氨基、烷基羰基、烷基羰基氧基、烷氧基羰基、烷基磺酰基氧基、羟亚氨基烷基或烷氧亚氨基烷基;

具有 3－6 个碳原子的环烷基,

连接在 2,3-位的 1,3-丙二基、1,4-丁二基、亚甲二氧基（$-O-CH_2-O-$）或 1,2-亚乙二氧基（$-O-CH_2-CH_2-O-$），其中所述这些基团可被相同或不同的选自下列的取代基单取代或多取代: 卤素、具有 1－4 个碳原子的烷基和/或具有 1－4 个碳原子和 1－9 个相同或不同的卤素原子的卤代烷基。

R^4 优选代表任选被 1－9 个卤素原子取代的具有 1－4 个碳原子的烷基，或代表任选被 1－9 个卤素原子取代的具有 3－6 个碳原子的环烷基。

X 优选代表氟、氯或溴。

R^1 特别优选代表羟基、氨基，代表甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、甲氧基甲基、2-甲氧基乙基、甲硫基甲基、2-甲硫基乙基、羟亚氨基甲基、甲氧亚氨基甲基、乙酰基甲基、2-羟亚氨基丙基、2-甲氧亚氨基丙基、烯丙基、2-甲基丙-2-烯基、炔丙基、2,2,2-三氟乙基、1-(三氟甲基)乙基、3,3,3-三氟丙基、环戊基、环己基,

环丙氧基、环丁氧基、环戊氧基、环己氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧

基、二氟氯甲氧基、三氟乙氧基，

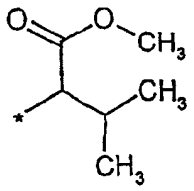
甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基或异丙基氨基、正丁基氨基、异丁基氨基、仲丁基氨基或叔丁基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、三氟乙基氨基、环己基甲基氨基、2-氰基乙基氨基、烯丙基氨基、1-环丙基乙基氨基、环丙基氨基、环丁基氨基、环戊基氨基、环己基氨基、1-甲基亚乙基氨基（Methylethylidenamino）、苯基、苄氧基、哌啶基、吗啉基、吡啶基甲氧基、噻唑基甲氧基，或代表-S-R^5，其中

R^5 代表甲基、乙基、正丙基或异丙基、二氟甲基、二氟氯甲基、二氯氟甲基或三氟甲基，

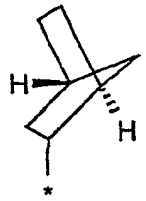
或者

R^1 代表(2,2-二氯环丙基)甲基、(2-呋喃基)甲基、(2-四氢呋喃基)甲基、(2-四氢吡喃基)甲基、1,2-二甲基丙基、1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基、1-环丙基乙基、1-环丙基乙基氨基、1-甲基亚乙基氨基、2,2,2-三氟-1-甲基乙基、2,4-二氯苄氧基、2,6-二氯苄氧基、2-丁基、2-氯苄氧基、2-氟环丙基、2-六氢吡喃基氧基、2-甲氧基乙基、2-噻吩基甲基、2-甲苯基、2-三氟甲基环己基、3-(二甲基氨基)丙基、3,5-双三氟甲基环己基、3,5-二氯苄氧基、3-氨基丙基、3-氯苄氧基、3-甲苯基、3-三氟甲基苄氧基、3-三氟甲基环己基、3,5-(双-三氟甲基)-环己基、2-三氟甲基环己基、4-三氟甲基环己基、4-氯苄氧基、4-氟苄氧基、4-氟苯基、4-甲苯基、4-三氟甲基苄氧基、4-三氟甲基环己基、烯丙基、烯丙基氨基、烯丙氧基、苄氧基、$-C(CH_3)_2-CF_3$、$-C(CH_3)_2-CH_2-COCH_3$、$-C_2H_5$、$-CH(CH_2OH)-COOCH_3$、$-CH(CH_3)-C(CH_3)_3-$、$-CH(CH_3)-CH(O-CH_3)_2-$、$-CH(CH_3)-CH=CH_2-$、$-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2-$、$-CH(CH_3)-CH_2-O-CH_3-$、$-CH(CH_3)-CH_2-OH$、$-CH(CH_3)-COOCH_3$、$-CH(CH_3)-COO-$叔丁基、$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$、$-CH_2-C(CH_3)_3$、$-CH_2-CF_3$、$-CH_2-CH(OCH_3)_2$、$-CH_2-CH_2-CF_3$、$-CH_2-CH_2-Cl$、$-CH_2-CH_2-CN$、$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$、$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$、$-CH_2-CH_2-NH_2$、$-CH_2-CHF_2$、$-CH_2-CN$、$-CH_2-COOC_2H_5$、$-CH_2-COOC_2H_5$、$-CH_2-COOCH_3$、$-CH_3$、环己基、环戊基、环丙基、环丙基甲基、二甲基氨基、异丁氧基、异丁基、异丙基氨基、正丁氧基、正丁基、正丁基氨基、$-NH_2$、$-NH-CH_2-CF_2-CHF_2$、$-NH-CH_2-CF_3$、$-NH-CH_2-CH(CH_3)_2$、$-O-C_2H_5$、$-O-CH(CH_3)-CH_2-CH_3$、$-O-CH_3$、-OH、O-异丙基、炔丙基、叔丁氧基、

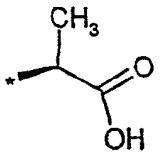
叔丁基、叔丁基氧基，或代表基团



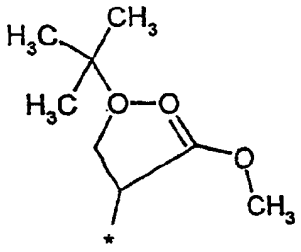
AB3



AB30



AB33



AB5

（*分别表示键合位点）

其中，上述噻唑基和吡啶基可以分别被下列相同或不同的基团单取代或二取代（对于噻唑基）和单取代至三取代（对于吡啶基）：氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基或异丙硫基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、三氟乙氧基、二氟甲硫基、二氟氯甲硫基、二氯氟甲硫基、三氟甲硫基和/或苯基，

其中上述苯基和苄氧基可以在苯基部分上被相同或不同的选自下列的取代基取代一至三次：

氟、氯、溴、氰基、硝基、氨基、羟基、甲酰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、三氟甲基、三氟乙基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、三氟乙氧基、二氟甲硫基、二氟氯甲硫基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、甲基氨基、乙基氨基、

正丙基氨基、异丙基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、乙酰基、丙酰基、乙酰氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、羟亚氨基甲基、羟亚氨基乙基、甲氧亚氨基甲基、乙氧亚氨基甲基、甲氧亚氨基乙基、乙氧亚氨基乙基、环丙基、环丁基、环戊基或环己基，

连接在2,3-位的1,3-丙二基、亚甲二氧基（$-O-CH_2-O-$）、1,2-亚乙二氧基（$-O-CH_2-CH_2-O-$），其中所述这些基团可被相同或不同的选自下列的取代基单取代或多取代：氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基和/或三氟甲基。

R^2特别优选代表氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、甲氧基甲基、2-甲氧基乙基、甲硫基甲基、2-甲硫基乙基、羟亚氨基甲基、甲氧亚氨基甲基、乙酰基甲基、2-羟亚氨基丙基、2-甲氧亚氨基丙基、烯丙基、炔丙基、2,2,2-三氟乙基、1-(1,1,1-三氟甲基)乙基、环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基或环己基甲基。

R^1和R^2特别优选与它们所连接的氮原子一起代表1-吡咯啉基、3-吡咯啉基、吡咯烷基、二氢吡啶基、哌啶基、吡唑啉基、吡唑烷基、咪唑啉基、咪唑烷基、1,2-二嗪烷基、1,3-二嗪烷基、哌嗪基、噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑基、异噁唑烷基、二氢噁嗪基、吗啉基、噻唑啉基、噻唑烷基、硫代吗啉基，其中所述杂环可被下列基团取代：

氟、氯、溴、氰基、硝基、氨基、羟基、甲酰基、羧基、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、三氟甲基、三氟乙基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、三氟乙氧基、二氟甲硫基、二氟氯甲硫基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基、异丙基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、乙酰基、丙酰基、乙酰氧基（Acetyloxa）、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、羟亚氨基甲基、羟亚氨基乙基、甲氧亚氨基甲基、乙氧亚氨基甲基、甲氧亚氨基乙基、乙氧亚氨基乙基、环丙基、环丁基、环戊基或环己基，

被稠合苯环取代或

被甲二基-或乙二基桥取代。

R^3 特别优选代表苯基，所述苯基可以被相同或不同的选自下列的取代基单取代至三取代:

氟、氯、溴、氰基、硝基、甲酰基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、烯丙基、炔丙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、甲硫基、乙硫基、正丙硫基、异丙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、烯丙氧基、炔丙氧基、三氟甲基、三氟乙基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、三氟乙氧基、二氟甲硫基、二氟氯甲硫基、三氟甲硫基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基、三氯乙炔氧基、三氟乙炔氧基、氯烯丙氧基、碘炔丙氧基、甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基、异丙基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基、乙酰基、丙酰基、乙酰氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、羟亚氨基甲基、羟亚氨基乙基、甲氧亚氨基甲基、乙氧亚氨基甲基、甲氧亚氨基乙基、乙氧亚氨基乙基、环丙基、环丁基、环戊基和环己基，

连接在 2,3-位的 1,3-丙二基、亚甲二氧基（-O-CH_2-O-）或 1,2-亚乙二氧基（-O-CH_2-CH_2-O-），其中所述这些基团可被相同或不同的选自下列的取代基单取代或多取代: 氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基和/或三氟甲基。

R^4 特别优选代表甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、三氟乙基或环丙基。

X 特别优选代表氟或氯。

R^1 和 R^2 非常特别优选一起代表其中一个下列基团:

-$CH(CF_3)$-CH_2-CH_2-CH_2-, -$CH(CF_3)$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-,

-$CH(CH_3)$-CH=CH-$CH(CH_3)$-, -$CH(CH_3)$-CH_2-CH_2-O-,

-$CH(COOCH_3)$-, -CH_2-$CH(CH_3)$-CH_2-$CH(CH_3)$-CH_2-,

-CH_2-$CH(CH_3)$-O-$CH(CH_3)$-CH_2-, -CH_2-$CH(NH_2)$-CH_2-CH_2-

CH_2-C-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-CH_2-

-CH_2-CH=$C(C_2H_5)$-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-$C(CH_3)_2$-CH_2-CH_2-

-CH_2-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-$CH(CF_3)$-CH_2-CH_2-

-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-

-CH_2-CH_2-CH($COCH_3$)-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-CH($COOCH_3$)-CH_2-CH_2-

-CH_2-CH_2-CH(NH-$COCH_3$)-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-

-CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_2-, -CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-

-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-, -CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-

-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-

-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-CHBr-CH_2-CH_2-

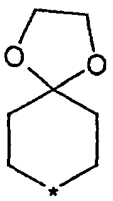
-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-CH_2-

-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-, -CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-

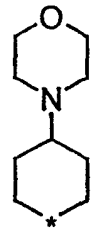
-CH_2-S-CH_2-CH_2-, -NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-

-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-, -O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-,

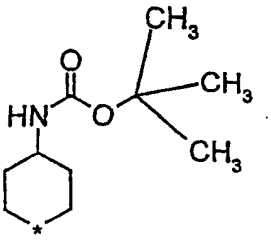
或者一起代表其中一个下列基团，其中 X_2 代表基团 R^1、R^2 所连接的氮原子：



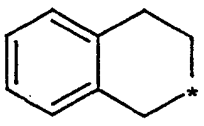
AB10 ,



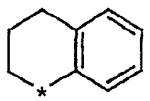
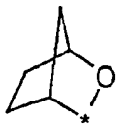
AB11

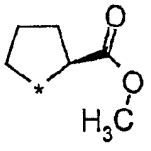
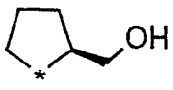


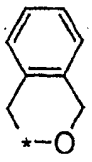
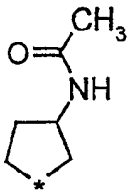
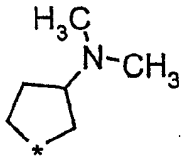
AB12 ,



AB13

AB28  , AB31  , AB32 

AB4  , AB6 

AB7  , AB8  , AB9  .

（*分别表示键合位点）

R^2 非常特别优选代表氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基。

R^3 非常特别优选代表苯基，所述苯基在 2、4 和 6 位被相同或不同的氟和/或氯单取代至三取代。

X 非常特别优选代表氯。

非常特别优选进一步给出定义如下的式(I)化合物：其中

R^1、R^2、R^4 和 X 具有上述优选的定义，且

R^3 代表 2,4-二取代的、2,6-二取代的或 2,4,6-三取代的苯基。

非常特别优选进一步给出定义如下的式(I)化合物：其中

R^1、R^2、R^4 和 X 具有上述定义，且

R^3 代表 2-氯-4-氟苯基、2-氯-6-氟苯基或 2-氯-4,6-二氟苯基。

非常特别优选进一步给出定义如下的式(I)化合物：其中

R^1、R^2、R^3 和 X 具有上述定义，且

R^4 代表环丙基。

非常特别优选进一步给出定义如下的式(I)化合物：其中

X、R^3 和 R^4 具有上述定义，

R^1代表氢，且

R^2代表-$CH(CH_3)CF_3$。

另一组非常特别优选的化合物是定义如下的式(I)三唑并嘧啶化合物：其中

R^4代表环丙基，且

R^1、R^2、R^3和X具有上述优选的定义。

上述基团定义可按照需要彼此组合。此外，个别的含义也可能不适用。

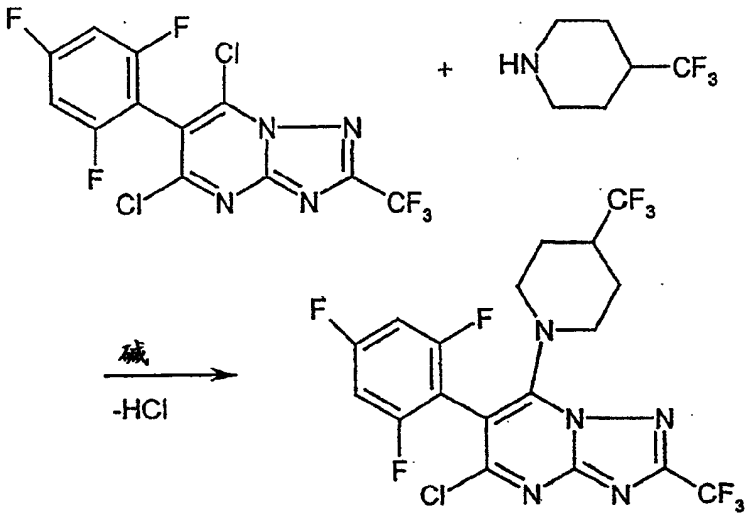
优选的本发明化合物还是酸和定义如下的式(I)三唑并嘧啶化合物的加成物：其中

R^1代表氨基，且

R^2、R^3、R^4和X具有上述对于这些基团来说是优选的定义。

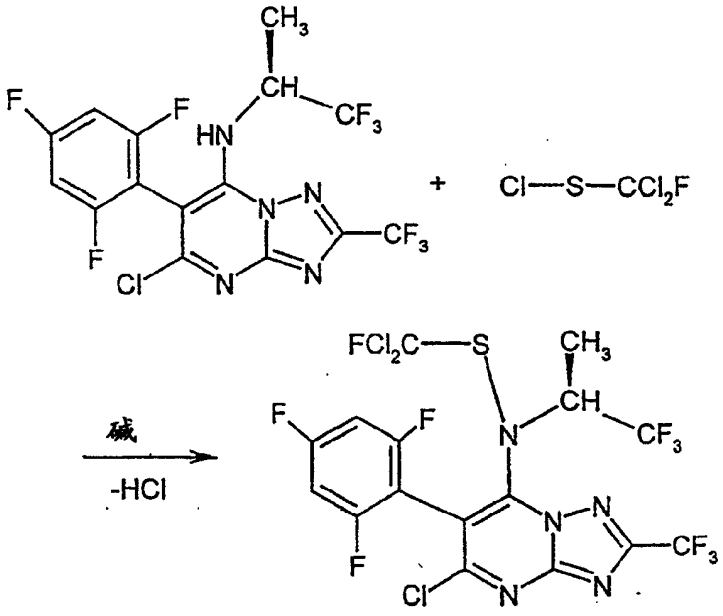
可用于加成的酸优选包括氢卤酸，例如盐酸和氢溴酸，例如尤其是盐酸，和磷酸、硝酸，一元和二元羧酸以及羟基羧酸，例如乙酸、马来酸、琥珀酸、富马酸、酒石酸、柠檬酸、水杨酸、山梨酸和乳酸，和磺酸，例如对甲苯磺酸、1,5-萘二磺酸、糖精和硫代糖精。

使用5,7-二氯-2-(三氟甲基)-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]-三唑并[1,5-a]嘧啶和4-三氟甲基哌啶作为原料，本发明方法(a)的过程可通过下述反应方案举例说明。



使用5-氯-2-(三氟甲基)-N-[(1S)-2,2,2-三氟-1-甲基乙基]-6-(2,4,6-三

氟苯基)-[1,2,4]-三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺和二氯氟甲硫基氯（sulfenylchlorid）作为原料，本发明方法(b)的过程可通过下述反应方案举例说明。

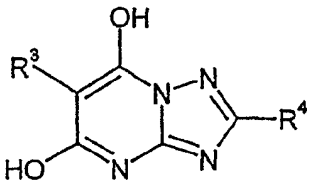


式(II)提供了用作进行本发明方法(a)所需原料的二卤代三唑并嘧啶化合物的一般定义。在该式中，R^3、R^4和X优选具有在描述本发明式(I)化合物时已提及的对于这些基团来说是优选的含义。Y^1优选代表氟、氯或溴，特别优选氟或氯。

式(II)二卤代三唑并嘧啶化合物是新的。这些化合物也适于控制不需要的微生物。

这些二卤代三唑并嘧啶化合物可通过下述方法制得:

c) 将式(V)二羟基三唑并嘧啶



(V)

其中

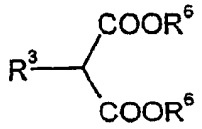
R^3和R^4具有上文给出的含义，

与卤化剂反应，任选地在稀释剂存在下进行该反应。

式(V)提供了用作进行方法(c)所需原料的二羟基三唑并嘧啶化合物的一般定义。在该式中，R^3和R^4优选具有在描述本发明式(I)化合物时已提及的对于这些基团来说是优选的含义。

式(V)二羟基三唑并嘧啶迄今为止也是未知的。它们可通过下述方法制得:

d) 将式(VI)芳基丙二酸酯



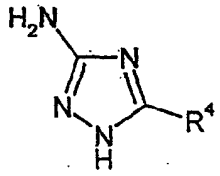
(VI)

其中

R^3具有上文给出的含义，且

R^6代表具有1－4个碳原子的烷基，

与式(VII)氨基三唑化合物反应



(VII)

其中

R^4具有上文给出的含义，

任选地在稀释剂存在下和任选地在酸结合剂存在下进行该反应。

式(VI)提供了用作进行方法(d)所需原料的芳基丙二酸酯的一般定义。在该式中，R^3优选具有在描述本发明式(I)化合物时已提及的对于该基团来说是优选的含义。R^6优选代表甲基或乙基。

式(VI)芳基丙二酸酯是已知的，或者可通过已知方法制得（参见US-A 6156925）。

式(VII)提供了用作进行方法(d)所需原料的氨基三唑化合物的一般定义。在该式中，R^4优选具有在描述本发明式(I)化合物时已提及的对于该基团来说是优选的含义。

式(VII)氨基三唑化合物是已知的，或者可通过已知方法制得（参见J. Org. Chem. (1974), 39(11), Khim. Geterotsikl. Soedin. (1989), (2),

278 或 Zh. Obshch. Khim. (1969), 39(11))。

适于进行方法(d)的稀释剂是常用于这类反应的所有惰性有机溶剂。优选使用醇，例如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇。

适于进行方法(d)的酸结合剂是常用于这类反应的所有无机和有机碱。优选使用叔胺，例如三丁基胺或吡啶。过量使用的胺还可以起稀释剂的作用。

当进行方法(d)时，温度可在较宽的范围内变化。该方法一般在 20℃－200℃、优选 50℃－180℃的温度下进行。

方法(d)一般在常压下进行。然而，该方法也可以在升压下或减压下进行。

当进行方法(d)时，式(VI)芳基丙二酸酯和式(VII)氨基三唑化合物一般以等当量的量使用。然而，还可以使用过量的一种或另一种成分。后处理通过常规方法进行。

适用于进行方法(c)的卤化剂是常用于通过卤素置换羟基的所有成分。优选使用三氯化磷、三溴化磷、五氯化磷、三氯氧化磷、亚硫酰氯、亚硫酰溴或其混合物。相应的式(II)氟化合物可通过与氟化钾反应而由氯-或溴化合物制得。

适用于进行方法(c)的稀释剂是常用于这类卤化反应的所有溶剂。优选使用卤代脂族或芳族烃，例如氯苯。然而，卤化剂自身，例如三氯氧化磷或卤化剂的混合物也能够起稀释剂的作用。

当进行方法(c)时，温度也可以在较宽的范围内变化。该方法一般在 0℃－150℃、优选 10℃－120℃的温度下进行。

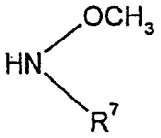
方法(c)一般在常压下进行。然而，该方法也可以在升压下进行。

当进行方法(d)时，一般将式(V)二羟基三唑并嘧啶化合物与过量卤化剂反应。后处理通过常规方法进行。

式(III)提供了用作进行本发明方法(a)所需原料的胺的一般定义。在该式中，R^1 和 R^2 优选具有在描述本发明式(I)化合物时已提及的对于 R^1 和 R^2 来说是优选的含义。

某些式(III)胺是已知的。

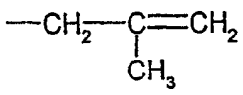
式(IIIa)胺是新的，



(IIIa)

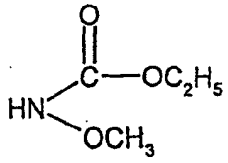
其中

R^7代表异丁基、2-甲氧基乙基或代表



式(IIIa)胺可这样制得:

e) 在第一个步骤中，将式(VIII) N-甲氧基氨基甲酸乙酯



(VIII)

与式(IX)卤素化合物反应，

$$R^7—X^1 \qquad (IX)$$

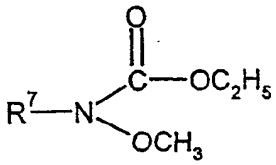
其中

R^7具有上文给出的含义，且

X^1代表溴或碘，

该反应在碱存在下和在稀释剂存在下进行，

和在第二个步骤中，将所得式(X)氨基甲酸酯



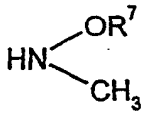
(X)

其中

R^7具有上文给出的含义，

与氢氧化钾在乙醇和水存在下反应。

式(IIIb)胺也是新的



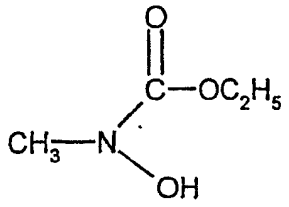
(IIIb)

其中

R^7具有上文给出的含义。

式(IIIb)胺可这样制得:

f) 在第一个步骤中，将式(XI) N-羟基-N-甲基氨基甲酸乙酯



(XI)

与式(IX)卤素化合物反应，

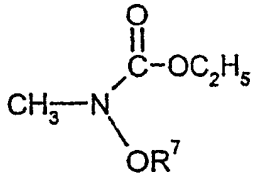
$$R^7—X^1 \qquad (IX)$$

其中

R^7和X^1具有上文给出的含义，

该反应在碱存在下和在稀释剂存在下进行，

和在第二个步骤中，将所得式(XII)氨基甲酸酯



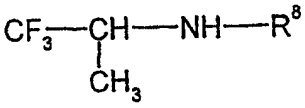
(XII)

其中

R^7具有上文给出的含义，

与氢氧化钾在乙醇和水存在下反应。

式(IIIc)三氟异丙基胺也是新的



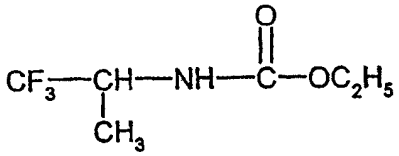
(IIIc)

其中

R^8代表甲基、乙基或丙基。

式(IIIc)三氟异丙基胺可这样制得:

g) 在第一个步骤中，将式(XIII) N-三氟异丙基氨基甲酸乙酯



(XIII)

与式(XIV)卤素化合物反应，

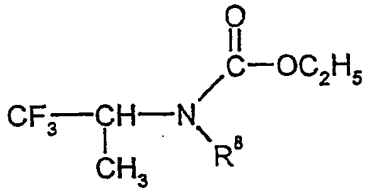
$$R^8—X^1 \qquad (XIV)$$

其中

R^8和X^1具有上文给出的含义，

该反应在碱存在下和在稀释剂存在下进行，

和在第二个步骤中，将所得式(XV)氨基甲酸酯



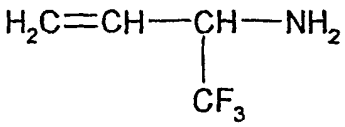
(XV)

其中

R^8具有上文给出的含义，

与氢氧化钾在乙醇和水存在下反应。

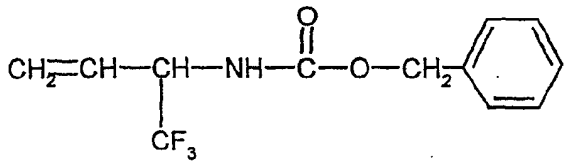
最后，式(III-4) 3-三氟甲基-3-氨基丙烯也是新的



(III-4)

式(IIId) 3-三氟甲基-3-氨基丙烯可这样制得:

h) 将式(XVI)氨基甲酸酯



(XVI)

与含水盐酸反应。

需要用作进行本发明方法(e)－(g)的原料的式(VIII)、(IX)、(XI)、(XIII)、(XIV)和(XVI)化合物是已知的，或者可通过已知方法制得。

适于进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第一个步骤的有机和无机酸受体包括常用于这类反应的所有酸受体。

可优选使用碱土金属或碱金属氢化物、-氢氧化物、-氨基化物、-醇化物、-乙酸盐、-碳酸盐或-碳酸氢盐，例如氢化钠、氨基钠、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾、氢氧化钠、氢氧化钾、乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾和碳酸氢钠，以及铵化合物，例如氢氧化铵、乙酸铵和碳酸铵。作为有机碱，可提及的有叔胺，例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基哌啶、N-甲基吗啉、N,N-二甲基氨基吡啶、二氮杂二环辛烷(DABCO)、二氮杂二环壬烯(DBN)或二氮杂二环十一碳烯(DBU)。

适于进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第一个步骤的稀释剂包括所有通常的惰性有机溶剂。可优选使用醚，例如乙醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或茴香醚；酰胺，例如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-N-甲酰苯胺或N-甲基吡咯烷酮；砜，例如环丁砜；醇，例如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、正丁醇。

当进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第一个步骤时，反应温度分别可在较宽的范围内变化。其通常在0℃-150℃、优选10℃-100℃的温度下进行。

当进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第一个步骤时，其通常分别在常压下进行。然而，也可以在升压下进行，或者，当反应中没有低沸点成分时，可以在减压下进行反应。

当进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第一个步骤时，

- 每摩尔式(VIII)N-甲氧基氨基甲酸乙酯，一般使用0.5-15摩尔、优选1-5摩尔式(IX)卤素化合物，或者

• 每摩尔式(XI)N-羟基-N-甲基氨基甲酸乙酯，一般使用 0.5－15 摩尔、优选 1－5 摩尔式(IX)卤素化合物，或者

• 每摩尔式(XIII) N-三氟异丙基氨基甲酸乙酯，一般使用 0.5－15 摩尔、优选 1－5 摩尔式(XIV)卤素化合物。

后处理分别依据常规方法来进行，例如萃取，然后干燥，或者沉淀，然后过滤并干燥。可通过常规方法除去仍然存在的任何杂质。

当进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第一个步骤时，作为中间体获得的式(X)、(XII)和(XV)化合物是新的。

当进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第二个步骤时，同样分别能够在较宽的范围内改变反应温度。其通常在 0℃－100℃、优选 10℃－80℃的温度下进行。

当进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第二个步骤时，其通常也分别在常压下进行。然而，也可以在升压下进行，或者，当欲分离的产物不具有非常低的沸点时，可以在减压下进行反应。

当进行本发明方法(e)、(f)和(g)的第二个步骤时，每摩尔式(X)、(XII)或(XV)化合物，分别使用最高达 10 摩尔氢氧化钾。后处理依据常规方法进行。一般通过加入酸，优选盐酸，将胺以其盐的形式适当地分离出来。

当进行本发明方法(h)时，同样能够在较宽的范围内改变反应温度。其通常在 10℃－150℃的温度下、优选回流温度下进行。

当进行本发明方法(h)时，通常在常压下进行。然而，也可以在升压下进行。

当进行本发明方法(h)时，每摩尔式(XVI)氨基甲酸酯，使用过量，优选最高达 10 摩尔盐酸。后处理也依据常规方法进行。

式(Ia)提供了用作进行本发明方法(b)所需原料的三唑并嘧啶化合物的一般定义。在该式中，R^2、R^3、R^4和 X 优选具有在描述本发明式(I)化合物时已提及的对于这些基团来说是优选的含义。

式(Ia)三唑并嘧啶化合物是本发明化合物，它们可通过本发明方法(a)制得。

式(IV)提供了用作进行本发明方法(b)所需原料的硫基卤（Sulfensäurehalogenide）的一般定义。在该式中，R^5优选具有在描述本发明式(I)化合物时已提及的对于该基团来说是优选的含义。

Y^2优选代表氟、氯或溴，特别优选氯。

式(IV)硫基卤是已知的或者可通过已知方法制得。

适于进行本发明方法(a)的稀释剂是所有常规惰性有机溶剂。优选使用脂族、脂环族或芳族烃，例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氢萘；卤代烃，例如氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚，例如乙醚、二异丙基醚、甲基叔丁基醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷或 1,2-二乙氧基乙烷；酰胺，例如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺或 N-甲基吡咯烷酮；酯，例如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亚砜，例如二甲亚砜；砜，例如环丁砜。

适于进行本发明方法(a)的酸受体是常用于这类反应的所有酸结合剂。优选使用叔胺，例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基哌啶、N-甲基吗啉、N,N-二甲基氨基吡啶、二氮杂二环辛烷(DABCO)、二氮杂二环壬烯(DBN)或二氮杂二环十一碳烯(DBU)。

当进行本发明方法(a)时，反应温度可在较宽的范围内变化。该方法一般在 0℃－150℃、优选 0℃－80℃的温度下进行。

本发明方法(a)和方法(b)一般都可以在常压下进行。然而，它们也可以在升压或减压下，一般在 0.1－10 巴压力下进行。

当进行本发明方法(a)时，每摩尔式(II)二卤代三唑并嘧啶化合物，一般使用 0.5－10 摩尔、优选 0.8－2 摩尔式(III)胺。后处理通过常规方法进行。

对于式(I)三唑并嘧啶化合物的酸加成盐的制备，合适的酸包括上文在描述本发明酸加成盐时已提及的优选的酸。

式(I)化合物的酸加成盐可依据常规成盐法以简单的方式获得，例如将式(I)化合物溶解在合适的惰性溶剂中，加入酸，例如盐酸，并通过已知方法例如过滤分离出盐，任选地通过用惰性有机溶剂洗涤来纯化。

本发明化合物具有强的杀微生物活性，并且可用于在农作物保护和材料保护中控制不需要的微生物，例如真菌和细菌。

杀真菌剂可用于在农作物保护中控制 Plasmodiophoromycetes、Oomycetes、Chytridiomycetes、Zygomycetes、Ascomycetes、担子菌纲

（Basidiomycetes）和 Deuteromycetes。

杀细菌剂可用于在农作物保护中控制假单胞菌科（Pseudomonadaceae）、根瘤菌科（Rhizobiaceae）、肠杆菌科（Enterobacteriaceae）、棒状杆菌科（Corynebacteriaceae）和链霉菌科（Streptomycetaceae）。

可提及在上面列出的属名下的某些引起真菌和细菌疾病的病原体作为实例（但不是为了限制）：

黄单胞菌属（Xanthomonas species），例如野油菜黄单胞菌水稻致病变种（Xanthomonas campestris pv. oryzae）；

假单胞菌属（Pseudomonas species），例如丁香假单胞菌黄瓜致病变种（Pseudomonas syringae pv. Lachrymans）；

欧文氏菌属（Erwinia species），例如解淀粉欧文氏菌（Erwinia amylovora）；

腐霉属（Pythium species），例如终极腐霉（Pythium ultimum）；

疫霉属（Phytophthora species），例如蔓延疫霉（Phytophthora infestans）；

假霜霉属（Pseudoperonospora species），例如律草假霜霉（Pseudoperonospora humuli）或古巴假霜霉（Pseudoperonospora cubensis）；

单轴霉属（Plasmopara species），例如葡萄生单轴霉（Plasmopara viticola）；

盘梗霉属（Bremia species），例如莴苣盘梗霉（Bremia lactucae）；

霜霉属（Peronospora species），例如豌豆霜霉（Peronospora pisi）或芸苔霜霉（Peronospora brassicae）；

白粉菌属（Erysiphe species），例如禾白粉菌（Erysiphe graminis）；

单丝壳菌属（Sphaerotheca species），例如苍耳单丝壳菌（Sphaerotheca fuliginea）；

柄球菌属（Podosphaera species），例如苹果白粉病柄球菌（Podosphaera leucotricha）；

黑星菌属（Venturia species），例如苹果黑星菌（Venturia inaequalis）；

核腔菌属（Pyrenophora species），例如圆核腔菌（Pyrenophora teres）或麦类核腔菌（Pyrenophora graminea）（分生孢子型：Drechslera，

syn: Helminthosporium）；

旋孢霉属（Cochliobolus species），例如禾旋孢霉（Cochliobolus sativus）（分生孢子型：Drechslera，syn: Helminthosporium）；

单胞锈菌属（Uromyces species），例如疣顶单胞锈菌（Uromyces appendiculatus）；

柄锈菌属（Puccinia species），例如隐匿柄锈菌（Puccinia recondita）；

核盘菌属（Sclerotinia species），例如油菜核盘菌（Sclerotinia sclerotiorum）；

腥黑粉菌属（Tilletia species），例如小麦网腥黑粉菌（Tilletia caries）；

黑粉菌属（Ustilago species），例如裸黑粉菌（Ustilago nuda）或燕麦黑粉菌（Ustilago avenae）；

薄膜革菌属（Pellicularia species），例如佐佐木氏薄膜革菌（Pellicularia sasakii）；

Pyricularia species，例如 Pyricularia oryzae;

镰孢属（Fusarium species），例如大刀镰孢（Fusarium culmorum）；

葡萄孢属（Botrytis species），例如灰色葡萄孢（Botrytis cinerea）；

壳针孢属（Septoria species），例如颖枯壳针孢（Septoria nodorum）；

小球腔菌属（Leptosphaeria species），例如 Leptosphaeria nodorum;

尾孢属（Cercospora species），例如 Cercospora canescens;

链格孢属（Alternaria species），例如甘蓝黑斑病链格孢（Alternaria brassicae）；和

Pseudocercosporella species 例如 Pseudocercosporella herpotrichoides。

本发明活性化合物在植物中还具有非常良好的加强作用。因此，它们可用于调动植物的防御以抵抗不需要的微生物的攻击。

应当理解，在本发明上下文中，植物加强（抵抗诱导）物质是指这样的物质，它们能够刺激植物的防御系统，这样当给植物接种不需要的微生物时，被处理的植物表现出针对这些微生物的实质抗性。

应当理解，在本发明上下文中，不需要的微生物是指导致植物病的真菌、细菌和病毒。因此，本发明化合物可用于在治疗后的一定时间内保护植物以抵抗所述病原体的攻击。用本发明活性化合物治疗植物后，所提供的保护时间一般为 1－10 天，优选 1－7 天。

在控制植物疾病所需的浓度下，本发明活性化合物被植物良好地耐

受，这使得可处理植物的地上部分、繁殖用茎干和种子以及土壤。

本发明活性化合物还适于提高农作物的产量。此外，它们表现出降低的毒性，并且被植物良好地耐受。

在一些浓度和施用量下，本发明活性化合物还可以用作除草剂，以影响植物生长和控制动物害虫。它们还可以用作合成另外的活性化合物的中间体和前体。

本发明活性化合物可用于处理所有植物和植物部分。在本文中，植物应当理解为是所有植物和植物群体，例如需要和不需要的野生植物或农作物（包括天然农作物）。农作物可以是可通过常规育种和优化方法，或通过生物技术和基因工程方法或这些方法的组合获得的植物，包括转基因植物，并包括可以或不可以被植物品种产权保护的植物变种。植物部分应理解为是指植物的所有地上和地下部分和器官，例如芽、叶、花和根，可提及的实例有叶、针状叶、茎、树干、花、芽体、果实和种子以及根、块茎和根茎。植物部分还包括收割的植物以及营养性与生殖繁殖性材料，例如幼苗、块茎、根茎、切茎和种子。

用本发明活性化合物处理植物和植物部分可直接进行，或通过依据常规处理法使化合物作用于其环境、习生地或贮藏区域来进行，例如通过浸泡、喷雾、蒸发、雾化、洒、刷涂来施加活性化合物，对于繁殖材料、特别是对于种子，还可以通过涂敷上单层或多层包衣来施加活性化合物。

在材料的保护中，还可以使用本发明化合物来保护工业材料抗不需要的微生物的感染和破坏。

应当理解，在本发明上下文中，工业材料是指已经制备的用于工业的非生活材料。例如，可通过本发明活性化合物保护以防止被微生物改变或破坏的工业材料可以是粘合剂、浆料、纸张和纸板、织物、皮革、木材、油漆和塑料制品、冷却润滑剂和可被微生物感染或破坏的其它材料。可由于微生物的增殖而遭到破坏的生产设备部分，例如冷却水回路也在可保护的材料范围内。可提及的在本发明范围内的工业材料优选为粘合剂、浆料、纸张和纸板、皮革、木材、油漆、冷却润滑剂和传热液体，特别优选木材。

可提及的能够降解或改变工业材料的微生物是例如细菌、真菌、酵母、藻类和粘液微生物。本发明活性化合物优选抗真菌，特别是霉菌，

使木材脱色和破坏木材的真菌（担子菌纲），和抗粘液微生物和藻类。

可提及下列属的微生物作为实例：

链格孢属（Alternaria），例如纤细链格孢（Alternaria tenuis），

曲霉属（Aspergillus），例如黑色曲霉（Aspergillus niger），

毛壳霉属（Chaetomium），例如球毛壳霉（Chaetomium globosum），

粉孢革菌属（Coniophora），例如单纯粉孢革菌（Coniophora puteana），

香菇属（Lentinus），例如 Lentinus tigrinus，

青霉属（Penicillium），例如灰绿青霉（Penicillium glaucum），

多孔菌属（Polyporus），例如变色多孔菌（Polyporus versicolor），

短柄霉属（Aureobasidium），例如出芽短柄霉（Aureobasidium pullulans），

Sclerophoma，例如 Sclerophoma pityophila，

木霉属（Trichoderma），例如绿色木霉（Trichoderma viride），

埃希氏杆菌属（Escherichia），例如大肠埃希氏杆菌（Escherichia coli），

假单胞菌属（Pseudomonas），例如铜绿假单胞菌（Pseudomonas aeruginosa），和

葡萄球菌属（Staphylococcus），例如金黄色葡萄球菌（Staphylococcus aureus）。

根据其特定的物理和/或化学性质，可将本发明活性化合物转化成常规制剂，例如溶液、乳剂、悬浮液、粉剂、泡沫剂、糊剂、粒剂、气雾剂和在聚合物以及种子包衣组合物中的微囊，ULV 冷和温热的雾化剂。

这些制剂可通过已知方法制得，例如通过将活性化合物与增容剂，即液体溶剂、在压力下的液化气体和/或固体载体混合，并任选使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂和/或泡沫形成剂来制得。如果所用的增容剂是水，例如还可以使用有机溶剂作为辅助溶剂。基本合适的液体溶剂有：芳族溶剂例如二甲苯、甲苯或烷基萘，氯代芳族烃和氯代脂族烃例如氯苯、氯乙烯（Chlorethylene）或二氯甲烷，脂族烃例如环己烷或石蜡，如石油馏分，醇例如丁醇或二醇，及其醚和酯，酮例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮，强极性溶剂例如二甲基甲酰胺或二甲亚砜，和水。液化气体增容剂或载体应当理解是指在标准温度和常压下是气态的液体，例如气雾剂推进剂如卤代烃或丁烷、丙

烷、氮和二氧化碳。合适的固体载体有：例如天然矿物，例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土，和合成矿物，例如细分散的二氧化硅、矾土和硅酸盐。适用于粒剂的固体载体有：例如粉碎和分级的天然岩石，例如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石，和合成的无机和有机粗粉颗粒，例如锯屑、椰壳、玉米棒碎块和烟草茎。合适的乳化剂和/或泡沫形成剂有：例如非离子和阴离子乳化剂，例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐或蛋白水解产物；合适的分散剂有：例如木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

可在制剂中使用增粘剂，例如粉末、颗粒或胶乳形式的羧甲基纤维素以及天然和合成聚合物，例如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，或天然磷脂，例如脑磷脂和卵磷脂，与合成磷脂。其它合适的添加剂是矿物油和植物油。

还可以使用着色剂，例如无机颜料，如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝，和有机染料，例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料，和微量营养素，例如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

制剂一般含有 0.1－95％重量的活性化合物、优选 0.5－90％重量的活性化合物。

本发明活性化合物可以以其自身的形式使用或在将制剂中使用，以及在与已知的杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂或杀昆虫剂的混合物中使用以拓宽例如活性谱或防止发展出抗药性。在许多情况下，可获得协同作用，即混合物的活性大于单独组分的活性。

合适的混合组分的实例如下：

杀真菌剂：

aldimorph, 氨丙膦酸、氨丙膦酸钾、andoprim、敌菌灵、戊环唑、腈嘧菌酯，

苯霜灵、麦锈灵、苯菌灵、苄烯酸、苄烯酸-异丁酯、双丙氨酰膦、乐杀螨、联苯、双苯三唑醇、灭瘟素、糠菌素、磺嘧菌灵、粉病定，

石硫合剂、capsimycin、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、萎锈灵、carvon、灭螨锰、灭瘟唑、苯咪唑菌、地茂散、氯化苦、百菌清、乙菌利、clozylacon、硫杂灵、清菌脲、环唑醇、环丙嘧啶、酯菌胺、氯环丙酰胺，

双乙氧咪唑威、双氯酚、苄氯三唑醇、diclofluanid、哒菌清、氯硝胺、乙霉威、噁醚唑、甲菌定、烯酰吗啉、烯唑醇、烯唑醇-M、敌螨普、二苯胺、吡菌硫、灭菌磷、二噻农、吗菌灵、多果定、敌菌酮，

克瘟散、氧唑菌、乙环唑、乙菌定、氯唑灵，

噁唑酮菌、菌拿灵、异嘧菌醇、腈苯唑、呋菌胺、种衣酯、拌种咯、苯锈定、丁苯吗啉、薯瘟锡、毒菌锡、福美铁、嘧菌腙、氟定胺、氟联苯菌（flumetover）、氟菌安、喹唑菌酮、调嘧醇、氟硅唑，磺菌胺、氟酰胺、粉唑胺、灭菌丹、藻菌磷（fosetyl-aluminium）、藻菌磷（fosetyl-sodium）、四氯苯酞、麦穗宁、呋氨丙灵、呋吡唑灵、灭菌安（furcarbonil）、呋菌唑、呋醚唑、拌种胺、fenhexamide，

双胍辛醋酸酯，

六氯苯、己唑醇、噁霉灵，

烯菌灵、酰胺唑、双胍辛醋酸盐、双八胍盐、双胍辛醋酸盐、iodocarb、环戊唑醇、异稻瘟腈(IBP)、异丙定、irumamycin、富士一号、氯苯咪菌酮、iprovalicarb，

春雷霉素、亚胺菌、铜制剂，例如：氢氧化铜、环烷酸铜、氯氧化铜、硫酸铜、氧化铜、喹啉铜和碱式硫酸铜混合物，

锰铜混剂、代森锰锌、代森锰、meferimzone、嘧菌胺、丙氧灭锈胺、甲霜灵、环戊唑菌、磺菌威、甲呋菌胺、代森联、苯吡洛菌（metomeclam）、metsulfovax、米多霉素、腈菌唑、甲菌利，

福美镍、异丙消、氟苯嘧啶醇，

呋酰胺、噁霜灵、oxamocarb、喹菌酮、氧化萎锈灵、oxyfenthiin，

多效唑、稻瘟酯、戊菌唑、戊菌隆、氯瘟磷、picoxystrobin、多马霉素、哌丙灵、多抗霉素、polyoxorim、烯丙苯噻唑、咪鲜胺、腐霉利、霜霉威、propanosine-sodium、丙环唑、丙森锌、pyraclostrobin、吡菌磷、啶斑肟、嘧霉胺、咯喹酮、氯吡呋醚，

唑喹菌酮、五氯硝基苯(PCNB)、喹氧灵，

硫磺粉和硫制剂、螺噁茂胺，

戊唑醇、叶枯酞、四氯硝基苯、四环唑、四氟醚唑、噻菌灵、噻菌腈、溴氟唑菌、甲基硫菌灵、福美双、硫氰苯甲酰胺、甲基立枯磷、甲苯氟磺胺、三唑酮、三唑醇、叶锈特、咪唑嗪、水杨菌胺、三环唑、十三吗啉、trifloxystrobin、氟菌唑、嗪胺灵、灭菌唑，

烯效唑，

有效霉素、乙烯菌核利、烯霜苄唑，

氰菌胺、代森锌、福美锌以及

咪草酸，

OK-8705，

OK-8801，

α-(1,1-二甲基乙基)-β-(2-苯氧基乙基)-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇，

α-(2,4-二氯苯基)-β-氟-b-丙基-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇，

α-(2,4-二氯苯基)-β-甲氧基-a-甲基-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇，

α-(5-甲基-1,3-二噁烷-5-基)-β-[[4-(三氟甲基)-苯基]-亚甲基]-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇，

(5RS,6RS)-6-羟基-2,2,7,7-四甲基-5-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-3-辛酮，

(E)-a-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-苯氧基-苯基乙酰胺，

1-(2,4-二氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-乙酮 O-(苯基甲基)-肟，

1-(2-甲基-1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮，

1-(3,5-二氯苯基)-3-(2-丙烯基)-2,5-吡咯烷二酮，

1-[(二碘甲基)-磺酰基]-4-甲基-苯，

1-[[2-(2,4-二氯苯基)-1,3-二氧戊环-2-基]-甲基]-1H-咪唑，

1-[[2-(4-氯苯基)-3-苯基环氧乙烷基]-甲基]-1 H-1,2,4-三唑，

1-[1-[2-[(2,4-二氯苯基)-甲氧基]-苯基]-乙烯基]-lH-咪唑，

1-甲基-5-壬基-2-(苯基甲基)-3-吡咯烷醇（pyrrolidinol），

2',6'-二溴-2-甲基-4'-三氟甲氧基-4'-三氟-甲基-l,3-噻唑-5-甲酰苯胺（carboxanilid），

2,6-二氯-5-(甲基硫基)-4-嘧啶基硫氰酸酯，

2,6-二氯-N-(4-三氟甲基苄基)-苯甲酰胺，

2,6-二氯-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]-甲基]-苯甲酰胺，

2-(2,3,3-三碘-2-丙烯基)-2H-四唑，

2-[(1-甲基乙基)-磺酰基]-5-(三氟甲基)-1,3,4-噻二唑，

2-[[6-去氧-4-O-(4-O-甲基-β-D-吡喃葡糖苷基)-a-D-吡喃葡糖基]-氨基]-4-甲氧基-1H-吡咯并[2,3-d]嘧啶-5-腈，

2-氨基丁烷，

2-溴-2-(溴甲基)-戊烷二腈，

2-氯-N-(2,3-二氢-1,1,3-三甲基-1H-茚-4-基)-3-吡啶甲酰胺，

2-氯-N-(2,6-二甲基苯基-N-(异硫氰酸根合甲基)-乙酰胺，

2-苯基苯酚(OPP)，

3,4-二氯-1-[4-(二氟甲氧基)-苯基]-1H-吡咯-2,5-二酮，

3,5-二氯-N-[氰基[(1-甲基-2-丙炔基)-氧基]-甲基]-苯甲酰胺，

3-(1,1-二甲基丙基-1-氧代-1H-茚-2-腈，

3-[2-(4-氯苯基)-5-乙氧基-3-异噁唑烷基]-吡啶，

4-氯-2-氰基-N,N-二甲基-5-(4-甲基苯基)-1H-咪唑-1-磺酰胺，

4-甲基-四唑并[1,5-a]喹唑啉-5(4H)-酮，

8-羟基喹啉硫酸盐，

9H-呫吨-2-[(苯基氨基)-羰基]-9-甲酸酰肼，

双-(1-甲基乙基)-3-甲基-4-[(3-甲基苯甲酰基)-氧基]2,5-噻吩二甲酸酯，

顺-1-(4-氯苯基)-2-（1H-1,2,4-三唑-1-基）-环庚醇，

顺-4-[3-[4-(1,1-二甲基丙基)-苯基-2-甲基丙基]-2,6-二甲基-吗啉盐酸盐，

[(4-氯苯基)-偶氮]-氰基乙酸乙酯，

碳酸氢钾，

甲四硫醇钠盐，

1-(2,3-二氢-2,2-二甲基-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯，

N-(2,6-二甲基苯基)-N-(5-异噁唑基羰基)-DL-丙氨酸甲酯，

N-(氯乙酰基)-N-(2,6-二甲基苯基)-DL-丙氨酸甲酯，

N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-呋喃基)-乙酰胺，

N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氢-2-氧代-3-噻吩基)-乙酰胺，

N-(2-氯-4-硝基苯基)-4-甲基-3-硝基-苯磺酰胺，

N-(4-环己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺，

N-(4-己基苯基)-1,4,5,6-四氢-2-嘧啶胺，

N-(5-氯-2-甲基苯基)-2-甲氧基-N-(2-氧代-3-噁唑烷基)-乙酰胺，

N-(6-甲氧基)-3-吡啶基)-环丙烷甲酰胺，

N-[2,2,2-三氯-1-[(氯乙酰基)-氨基]-乙基]-苯甲酰胺，

N-[3-氯-4,5-双(2-丙炔基氧基)-苯基]-N'-甲氧基-甲亚氨酰胺(methanimidamid)，

N-甲酰基-N-羟基-DL-丙氨酸-钠盐，

[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸 O,O-二乙酯

苯基丙基硫代氨基磷酸 O-甲基 S-苯基酯，

1,2,3-苯并噻二唑-7-硫代羟酸 S-甲酯，

螺[2H]-1-苯并吡喃-2,1'(3'H)-异苯并呋喃]-3'-酮，

4-[3,4-二甲氧基苯基]-3-(4-氟苯基)-丙烯酰基]吗啉。

杀细菌剂：

溴硝丙二醇、双氯酚、三氯甲基吡啶、福美镍、春雷霉素、辛噻酮、呋喃羧酸、土霉素、烯丙苯噻唑、链霉素、叶枯酞、硫酸铜和其它铜制剂。

杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂：

阿维菌素、乙酰甲胺磷、啶虫脒、氟丙菊酯、棉铃威、涕灭威、砜灭威、顺式氯氰菊酯、甲体氯氰菊酯、双甲脒、齐墩螨素、AZ 60541、艾扎丁、甲基吡噁磷、谷硫磷 A、谷硫磷 M、三唑锡，

日本甲虫芽孢杆菌、球形芽孢杆菌、枯草芽孢杆菌、苏云金杆菌、baculoviruses、蚕白僵菌、纤细白僵菌、噁虫威、丙硫克百威、杀虫磺、苯螨特、高效氟氯氰菊酯、联苯肼酯、联苯菊酯、bioethanomethrin、生物氯菊酯、bistrifluron、仲丁威、溴硫磷 A、合杀威、噻嗪酮、特密硫磷、丁酮威、butylpyridaben，

硫线磷、甲萘威、克百威、三硫磷、丁硫克百威、杀螟丹、chloethocarb、氯氧磷、氟唑虫清、毒虫畏、氟啶脲、氯甲磷、毒死蜱、甲基毒死蜱、chlovaporthrin、chromafenozide、顺式苄呋菊酯、顺式氯菊酯、clocythrin、除线威、四螨嗪、clothianidine、杀螟腈、cycloprene、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、三环锡、氯氰菊酯、灭蝇胺，

溴氰菊酯、甲基内吸磷、内吸磷硫赶式异构体、甲基内吸磷硫赶式异构体、丁醚脲、二嗪磷、敌敌畏、三氯杀螨醇、除虫脲、乐果、甲基毒虫畏、苯虫醚、乙拌磷、碘酰丁二辛、苯氧炔螨，

eflusilanate、emamectin、右旋烯炔菊酯、硫丹、虫霉属、S-氰戊聚酯、乙硫苯威、乙硫磷、灭线磷、醚菊酯、特苯噁唑、乙嘧硫磷，

苯线磷、喹螨醚、苯丁锡、杀螟硫磷、苯硫威、fenoxacrim、苯氧威、甲氰菊酯、fenpyrad、fenpyrithrin、唑螨酯、杀灭菊酯、锐劲特、氟啶蜱脲、flubrocythrinate、氟螨脲、氟氰戊菊酯、氟虫脲、氟氯苯

菊酯、flutenzine、氟胺氰菊酯、地虫硫磷、丁苯硫磷、噻唑磷、fubfenprox、呋线威，

颗粒体病毒

特丁苯酰肼、六六六、庚烯磷、氟铃脲、噻螨酮、烯虫乙酯，

吡虫啉、噁二唑虫、氯唑磷、异柳磷、噁唑磷、齐墩螨素，

核多角体病毒，

高效氯氟氰菊酯、氟丙氧脲，

马拉硫磷、灭蚜磷、四聚乙醛、甲胺磷、Metharhizium anisopliae、Metharhizium flavoviride、杀扑磷、甲硫威、蒙五一五、灭多威、甲氧苯酰肼、速灭威、噁虫酮、速灭磷、米尔螨素、milbemycin、久效磷，

二溴磷、烯啶虫胺、硝虫噻嗪、双苯氟脲，

氧乐果、杀线威、亚砜磷，

玫烟色拟青霉、对硫磷A、甲基对硫磷、氯菊酯、稻丰散、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、抗蚜威、甲基嘧啶磷、嘧啶磷A、丙溴磷、猛杀威、克螨特、残杀威、丙硫磷、发硫磷、吡蚜酮、吡唑硫磷、反灭虫菊、除虫菊素、哒螨灵、pyridathion、嘧胺苯醚、蚊蝇醚，

奎硫磷，

ribavirin，

杀抗松、硫线磷、氟硅菊酯、艾克敌105、spirodiclofen、sulfotep、硫丙磷，

氟胺氰菊酯、虫酰肼、吡螨胺、嘧丙磷、氟苯脲、七氟菊酯、双硫磷、灭虫畏、特丁硫磷、杀虫畏、三氯杀螨砜、辛体氯氰菊酯、thiacloprid、thiamethoxam、噻丙腈、thiatriphos、硫环杀、硫双威、久效威、敌贝特、氯溴氰菊酯、四溴菊酯、苯螨噻、唑蚜威、三唑磷、triazuron、氯咪唑、敌百虫、杀铃脲、混杀威、

蚜灭多、氟吡唑虫、麦柯特尔，

YI 5302，

己体氯氰菊酯、zolaprofos，

(1R-顺)-[5-(苯基甲基)-3-呋喃基]-甲基-3-[(二氢-2-氧代-3(2H)-亚呋喃基)-甲基]2,2-二甲基环丙烷羧酸酯，

(3-苯氧基苯基)-甲基 2,2,3,3-四甲基环丙烷羧酸酯，

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]四氢-3,5-二甲基-N-硝基-1,3,5-三嗪-2(1H)-亚胺，

2-(2-氯-6-氟苯基)-4-[4-(1,1-二甲基乙基)苯基]-4,5-二氢噁唑，

2-(乙酰氧基)-3-十二烷基-1,4-萘二酮，

2-氯-N-[[[4-(1-苯基乙氧基)-苯基]-氨基]-羰基]-苯甲酰胺，

2-氯-N-[[[4-(2,2-二氯-1,1-二氟乙氧基)-苯基]-氨基]-羰基]-苯甲酰胺，

丙基氨基甲酸(3-甲基苯基)酯，

4-[4-(4-乙氧基苯基)-4-甲基戊基]-1-氟-2-苯氧基-苯，

4-氯-2-(1,1-二甲基乙基)-5-[[2-(2,6-二甲基-4-苯氧基苯氧基)乙基]硫代]-3(2H)-哒嗪酮，

4-氯-2-(2-氯-2-甲基丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]-3(2H)-哒嗪酮，

4-氯-5-[(6-氯-3-吡啶基)甲氧基]-2-(3,4-二氯苯基)-3(2H)-哒嗪酮，

苏云金芽孢杆菌 EG-2348 株系，

[2-苯甲酰基-1-(1,1-二甲基乙基)]-苯甲酰肼，

丁酸 2,2-二甲基-3-(2,4-二氯苯基)-2-氧代-1-氧杂螺[4,5]癸-3-烯-4-基酯，

[3-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚噻唑烷基]-氰腈，

二氢-2-(硝基亚甲基)-2H-1,3-噻嗪-3(4H)-甲醛，

[2-[[1,6-二氢-6-氧代-1-(苯基甲基)-4-哒嗪基]氧基]乙基]-氨基甲酸乙酯，

N-(3,4,4-三氟-1-氧代-3-丁烯基)-甘氨酸，

N-(4-氯苯基)-3-[4-(二氟甲氧基)苯基]-4,5-二氢-4-苯基-1H-吡唑-1-甲酰胺，

N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-N'-甲基-N''-硝基-胍，

N-甲基-N'-(1-甲基-2-丙烯基)-1,2-肼二硫代甲酰胺，

N-甲基-N'-2-丙烯基-1,2-肼二硫代甲酰胺，

[2-(二丙基氨基)-2-氧代乙基]-乙基硫代氨基磷酸 O,O-二乙酯，

N-氰基甲基-4-三氟甲基-烟酰胺，

3,5-二氯-1-(3,3-二氯-2-丙烯氧基)-4-[3-(5-三氟甲基吡啶-2-基氧基)-丙氧基]-苯。

与其它已知的活性化合物，例如除草剂或与肥料和生长调节剂的混合物也是可能的。

此外，本发明式(I)化合物还具有非常良好的抗霉菌活性。它们具有非常广的抗霉菌活性谱，特别是抗皮真菌和酵母，霉菌和二相真菌（例如抗假丝酵母属(Candida species)，例如白色假丝酵母(Candida albicans)、Candida glabrata），和絮状表皮癣菌（Epidermophyton fluccosum），曲霉属，例如黑色曲霉和烟曲霉（Aspergillus fumigatus），发癣菌属（Trichophyton species），例如须发癣菌属（Trichophyton mentagrophytes），小孢子菌属（Microsporon species），例如犬小孢子菌（Microsporon canis）和头癣小孢子菌（Microsporon audouinii）。列出这些真菌并不是限制所覆盖的霉菌谱，而只是为了举例说明。

本发明活性化合物可以其自身或其制剂形式，或从中制备的应用形式使用，如现用溶液，悬浮液，可湿性粉剂，糊剂，可溶粉剂，粉剂和粒剂。可以以常规方式使用活性化合物，例如泼浇、喷雾、弥雾、撒播、喷粉、成泡、涂布等。还可通过超低容量的方法，或注射活性化合物的制剂或活性化合物本身至土壤的方法使用活性化合物。还可以处理植物的种子。

当使用本发明活性化合物作为杀真菌剂时，根据施用方式，施用比例可在较宽的范围内变化。在处理植物部分时，活性化合物的施用比例通常为0.1－10000 g/ha，优选10－1000g/ ha。在给种子包衣时，活性化合物的施用比例通常是每千克种子需要0.001－50 g，优选0.01－10 g活性化合物。在处理土壤时，活性化合物的施用比例通常是0.1－10000 g/ha，优选1－5000 g/ha。

如上所述，可用本发明活性化合物处理所有植物和植物部分。在优选的实施方案中，可以处理野生植物种类和植物品种，或通过常规生物培养的方法，如杂交或原生质体融合制备的植物种类和植物品种及其部分。在更优选的实施方案中，可处理通过基因工程方法，如果需要与常规方法组合获得的转基因植物和植物品种及其部分(改变基因的生物体)。术语“部分”或“植物的部分”或“植物部分”如上所述。

特别优选根据本发明处理各自可从市场上购买或正在应用的植物品种的植株。植物品种意义上应理解为通过常规栽培、通过诱变或也

通过DNA重组技术获得的具有某些新品质（“特征”）的植物。它们可以是品种、生物型或基因型。

根据植物种类或植物品种、其生长地和生长条件(土壤、气候、种植期、营养)，依据本发明的处理还可以获得超叠加(“协同”)作用。因此，例如，降低施用比例和/或拓宽活性谱和/或增加可根据本发明使用的物质和组合物的活性，使植物更好的生长、增加对高温或低温的耐受性、增加对干旱或对水或对土壤盐含量的耐受性、增加开花的质量、更容易收获、加速成熟、较高产量、收获产品的较好品质和/或较高的营养价值、收获产品的较好储藏稳定性和/或可加工性是可能的，这超过了实际所预期的效果。

优选根据本发明处理的转基因(即通过基因工程获得的)植物或植物品种包括所有植物，由于采用基因重组的方法改性，上述植物含有给予它们特别有益品质的基因材料。上述品质的实例为使植物更好的生长、增加对高或低温的耐受性、增加对干旱或对水或对土壤盐含量的耐受性、增加开花的质量、更容易收获、加速成熟、较高产量、收获产品的较好品质和/或较高的营养价值、较好的储藏稳定性和/或收获产品的可加工性。其他应特别强调的上述品质的实例是增加保护植物不受有害动物和微生物，如昆虫、螨、致病真菌、细菌和/或病毒的侵害，且还可增加植物对一些除草活性化合物的耐受性。可以提及的上述转基因植物的实例为重要的作物，如谷类(小麦、水稻)、玉米、大豆、马铃薯、棉花、菜籽油菜以及果树植物(苹果、梨、柑桔和葡萄)，且特别应强调的是玉米、大豆、马铃薯、棉花和菜籽油菜。应特别强调的品质是在植物中增加保护植物不受昆虫侵害的毒素的形成，特别是在植物中形成从苏云菌芽孢杆菌基因材料(例如通过基因CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、 CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb和CryIF及其组合)中获得的毒素(本文中称作“Bt植物”)。应更特别强调的品质是通过获得系统抗性(SAR)、系统毒素、植物抗毒素、引导物和抗性基因、和表达的相应蛋白质和毒素而增加植物对真菌、细菌和病毒的抗性。应更特别强调的品质是增加植物对一些除草剂活性化合物，例如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或Phosphinothricin(例如“PAT”基因)的耐受性。在转基因植物中，具有上述的有益品质的基因，还可以以彼此组合的形式存在。可以提及

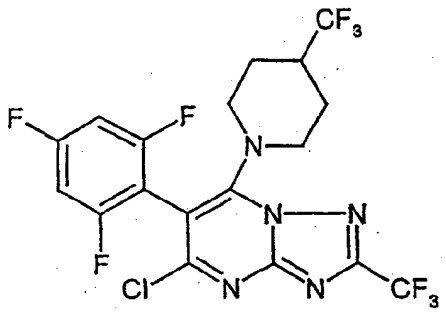
的“Bt植物”的实例为以下述商品名销售的玉米品种、棉花品种、大豆品种和马铃薯品种：YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)和NewLeaf®(马铃薯)。可以提及的耐除草剂植物的实例为以下述商品名销售的玉米品种、棉花品种和大豆品种：Roundup Ready®(例如耐草甘膦的玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(例如耐phosphinothricin的菜籽油菜)、IMI®(耐咪唑啉酮类)和STS®(例如耐磺酰脲的玉米)。还可以提及的抗除草剂植物(以常规方式培养的耐除草剂植物)包括以商品名Clearfield®(例如玉米)销售的品种。当然，上述说明还适用于具有这些基因品质或有待在将来发展的基因品质的植物品种，在将来这些植物将被培育和/或市场化。

可根据本发明以特别有利的方式用本发明式(I)化合物处理上面列出的植物。上文列出的关于活性化合物的优选范围也适用于这些植物的处理。特别应强调的是用本文中具体提及的化合物处理植物。

下面通过实施例举例说明本发明。

制备实施例

实施例1



方法(a)

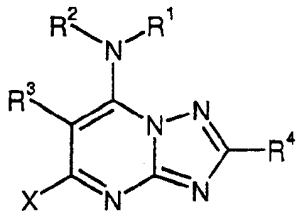
将0.18 g三乙胺加到0.7 g (181 mmol) 5,7-二氯-2-(三氟甲基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶和0.28 g (1.81 mmol) 4-三氟甲基哌啶在20 ml二氯甲烷内的溶液中。将该混合物在室温搅拌18小时。然后在搅拌下向该反应混合物中加入1N盐酸并搅拌直至混合物的pH为1－2 (约50 ml)。分离出有机相，用硫酸钠干燥，并减压浓缩。用石油醚研制该残余物，并抽滤。获得了0.3 g (产率为30.3％) 5-氯-2-(三氟

甲基)-7-[4-三氟甲基)-1-哌啶基]-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶。

HPLC: logP = 4.43

下表1中列出的式（I）化合物也是通过上述方法获得的。

表1



(I)

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
1	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.43	
2	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.99	
3	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.94	
4	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.39	
5	$-CH_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.06	
6	$-CH_2-CH_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.18	
7	$-CH_2-CH_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.76	
8	$-CH_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.64	
9	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	t-butyl	Cl		4.24	
10	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.73	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
11	-异丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.8	
12	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.01	
13	$-CH_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.69	
14	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.83	
15	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		4.34	
16	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.76	
17	-异丙基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl		3.39	
18	$-CH_2-CN$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.02	
19	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl	AS	3.59	
20	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl	BS	3.61	
21	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.15	
22	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.82	
23	$-CH_2-CN$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		2.27	
24	$-CH_2-CN$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		2.91	
25	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Br		3.99	
26	-异丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.71	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
27	$-NH_2$	-异丙基	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.77	
28	异丙基氨基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.7	
29	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.93	
30	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.37	
31	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.04	
32	环戊基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.25	
33	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.25	
34	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.22	
35	环丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.53	
36	$-CH_3$	$-CH_3$	2-氯苯基	环丙基	Cl		3.13	
37	$-C_2H_5$	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
38	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	环丙基	Cl			
39	$-CH_2-CN$	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
40	环戊基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
41	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2-氯苯基	环丙基	Cl			
42	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	环丙基	Cl			

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
43	2-甲氧基乙基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
44	$-CH_3$	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
45	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	环丙基	Cl			
46	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	环丙基	Cl			
47	环己基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
48	环丙基甲基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
49	异丙基氧基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.05	
50	1-环丙基乙基氧基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
51	正丁基氧基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
52	$-NH-CH_2-CF_2-CHF_2$	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
53	$-NH-CH_2-CH(CH_3)_2$	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
54	烯丙基氧基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
55	$-NH-CH_2-CF_3$	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
56	异丙基氧基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
57	叔丁基氧基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl			
58	$-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.:(℃)
59	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.86	
60	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.43	
61	正丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.75	
62	环戊基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.23	
63	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.23	
64	2-甲氧基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.34	
65	环丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.51	
66	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.09	
67	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.6	
68	环丙基甲基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.86	
69	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.04	
70	$-CH_2-CH_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.85	
71	$-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.57	
72	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.29	
73	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.94	
74	正丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.14	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
75	环戊基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.66	
76	-异丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.15	
77	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.71	
78	2-甲氧基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		2.68	
79	环丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		2.85	
80	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.53	
81	环丙基甲基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.23	
82	-异丙基	-H	3-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.01	
83	$-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.2	
84	异丙基氧基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.68	
85	$-CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.57	
86	$-CH_3$	$-CH_3$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.49	
87	$-C_2H_5$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.44	
88	$-C(CH_3)_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.7	
89	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.43	
90	$-CH_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.12	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
91	$-C_2H_5$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		2.78	
92	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		2.8	
93	$-CH_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		2.44	
94	$-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		4.27	
95	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.69	123-25
96	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.73	100-02
97	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	3-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.32	
98	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.85	
99	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.15	
100	$-CH_3$	$-CH_3$	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.6	
101	$-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.18	
102	$-C_2H_5$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.5	
103	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.92	
104	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.46	
105	$-C(CH_3)_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.37	
106	环丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.82	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
107	2-甲氧基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.38	
108	$-CH_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.17	
109	$-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.76	
110	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.09	
111	环丙基甲基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.89	
112	$-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.84	
113	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.03	
114	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.91	
115	$-CH(CH_2OH)-COOCH_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.93	
116	$-CH(CH_3)-CH_2-O-CH_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.64	
117	$-CH(CH_3)-CH=CH-CH(CH_3)-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.52	
118	AB3	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.11	
119	AB4		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.65	
120	AB5	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.47	
121	AB6		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.13	
122	$-CH(CH_3)-CH_2-OH$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.93	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
123	$-CH(CH_3)-CH(O-CH_3)_2$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.74	
124	$-CH(CH_3)-COOCH_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.45	
125	$-CH_2-COOCH_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.13	
126	$-CH(CH_3)-COO-t-$叔丁基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.44	
127	$-NH_2$	异丁基	2,4,6-三氟苯基	$-C_2H_5$	Cl		3.47	176-78
128	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.84	
129	$-NH_2$	异丁基	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.06	糊
130	$-NH_2$	异丁基	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.12	157-8
131	$-NH_2$	异丁基	3-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.31	155-8
132	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.01	
133	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.9	
134	1,2-二甲基丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.37	
135	异丁氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.88	
136	$-O-C_2H_5$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.22	
137	3-氯苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.21	
138	4-氯苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.23	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
139	-O-CH(CH_3)-CH_2-CH_3	-H	2,6-二氟苯基	-CH_3	Cl		2.78	
140	烯丙氧基	-H	2,6-二氟苯基	-CH_3	Cl		2.38	
141	叔丁氧基	-H	2,6-二氟苯基	-CH_3	Cl		2.68	
142	2-六氢吡喃基氧基	-H	2,6-二氟苯基	-CH_3	Cl		2.54	
143	-O-CH_3	-CH_3	2,6-二氟苯基	-CH_3	Cl		2.54	
144	O-异丙基	-H	2,6-二氟苯基	-CH_3	Cl		2.46	
145	异丁基	-H	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		3.14	
146	-CH_2-C(CH_3)$_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		3.5	
147	2-丁基	-H	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		3.1	
148	-CH_2-CH_2-N(CH_3)$_2$	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		1.5	
149	炔丙基	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		2.77	
150	-CH_2-$COOC_2H_5$	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		2.8	
151	1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		2.67	
152	烯丙基	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		3.18	
153	(2-呋喃基)甲基	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		3.22	
154	异丁丙	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		3.63	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
155	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.55	
156	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.59	
157	烯丙基	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.5	
158	(2-呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.55	
159	(2-四氢呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.26	
160	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.14	
161	正丁基	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.08	
162	环丙基甲基	正丙基	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.08	
163	(2-四氢呋喃基)甲基	正丙基	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.68	
164	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.81	
165	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.9	
166	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.9	
167	$-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.03	
168	AB7		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.73	
169	$-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.84	
170	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.61	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
171	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.17	
172	正丙基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.52	
173	环戊基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.97	
174	-异丙基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.52	
175	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.98	
176	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.2	
177	2-甲氧基乙基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.12	
178	环丙基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.28	
179	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.84	
180	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.36	
181	环丙基甲基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.62	
182	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.78	
183	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.56	
184	$-CH_2-CH_2-CF_3$	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.63	
185	1-环己基乙基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		4	
186	环己基	-H	2,6-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.28	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
187	2-丁基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.82	
188	3-三氟甲基环己基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.37	
189	3,5-双-三氟甲基环己基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.62	
190	4-三氟甲基环己基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.39	
191	异丁基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3	
192	正丁基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.04	
193	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.4	
194	2-丁基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.01	
195	$-CH_2-CH_2-CF_3$	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.76	
196	-异丙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.69	
197	环己基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.46	
198	1-环己基乙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.24	
199	环丙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.45	
200	环丙基甲基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.77	
201	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.72	
202	1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.56	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
203	烯丙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.06	
204	(2-呋喃基)甲基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.1	
205	异丁基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.49	
206	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.41	
207	烯丙基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.35	
208	(2-四氢呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.18	
209	2-甲氧基乙基	正丙基	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.26	
210	异丁基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.1	
211	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.57	
212	2-丁基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.09	
213	环戊基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.28	
214	-异丙基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.75	
215	环丙基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.54	
216	环丙基甲基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.85	
217	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.83	
218	$-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2$	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.84	
219	1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基	$-CH_3$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.62	
220	烯丙基	$-CH_3$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.19	
221	异丁基	$-CH_3$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.65	
222	2-甲氧基乙基	$-CH_3$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.64	
223	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.57	
224	烯丙基	$-C_2H_5$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.5	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
225	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.94	
226	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.27	
227	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		0.75	
228	$-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		0.75	
229	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.92	
230	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.94	
231	$-CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.7	
232	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.63	
233	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.48	
234	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.38	
235	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.09	
236	2-甲氧基乙基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.3	
237	炔丙基	$-CH_3$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		2.75	
238	(2-呋喃基)甲基	$-CH_3$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.2	
239	(2-四氢呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.23	
240	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-C_2H_5$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.11	
241	正丁基	$-C_2H_5$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		4.1	
242	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.24	
243	环丙基甲基	正丙基	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		4.07	
244	(2-四氢呋喃基)甲基	正丙基	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.7	
245	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		0.75	
246	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.48	
247	正丁基	$-C_2H_5$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.18	
248	异丁基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.14	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
249	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.59	
250	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.8	
251	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.95	
252	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.33	
253	$-CH_2-CN$	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.11	
254	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.55	
255	环戊基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.29	
256	-异丙基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.77	
257	2-甲氧基乙基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.42	
258	环丙基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.77	
259	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.18	
260	$-CH_2-CF_3$	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.77	
261	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.72	
262	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.99	
263	环丙基甲基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.95	
264	2-丁基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.14	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
265	$-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.33	
266	$-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.07	
267	烯丙基	$-C_2H_5$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.59	
268	(2-四氢呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.29	
269	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.03	
270	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-C_2H_5$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.14	
271	炔丙基	$-CH_3$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.77	
272	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-CH_3$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.48	
273	烯丙基	$-CH_3$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.26	
274	(2-呋喃基)甲基	$-CH_3$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.26	
275	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.63	
276	异丁基	$-CH_3$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.68	
277	(2-四氢呋喃基)甲基	正丙基	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.72	
278	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.02	
279	1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基	$-CH_3$	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl			
280	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.14	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
281	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.74	
282	$-CH_2-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.9	
283	$-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.11	
284	AB10		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.68	
285	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.7	
286	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.74	
287	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.75	
288	$-CH_2-CH_2-C(CH_3)_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.01	
289	$-CH_2-CH_2-CH(COCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.5	
290	$-CH_2-CH=C(C_2H_5)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.94	
291	$-CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.49	
292	$-CH_2-CH_2-CH(COOCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.78	
293	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.49	
294	$-CH_2-CH_2-CH(NH-COCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.85	
295	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.32	
296	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.3	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
297	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.97	
298	4-甲苯基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.05	
299	4-氟苯基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.7	
300	AB13		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.28	
301	$-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2$	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.7	
302	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.99	
303	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.73	
304	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.02	
305	AB8		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.64	
306	AB9		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.18	
307	$-CH_2-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.83	
308	$-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.01	
309	AB10		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.6	
310	$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.08	
311	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.57	
312	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.63	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
313	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.64	
314	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.03	
315	$-CH_2-CH_2-C(CH_3)_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.91	
316	$-CH_2-CH=C(C_2H_5)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.84	
317	$-CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.39	
318	$-CH_2-CH_2-CH(COOCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.69	
319	$-CH_2-CH_2-CHBr-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.33	
320	$-CH(COOCH_3)-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.04	
321	AB12		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.15	
322	AB11		2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.26	
323	$-CH_2-CH_2-CH(NH-COCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.78	
324	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.12	
325	AB14		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.56	
326	3-甲苯基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.89	
327	AB13		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.22	
328	异丙基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.85	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
329	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.27	
330	$-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.55	
331	炔丙基	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.54	
332	1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.43	
333	烯丙基	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.95	
334	$-CH_2-CH(OCH_3)_2$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.55	
335	异丁基	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.37	
336	2-甲氧基乙基	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.45	
337	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.3	
338	正丁基	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.46	
339	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.65	
340	(2-呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.28	
341	(2-四氢呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3	
342	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.74	
343	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.85	
344	正丁基	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.82	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
345	环丙基甲基	正丙基	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.83	
346	(2-四氢吡喃基)甲基	正丙基	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.95	
347	(2-四氢呋喃基)甲基	正丙基	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.39	
348	2-甲氧基乙基	正丙基	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.12	
349	3-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.52	
350	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.23	
351	炔丙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.67	
352	2-甲氧基乙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.58	
353	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.37	
354	(2-呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.39	
355	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.04	
356	环丙基甲基	正丙基	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.91	
357	(2-四氢呋喃基)甲基	正丙基	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.6	
358	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.89	
359	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl	AS	2.95	
360	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl	BS	2.96	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
361	异丁氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.98	
362	$-O-C_2H_5$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.28	
363	苄氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.93	
364	3,5-二氟苄氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.76	
365	4-三氟甲基苄氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.43	
366	2-氯苄氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.21	
367	3-氯苄氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.28	
368	4-氯苄氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.3	
369	4-氟苄氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.98	
370	$-O-CH(CH_3)-CH_2-CH_3$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.87	
371	3-三氟甲基苄氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.38	
372	-正丁氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.98	
373	烯丙氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.42	
374	叔丁氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.75	
375	2-六氢吡喃基氧基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.59	
376	$-O-CH_3$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.03	
377	$-O-CH_3$	$-CH_3$	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.5	
378	O-异丙基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.54	
379	1-环丙基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.09	
380	$-CH_2-CF_3$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.42	
381	$-CH_3$	$-CH_3$	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.34	
382	$-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$		2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.8	
383	$-C_2H_5$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.3	
384	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.19	
385	环戊基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.11	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
386	-异丙基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.63	
387	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.95	
388	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.16	
389	$-CH_3$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.02	
390	环丙基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.41	
391	$-CH_2-CF_3$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.53	
392	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.37	
393	环丙基甲基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.72	
394	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.68	
395	$-CH_2-CH_2-CF_3$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.7	
396	1-环己基乙基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.16	
397	环己基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.43	
398	2-三氟甲基环己基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.49	
399	3,5-双-三氟甲基环己基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.73	
400	4-三氟甲基环己基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.48	
401	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.91	
402	$-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-$		2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.05	
403	$-CH_2-CN$	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.03	
404	(2-呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.56	
405	环戊基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.24	
406	$-CH_2-CF_3$	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.68	
407	$-C(CH_3)_2-CH_2-COCH_3$	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.53	
408	2-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.56	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
409	4-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.56	
410	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.8	
411	$-CH_2-CH_2-CN$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.34	
412	$-CH_2-CN$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.34	
413	$-CH_2-CH_2-CN$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.58	
414	$-CH_2-COOC_2H_5$	环丙基	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.29	
415	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.95	
416	2-甲氧基乙基	正丙基	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.36	
417	$-CH(CH_3)-CH=CH_2$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.85	
418	$-CH_3$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.37	
419	$-C_2H_5$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.31	
420	$-CH_2-CN$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.91	
421	$-C(CH_3)_2-CF_3$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.34	
422	$-CH_3$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.03	
423	$-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.33	
424	$-CH_2-CF_3$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.56	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
425	2-三氟甲基环己基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.52	
426	-OH	-异丙基	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.52	
427	苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.93	
428	3,5-二氯苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.75	
429	2,4-二氯苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.69	
430	4-三氟甲基苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.44	
431	2-氯苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.13	
432	4-氟苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.9	
433	3-三氟甲基苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.41	
434	-正丁氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.96	
435	2,6-二氯苄氧基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.31	
436	$-O-CH_3$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.07	
437	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.1	
438	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯苯基	$-CH_3$	F		2.97	
439	2-氟环丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.3	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
440	$-CH_2-COOC_2H_5$	环丙基	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3	
441	$-CH_2-CH(NH_2)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.19	
442	$-CH_2-CH_2-CH(COCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.49	
443	$-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.85	
444	4-甲苯基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.01	
445	4-氟苯基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.71	
446	AB28		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.34	
447	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2-氯苯基	环丙基	Cl		4.59	
448	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.49	
449	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.61	
450	AB8		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.73	
451	$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.16	
452	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.2	
453	$-CH(COOCH_3)-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.36	
454	$-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.96	
455	$-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.94	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
456	3-甲苯基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3	
457	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.59	
458	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.58	
459	$-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.46	
460	异丁基	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.69	
461	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.19	
462	2-丁基	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.69	
463	环戊基	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.9	
464	-异丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.35	
465	环丙基甲基	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.43	
466	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.34	
467	异丁基	$-CH_3$	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.36	
468	2-甲氧基乙基	$-CH_3$	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.29	
469	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.27	
470	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.64	
471	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.9	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
472	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.52	
473	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.66	
474	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.22	
475	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.02	
476	异丁基	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.64	
477	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.08	
478	2-丁基	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.66	
479	环戊基	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.83	
480	-异丙基	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.33	
481	$-CH_2-CF_3$	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.19	
482	环丙基甲基	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.4	
483	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.31	
484	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯苯基	环丙基	Cl		3.71	
485	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.74	
486	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.74	
487	$-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.42	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
488	-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-		2-氯苯基	环丙基	Cl		3.39	
489	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl	AS	3.51	
490	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl	BS	3.52	
491	-CH_2-$C(CH_3)$=CH_2	-C_2H_5	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.37	96-98
492	异丁基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl		3.76	
493	-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-		2-氯苯基	环丙基	Cl		4.27	
494	2-丁基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl		3.76	
495	-CH_2-$C(CH_3)$=CH_2	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl		3.41	
496	-CH_2-$C(CH_3)$=CH_2	-CH_3	2-氯苯基	环丙基	Cl		4.32	
497	异丁基	-CH_3	2-氯苯基	环丙基	Cl		4.41	
498	-CH_2-CH_2-CH_2-$CH(CH_3)$-		2-氯苯基	环丙基	Cl		3.99	
499	-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$CH(CH_3)$-		2-氯苯基	环丙基	Cl		4.61	
500	-CH_2-CF_3	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl		3.22	
501	-$CH(CF_3)$-CH_2-CH_2-CH_2-		2-氯苯基	环丙基	Cl		4.41	
502	(2,2-二氯环丙基)甲基	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		3.68	
503	-异丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.5	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
504	-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.58	
505	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AS+BS	3.75	
506	1,2-二甲基丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	-CH_3	Cl		3.35	
507	(2,2二氯环丙基)甲基	-CH_3	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.18	133-36
508	(2,2二氯环丙基)甲基	-CH_3	2-氟苯基	环丙基	Cl		4.29	
509	(2,2二氯环丙基)甲基	-CH_3	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.26	
510	(2,2二氯环丙基)甲基	-CH_3	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.37	
511	-CH_2-CH=C(C_2H_5)-CH_2-CH_2-		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.59	
512	-CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_2-		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.14	
513	-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.45	
514	AB12		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.78	
515	-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.07	
516	-CH_2-CH_2-CH(NH-$COCH_3$)-CH_2-CH_2-		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		2.2	
517	-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.03	
518	-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		2.85	
519	-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.58	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
520	AB14		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.25	
521	4-甲苯基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.6	
522	AB13		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.87	
523	1,2-二甲基丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.38	
524	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.84	
525	异丁基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.03	
526	正丁基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.07	
527	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.4	
528	2-丁基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.03	
529	$-CH_2-CH_2-CF_3$	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.7	
530	环戊基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.21	
531	环丙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.49	
532	$-CH_2-CF_3$	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.58	
533	环丙基甲基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.8	
534	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.75	
535	叔丁基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.19	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
536	3-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.44	
537	4-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.43	
538	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		1.77	
539	炔丙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.65	
540	1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.62	
541	烯丙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.09	
542	$-CH_2-CH_2-CN$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.19	
543	(2-呋喃基)甲基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.11	
544	异丁基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.54	
545	2-甲氧基乙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.73	
546	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.44	
547	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		1.91	
548	烯丙基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.4	
549	(2-呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.42	
550	$-CH_2-CH_2-CN$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.46	
551	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.05	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
552	(2-四氫呋喃基)甲基	正丙基	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.77	
553	2-甲氧基乙基	正丙基	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.39	
554	$-CH_2-COOC_2H_5$	环丙基	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.28	
555	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		2.76	
556	环己基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.47	
557	1-环己基乙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		5.12	
558	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.03	
559	AB30	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.71	
560	正丁基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.89	
561	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.28	
562	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.62	
563	$-CH_2-CH_2-CN$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.17	
564	$-CH_2-CN$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.18	
565	$-CH_2-COOCH_3$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.32	
566	(2-呋喃基)甲基	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.97	
567	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.46	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
568	烯丙基	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.3	
569	$-CH_2-CH_2-CN$	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.41	
570	2-噻吩基甲基	正丙基	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.96	
571	$-CH_2-CH_2-NH_2$	-异丙基	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		1.28	
572	AB31		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.66	
573	AB31		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.9	
574	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.07	
575	AB31		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.74	
576	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.95	
577	1,2-二甲基丙基	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl			
578	$-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-O-$		2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.61	
579	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl		4.14	
580	$-CH(CH_3)-CH=CH-CH(CH_3)-$		2-氯苯基	环丙基	Cl		4.19	
581	1,2-二甲基丙基	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.03	
582	$-CH(CH_3)-CH=CH-CH(CH_3)-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.17	
583	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.12	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
584	$-CH(CH_3)-CH=CH-CH(CH_3)-$		2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.15	
585	$-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-O-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.93	
586	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AS + BR	4.25	
587	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AR + BS	4.25	
588	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.6	
589	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.23	
590	AB31		2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.99	
591	烯丙基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.96	
592	(2-呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.97	
593	(2-四氢呋喃基)甲基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.78	
594	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.46	
595	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.54	
596	正丁基	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.52	
597	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.73	
598	环丙基甲基	正丙基	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.53	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
599	(2-四氢吡喃基)甲基	正丙基	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.71	
600	(2-四氢呋喃基)甲基	正丙基	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.22	
601	2-噻吩基甲基	正丙基	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.64	
602	2-甲氧基乙基	正丙基	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.84	
603	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		2.2	
604	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.76	
605	AB9		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		1.46	
606	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.36	
607	$-CH_2-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		2.29	
608	$-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.72	
609	AB10		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.22	
610	$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.72	
611	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.3	
612	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.37	
613	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.41	
614	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		2.57	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
615	$-CH_2-CH_2-C(CH_3)_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.67	
616	2-甲氧基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.07	
617	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.72	
618	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.82	
619	二甲基氨基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.29	
620	1-环丙基乙基氨基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.81	
621	异丁基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.9	
622	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.37	
623	2-丁基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.9	
624	环戊基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.13	
625	环丙基甲基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.63	
626	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.59	
627	异丁基	$-CH_3$	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.51	
628	2-甲氧基乙基	$-CH_3$	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.46	
629	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.41	
630	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.77	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
631	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.81	
632	$-C_2H_5$	$-C_2H_5$	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.13	
633	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.08	
634	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.72	
635	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.37	
636	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.18	
637	$-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2$	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.61	
638	$-CH_2-CF_3$	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.37	
639	$-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		4.23	
640	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl	AS + BS	3.19	
641	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl	AS	3.2	
642	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl	BS	3.17	
643	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		4.06	
644	异丁基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.38	
645	正丁基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.6	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
646	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4	
647	2-丁基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.57	
648	$-CH_2-CH_2-CF_3$	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.25	
649	正丙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.2	
650	环戊基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.76	
651	-异丙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.2	
652	环己基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.02	
653	1-环己基乙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.84	
654	2-甲氧基乙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		2.75	
655	环丙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		2.95	
656	环丙基甲基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.26	
657	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.22	
658	3-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.98	
659	4-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.93	
660	$-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2$	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.24	
661	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		1.56	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
662	炔丙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.21	
663	1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.1	
664	烯丙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.61	
665	3-(二甲基氨基)丙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		1.61	
666	$-CH_2-CH(OCH_3)_2$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.24	
667	(2-呋喃基)甲基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.63	
668	异丁基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.07	
669	2-甲氧基乙基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.16	
670	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.05	
671	正丁基	$-CH_3$	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.21	
672	$-CH_2-CF_3$	-H	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.25	
673	$-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.08	
674	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		4.6	
675	$-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.68	
676	异丁基	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		4.08	
677	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.98	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
678	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.68	
679	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.25	
680	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.17	
681	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		4.34	
682	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.9	
683	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		2.78	
684	1,2-二甲基丙基	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.18	
685	$-CH(CH_3)-C(CH_3)_3$	-H	2,6-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.56	
686	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.42	
687	$-C_2H_5$	-H	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.08	
688	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-6-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.43	
689	AB31		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.32	
690	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.56	
691	$-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.94	
692	$-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.83	
693	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.3	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
694	$-CH_2-CHF_2$	-H	2,4,6-三氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.41	
695	$-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-O-$		2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.79	
696	1,2-二甲基丙基	-H	2-氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.46	
697	$-CH_2-CHF_2$	-H	2-氟-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.54	
698	异丁基	$-CH_3$	2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.32	
699	2-甲氧基乙基	$-CH_3$	2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.3	
700	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-CH_3$	2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.21	
701	2-甲氧基乙基	$-C_2H_5$	2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.66	
702	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.94	
703	$-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.1	
704	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.55	
705	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.54	
706	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.59	
707	$-CH_2-CH_2-CHF-CH_2-CH_2-$		2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.63	
708	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		4.19	
709	$-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$		2-氟-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.05	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
710	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl	AS	4.12	
711	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl	BS	4.19	
712	$-C_2H_5$	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		2.97	
713	$-CH_2-CN$	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		2.42	
714	$-CH_2-CF_3$	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		3.17	
715	2-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		4.08	
716	3,5-双-三氟甲基环己基	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		4.31	
717	$-CH_2-COOC_2H_5$	$-CH_3$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		3.28	
718	$-CH_2-CH_2-CN$	$-CH_3$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		2.79	
719	$-CH_2-CN$	$-CH_3$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		2.79	
720	$-CH_2-COOCH_3$	$-CH_3$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		2.95	
721	$-CH_2-CH_2-Cl$	$-CH_3$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		3.5	
722	$-CH_3$	$-CH_3$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		3.06	
723	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	$-C_2H_5$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		1.65	
724	$-CH_2-CH_2-NH_2$	$-C_2H_5$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		1.47	
725	$-CH_2-CH_2-CN$	$-C_2H_5$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		3.07	
726	3-氨基丙基	正丙基	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		1.61	
727	$-CH_2-COOC_2H_5$	环丙基	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		3.84	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.:(℃)
728	AB8		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		2.17	
729	$-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.14	
730	$-CH_2-CH_2-CH(COCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.07	
731	$-CH_2-CH_2-CH(COOCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.38	
732	$-CH_2-CH_2-CHBr-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.08	
733	$-CH(COOCH_3)-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.92	
734	AB11		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		1.55	
735	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		1.43	
736	$-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.63	
737	3-甲苯基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.61	
738	4-氟苯基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		3.27	
739	-异丙基	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.14	
740	环戊基	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.66	
741	$-CH_2-CHF_2$	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		3.42	
742	$-CH_2-CF_3$	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		3.72	
743	AB31		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.23	
744	异丁基	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.44	
745	(2,2二氯环丙基)甲基	-H	2-氯苯基	环丙基	Cl		3.78	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
746	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AS + BS + AR + BR		
747	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AS + BR	3.73	
748	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AR + BS	3.77	
749	1,2-二甲基丙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.72	
750	$-NH_2$	丁基	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.36	
751	1,2-二甲基丙基	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.82	
752	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		4.31	
753	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.47	
754	$-NH_2$	丁基	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.47	
755	$-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	环丙基	Cl		4.02	208-9
756	1,2-二甲基丙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl	AR	4.72	
757	1,2-二甲基丙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl	BR	4.72	
758	1,2-二甲基丙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl	AS	4.72	
759	1,2-二甲基丙基	-H	2,4-二氟苯基	环丙基	Cl	BS	4.72	
760	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.28	
761	2-丁基	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.44	
762	$-CH_2-C(CH_3)_3$	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.9	
763	$-CH_2-CHF_2$	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		2.72	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
764	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.98	
765	$-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-O-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.26	
766	$-CH_2-CF_3$	-H	2-氯-4-氟苯基	$-CH_3$	Cl		2.8	
767	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AS	3.73	
768	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	BS	3.77	
769	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		5.25	
770	AB32		2,6-二氟苯基	cyclo-l	Cl		3.32	
771	$-CH_2-CF_3$	-H	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.04	
772	$-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		3.19	
773	$-NH_2$	异丁基	2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.65	186-8
774	AB33	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		2.7	
775	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AR + BR	4.23	
776	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	BR	4.25	
777	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AR	4.23	
778	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	AS	4.23	
779	1,2-二甲基丙基	-H	2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl	BS	4.23	
780	AB31		2,4-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.41	

实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
781	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氯苯基	$-CH_3$	Cl	AS	3.55	210-1
782	2,2,2-三氟-1-甲基乙基	-H	2,4-二氯苯基	$-CH_3$	Cl	BS	3.58	216-7
783	$-CH_2-C(CH_3)=CH_2$	$-C_2H_5$	2,4-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		4.56	
784	$-NH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.35	
785	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2-氯-4-氟苯基	环丙基	Cl		3.87	
786	AB32		2,4,6-三氟苯基	环丙基	Cl		3.56	
787	1-甲基亚乙基氨基	异丁基	2,6-二氟苯基	环丙基	Cl		4.21	
788	1,2-二甲基丙基	-H	2,4-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		4.06	132-35
789	异丁基	-H	2,4-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.68	
790	异丁基	-H	2,4-二氯苯基	环丙基	Cl		4.3	
791	$-NH_2$	异丁基	2-氯-6-氟苯基	环丙基	Cl		3.74	175-6
792	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$		2,4-二氯苯基	$-CF_3$	Cl		4.27	
793	AB8		2,4-二氯苯基	$-CF_3$	Cl		2.56	
794	$-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氯苯基	$-CF_3$	Cl		4.44	
795	AB9		2,4-二氯苯基	$-CF_3$	Cl		1.67	
796	AB10		2,4-二氯苯基	$-CF_3$	Cl		3.8	
797	$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氯苯基	$-CF_3$	Cl		5.18	
798	$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氯苯基	$-CF_3$	Cl		4.8	

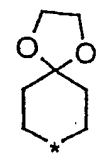
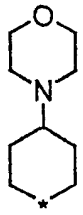
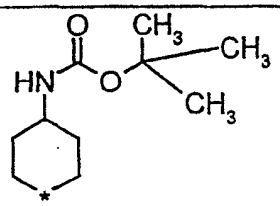
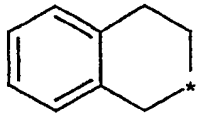
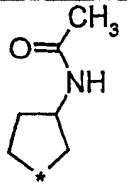
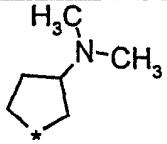
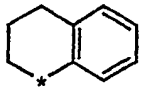
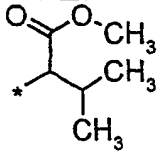
实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
799	$-CH_2-CH(OH)-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.07	
800	$-CH_2-CH_2-C(CH_3)_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		5.03	
801	$-CH_2-CH=C(C_2H_5)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.95	
802	$-CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.55	
803	$-CH_2-CH_2-CH(COOCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.81	
804	$-CH(COOCH_3)-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.32	
805	$-CH_2-CH_2-CH(CF_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.43	
806	$-CH_2-CH_2-CH(NH-COCH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		2.71	
807	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		1.65	
808	$-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.1	
809	$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.45	
810	$-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-$		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.04	
811	2-甲苯基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.99	
812	3-甲苯基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.04	
813	4-甲苯基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.08	
814	4-氟苯基	-H	2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		3.69	
815	AB13		2,4-二氟苯基	$-CF_3$	Cl		4.35	
816	$-NH_2$	异丁基	2,4-二氟苯基	$-CH_3$	Cl		3.71	

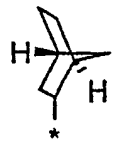
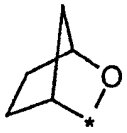
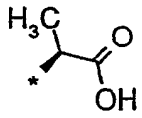
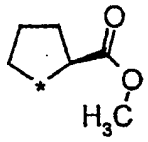
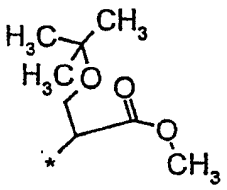
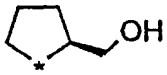
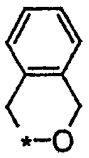
实施例序号	R^1	R^2	R^3	R^4	X	异构体	logP	m.p.: (°C)
817	$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$		2,4-二氯苯基	$-CH_3$	Cl		3.67	
818	$-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2$	-H	2,4-二氯苯基	$-CF_3$	Cl		4.73	

logP值是依据EEC-Directive 79/831 Annex V.A8通过HPLC（梯度法，乙腈/0.1％含水磷酸）确定的

***)表示R^1和R^2与它们所连接的氮原子一起形成杂环。**

****)在某些情况下，产物是作为立体异构体分离出来的。“S”或“R”分别表示在手性中心的S或R-构型。“AS”表示在阻转中心的清楚但是未知的构型和在手性中心的S构型。“BS”表示在每种情况下在阻转中心的另一个清楚但是未知的构型和在手性中心的S构型。“AR”和“BR”表示在阻转中心的各个互补构型和在手性中心的R构型。因此，在相同的取代基这种情况下，“AR”与“BS”以及“AS”与“BR”在每种情况下是对映体对。**

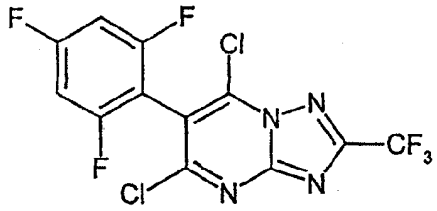
AB10	
AB11	
AB12	
AB14	
AB8	
AB9	
AB28	
AB3	

AB30	
AB31	
AB32	
AB33	
AB4	
AB5	
AB6	
AB7	

*分别表示键合位点

制备原料

实施例819



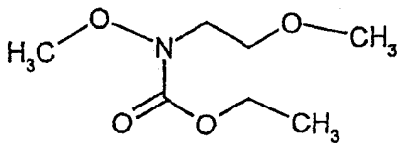
(II-1)

在室温，将2.6 g (7.43 mmol) 2-三氟甲基-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-5,7-二醇溶解在20 ml三氯氧化磷中，以少量多次的方式加入1.2 g五氯化磷，然后将该混合物加热回流6小时。在减压下蒸馏掉该反应混合物的挥发性组分。向残余物中加入20 ml水，并用20 ml二氯甲烷萃取该混合物。用硫酸钠将有机相干燥，通过硅胶色谱纯化，用二氯甲烷洗脱。获得了1.2 g (产率为37.6%) 5,7-二氯-2-(三氟甲基)-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶。

HPLC: logP = 3.71

实施例820

方法(e)，第一个步骤：

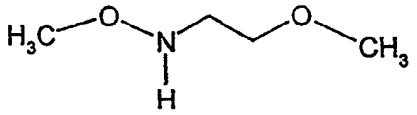


(X-1)

将1000 mg N-甲氧基氨基甲酸乙酯置于10.0 ml二甲基甲酰胺中，并分批加入403 mg氢化钠，通过冷却将温度调节至30℃。将该反应混合物在30℃搅拌2小时，然后加入3500 mg 2-溴乙基甲基醚。将该反应混合物在20℃－25℃搅拌18小时，然后搅拌到20 ml水中。将所获得的反应混合物减压浓缩至干，并用30 ml二氯甲烷萃取4次。用硫酸钠将有机萃取液干燥，过滤，并减压浓缩至干。

获得了1200 mg (N-甲氧基-N-甲氧基乙基)氨基甲酸乙酯（纯度为77.6%，产率为62.6%）。

方法(e)，第二个步骤：



(III-1)

将200 mg (N-甲氧基-N-甲氧基乙基)氨基甲酸乙酯置于4.0 ml含水乙醇(59%)中，加入240.6 mg氢氧化钾，将该混合物在40℃搅拌18小时。然后将该反应混合物搅拌到50 ml水中，用20 ml乙醚萃取3次，用20 ml二氯甲烷萃取3次。将合并的有机相用20 ml水洗涤2次，干燥，在20℃减压浓缩至20 ml的体积。

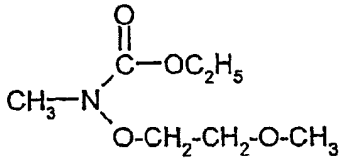
在冰冷却下向所得溶液中加入2 ml盐酸，然后将该溶液在室温搅拌1小时，并在20℃减压浓缩至干。

用15 ml甲醇将所获得的产物消融（digeriert）3次，然后在20℃减压浓缩至干。

获得了140 mg N-甲氧基-N-甲氧基乙基胺盐酸盐（产率为87.6%）。

实施例821

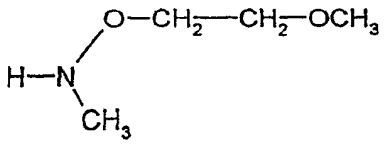
方法(f)，第一个步骤：



(XII-1)

在搅拌下将1000 mg N-羟基-N-甲基氨基甲酸乙酯与1166 mg 2-溴乙基甲基醚加热至回流温度，然后滴加493 mg氢氧化钾在5 ml乙醇中的溶液。将该反应混合物在回流状态下煮沸10小时，然后通过将反应混合物过滤并减压浓缩滤液来进行后处理。将剩余的残余物与水和乙酸乙酯的混合物混合。分离出有机相，用饱和氯化铵水溶液洗涤，然后用水洗涤。用硫酸钠将有机相干燥，并减压浓缩。获得了0.7 g产物，气相色谱表明其含有83%的(N-甲基-N-甲氧基乙氧基)氨基甲酸乙酯。由此计算的产率为39%。

方法(f)，第二个步骤：

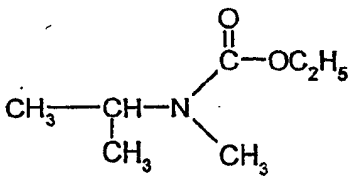


(III-2)

将200 mg (N-甲基-N-甲氧基乙氧基)氨基甲酸乙酯、4 ml乙醇和4 ml水的混合物与240.6 mg氢氧化钾粉末混合，并将该混合物在40℃搅拌2小时。然后将该反应混合物搅拌到50 ml水中，用20 ml乙醚萃取3次，之后用20 ml二氯甲烷萃取3次。将合并的有机相用20 ml水洗涤2次，用硫酸钠干燥，在室温减压浓缩至20 ml的体积。在冰冷却下将所得溶液与1 ml氯化氢乙醚溶液混合。过滤出沉淀的晶体，并干燥。获得了190 mg N-甲基-N-甲氧基乙氧基胺盐酸盐。

实施例822

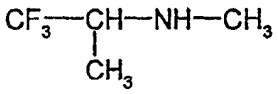
步骤(g)，第一个步骤：



(XV-1)

在室温、搅拌下将2000 mg N-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)氨基甲酸乙酯和20 ml四氢呋喃的混合物与475 mg氢化钠混合。然后在室温、搅拌下滴加4600 mg碘甲烷在10 ml四氢呋喃中的溶液。将该反应混合物在50℃搅拌16小时，然后加入水。用20 ml二氯甲烷萃取3次，用硫酸钠将合并的有机相干燥，并减压浓缩。获得了1000 mg产物，气相色谱表明其含有75％的N-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)-N-甲基氨基甲酸乙酯。由此计算的产率为34.86％。

方法(g)，第二个步骤：



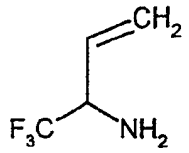
(III-3)

将1000 mg N-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)-N-甲基氨基甲酸乙酯、20 ml乙醇和20 ml水的混合物与1070 mg氢氧化钾粉末混合，并将该混合物在40℃搅拌66小时。然后用水稀释该反应混合物，用20 ml由等份二氯甲烷和乙醚组成的混合物萃取3次。用硫酸钠将合并的有机相干燥，然后

在室温于轻度减压下浓缩。在冰冷却下将所得溶液与氯化氢乙醚溶液混合，在室温搅拌60小时。减压浓缩，获得了280 mg N-(2,2,2-三氟-1-甲基乙基)-N-甲基胺盐酸盐。由此计算的产率为理论值的34％。

实施例823

方法(h):



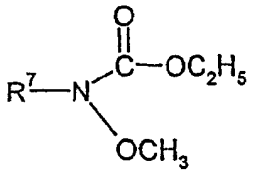
(III-4)

将600 mg N-(1-三氟甲基-2-丙烯)氨基甲酸苄酯在8.0 ml 16％浓度的盐酸中加热回流1.5小时。冷却至20℃后，将该混合物用20 ml乙醚萃取2次。

将剩余的水相减压浓缩至干，并与10 ml甲醇混合3次。减压除去甲醇后，分离出了310 mg (1-三氟甲基丙-2-烯)胺盐酸盐。由此计算的产率是82.9％。

下表中列出的氨基甲酸酯也可以通过上述方法制得。

表2



(X)

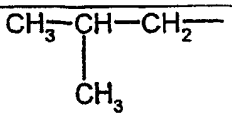
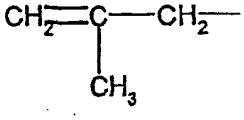
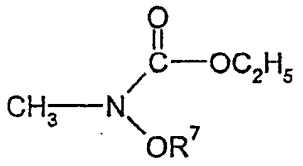
实施例序号	化合物序号	R^7	logP
824	X-2		2.38
825	X-3		2.06

表3



(XII)

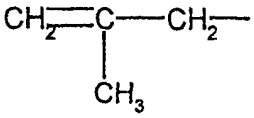
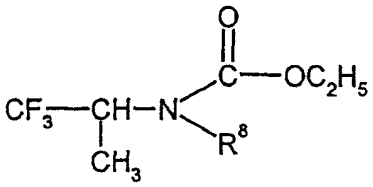
实施例序号	化合物序号	R^7	物理常数
826	XII-2		

表4

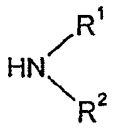


(XV)

实施例序号	化合物序号	R^8	物理常数
827	XV-2	$-C_2H_5$	^{1}H-NMR (400 MHz, CD_3CN): δ (ppm) = 1.13 (t, $\underline{CH_3}CH_2N$), 1.21 (t, $\underline{CH_3}CHCF_3$), 1.23 (t, $\underline{CH_3}CH_2O$), 3.20 (m, $\underline{CH_2}N$, $C\underline{H}CF_3$), 4.1 (q, $CH_3\underline{CH_2}O$).

下表中列出的胺也可以通过上述方法制得。

表5

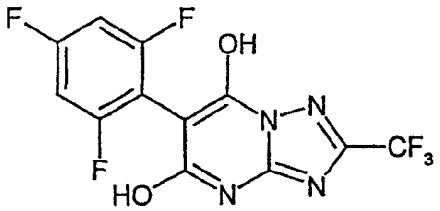


(III)

实施例序号	化合物序号	R^1	R^2	物理常数
828	III-5	$CH_3-CH(CH_3)-CH_2-$	$-OCH_3$	^{1}H-NMR (400 MHz, CD_3CN): δ (ppm) = 1.03 (d, $\underline{CH_3}_2CH$), 3.06 (d, $\underline{CH_2}$), 3.28 (b, $(CH_3)_2\underline{CH}$), 4.01 (s, OCH_3)
829	III-6	$CH_2=C(CH_3)-CH_2-$	$-OCH_3$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 1.76 (s, $\underline{CH_3}(CCH_2)CH_2$), 3.29 (b, NH, $CH_3(CCH_2)\underline{CH_2}$, OCH_3), 7.89, 5.02 (2 s, $CH_3(C\underline{CH_2})CH_2$).
830	III-7	$CH_2=C(CH_3)-CH_2-$		
831	III-8	$CF_3-CH(CH_3)-$	$-C_2H_5$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 1.06 (m, $\underline{CH_3}CH_2N$, $\underline{CH_3}CHCF_3$), 3.20 (m, $\underline{CH_2}N$), 4.1 (m, $C\underline{H}CF_3$).

实施例828－831中列出的胺分别是以其盐酸盐的形式分离出来和进行表征的。

实施例832



(V-1)

将10.1 g (38.5 mmol) 2-(2,4,6-三氟苯基)丙二酸二甲酯和5.85 g (38.5 mmol) 5-三氟甲基-1H-[1,2,4]三唑-3-基胺在10.1 ml三正丁基胺中于180℃加热6小时，期间蒸馏出所形成的甲醇。在强减压条件下蒸馏出三正丁基胺。获得了17.8 g 2-三氟甲基-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-5,7-二醇粗产物，其不用进一步纯化直接用于随后的反应。

HPLC: lopP = 0.81

实施例A

柄锈菌属（Puccinia）测试（小麦）/保护

溶剂：25 重量份的 N,N-二甲基乙酰胺

乳化剂：0.6 重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

为了制备合适的活性化合物制剂，将1重量份的活性化合物与上述量的溶剂和乳化剂混合，并用水将该浓缩物稀释至所需浓度。

为了测试保护活性，用活性化合物制剂以所指定的施用比例喷雾幼小植物。当喷雾层干燥后，用隐匿柄锈菌（Puccinia recondita）的分生孢子悬浮液喷雾植物。将植物在培养室中以20℃和100％的相对湿度放置48小时。

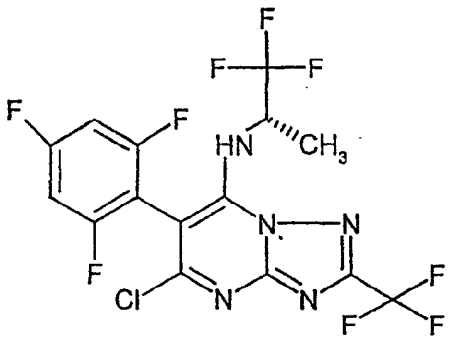
然后将植物置于温度为约20℃且相对湿度为80％的温室中，以促进锈脓疱（Rostpusteln）的形成。

接种10天后进行评价，0％表示相当于对照的效力，而100％表示没有观察到任何感染。

活性化合物、施用比例和实验结果可见下表。

表A

柄锈菌属测试（小麦）/保护

活性化合物	活性化合物的施用比例(g/ha)	效力(%)
本发明 手性  (3)	500	100

实施例B

柄球菌属（Podosphaera）测试（苹果）/保护

溶剂：24.5重量份的丙酮

24.5重量份的二甲基乙酰胺

乳化剂：1重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

为了制备合适的活性化合物制剂，将1重量份的活性化合物与上述量的溶剂和乳化剂混合，并用水将该浓缩物稀释至所需浓度。

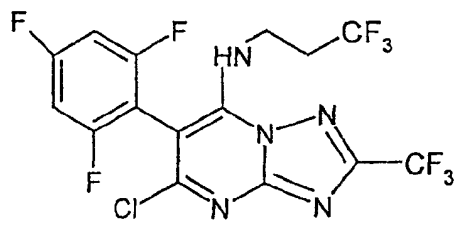
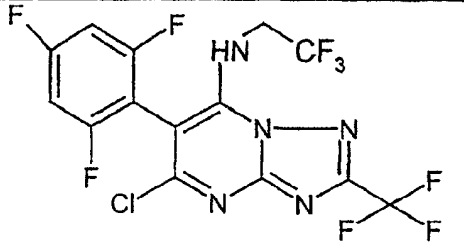
为了测试保护活性，用活性化合物制剂以所指定的施用比例喷雾幼小植物。当喷雾层干燥后，用引起苹果霉病的微生物苹果白粉病柄球菌（Podosphaera leucotricha）的孢子水悬浮液接种植物。然后将植物置于温度为约23℃且相对湿度为约70%的温室中。

接种10天后进行评价，0%表示相当于对照的效力，而100%表示没有观察到任何感染。

活性化合物、施用比例和实验结果可见下表。

表B

柄球菌属测试（苹果）/保护

活性化合物	活性化合物的施用比例(g/ha)	效力(%)
本发明  (7)	100	100
 (8)	100	100

实施例C

单丝壳菌（Spaerotheca）属测试（黄瓜）/保护

溶剂：49重量份的N,N-二甲基甲酰胺

乳化剂：1重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

为了制备合适的活性化合物制剂，将1重量份的活性化合物与上述量的溶剂和乳化剂混合，并用水将该浓缩物稀释至所需浓度。

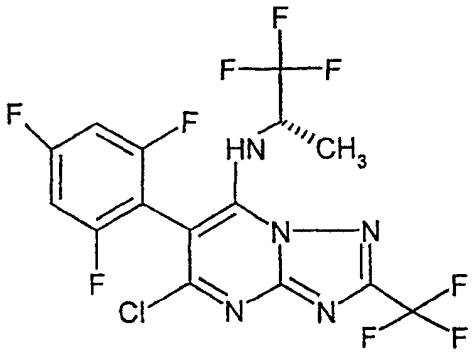
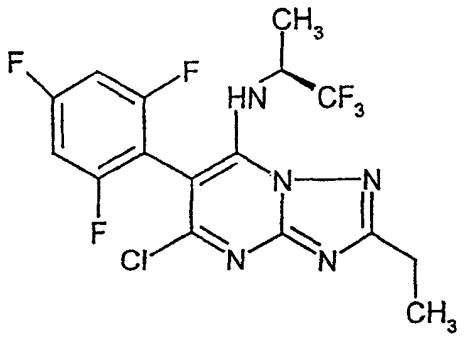
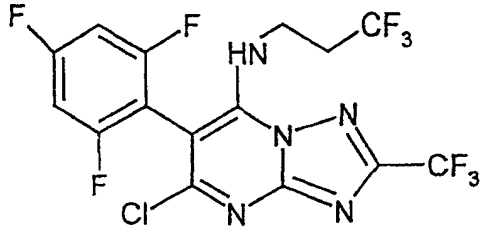
为了测试保护活性，用活性化合物制剂以所指定的施用比例喷雾幼小黄瓜植物。当喷雾层干燥后，用苍耳单丝壳菌的孢子悬浮液接种植物。然后将植物置于温度为约23℃且相对湿度为70%的温室中。

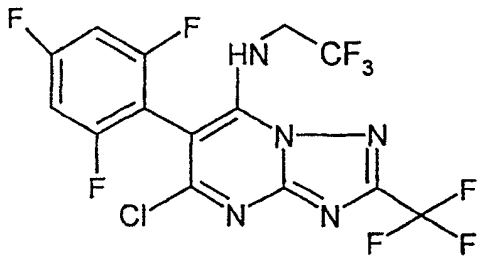
接种7天后进行评价，0%表示相当于对照的效力，而100%表示没有观察到任何感染。

活性化合物、施用比例和实验结果可见下表。

表C

单丝壳菌属测试（黄瓜）/保护

活性化合物	活性化合物的施用比例(g/ha)	效力(%)
本发明 手性  (3)	750	93
手性  (4)	750	93
 (7)	750	100

活性化合物	活性化合物的施用比例(g/ha)	效力(%)
 (8)	750	100