

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl<sup>7</sup>

C07D417/04



# [12] 发明专利说明书

A01N 43/56 C07D413/10

C07D417/10 C07D413/04

[21] ZL 专利号 97181435.X

[45] 授权公告日 2004 年 4 月 14 日

[11] 授权公告号 CN 1145626C

[22] 申请日 1997.12.1 [21] 申请号 97181435.X

[30] 优先权

[32] 1996.12.16 [33] DE [31] 19652240.4

[86] 国际申请 PCT/EP1997/006715 1997.12.1

[87] 国际公布 WO98/27090 德 1998.6.25

[85] 进入国家阶段日期 1999.7.16

[71] 专利权人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72] 发明人 C·萨加 G·哈姆普里克特

M·门吉斯 O·门克 P·莎夫

K-O·维斯特法兰 U·密斯里兹

H·瓦尔特

审查员 刘文霞

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利

商标事务所

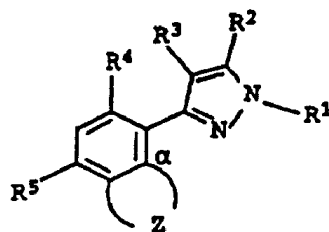
代理人 吴亦华

权利要求书 4 页 说明书 84 页

[54] 发明名称 取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物及其在农业中的应用

[57] 摘要

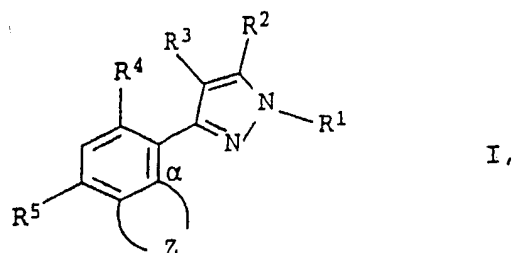
本发明涉及式 I 取代的吡唑-3-基苯并唑类及其盐，其中各取代基如说明书中所定义。本发明还涉及这些化合物用作除草剂和用于使植物干燥和/或落叶的应用。



(I)

ISSN 1008-4274

## 1. 式 I 取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物及其农业上有用的盐



其中各变量具有下列含义:

$R^1$  是  $C_1-C_4$ -烷基;

$R^2$  是  $C_1-C_4$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷基磺酰基;

$R^3$  是卤素;

$R^4$  是氢或卤素;

$R^5$  是卤素;

Z 是基团  $-N=C(XR^6) -O-$ , 它可以经氮或氧键合在  $\alpha$  上;

X 是化学键、氧、硫、 $-NH-$  或  $-N(R^7)-$

$R^6$  是  $C_1-C_6$ -烷基、羟基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_3-C_6$ -炔基、  
( $C_1-C_4$ -烷氧基) 羰基- $C_1-C_4$ -烷基, 该 ( $C_1-C_4$ -烷氧基) 羰基-  
 $C_1-C_4$ -烷基可以携带一个 ( $C_1-C_4$ -烷氧基) 羰基, 或是 ( $C_1-C_4$ -烷基)  
羰基;

如果 X 是化学键, 那么此外  $R^6$  可以是氢、氨基、卤素、 $-\text{CH}=\text{CH}-R^8$ , 其中  $R^8$  是 ( $\text{C}_1-\text{C}_4$ -烷氧基) 羰基,

$R^7$  是  $\text{C}_1-\text{C}_6$  烷基。

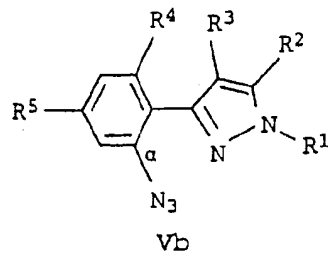
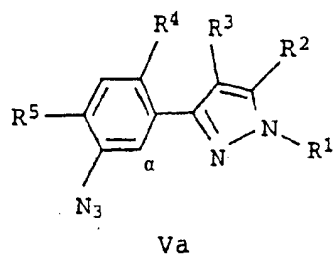
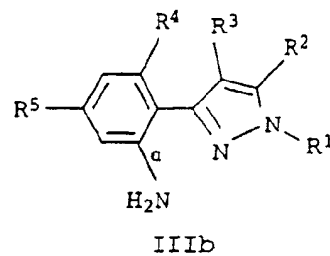
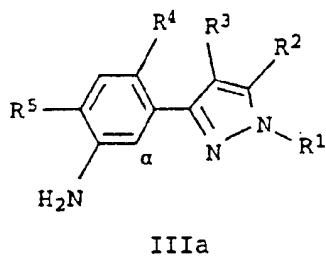
2. 权利要求 1 中所要求的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物及其农业上有用的盐作为除草剂或用于使植物干燥和/或落叶的应用。
3. 一种除草组合物, 它包含除草有效量的权利要求 1 中所要求的至少一种式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物或其农业上有用的盐和至少一种惰性液体和/或固体载体以及非必需的至少一种表面活性剂。
4. 一种用于使植物干燥和/或落叶的组合物, 它包含作为干燥剂和/或落叶剂有效量的权利要求 1 中所要求的至少一种式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物或其农业上有用的盐和至少一种惰性液体和/或固体载体以及非必需的至少一种表面活性剂。
5. 一种制备除草活性组合物的方法, 其特征在于, 将除草有效量的权利要求 1 中所要求的至少一种式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物或其农业上有用的盐与至少一种惰性液体和/或固体载体以及非必需的至少一种表面活性剂混合。
6. 一种制备作为干燥剂和/或落叶剂的组合物的方法, 其特征在于, 将作为干燥剂和/或落叶剂有效量的权利要求 1 中所要求的至少一种式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物或其农业上有用的盐与至少一种惰性液体和/或固体载体以及非必需的至少一种表面活性剂混合。

7. 一种防治有害植物的方法, 其特征在于, 使除草有效量的权利要求 1 中所要求的至少一种式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物或其农业上有用的盐作用于植物及其生存环境或种子上。
8. 一种使植物干燥和/或落叶的方法, 其特征在于, 使作为干燥剂和/或落叶剂有效量的权利要求 1 中所要求的至少一种式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物或其农业上有用的盐作用于植物上。
9. 根据权利要求 8 的方法, 其特征在于, 用于处理棉花。
10. 制备权利要求 1 的式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物的方法,
  - a) 制备其中  $\text{XR}^6$  表示卤素的式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物的方法, 其特征在于, 使其中  $\text{XR}^6$  表示氨基的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物 I 重氮化, 接着所获得的重氮盐与卤化铜 (I) 反应;
  - b) 制备其中 X 表示硫的式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物的方法, 其特征在于, 使其中  $\text{XR}^6$  表示氨基的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物 I 重氮化, 接着使所获得的重氮盐与分子式为  $\text{R}^6\text{S}-\text{SR}^6$  的二硫化二烷基反应;
  - c) 制备其中  $\text{XR}^6$  表示  $-\text{CH}=\text{CH}-\text{R}^8$  的式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物的方法, 其特征在于, 使其中  $\text{XR}^6$  表示氨基的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物 I 重氮化, 接着所获得的重氮盐与分子式为  $\text{H}_2\text{C}=\text{CH}-\text{R}^8$  的烯烃或分子式为  $\text{HC}\equiv\text{C}-\text{R}^8$  的炔烃和氯化铜 (I)、溴化铜 (I)、氯化铜 (II) 或溴化铜 (II) 反应, 其中  $\text{R}^8$  具有权利要求 1 中所给出的含义;
  - d) 制备其中 X 表示氧、硫、 $-\text{NH}-$  或  $-\text{N}(\text{R}^7)$  或其中  $\text{XR}^6$  表示  $\text{CH}(\text{R}^b)\text{R}^c$  的式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物的方法, 其特征

在于, 使其中  $\text{XR}^6$  表示氯、溴、 $-\text{SO}_2$ -烷基或 $-\text{SO}_2$ -卤代烷基的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物 I 在碱的存在下与亲核试剂  $\text{HO R}^6$ 、 $\text{HSR}^6$ 、 $\text{H}_2\text{NR}^6$ 、 $\text{HN}(\text{R}^6)\text{R}^7$  或  $\text{H}_2\text{C}(\text{R}^b)\text{R}^c$  反应, 其中  $\text{R}^b$  和  $\text{R}^c$  表示 ( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷氧基) 羰基,  $\text{R}^6$  和  $\text{R}^7$  具有权利要求 1 中所给出的含义;

e) 制备其中  $\text{XR}^6$  表示  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -烷基的式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物的方法, 其特征在于, 使其中  $\text{XR}^6$  表示卤素的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物 I, 在或不在催化剂的存在下, 与 ( $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -烷基)-格利雅-化合物反应;

f) 制备其中 Z 表示  $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^6)-\text{O}-$  的式 I 的取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物的方法, 其特征在于, 使式 IIIa 或 IIIb 的氨基苯基吡唑重氮化, 形成的重氮盐与碱金属叠氮化物反应, 获得式 Va 或 Vb 的叠氮基苯基吡唑, 该化合物接着与式  $\text{R}^6-\text{COOH}$  的羧酸反应, 其中  $\text{R}^6$  具有权利要求 1 中所给出的含义。



## 取代的吡唑-3-基苯并唑类化合物及其在农业中的应用

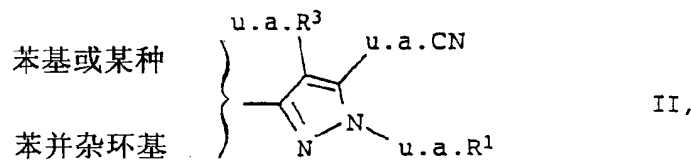
### 技术领域

本发明涉及新颖的式 I 取代的吡唑-3-基苯并唑类 (Pyrazol-3-ylbenzazole) 及其农业上有用的盐及其在农业中的应用。

### 背景技术

专利申请 WO 92/02509、WO 92/06 962、WO 86/01255、WO 96/15115、WO 96/15116 和 WO 96/40643 已经公开某些芳基吡唑作为除草剂，该化合物中的芳基除苯基外原则上还可以是不同的苯杂环基基团。

此外，WO 96/01254 通式 - 通过选择适当的取代基 - 包括式 II 化合物



其也具有除草活性。

### 发明技术内容

本发明的任务是提供新颖的有除草活性的吡唑化合物，用该化合物可以比迄今所知的化合物更好地实现有害植物的目标防治。本发明的任务还涉及提供有干燥/落叶活性的新颖化合物。

因此，发现本发明式 I 的取代的吡唑-3-基-吡唑。



烯基、 $C_3-C_6$ -炔基、氰基- $C_3-C_6$ -炔基、 $C_3-C_6$ -卤代炔基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -链烯基氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -炔基氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$ -环烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、氨基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷基氨基- $C_1-C_4$ -烷基、二( $C_1-C_4$ -烷基)氨基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷硫基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -链烯基硫基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -炔基硫基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷基亚磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基亚磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -链烯基亚磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -炔基亚磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷基磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -链烯基磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -炔基磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、羟基羰基- $C_1-C_4$ -烷基、( $C_1-C_4$ -烷氧基)羰基- $C_1-C_4$ -烷基，其可以携带一个氰基或( $C_1-C_4$ -烷氧基)羰基，( $C_1-C_4$ -烷硫基)羰基- $C_1-C_4$ -烷基、氨基羰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷基氨基羰基- $C_1-C_4$ -烷基、二( $C_1-C_4$ -烷基)氨基羰基- $C_1-C_4$ -烷基、二( $C_1-C_4$ -烷基)膦酰基- $C_1-C_4$ -烷基、( $C_1-C_4$ -烷氧基)亚氨基- $C_1-C_4$ -烷基、( $C_3-C_4$ -链烯基氧基)亚氨基- $C_1-C_4$ -烷基，

$C_3-C_8$ -环烷基、 $C_3-C_8$ -环烷基- $C_1-C_4$ -烷基、苯基、苯基- $C_1-C_4$ -烷基、3至7元杂环基或杂环基- $C_1-C_4$ -烷基，其中每个环烷基-和每个杂环基-环可以包含一个羰基环单元或硫羰基环单元，

并且其中每个环烷基环、苯基环和杂环基环是未取代的或带有一至四个各选自下列基团的取代基：氰基、硝基、氨基、羟基、羰基、卤素、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷硫基、 $C_1-C_4$ -卤代烷硫基、 $C_1-C_4$ -烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ -卤代烷基磺酰基、( $C_1-C_4$ -烷氧基)羰基、( $C_1-C_4$ -烷基)羰基、( $C_1-C_4$ -卤代烷基)羰基、( $C_1-C_4$ -烷基)羰基氧基、( $C_1-C_4$ -卤代烷基)羰基氧基或二( $C_1-C_4$ -烷基)氨基；

如果X是化学键、氧、硫、-NH-或-N( $R^7$ )-，那么 $R^6$ 可以是( $C_1-C_4$ -烷基)羰基、( $C_1-C_4$ -卤代烷基)羰基、( $C_1-C_4$ -烷氧基)羰基、 $C_1-C_4$ -烷基磺酰

基或  $C_1-C_4$ -卤代烷基磺酰基;

如果 X 是化学键, 那么此外  $R^6$  可以是氢、氰基、巯基、氨基、卤素、 $-CH_2-CH$

(卤素)  $-R^8$ 、 $-CH=CH-R^8$  或  $-CH=C$  (卤素)  $-R^8$ , 其中

$R^8$  是羟基羰基、( $C_1-C_4$ -烷氧基)羰基、( $C_1-C_4$ -烷硫基)羰基、氨基羰基、 $C_1-C_4$ -烷基氨基羰基、二( $C_1-C_4$ -烷基)氨基羰基或二( $C_1-C_4$ -烷基)膦酰基,

或者  $R^6$  和  $R^7$  一起表示 1,3-亚丙基-、四亚甲基-、五亚甲基-或亚乙基氧基亚乙基链, 它们分别是未取代的或者可以携带一至四个  $C_1-C_4$ -烷基或一或二个 ( $C_1-C_4$ -烷氧基)羰基。

此外, 本发明涉及

- 化合物 I 作为除草剂和/或用于使植物干燥/脱叶的用途,
- 包含化合物 I 作为活性成分的除草组合物和植物的干燥和/或脱叶组合物,
- 制备化合物 I 的方法和应用化合物 I 制备除草组合物和植物干燥和/或脱叶组合物的方法, 以及
- 使用化合物 I 防治有害植物和使植物干燥/脱叶的方法。

还发现包含化合物 I 并具有非常好的除草作用的除草组合物。而且, 还发现制备这些组合物的方法和采用化合物 I 控制有害植物的方法。

此外还发现, 化合物 I 还适合于使植物部分落叶和/或干燥, 例如, 适合于此的作物为农作物诸如棉花、马铃薯、油菜、向日葵、大豆或矮菜豆, 特别是棉花。在这方面, 我们已发现使植物干燥和/或落叶的组合物, 制备这些组合物的方法和用化合物 I 使植物干燥和/或落叶的方法。

根据取代基的类型, 式 I 化合物可以含有一或多个手性中心, 且因此存在对映体或非对映异构体混合物。本发明涉及纯对映体或非对映异构体及其混合物。

对于取代基  $R^1$  至  $R^3$ 、 $R^5$  至  $R^8$  或作为在环烷基、苯环或杂环上的残基所提到的有机分子部分—如卤素—是单独列举的单个的基团成员的集合名称。所有的碳链，即，所有的烷基、卤代烷基、氟基烷基、氧基烷基、氨基烷基、氧基羰基烷基、氨基羰基烷基、膦酰基烷基、氧基氨基烷基、苯基烷基、杂环基烷基、链烯基、卤代链烯基、氟基链烯基、炔基、卤代炔基和氟基炔基部分可以是直链或支链的。卤代取代基优选带有一至五个相同或不同的卤原子。卤素在每一情况下代表氟、氯、溴或碘。

下列取代基例如代表：

- $C_1$ - $C_4$ -烷基： $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、正丙基、 $CH(CH_3)_2$ 、正丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基或  $C(CH_3)_3$ ；
- $C_1$ - $C_4$ -卤代烷基：如上所述的  $C_1$ - $C_4$ -烷基，它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代，例如， $CH_2F$ 、 $CHF_2$ 、 $CF_3$ 、 $CH_2Cl$ 、 $CH(Cl)_2$ 、 $C(Cl)_3$ 、氟基甲基、二氟基甲基、氯二氟基甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、 $C_2F_5$ 、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、 $CH_2-C_2F_5$ 、 $CF_2-C_2F_5$ 、1-(氟甲基)-2-氟乙基、1-(氯甲基)-2-氯乙基、1-(溴甲基)-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基或九氟丁基；
- $C_1$ - $C_6$ -烷基：如上所述的  $C_1$ - $C_4$ -烷基，以及例如正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁

基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基或1-乙基-2-甲基丙基, 优选  $\text{CH}_3$ 、 $\text{C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、正丁基、 $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、正戊基或正己基;

-  $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基: 如上所述的  $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基, 它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代, 例如  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基下面提及的基团或者是5-氟-1-戊基、5-氯-1-戊基、5-溴-1-戊基、5-碘-1-戊基、5,5,5-三氟-1-戊基、十一氟戊基、6-氟-1-己基、6-氯-1-己基、6-溴-1-己基、6-碘-1-己基、6,6,6-三氟-1-己基或十二氟己基;

- 氰基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基:  $\text{CH}_2\text{CN}$ 、1-氰基乙基、2-氰基乙基、1-氰基丙-1-基、2-氰基丙-1-基、3-氰基丙-1-基、1-氰基丁-1-基、2-氰基丁-1-基、3-氰基丁-1-基、4-氰基丁-1-基、1-氰基丁-2-基、2-氰基丁-2-基、3-氰基丁-2-基、4-氰基丁-2-基、1-( $\text{CH}_2\text{CN}$ )乙-1-基、1-( $\text{CH}_2\text{CN}$ )-1-( $\text{CH}_3$ )-乙-1-基或1-( $\text{CH}_2\text{CN}$ )-丙-1-基;

- 羟基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基:  $\text{CH}_2\text{OH}$ 、1-羟基乙基、2-羟基乙基、1-羟基丙-1-基、2-羟基丙-1-基、3-羟基丙-1-基、1-羟基丁-1-基、2-羟基丁-1-基、3-羟基丁-1-基、4-羟基丁-1-基、1-羟基丁-2-基、2-羟基丁-2-基、3-羟基丁-2-基、4-羟基丁-2-基、1-( $\text{CH}_2\text{OH}$ )乙-1-基、1-( $\text{CH}_2\text{OH}$ )-1-( $\text{CH}_3$ )乙-1-基或1-( $\text{CH}_2\text{OH}$ )-丙-1-基;

- 氨基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基:  $\text{CH}_2\text{NH}_2$ 、1-氨基乙基、2-氨基乙基、1-氨基丙-1-基、2-氨基丙-1-基、3-氨基丙-1-基、1-氨基丁-1-基、2-氨基丁-1-基、3-氨基丁-1-基、4-氨基丁-1-基、1-氨基丁-2-基、2-氨基丁-2-基、3-氨基丁-2-基、4-氨基丁-2-基、1-( $\text{CH}_2\text{NH}_2$ )乙-1-基、1-( $\text{CH}_2\text{NH}_2$ )-1-( $\text{CH}_3$ )乙-1-基或1-( $\text{CH}_2\text{NH}_2$ )-丙-1-基;

- 羧基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: CH<sub>2</sub>COOH、1-(COOH)乙基、2-(COOH)乙基、1-(COOH)丙-1-基、2-(COOH)丙-1-基、3-(COOH)丙-1-基、1-(COOH)丁-1-基、2-(COOH)丁-1-基、3-(COOH)丁-1-基、4-(COOH)丁-1-基、1-(COOH)丁-2-基、2-(COOH)丁-2-基、3-(COOH)丁-2-基、4-(COOH)丁-2-基、1-(CH<sub>2</sub>COOH)乙-1-基、1-(CH<sub>2</sub>COOH)-1-(CH<sub>3</sub>)乙-1-基或1-(CH<sub>2</sub>COOH)-丙-1-基;

- 氨基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、1-(CONH<sub>2</sub>)乙基、2-(CONH<sub>2</sub>)乙基、1-(CONH<sub>2</sub>)丙-1-基、2-(CONH<sub>2</sub>)丙-1-基、3-(CONH<sub>2</sub>)丙-1-基、1-(CONH<sub>2</sub>)丁-1-基、2-(CONH<sub>2</sub>)丁-1-基、3-(CONH<sub>2</sub>)丁-1-基、4-(CONH<sub>2</sub>)丁-1-基、1-(CONH<sub>2</sub>)丁-2-基、2-(CONH<sub>2</sub>)丁-2-基、3-(CONH<sub>2</sub>)丁-2-基、4-(CONH<sub>2</sub>)丁-2-基、1-(CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>)乙-1-基、1-(CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>)-1-(CH<sub>3</sub>)乙-1-基或1-(CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>)-丙-1-基;

- 苯基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 苄基、1-苯基乙基、2-苯基乙基、1-苯基丙-1-基、2-苯基丙-1-基、3-苯基丙-1-基、1-苯基丁-1-基、2-苯基丁-1-基、3-苯基丁-1-基、4-苯基丁-1-基、1-苯基丁-2-基、2-苯基丁-2-基、3-苯基丁-2-基、4-苯基丁-2-基、1-(苄基)乙-1-基、1-(苄基)-1-(甲基)乙-1-基或1-(苄基)-丙-1-基, 优选苄基或2-苯基乙基;

- 杂环基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 杂环基甲基、1-(杂环基)乙基、2-(杂环基)乙基、1-(杂环基)丙-1-基、2-(杂环基)丙-1-基、3-(杂环基)丙-1-基、1-(杂环基)丁-1-基、2-(杂环基)丁-1-基、3-(杂环基)丁-1-基、4-(杂环基)丁-1-基、1-(杂环基)丁-2-基、2-(杂环基)丁-2-基、3-(杂环基)丁-2-基、4-(杂环基)丁-2-基、1-(杂环基甲基)乙-1-基、1-(杂环基甲基)-1-(甲基)乙-1-基或1-(杂环基甲基)-丙-1-基, 优选(杂环基)甲基或2-(杂环基)乙基;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基: OCH<sub>3</sub>、OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、OCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、正丁氧

基、 $\text{OCH}(\text{CH}_3) - \text{C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{OCH}_2 - \text{CH}(\text{CH}_3)_2$  或  $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ ，特别是  $\text{OCH}_3$ 、 $\text{OC}_2\text{H}_5$  或  $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ ；

-  $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -卤代烷氧基：如上所述的  $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷氧基，它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代，例如， $\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCHF}_2$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}(\text{Cl})_2$ 、 $\text{OC}(\text{Cl})_3$ 、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、 $\text{OC}_2\text{F}_5$ 、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、 $\text{OCH}_2 - \text{C}_2\text{F}_5$ 、 $\text{OCF}_2 - \text{C}_2\text{F}_5$ 、1-( $\text{CH}_2\text{F}$ )-2-氟乙氧基、1-( $\text{CH}_2\text{Cl}$ )-2-氯乙氧基、1-( $\text{CH}_2\text{Br}$ )-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、4-溴丁氧基或九氟丁氧基，优选  $\text{OCHF}_2$ 、 $\text{OCF}_3$ 、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基或 2,2,2-三氟乙氧基；

-  $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷硫基： $\text{SCH}_3$ 、 $\text{SC}_2\text{H}_5$ 、 $\text{SCH}_2 - \text{C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{SCH}(\text{CH}_3)_2$ 、正丁硫基、1-甲基丙硫基、 $\text{SCH}_2 - \text{CH}(\text{CH}_3)_2$  或  $\text{SC}(\text{CH}_3)_3$ ，特别是  $\text{SCH}_3$  或  $\text{SC}_2\text{H}_5$ ；

-  $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -卤代烷硫基：如上所述的  $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷硫基，它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代，例如， $\text{SCH}_2\text{F}$ 、 $\text{SCHF}_2$ 、 $\text{SCF}_3$ 、 $\text{SCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{SCH}(\text{Cl})_2$ 、 $\text{SC}(\text{Cl})_3$ 、氯氟甲硫基、二氯氟甲硫基、氯二氟甲硫基、2-氟乙硫基、2-氯乙硫基、2-溴乙硫基、2-碘乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基、 $\text{SC}_2\text{F}_5$ 、2-氟丙硫基、3-氟丙硫基、2,2-二氟丙硫基、2,3-二氟丙硫基、2-氯丙硫基、3-氯丙硫基、2,3-二氯丙硫基、2-溴丙硫基、3-溴丙硫基、3,3,3-三氟丙硫基、3,3,3-三氯丙硫基、 $\text{SCH}_2 - \text{C}_2\text{F}_5$ 、 $\text{SCF}_2 - \text{C}_2\text{F}_5$ 、1-( $\text{CH}_2\text{F}$ )-2-氟乙硫基、1-( $\text{CH}_2\text{Cl}$ )-2-氯乙

硫基、1-(CH<sub>2</sub>Br)-2-溴乙硫基、4-氟丁硫基、4-氯丁硫基、4-溴丁硫基或 SCF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, 优选 SCHF<sub>2</sub>、SCF<sub>3</sub>、二氯氟甲硫基、氯二氟甲硫基或 2,2,2-三氟乙硫基;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 被上述 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 例如 CH<sub>2</sub>-OCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、正丙氧基甲基、CH<sub>2</sub>-OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、正丁氧基甲基、(1-甲基丙氧基)甲基、(2-甲基丙氧基)甲基、CH<sub>2</sub>-OC(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、2-(甲氧基)乙基、2-(乙氧基)乙基、2-(正丙氧基)乙基、2-(1-甲基乙氧基)乙基、2-(正丁氧基)乙基、2-(1-甲基丙氧基)乙基、2-(2-甲基丙氧基)乙基、2-(1,1-二甲基乙氧基)乙基、2-(甲氧基)丙基、2-(乙氧基)丙基、2-(正丙氧基)丙基、2-(1-甲基乙氧基)丙基、2-(正丁氧基)丙基、2-(1-甲基丙氧基)丙基、2-(2-甲基丙氧基)丙基、2-(1,1-二甲基乙氧基)丙基、3-(甲氧基)丙基、3-(乙氧基)丙基、3-(正丙氧基)丙基、3-(1-甲基乙氧基)丙基、3-(正丁氧基)丙基、3-(1-甲基丙氧基)丙基、3-(2-甲基丙氧基)丙基、3-(1,1-二甲基乙氧基)丙基、2-(甲氧基)丁基、2-(乙氧基)丁基、2-(正丙氧基)丁基、2-(1-甲基乙氧基)丁基、2-(正丁氧基)丁基、2-(1-甲基丙氧基)丁基、2-(2-甲基丙氧基)丁基、2-(1,1-二甲基乙氧基)丁基、3-(甲氧基)丁基、3-(乙氧基)丁基、3-(正丙氧基)丁基、3-(1-甲基乙氧基)丁基、3-(正丁氧基)丁基、3-(1-甲基丙氧基)丁基、3-(2-甲基丙氧基)丁基、3-(1,1-二甲基乙氧基)丁基、4-(甲氧基)丁基、4-(乙氧基)丁基、4-(正丙氧基)丁基、4-(1-甲基乙氧基)丁基、4-(正丁氧基)丁基、4-(1-甲基丙氧基)丁基、4-(2-甲基丙氧基)丁基、4-(1,1-二甲基乙氧基)丁基, 优选 CH<sub>2</sub>-OCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、2-(OCH<sub>3</sub>)乙基或者 2-(OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)乙基;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 被上述 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷氧基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 例如 2-(OCHF<sub>2</sub>)乙基、2-(OCF<sub>3</sub>)乙基或者 2-(OC<sub>2</sub>F<sub>5</sub>)乙基;

乙基;

-  $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_1-C_4$ -烷基: 被上述  $C_1-C_4$ -烷硫基取代的  $C_1-C_4$ -烷基, 例如  $CH_2-SCH_3$ 、 $CH_2-SC_2H_5$ 、正丙基硫基甲基、 $CH_2-SCH(CH_3)_2$ 、正丁基硫基甲基、(1-甲基丙基硫基)甲基、(2-甲基丙基硫基)甲基、 $CH_2-SC(CH_3)_2$ 、2-(甲基硫基)乙基、2-(乙基硫基)乙基、2-(正丙基硫基)乙基、2-(1-甲基乙基硫基)乙基、2-(正丁基硫基)乙基、2-(1-甲基丙基硫基)乙基、2-(2-甲基丙基硫基)乙基、2-(1,1-二甲基乙基硫基)乙基、2-(甲基硫基)丙基、2-(乙基硫基)丙基、2-(正丙基硫基)丙基、2-(1-甲基乙基硫基)丙基、2-(正丁基硫基)丙基、2-(1-甲基丙基硫基)丙基、2-(2-甲基丙基硫基)丙基、2-(1,1-二甲基乙基硫基)丙基、3-(甲基硫基)丙基、3-(乙基硫基)丙基、3-(正丙基硫基)丙基、3-(1-甲基乙基硫基)丙基、3-(正丁基硫基)丙基、3-(1-甲基丙基硫基)丙基、3-(2-甲基丙基硫基)丙基、3-(1,1-二甲基乙基硫基)丙基、2-(甲基硫基)丁基、2-(乙基硫基)丁基、2-(正丙基硫基)丁基、2-(1-甲基乙基硫基)丁基、2-(正丁基硫基)丁基、2-(1-甲基丙基硫基)丁基、2-(2-甲基丙基硫基)丁基、2-(1,1-二甲基乙基硫基)丁基、3-(甲基硫基)丁基、3-(乙基硫基)丁基、3-(正丙基硫基)丁基、3-(1-甲基乙基硫基)丁基、3-(正丁基硫基)丁基、3-(1-甲基丙基硫基)丁基、3-(2-甲基丙基硫基)丁基、3-(1,1-二甲基乙基硫基)丁基、4-(甲基硫基)丁基、4-(乙基硫基)丁基、4-(正丙基硫基)丁基、4-(1-甲基乙基硫基)丁基、4-(正丁基硫基)丁基、4-(1-甲基丙基硫基)丁基、4-(2-甲基丙基硫基)丁基、4-(1,1-二甲基乙基硫基)丁基, 优选  $CH_2-SCH_3$ 、 $CH_2-SC_2H_5$ 、2-( $SCH_3$ )乙基或者 2-( $SC_2H_5$ )乙基;

-  $C_1-C_4$ -卤代烷硫基- $C_1-C_4$ -烷基: 被上述  $C_1-C_4$ -卤代烷硫基取代的  $C_1-C_4$ -烷基, 例如 2-( $SCHF_2$ )乙基、2-( $SCF_3$ )乙基或者 2-( $SC_2F_5$ )乙基;

- (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基) 亚氨基 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 被 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基) 亚氨基如=N-CH<sub>3</sub>、=N-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、=N-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、=N-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、=N-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、=NCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、=NCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 或=N-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> 取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 例如 CH=N-CH<sub>3</sub>、CH=N-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CH<sub>2</sub>-CH=N-CH<sub>3</sub> 或 CH<sub>2</sub>-CH=N-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基) 羰基: 例如 CO-CH<sub>3</sub>、CO-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CO-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、正丁基羰基、CO-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CO-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 或 CO-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, 优选 CO-CH<sub>3</sub> 或 CO-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基) 羰基: 如上所述的 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基) 羰基, 它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代, 例如, CO-CH<sub>2</sub>F、CO-CHF<sub>2</sub>、CO-CF<sub>3</sub>、CO-CH<sub>2</sub>Cl、CO-CH(Cl)<sub>2</sub>、CO-C(Cl)<sub>3</sub>、氯氟甲基羰基、二氯氟甲基羰基、氯二氟甲基羰基、2-氟乙基羰基、2-氯乙基羰基、2-溴乙基羰基、2-碘乙基羰基、2,2-二氟乙基羰基、2,2,2-三氟乙基羰基、2-氯-2-氟乙基羰基、2-氯-2,2-二氟乙基羰基、2,2-二氯-2-氟乙基羰基、2,2,2-三氯乙基羰基、CO-C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>、2-氟丙基羰基、3-氟丙基羰基、2,2-二氟丙基羰基、2,3-二氟丙基羰基、2-氯丙基羰基、3-氯丙基羰基、2,3-二氯丙基羰基、2-溴丙基羰基、3-溴丙基羰基、3,3,3-三氟丙基羰基、3,3,3-三氯丙基羰基、CO-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>、CO-CF<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>、1-(氟甲基)-2-氟乙基羰基、1-(氯甲基)-2-氯乙基羰基、1-(溴甲基)-2-溴乙基羰基、4-氟丁基羰基、4-氯丁基羰基、4-溴丁基羰基或九氟丁基羰基; 优选 CO-CF<sub>3</sub>、CO-CH<sub>2</sub>Cl 或 2,2,2-三氟乙基羰基;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基) 羰基氧基: 例如 O-CO-CH<sub>3</sub>、O-CO-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、O-CO-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、O-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、O-CO-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、O-CO-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、O-CO-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 或 O-CO-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, 优选 O-CO-CH<sub>3</sub> 或 O-CO-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

- ( $C_1-C_4$ -卤代烷基) 羰基氧基: 如上所述的 ( $C_1-C_4$ -烷基) 羰基, 它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代, 例如,  $O-CO-CH_2F$ 、 $O-CO-CHF_2$ 、 $O-CO-CF_3$ 、 $O-CO-CH_2Cl$ 、 $O-CO-CH(Cl)_2$ 、 $O-CO-C(Cl)_3$ 、氯氟甲基羰基氧基、二氯氟甲基羰基氧基、氯二氟甲基羰基氧基、2-氟乙基羰基氧基、2-氯乙基羰基氧基、2-溴乙基羰基氧基、2-碘乙基羰基氧基、2,2-二氟乙基羰基氧基、2,2,2-三氟乙基羰基氧基、2-氯-2-氟乙基羰基氧基、2-氯-2,2-二氟乙基羰基氧基、2,2-二氯-2-氟乙基羰基氧基、2,2,2-三氯乙基羰基氧基、 $O-CO-C_2F_5$ 、2-氟丙基羰基氧基、3-氟丙基羰基氧基、2,2-二氟丙基羰基氧基、2,3-二氟丙基羰基氧基、2-氯丙基羰基氧基、3-氯丙基羰基氧基、2,3-二氯丙基羰基氧基、2-溴丙基羰基氧基、3-溴丙基羰基氧基、3,3,3-三氟丙基羰基氧基、3,3,3-三氯丙基羰基氧基、 $O-CO-CH_2-C_2F_5$ 、 $O-CO-CF_2-C_2F_5$ 、1-(氟甲基)-2-氟乙基羰基氧基、1-(氯甲基)-2-氯乙基羰基氧基、1-(溴甲基)-2-溴乙基羰基氧基、4-氟丁基羰基氧基、4-氯丁基羰基氧基、4-溴丁基羰基氧基或九氟丁基羰基氧基; 优选  $O-CO-CF_3$ 、 $O-CO-CH_2Cl$  或 2,2,2-三氟乙基羰基氧基;

- ( $C_1-C_4$ -烷氧基) 羰基: 例如  $CO-OCH_3$ 、 $CO-OC_2H_5$ 、正丙氧基羰基、 $CO-OCH(CH_3)_2$ 、正丁氧基羰基、 $CO-OCH(CH_3)-C_2H_5$ 、 $CO-OCH_2-CH(CH_3)_2$  或  $CO-OC(CH_3)_3$ , 优选  $CO-OCH_3$  或  $CO-OC_2H_5$ ;

- ( $C_1-C_4$ -烷氧基) 羰基- $C_1-C_4$ -烷基: 被上述 ( $C_1-C_4$ -烷氧基) 羰基取代的  $C_1-C_4$ -烷基, 例如  $CH_2-CO-OCH_3$ 、 $CH_2-CO-OC_2H_5$ 、正丙氧基羰基甲基、 $CH_2-CO-OCH(CH_3)_2$ 、正丁氧基羰基甲基、 $CH_2-CO-OCH(CH_3)-C_2H_5$ 、 $CH_2-CO-OCH_2-CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2-CO-OC(CH_3)_3$ 、1-(甲氧基羰基)乙基、1-(乙氧基羰基)乙基、1-(正丙氧基羰基)乙基、1-(1-甲基乙氧基羰基)乙基、1-(正丁氧基羰基)乙基、2-(甲氧基羰基)乙基、2-(乙氧基羰基)乙基、2-(正丙氧基羰基)乙基、2-(1-甲基乙氧基羰基)乙基、2-(正丁氧基羰基)乙基、2-(1-甲基丙氧基羰基)乙基、2-(2-甲基丙氧基羰基)乙基、2-(1,1-二甲基乙氧基羰基)乙基;

基)乙基、2-(甲氧基羰基)丙基、2-(乙氧基羰基)丙基、2-(正丙氧基羰基)丙基、2-(1-甲基乙氧基羰基)丙基、2-(正丁氧基羰基)丙基、2-(1-甲基丙氧基羰基)丙基、2-(2-甲基丙氧基羰基)丙基、2-(1,1-二甲基乙氧基羰基)丙基、3-(甲氧基羰基)丙基、3-(乙氧基羰基)丙基、3-(正丙氧基羰基)丙基、3-(1-甲基乙氧基羰基)丙基、3-(正丁氧基羰基)丙基、3-(1-甲基丙氧基羰基)丙基、3-(2-甲基丙氧基羰基)丙基、3-(1,1-二甲基乙氧基羰基)丙基、2-(甲氧基羰基)丁基、2-(乙氧基羰基)丁基、2-(正丙氧基羰基)丁基、2-(1-甲基乙氧基羰基)丁基、2-(正丁氧基羰基)丁基、2-(1-甲基丙氧基羰基)丁基、2-(2-甲基丙氧基羰基)丁基、2-(1,1-二甲基乙氧基羰基)丁基、3-(甲氧基羰基)丁基、3-(乙氧基羰基)丁基、3-(正丙氧基羰基)丁基、3-(1-甲基乙氧基羰基)丁基、3-(正丁氧基羰基)丁基、3-(1-甲基丙氧基羰基)丁基、3-(2-甲基丙氧基羰基)丁基、3-(1,1-二甲基乙氧基羰基)丁基、4-(甲氧基羰基)丁基、4-(乙氧基羰基)丁基、4-(正丙氧基羰基)丁基、4-(1-甲基乙氧基羰基)丁基、4-(正丁氧基羰基)丁基、4-(1-甲基丙氧基羰基)丁基、4-(2-甲基丙氧基羰基)丁基或4-(1,1-二甲基乙氧基羰基)丁基, 优选  $\text{CH}_2\text{-CO-OCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-OC}_2\text{H}_5$ 、1-(甲氧基羰基)乙基或者1-(乙氧基羰基)乙基;

- ( $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷硫基)羰基: 例如  $\text{CO-SCH}_3$ 、 $\text{CO-SC}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CO-SCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CO-SCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{CO-SCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CO-SCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CO-SCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$  或  $\text{CO-SC}(\text{CH}_3)_3$ , 优选  $\text{CO-SCH}_3$  或  $\text{CO-SC}_2\text{H}_5$ ;

- ( $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷硫基)羰基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基: 被上述( $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷硫基)羰基取代的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基, 例如  $\text{CH}_2\text{-CO-SCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-SC}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-SCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-SCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-SCH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-SCH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-SCH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-SC}(\text{CH}_3)_3$ 、1-( $\text{CO-SCH}_3$ )乙基, 1-( $\text{CO-SC}_2\text{H}_5$ )乙基;

基, 1-(CO-SCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基, 1-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 乙基, 1-(CO-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基, 1-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 乙基, 1-[CO-SCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 乙基, 1-[CO-SC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 乙基, 2-(CO-SCH<sub>3</sub>) 乙基, 2-(CO-SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基, 2-(CO-SCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基, 2-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 乙基, 2-(CO-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基, 2-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 乙基, 2-[CO-SCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 乙基, 2-[CO-SC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 乙基, 2-(CO-SCH<sub>3</sub>)-丙基, 2-(CO-SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 2-(CO-SCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 2-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丙基, 2-(CO-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 2-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丙基, 2-[CO-SCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丙基, 2-[CO-SC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丙基, 3-(CO-SCH<sub>3</sub>) 丙基, 3-(CO-SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 3-(CO-SCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 3-(CO-SCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>) 丙基, 3-(CO-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 3-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丙基, 3-[CO-SCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丙基, 3-[CO-SC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丙基, 2-(CO-SCH<sub>3</sub>) 丁基, 2-(CO-SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-(CO-SCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 2-(CO-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丁基, 2-[CO-SCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 2-[CO-SC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 3-(CO-SCH<sub>3</sub>) 丁基, 3-(CO-SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-(CO-SCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 3-(CO-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丁基, 3-[CO-SCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 3-[CO-SC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 4-(CO-SCH<sub>3</sub>)-丁基, 4-(CO-SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-(CO-SCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 4-(CO-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-[CO-SCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丁基, 4-[CO-SCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基或 4-[CO-SC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 优选是 CH<sub>2</sub>-CO-SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-CO-SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, 1-(CO-SCH<sub>3</sub>) 乙基或 1-(CO-SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基亚磺酰基: SO-CH<sub>3</sub>、SO-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、SO-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、SO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、正丁基亚磺酰基、SO-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、SO-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 或 SO-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, 优选 SO-CH<sub>3</sub> 或 SO-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基亚磺酰基: 如上所述的 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基亚磺酰基, 它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代, 例如, SO-CH<sub>2</sub>F、SO-CHF<sub>2</sub>、SO-CF<sub>3</sub>、SO-CH<sub>2</sub>Cl、SO-CH(Cl)<sub>2</sub>、SO-C(Cl)<sub>3</sub>、氯氟甲基亚磺酰基、二氯氟

甲基亚磺酰基、氯二氟甲基亚磺酰基、2-氟乙基亚磺酰基、2-氯乙基亚磺酰基、2-溴乙基亚磺酰基、2-碘乙基亚磺酰基、2,2-二氟乙基亚磺酰基、2,2,2-三氟乙基亚磺酰基、2-氯-2-氟乙基亚磺酰基、2-氯-2,2-二氟乙基亚磺酰基、2,2-二氯-2-氟乙基亚磺酰基、2,2,2-三氯乙基亚磺酰基、 $\text{SO-C}_2\text{F}_5$ 、2-氟丙基亚磺酰基、3-氟丙基亚磺酰基、2,2-二氟丙基亚磺酰基、2,3-二氟丙基亚磺酰基、2-氯丙基亚磺酰基、3-氯丙基亚磺酰基、2,3-二氯丙基亚磺酰基、2-溴丙基亚磺酰基、3-溴丙基亚磺酰基、3,3,3-三氟丙基亚磺酰基、3,3,3-三氯丙基亚磺酰基、 $\text{SO-CH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ 、 $\text{SO-CF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ 、1-(氟甲基)-2-氟乙基亚磺酰基、1-(氯甲基)-2-氯乙基亚磺酰基、1-(溴甲基)-2-溴乙基亚磺酰基、4-氟丁基亚磺酰基、4-氯丁基亚磺酰基、4-溴丁基亚磺酰基或九氟丁基亚磺酰基；优选  $\text{SO-CF}_3$ 、 $\text{SO-CH}_2\text{Cl}$  或 2,2,2-三氟乙基亚磺酰基；

-  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基亚磺酰基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基：被上述  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基亚磺酰基取代的  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基，例如  $\text{CH}_2\text{SOCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{SOC}_2\text{H}_5$ 、正丙基亚磺酰基甲基、 $\text{CH}_2\text{SOCH}(\text{CH}_3)_2$ 、正丁基亚磺酰基甲基、(1-甲基丙基亚磺酰基)甲基、(2-甲基丙基亚磺酰基)甲基、(1,1-二甲基乙基亚磺酰基)甲基、2-(甲基亚磺酰基)乙基、2-(乙基亚磺酰基)乙基、2-(正丙基亚磺酰基)乙基、2-(1-甲基乙基亚磺酰基)乙基、2-(正丁基亚磺酰基)乙基、2-(1-甲基丙基亚磺酰基)乙基、2-(2-甲基丙基亚磺酰基)乙基、2-(1,1-二-甲基乙基亚磺酰基)乙基、2-( $\text{SOCH}_3$ )丙基、3-( $\text{SOCH}_3$ )丙基、2-( $\text{SOC}_2\text{H}_5$ )丙基、3-( $\text{SOC}_2\text{H}_5$ )丙基、3-(丙基亚磺酰基)丙基、3-(丁基亚磺酰基)丙基、4-( $\text{SOCH}_3$ )丁基、4-( $\text{SOC}_2\text{H}_5$ )丁基、4-(正丙基亚磺酰基)丁基或4-(正丁基亚磺酰基)丁基，特别 2-( $\text{SOCH}_3$ )乙基；

-  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基亚磺酰基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基：被上述  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基亚磺酰基取代的  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基，例如 2-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)-乙基；

-  $C_1-C_4$ -烷基磺酰基: 例如  $SO-CH_3$ 、 $SO_2-C_2H_5$ 、 $SO_2-CH_2-C_2H_5$ 、 $SO_2-CH(CH_3)_2$ 、正丁基磺酰基、 $SO_2-CH(CH_3)-C_2H_5$ 、 $SO_2-CH_2-CH(CH_3)_2$  或  $SO_2-C(CH_3)_3$ , 优选  $SO_2-CH_3$  或  $SO_2-C_2H_5$ ;

-  $C_1-C_4$ -卤代烷基磺酰基: 如上所述的  $C_1-C_4$ -烷基磺酰基, 它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代, 例如,  $SO_2-CH_2F$ 、 $SO_2-CHF_2$ 、 $SO_2-CF_3$ 、 $SO_2-CH_2Cl$ 、 $SO_2-CH(Cl)_2$ 、 $SO_2-C(Cl)_3$ 、氯氟甲基磺酰基、二氯氟甲基磺酰基、氯二氟甲基磺酰基、2-氟乙基磺酰基、2-氯乙基磺酰基、2-溴乙基磺酰基、2-碘乙基磺酰基、2,2-二氟乙基磺酰基、2,2,2-三氟乙基磺酰基、2-氯-2-氟乙基磺酰基、2-氯-2,2-二氟乙基磺酰基、2,2-二氯-2-氟乙基磺酰基、2,2,2-三氯乙基磺酰基、 $SO_2-C_2F_5$ 、2-氟丙基磺酰基、3-氟丙基磺酰基、2,2-二氟丙基磺酰基、2,3-二氟丙基磺酰基、2-氟丙基磺酰基、3-氟丙基磺酰基、2,3-二氟丙基磺酰基、2-溴丙基磺酰基、3-溴丙基磺酰基、3,3,3-三氟丙基磺酰基、3,3,3-三氯丙基磺酰基、 $SO_2-CH_2-C_2F_5$ 、 $SO_2-CF_2-C_2F_5$ 、1-(氟甲基)-2-氟乙基磺酰基、1-(氟甲基)-2-氯乙基磺酰基、1-(溴甲基)-2-溴乙基磺酰基、4-氟丁基磺酰基、4-氯丁基磺酰基、4-溴丁基磺酰基或九氟丁基磺酰基; 优选  $SO_2-CF_3$ 、 $SO_2-CH_2Cl$  或 2,2,2-三氟乙基磺酰基;

-  $C_1-C_4$ -烷基磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基: 被上述  $C_1-C_4$ -烷基磺酰基取代的  $C_1-C_4$ -烷基, 例如  $CH_2SO_2-CH_3$ 、 $CH_2SO_2-C_2H_5$ 、 $CH_2SO_2-CH_2-C_2H_5$ 、 $CH_2SO_2-CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2SO_2-CH_2CH_2-C_2H_5$ 、(1-甲基丙基磺酰基)甲基、(2-甲基丙基磺酰基)甲基、 $CH_2SO_2-C(CH_3)_3$ 、 $CH(CH_3)SO_2-CH_3$ 、 $CH(CH_3)SO_2-C_2H_5$ 、 $CH_2CH_2SO_2-CH_3$ 、 $CH_2CH_2SO_2-C_2H_5$ 、 $CH_2CH_2SO_2-CH_2-C_2H_5$ 、 $CH_2CH_2SO_2-CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2CH_2SO_2-CH_2CH_2-C_2H_5$ 、2-(1-甲基丙基磺酰基)乙基、2-(2-甲基丙基磺酰基)乙基、 $CH_2CH_2SO_2-C(CH_3)_3$ 、2-( $SO_2-CH_3$ )丙基、2-( $SO_2-C_2H_5$ )丙基、2-( $SO_2-CH_2-C_2H_5$ )丙基、2- $[SO_2-CH(CH_3)_2]$ 丙基、2-( $SO_2-CH_2CH_2-C_2H_5$ )丙基、2-(1-甲基丙基磺酰基)丙基、2-(2-甲基丙基磺酰基)丙基、2- $[SO_2-C(CH_3)_3]$ 丙基、3-( $SO_2-CH_3$ )丙基、3-( $SO_2-C_2H_5$ )丙基、3-( $SO_2-CH_2-C_2H_5$ )丙基、3- $[SO_2-$

CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丙基, 3-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 3-(1-甲基丙基磺酰基) 丙基, 3-(2-甲基丙基磺酰基) 丙基, 3-[SO<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丙基, 2-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>) 丁基, 2-(SO<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-[SO<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 2-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-(1-甲基丙基磺酰基) 丁基, 2-(2-甲基丙基磺酰基) 丁基, 2-[SO<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 3-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>) 丁基, 3-(SO<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-[SO<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 3-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-(1-甲基丙基磺酰基) 丁基, 3-(2-甲基丙基磺酰基) 丁基, 3-[SO<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 4-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>) 丁基, 4-(SO<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-[SO<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 4-(SO<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-(1-甲基丙基磺酰基) 丁基, 4-(2-甲基丙基磺酰基) 丁基或 4-[SO<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 特别是 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub> 或 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 被上述 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基磺酰基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 例如 2-(2,2,2-三氟乙基磺酰基)-乙基;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 被 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基氨基如 H<sub>3</sub>C-NH-, H<sub>5</sub>C<sub>2</sub>-NH-, 正丙基-NH-, 1-甲基乙基-NH-, 正丁基-NH-, 1-甲基丙基-NH-, 2-甲基丙基-NH-和 1,1-二甲基乙基-NH-, 优选 H<sub>3</sub>C-NH-或 H<sub>5</sub>C<sub>2</sub>-NH-取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 例如 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基氨基羰基: 例如 CO-NH-CH<sub>3</sub>、CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、正丙基氨基基、CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CO-NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CO-NH-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 或 CO-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, 优选 CO-NH-CH<sub>3</sub> 或 CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基氨基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 被上述 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基氨基羰基优选 CO-NH-CH<sub>3</sub> 或 CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> 取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 例如 CH<sub>2</sub>-CO-NH-CH<sub>3</sub>,

$\text{CH}_2\text{-CO-NH-C}_2\text{H}_5$ ,  $\text{CH}_2\text{-CO-NH-CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$ ,  $\text{CH}_2\text{-CO-NH-CH(CH}_3)_2$ ,  $\text{CH}_2\text{-CO-NH-CH}_2\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$ ,  $\text{CH}_2\text{-CO-NH-CH(CH}_3\text{)-C}_2\text{H}_5$ ,  $\text{CH}_2\text{-CO-NH-CH}_2\text{-CH(CH}_3)_2$ ,  $\text{CH}_2\text{-CO-NH-C(CH}_3)_3$ ,  $\text{CH(CH}_3\text{)-CO-NH-CH}_3$ ,  $\text{CH(CH}_3\text{)-CO-NH-C}_2\text{H}_5$ , 2-(CO-NH-CH<sub>3</sub>) 乙基, 2-(CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基, 2-(CO-NH-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基, 2-[CH<sub>2</sub>-CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 乙基, 2-(CO-NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 乙基, 2-[CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 乙基, 2-[CO-NH-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 乙基, 2-[CO-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 乙基, 2-(CO-NH-CH<sub>3</sub>) 丙基, 2-(CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 2-(CO-NH-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 2-[CH<sub>2</sub>-CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丙基, 2-(CO-NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 2-[CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丙基, 2-[CO-NH-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丙基, 2-[CO-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丙基, 3-(CO-NH-CH<sub>3</sub>) 丙基, 3-(CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 3-(CO-NH-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 3-[CH<sub>2</sub>-CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丙基, 3-(CO-NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丙基, 3-[CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丙基, 3-[CO-NH-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丙基, 3-[CO-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丙基, 2-(CO-NH-CH<sub>3</sub>) 丁基, 2-(CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-(CO-NH-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-[CH<sub>2</sub>-CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 2-(CO-NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 2-[CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丁基, 2-[CO-NH-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 2-[CO-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 3-(CO-NH-CH<sub>3</sub>) 丁基, 3-(CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-(CO-NH-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-[CH<sub>2</sub>-CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 3-(CO-NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 3-[CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丁基, 3-[CO-NH-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 3-[CO-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 4-(CO-NH-CH<sub>3</sub>) 丁基, 4-(CO-NH-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-(CO-NH-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-[CH<sub>2</sub>-CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基, 4-(CO-NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) 丁基, 4-[CO-NH-CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>] 丁基, 4-[CO-NH-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>] 丁基或 4-[CO-NH-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>] 丁基, 优选是  $\text{CH}_2\text{-CO-NH-CH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{-CO-NH-C}_2\text{H}_5$ ,  $\text{CH(CH}_3\text{)-CO-NH-CH}_3$  或  $\text{CH(CH}_3\text{)-CO-NH-C}_2\text{H}_5$ .

- 二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基) 氨基: N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, N,N-二丙基氨基、N,N-二-(1-甲基乙基) 氨基、N,N-二丁基氨基、N,N-二-(1-甲基丙基) 氨基、N,N-二-(2-甲基丙基) 氨基、N,N-二-(1,1-二甲基乙基) 氨基、N-乙基-N-甲基氨基、N-甲基-N-丙基氨基、N-甲基-N-(1-

甲基乙基)氨基、N-丁基-N-甲基氨基、N-甲基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基氨基、N-乙基-N-丙基氨基、N-乙基-N-(1-甲基乙基)氨基、N-丁基-N-乙基氨基、N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-丙基氨基、N-丁基-N-丙基氨基、N-(1-甲基丙基)-N-丙基氨基、N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-丙基氨基、N-丁基-N-(1-甲基乙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基乙基)氨基、N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-丁基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基、N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基或N-(1,1-二甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基, 优选N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>或N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>;

- 二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基)氨基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 被上述二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基)氨基取代的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, 例如CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、N,N-二丙基氨基甲基、N,N-二-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基甲基、N,N-二丁基氨基甲基、N,N-二-(1-甲基丙基)氨基甲基、N,N-二-(2-甲基丙基)氨基甲基、N,N-二-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]氨基甲基、N-乙基-N-甲基氨基甲基、N-甲基-N-丙基氨基甲基、N-甲基-N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基甲基、N-丁基-N-甲基氨基甲基、N-甲基-N-(1-甲基丙基)氨基甲基、N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基甲基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-甲基氨基甲基、N-乙基-N-丙基氨基甲基、N-乙基-N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基甲基、N-丁基-N-乙基氨基甲基、N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基甲基、N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基甲基、N-乙基-N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]氨基甲基、N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]-N-丙基氨基甲基、N-丁基-N-丙基氨基甲基、N-(1-甲基丙基)-N-丙基氨基甲基、N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基甲

基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-丙基氨基甲基、N-丁基-N-(1-甲基乙基)氨基甲基、N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]-N-(1-甲基丙基)氨基甲基、N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]-N-(2-甲基丙基)氨基甲基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基甲基、N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基甲基、N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基甲基、N-丁基-N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]氨基甲基、N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基甲基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-(1-甲基丙基)氨基甲基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-(2-甲基丙基)氨基甲基、N,N-二甲基氨基乙基、N,N-二乙基氨基乙基、N,N-二正丙基氨基乙基、N,N-二-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基乙基、N,N-二丁基氨基乙基、N,N-二-(1-甲基丙基)氨基乙基、N,N-二-(2-甲基丙基)氨基乙基、N,N-二-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]氨基乙基、N-乙基-N-甲基氨基乙基、N-甲基-N-丙基氨基乙基、N-甲基-N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基乙基、N-丁基-N-甲基氨基乙基、N-甲基-N-(1-甲基丙基)氨基乙基、N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基乙基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-甲基氨基乙基、N-乙基-N-丙基氨基乙基、N-乙基-N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基乙基、N-丁基-N-乙基氨基乙基、N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基乙基、N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基乙基、N-乙基-N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]氨基乙基、N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]-N-丙基氨基乙基、N-丁基-N-丙基氨基乙基、N-(1-甲基丙基)-N-丙基氨基乙基、N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基乙基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-丙基氨基乙基、N-丁基-N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基乙基、N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]-N-(1-甲基丙基)氨基乙基、N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]-N-(2-甲基丙基)氨基乙基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-[CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>]氨基乙基、N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基乙基、N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基乙基、N-丁基-N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]氨基乙基、N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基乙基、N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-(1-甲基丙基)氨基乙基或N-[C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>]-N-(2-甲基丙基)氨基乙基，特别是N,N-二甲基氨基乙基或N,N-二乙基氨基乙基；

- 二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基)氨基羰基：CO-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CO-N(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、CO-N

$(\text{CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5)_2$ 、 $\text{CO-N}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]_2$ 、 $\text{N,N-二丁基氨基羰基}$ 、 $\text{CO-N}[\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5]_2$ 、 $\text{CO-N}[\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2]_2$ 、 $\text{CO-N}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]_2$ 、 $\text{N-乙基-N-甲基氨基羰基}$ 、 $\text{N-甲基-N-丙基氨基羰基}$ 、 $\text{N-甲基-N-}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]\text{氨基羰基}$ 、 $\text{N-丁基-N-甲基氨基羰基}$ 、 $\text{N-甲基-N-(1-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]\text{-N-甲基氨基羰基}$ 、 $\text{N-乙基-N-丙基氨基羰基}$ 、 $\text{N-乙基-N-}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]\text{氨基羰基}$ 、 $\text{N-丁基-N-乙基氨基羰基}$ 、 $\text{N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-乙基-N-}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]\text{氨基羰基}$ 、 $\text{N-}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]\text{-N-丙基氨基羰基}$ 、 $\text{N-丁基-N-丙基氨基羰基}$ 、 $\text{N-(1-甲基丙基)-N-丙基氨基羰基}$ 、 $\text{N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基羰基}$ 、 $\text{N-}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]\text{-N-丙基氨基羰基}$ 、 $\text{N-丁基-N-}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]\text{氨基羰基}$ 、 $\text{N-}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]\text{-N-(1-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]\text{-N-(2-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]\text{-N-}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]\text{氨基羰基}$ 、 $\text{N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-丁基-N-}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]\text{氨基羰基}$ 、 $\text{N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基羰基}$ 、 $\text{N-}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]\text{-N-(1-甲基丙基)氨基羰基}$ 或 $\text{N-}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]\text{-N-(2-甲基丙基)氨基羰基}$ ，优选 $\text{CO-N}(\text{CH}_3)_2$ 或 $\text{CO-N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ ；

- 二( $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ )氨基羰基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ ：被上述二( $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ )氨基羰基优选 $\text{CO-N}(\text{CH}_3)_2$ 或 $\text{CO-N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ 取代的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ ，例如 $\text{CH}_2\text{-CO-N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{-CO-N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CO-N}(\text{CH}_3)_2$ 或 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CO-N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ ，优选 $\text{CH}_2\text{-CO-N}(\text{CH}_3)_2$ 或 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CO-N}(\text{CH}_3)_2$ ；

- 二( $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ )膦酰基： $-\text{PO}(\text{OCH}_3)_2$ 、 $-\text{PO}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ 、 $\text{N,N-二丙基膦酰基}$ 、 $\text{N,N-二-(1-甲基乙基)膦酰基}$ 、 $\text{N,N-二丁基膦酰基}$ 、 $\text{N,N-二-(1-甲基丙基)膦酰基}$ 、 $\text{N,N-二-(2-甲基丙基)膦酰基}$ 、 $\text{N,N-二-}$

(1,1-二甲基乙基)膦酰基、N-乙基-N-甲基膦酰基、N-甲基-N-丙基膦酰基、N-甲基-N-(1-甲基乙基)膦酰基、N-丁基-N-甲基膦酰基、N-甲基-N-(1-甲基丙基)膦酰基、N-甲基-N-(2-甲基丙基)膦酰基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基膦酰基、N-乙基-N-丙基膦酰基、N-乙基-N-(1-甲基乙基)膦酰基、N-丁基-N-乙基膦酰基、N-乙基-N-(1-甲基丙基)膦酰基、N-乙基-N-(2-甲基丙基)膦酰基、N-乙基-N-(1,1-二甲基乙基)膦酰基、N-(1-甲基乙基)-N-丙基膦酰基、N-丁基-N-丙基膦酰基、N-(1-甲基丙基)-N-丙基膦酰基、N-(2-甲基丙基)-N-丙基膦酰基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-丙基膦酰基、N-丁基-N-(1-甲基乙基)膦酰基、N-(1-甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)膦酰基、N-(1-甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)膦酰基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基乙基)膦酰基、N-丁基-N-(1-甲基丙基)膦酰基、N-丁基-N-(2-甲基丙基)膦酰基、N-丁基-N-(1,1-二甲基乙基)膦酰基、N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)膦酰基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)膦酰基或N-(1,1-二甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)膦酰基, 优选 $-\text{PO}(\text{OCH}_3)_2$ 或 $-\text{PO}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ ;

- 二( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基)膦酰基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基: 被上述二( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基)膦酰基优选 $-\text{PO}(\text{OCH}_3)_2$ 或 $-\text{PO}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ 取代的 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基, 例如 $\text{CH}_2-\text{PO}(\text{OCH}_3)_2$ 、 $\text{CH}_2-\text{PO}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{PO}(\text{OCH}_3)_2$ 或 $\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{PO}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ ;

-  $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -链烯基: 丙-1-烯-1-基、烯丙基、1-甲基乙烯基、1-丁烯-1-基、1-丁烯-2-基、1-丁烯-3-基、2-丁烯-1-基、1-甲基-丙-1-烯-1-基、2-甲基-丙-1-烯-1-基、1-甲基-丙-2-烯-1-基、2-甲基-丙-2-烯-1-基、正戊烯-1-基、正戊烯-2-基、正戊烯-3-基、正戊烯-4-基、1-甲基丁-1-烯-1-基、2-甲基丁-1-烯-1-基、3-甲基丁-1-烯-1-基、1-甲基丁-2-烯-1-基、2-甲基丁-2-烯-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、1-

甲基丁-3-烯-1-基、2-甲基丁-3-烯-1-基、3-甲基丁-3-烯-1-基、1,1-二甲基丙-2-烯-1-基、1,2-二甲基丙-1-烯-1-基、1,2-二甲基丙-2-烯-1-基、1-乙基丙-1-烯-2-基、1-乙基丙-2-烯-1-基、正己-1-烯-1-基、正己-2-烯-1-基、正己-3-烯-1-基、正己-4-烯-1-基、正己-5-烯-1-基、1-甲基戊-1-烯-1-基、2-甲基戊-1-烯-1-基、3-甲基戊-1-烯-1-基、4-甲基戊-1-烯-1-基、1-甲基戊-2-烯-1-基、2-甲基戊-2-烯-1-基、3-甲基戊-2-烯-1-基、4-甲基戊-2-烯-1-基、1-甲基戊-3-烯-1-基、2-甲基戊-3-烯-1-基、3-甲基戊-3-烯-1-基、4-甲基戊-3-烯-1-基、1-甲基戊-4-烯-1-基、2-甲基戊-4-烯-1-基、3-甲基戊-4-烯-1-基、4-甲基戊-4-烯-1-基、1,1-二甲基丁-2-烯-1-基、1,1-二甲基丁-3-烯-1-基、1,2-二甲基丁-1-烯-1-基、1,2-二甲基丁-2-烯-1-基、1,2-二甲基丁-3-烯-1-基、1,3-二甲基丁-1-烯-1-基、1,3-二甲基丁-2-烯-1-基、1,3-二甲基丁-3-烯-1-基、2,2-二甲基丁-3-烯-1-基、2,3-二甲基丁-1-烯-1-基、2,3-二甲基丁-2-烯-1-基、2,3-二甲基丁-3-烯-1-基、3,3-二甲基丁-1-烯-1-基、3,3-二甲基丁-2-烯-1-基、1-乙基丁-1-烯-1-基、1-乙基丁-2-烯-1-基、1-乙基丁-3-烯-1-基、2-乙基丁-1-烯-1-基、2-乙基丁-2-烯-1-基、2-乙基丁-3-烯-1-基、1,1,2-三甲基丙-2-烯-1-基、1-乙基-1-甲基丙-2-烯-1-基、1-乙基-2-甲基丙-1-烯-1-基或1-乙基-2-甲基丙-2-烯-1-基;

-  $C_3-C_6$ -卤代链烯基:如上所述的  $C_3-C_6$ -链烯基,它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代,例如2-氯烯丙基、3-氯烯丙基、2,3-二氯烯丙基、3,3-二氯烯丙基、2,3,3-三氯烯丙基、2,3-二氯丁-2-烯基、2-溴烯丙基、3-溴烯丙基、2,3-二溴烯丙基、3,3-二溴烯丙基、2,3,3-三溴烯丙基或2,3-二溴丁-2-烯基;

- 氰基- $C_3-C_6$ -链烯基:例如2-氰基烯丙基、3-氰基烯丙基、4-氰基丁-2-烯基、4-氰基丁-3-烯基或5-氰基戊-4-烯基;

-  $C_3-C_6$ -炔基:丙-1-炔-1-基、丙-2-炔-1-基、正丁-1-炔-1-基、正丁-1-炔-3-基、正丁-1-炔-4-基、正丁-2-炔-1-基、正戊-1-炔-1-基、正戊-1-炔-3-基、正戊-1-炔-4-基、正戊-1-炔-5-基、正戊-2-炔-1-基、正戊-2-炔-4-基、正戊-2-炔-5-基、3-甲基丁-1-炔-3-基、3-甲基丁-1-炔-4-基、正己-1-炔-1-基、正己-1-炔-3-基、正己-1-炔-4-基、正己-1-炔-5-基、正己-1-炔-6-基、正己-2-炔-1-基、正己-2-炔-4-基、正己-2-炔-5-基、正己-2-炔-6-基、正己-3-炔-1-基、正己-3-炔-2-基、3-甲基戊-1-炔-1-基、3-甲基戊-1-炔-3-基、3-甲基戊-1-炔-4-基、3-甲基戊-1-炔-5-基、4-甲基戊-1-炔-1-基、4-甲基戊-2-炔-4-基或4-甲基戊-2-炔-5-基, 优选丙-2-炔-1-基;

-  $C_3-C_6$ -卤代炔基:如上所述的  $C_3-C_6$ -炔基, 它部分或全部由氟、氯、溴和/或碘取代, 例如 1,1-二氟丙-2-炔-1-基、4-氟丁-2-炔-1-基、4-氟丁-2-炔-1-基、1,1-二氟丁-2-炔-1-基、5-氟戊-3-炔-1-基和 6-氟己-4-炔-1-基;

- 氟基- $C_3-C_6$ -炔基:例如 3-氟基炔丙基、4-氟基丁-2-炔-1-基、5-氟基戊-3-炔-1-基和 6-氟基己-4-炔-1-基;

-  $C_3-C_4$ -链烯基氧基- $C_1-C_4$ -烷基:由  $C_3-C_4$ -链烯基氧基例如烯丙基氧基、丁-1-烯-3-基氧基、丁-1-烯-4-基氧基、丁-2-烯-1-基氧基、1-甲基丙-2-烯基氧基和 2-甲基丙-2-烯基氧基取代的  $C_1-C_4$ -烷基, 例如烯丙基氧基甲基、2-烯丙基氧基乙基或丁-1-烯-4-基氧基甲基, 特别是 2-烯丙基氧基乙基;

-  $C_3-C_4$ -炔基氧基- $C_1-C_4$ -烷基:由  $C_3-C_4$ -炔基氧基例如炔丙基氧基、丁-1-炔-3-基氧基、丁-1-炔-4-基氧基、丁-2-炔-1-基氧基、1-甲基丙-2-炔基氧基和 2-甲基丙-2-炔基氧基优选炔丙基氧基取代的  $C_1-C_4$ -烷基, 例如炔丙基氧基甲基或 2-炔丙基氧基乙基, 特别是 2-炔丙基氧基

乙基;

- ( $C_3-C_4$ -链烯基氧基)亚氨基- $C_1-C_4$ -烷基:由( $C_3-C_4$ -链烯基氧基)亚氨基例如烯丙基氧基亚氨基、丁-1-烯-3-基氧基亚氨基、丁-1-烯-4-基氧基亚氨基、丁-2-烯-1-基氧基亚氨基、1-甲基丙-2-烯基氧基亚氨基或2-甲基丙-2-烯基氧基亚氨基取代的 $C_1-C_4$ -烷基,例如烯丙基氧基-N=CH- $CH_2$ 或丁-1-烯-4-基氧基-N=CH,特别是烯丙基氧基-N=CH- $CH_2$ ;

-  $C_3-C_4$ -链烯基硫基- $C_1-C_4$ -烷基:由 $C_3-C_4$ -链烯基硫基例如烯丙基硫基、丁-1-烯-3-基硫基、丁-1-烯-4-基硫基、丁-2-烯-1-基硫基、1-甲基丙-2-烯基硫基或2-甲基丙-2-烯基硫基取代的 $C_1-C_4$ -烷基,例如烯丙基硫基甲基、2-烯丙基硫基乙基或丁-1-烯-4-基硫基甲基,特别是2-烯丙基硫基乙基;

-  $C_3-C_4$ -炔基硫基- $C_1-C_4$ -烷基:由 $C_3-C_4$ -炔基硫基例如炔丙基硫基、丁-1-炔-3-基硫基、丁-1-炔-4-基硫基、丁-2-炔-1-基硫基、1-甲基丙-2-炔基硫基或2-甲基丙-2-炔基硫基优选炔丙基硫基取代的 $C_1-C_4$ -烷基,例如炔丙基硫基甲基或2-炔丙基硫基乙基,特别是2-炔丙基硫基乙基;

-  $C_3-C_4$ -链烯基亚磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基:由 $C_3-C_4$ -链烯基亚磺酰基例如烯丙基亚磺酰基、丁-1-烯-3-基亚磺酰基、丁-1-烯-4-基亚磺酰基、丁-2-烯-1-基亚磺酰基、1-甲基丙-2-烯基亚磺酰基或2-甲基丙-2-烯基亚磺酰基取代的 $C_1-C_4$ -烷基,例如烯丙基亚磺酰基甲基、2-烯丙基亚磺酰基乙基或丁-1-烯-4-基亚磺酰基甲基,特别是2-烯丙基亚磺酰基乙基;

-  $C_3-C_4$ -炔基亚磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基:由 $C_3-C_4$ -炔基亚磺酰基例如炔丙

基亚磺酰基、丁-1-炔-3-基亚磺酰基、丁-1-炔-4-基亚磺酰基、丁-2-炔-1-基亚磺酰基、1-甲基丙-2-炔基亚磺酰基或2-甲基丙-2-炔基亚磺酰基优选炔丙基亚磺酰基取代的  $C_1-C_4$ -烷基，例如炔丙基亚磺酰基甲基或2-炔丙基亚磺酰基乙基，特别是2-炔丙基亚磺酰基乙基；

-  $C_3-C_4$ -链烯基磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基：由  $C_3-C_4$ -链烯基磺酰基例如烯丙基磺酰基、丁-1-烯-3-基磺酰基、丁-1-烯-4-基磺酰基、丁-2-烯-1-基磺酰基、1-甲基丙-2-烯基磺酰基或2-甲基丙-2-烯基磺酰基取代的  $C_1-C_4$ -烷基，例如烯丙基磺酰基甲基、2-烯丙基磺酰基乙基或丁-1-烯-4-基磺酰基甲基，特别是2-烯丙基磺酰基乙基；

-  $C_3-C_4$ -炔基磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基：由  $C_3-C_4$ -炔基磺酰基例如炔丙基磺酰基、丁-1-炔-3-基磺酰基、丁-1-炔-4-基磺酰基、丁-2-炔-1-基磺酰基、1-甲基丙-2-炔基磺酰基或2-甲基丙-2-炔基磺酰基优选炔丙基磺酰基取代的  $C_1-C_4$ -烷基，例如炔丙基磺酰基甲基或2-炔丙基磺酰基乙基，特别是2-炔丙基磺酰基乙基；

-  $C_3-C_8$ -环烷基：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基或环辛基；

-  $C_3-C_8$ -环烷基- $C_1-C_6$ -烷基：例如环丙基甲基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基、环庚基甲基、环辛基甲基、2-(环丙基)乙基、2-(环丁基)乙基、2-(环戊基)乙基、2-(环己基)乙基、2-(环庚基)乙基、2-(环辛基)乙基、3-(环丙基)丙基、3-(环丁基)丙基、3-(环戊基)丙基、3-(环己基)丙基、3-(环庚基)丙基、3-(环辛基)丙基、4-(环丙基)丁基、4-(环丁基)丁基、4-(环戊基)丁基、4-(环己基)丁基、4-(环庚基)丁基、4-(环辛基)丁基、5-(环丙基)戊基、5-(环丁基)戊基、5-(环戊基)戊基、5-(环己基)戊基、5-(环庚基)戊基、5-(环辛基)戊基、6-(环丙基)己基、6-(环丁基)

己基、6-(环戊基)己基、6-(环己基)己基、6-(环庚基)己基或6-(环辛基)己基;

-包含一个羰基或硫羰基环单元的 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-环烷基: 环丁酮-2-基、环丁酮-3-基、环戊酮-2-基、环戊酮-3-基、环己酮-2-基、环己酮-4-基、环庚酮-2-基、环辛酮-2-基、环丁烷硫酮-2-基、环丁烷硫酮-3-基、环戊烷硫酮-2-基、环戊烷硫酮-3-基、环己烷硫酮-2-基、环己烷硫酮-4-基、环庚烷硫酮-2-基或环辛烷硫酮-2-基, 优选环戊酮-2-基或环己酮-2-基;

-包含一个羰基或硫羰基环单元的 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-环烷基- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基: 环丁酮-2-基甲基、环丁酮-3-基甲基、环戊酮-2-基甲基、环戊酮-3-基甲基、环己酮-2-基甲基、环己酮-4-基甲基、环庚酮-2-基甲基、环辛酮-2-基甲基、环丁烷硫酮-2-基甲基、环丁烷硫酮-3-基甲基、环戊烷硫酮-2-基甲基、环戊烷硫酮-3-基甲基、环己烷硫酮-2-基甲基、环己烷硫酮-4-基甲基、环庚烷硫酮-2-基甲基、环辛烷硫酮-2-基甲基、1-(环丁酮-2-基)乙基、1-(环丁酮-3-基)乙基、1-(环戊酮-2-基)乙基、1-(环戊酮-3-基)乙基、1-(环己酮-2-基)乙基、1-(环己酮-4-基)乙基、1-(环庚酮-2-基)乙基、1-(环辛酮-2-基)乙基、1-(环丁烷硫酮-2-基)乙基、1-(环丁烷硫酮-3-基)乙基、1-(环戊烷硫酮-2-基)乙基、1-(环戊烷硫酮-3-基)乙基、1-(环己烷硫酮-2-基)乙基、1-(环己烷硫酮-4-基)乙基、1-(环庚烷硫酮-2-基)乙基、1-(环辛烷硫酮-2-基)乙基、2-(环丁酮-2-基)乙基、2-(环丁酮-3-基)乙基、2-(环戊酮-2-基)乙基、2-(环戊酮-3-基)乙基、2-(环己酮-2-基)乙基、2-(环己酮-4-基)乙基、2-(环庚酮-2-基)乙基、2-(环辛酮-2-基)乙基、2-(环丁烷硫酮-2-基)乙基、2-(环丁烷硫酮-3-基)乙基、2-(环戊烷硫酮-2-基)乙基、2-(环戊烷硫酮-3-基)乙基、2-(环己烷硫酮-2-基)乙基、2-(环己烷硫酮-4-基)乙基、2-(环庚烷硫酮-2-基)乙基、2-(环辛烷硫酮-2-基)乙基、3-(环丁酮

-2-基)丙基、3-(环丁酮-3-基)丙基、3-(环戊酮-2-基)丙基、3-(环戊酮-3-基)丙基、3-(环己酮-2-基)丙基、3-(环己酮-4-基)丙基、3-(环庚酮-2-基)丙基、3-(环辛酮-2-基)丙基、3-(环丁烷硫酮-2-基)丙基、3-(环丁烷硫酮-3-基)丙基、3-(环戊烷硫酮-2-基)丙基、3-(环戊烷硫酮-3-基)丙基、3-(环己烷硫酮-2-基)丙基、3-(环己烷硫酮-4-基)丙基、3-(环庚烷硫酮-2-基)丙基、3-(环辛烷硫酮-2-基)丙基、4-(环丁酮-2-基)丁基、4-(环丁酮-3-基)丁基、4-(环戊酮-2-基)丁基、4-(环戊酮-3-基)丁基、4-(环己酮-2-基)丁基、4-(环己酮-4-基)丁基、4-(环庚酮-2-基)丁基、4-(环辛酮-2-基)丁基、4-(环丁烷硫酮-2-基)丁基、4-(环丁烷硫酮-3-基)丁基、4-(环戊烷硫酮-2-基)丁基、4-(环戊烷硫酮-3-基)丁基、4-(环己烷硫酮-2-基)丁基、4-(环己烷硫酮-4-基)丁基、4-(环庚烷硫酮-2-基)丁基或4-(环辛烷硫酮-2-基)丁基;

- C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-环烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基:环丙氧基甲基、1-环丙氧基-乙基、2-环丙氧基-乙基、1-环丙氧基-丙-1-基、2-环丙氧基-丙-1-基、3-环丙氧基-丙-1-基、1-环丙氧基-丁-1-基、2-环丙氧基-丁-1-基、3-环丙氧基-丁-1-基、4-环丙氧基-丁-1-基、1-环丙氧基-丁-2-基、2-环丙氧基-丁-2-基、3-环丙氧基-丁-2-基、3-环丙氧基-丁-2-基、4-环丙氧基-丁-2-基、1-(环丙氧基甲基)-乙-1-基、1-(环丙氧基甲基)-1-(CH<sub>3</sub>)-乙-1-基、1-(环丙基甲基氧基)-丙-1-基、环丁氧基甲基、1-环丁氧基-乙基、2-环丁氧基-乙基、1-环丁氧基-丙-1-基、2-环丁氧基-丙-1-基、3-环丁氧基-丙-1-基、1-环丁氧基-丁-1-基、2-环丁氧基-丁-1-基、3-环丁氧基-丁-1-基、4-环丁氧基-丁-1-基、1-环丁氧基-丁-2-基、2-环丁氧基-丁-2-基、3-环丁氧基-丁-2-基、3-环丙氧基-丁-2-基、4-环丁氧基-丁-2-基、1-(环丁氧基甲基)-乙-1-基、1-(环丁氧基甲基)-1-(CH<sub>3</sub>)-乙-1-基、1-(环丁氧基甲基)-丙-1-基、环戊氧基甲基、1-环戊氧基-乙基、2-环戊氧基-乙基、1-环戊氧基-丙-1-基、2-环戊氧基-丙-1-基、3-环戊氧基-丙-1-基、1-环戊氧基-丁-1-基、2-

环戊氧基-丁-1-基、3-环戊氧基-丁-1-基、4-环戊氧基-丁-1-基、1-环戊氧基-丁-2-基、2-环戊氧基-丁-2-基、3-环戊氧基-丁-2-基、3-环戊氧基-丁-2-基、4-环戊氧基-丁-2-基、1-(环戊氧基甲基)-乙-1-基、1-(环戊氧基甲基)-1-(CH<sub>3</sub>)-乙-1-基、1-(环戊氧基甲基)-丙-1-基、环己氧基甲基、1-环己氧基-乙基、2-环己氧基-乙基、1-环己氧基-丙-1-基、2-环己氧基-丙-1-基、3-环己氧基-丙-1-基、1-环己氧基-丁-1-基、2-环己氧基-丁-1-基、3-环己氧基-丁-1-基、4-环己氧基-丁-1-基、1-环己氧基-丁-2-基、2-环己氧基-丁-2-基、3-环己氧基-丁-2-基、3-环己氧基-丁-2-基、4-环己氧基-丁-2-基、1-(环己氧基甲基)-乙-1-基、1-(环己氧基甲基)-1-(CH<sub>3</sub>)-乙-1-基、1-(环己氧基甲基)-丙-1-基、环庚氧基甲基、1-环庚氧基-乙基、2-环庚氧基-乙基、1-环庚氧基-丙-1-基、2-环庚氧基-丙-1-基、3-环庚氧基-丙-1-基、1-环庚氧基-丁-1-基、2-环庚氧基-丁-1-基、3-环庚氧基-丁-1-基、4-环庚氧基-丁-1-基、1-环庚氧基-丁-2-基、2-环庚氧基-丁-2-基、3-环庚氧基-丁-2-基、3-环庚氧基-丁-2-基、4-环庚氧基-丁-2-基、1-(环庚氧基甲基)-乙-1-基、1-(环庚氧基甲基)-1-(CH<sub>3</sub>)-乙-1-基、1-(环庚氧基甲基)-丙-1-基、环辛氧基甲基、1-环辛氧基-乙基、2-环辛氧基-乙基、1-环辛氧基-丙-1-基、2-环辛氧基-丙-1-基、3-环辛氧基-丙-1-基、1-环辛氧基-丁-1-基、2-环辛氧基-丁-1-基、3-环辛氧基-丁-1-基、4-环辛氧基-丁-1-基、1-环辛氧基-丁-2-基、2-环辛氧基-丁-2-基、3-环辛氧基-丁-2-基、3-环辛氧基-丁-2-基、4-环辛氧基-丁-2-基、1-(环辛氧基甲基)-乙-1-基、1-(环辛氧基甲基)-1-(CH<sub>3</sub>)-乙-1-基或1-(环辛氧基甲基)-丙-1-基，特别是C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷氧基甲基或2-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷氧基)乙基。

3-至7-元杂环基是具有1-3个杂原子的饱和的，部分或完全不饱和的，或芳族的杂环基，杂原子选自下列组成的组中：

- 1至3个氮原子，
- 1或2个氧原子和

- 1 或 2 个硫原子。

包含一个羰基或硫羰基环单元的饱和杂环基的实例是：环氧乙烷基、硫杂丙环基 (Thiiranyl)、氮丙啶-1-基、氮丙啶-2-基、二氮丙啶 (diaziridin)-1-基、二氮丙啶-3-基、噁丁环 (Oxetan)-2-基、噁丁环-3-基、噻丁环 (Thietan)-2-基、噻丁环-3-基、氮杂环丁烷-1-基、氮杂环丁烷-2-基、氮杂环丁烷-3-基、四氢呋喃-2-基、四氢呋喃-3-基、四氢噻吩-2-基、四氢噻吩-3-基、吡咯烷-1-基、吡咯烷-2-基、吡咯烷-3-基、1,3-二氧戊环-2-基、1,3-二氧戊环-4-基、1,3-氧硫戊环 (Oxathiolan)-2-基、1,3-氧硫戊环-4-基、1,3-氧硫戊环-5-基、1,3-噁唑烷-2-基、1,3-噁唑烷-3-基、1,3-噁唑烷-4-基、1,3-噁唑烷-5-基、1,2-噁唑烷-2-基、1,2-噁唑烷-3-基、1,2-噁唑烷-4-基、1,2-噁唑烷-5-基、1,3-二硫戊环-2-基、1,3-二硫戊环-4-基、吡咯烷-1-基、吡咯烷-2-基、吡咯烷-5-基、四氢吡唑-1-基、四氢吡唑-3-基、四氢吡唑-4-基、四氢吡喃-2-基、四氢吡喃-3-基、四氢吡喃-4-基、四氢噻喃-2-基、四氢噻喃-3-基、四氢吡喃-4-基、哌啶-1-基、哌啶-2-基、哌啶-3-基、哌啶-4-基、1,3-二噁烷-2-基、1,3-二噁烷-4-基、1,3-二噁烷-5-基、1,4-二噁烷-2-基、1,3-噁噻烷 (Oxathian)-2-基、1,3-噁噻烷-4-基、1,3-噁噻烷-5-基、1,3-噁噻烷-6-基、1,4-噁噻烷-2-基、1,4-噁噻烷-3-基、吗啉-2-基、吗啉-3-基、吗啉-4-基、六氢哒嗪-1-基、六氢哒嗪-3-基、六氢哒嗪-4-基、六氢嘧啶-1-基、六氢嘧啶-2-基、六氢嘧啶-4-基、六氢嘧啶-5-基、哌嗪-1-基、哌嗪-2-基、哌嗪-3-基、六氢-1,3,5-三嗪-1-基、六氢-1,3,5-三嗪-2-基、噁庚环 (Oxepan)-2-基、噁庚环-3-基、噁庚环-4-基、噻庚环 (Thiepan)-2-基、噻庚环-3-基、噻庚环-4-基、1,3-二噁庚环 (Dioxepan)-2-基、1,3-二噁庚环-4-基、1,3-二噁庚环-5-基、1,3-二噁庚环-6-基、1,3-二噻庚环 (Dithiepan)-2-基、1,3-二噻庚环-2-基、1,3-二噻庚环-2-基、1,4-二噁庚环-2-基、1,4-二噁庚环-7-基、六氢氮杂萘-1-基、六氢氮杂萘-2-基、

六氢氮杂草-3-基、六氢氮杂草-4-基、六氢-1,3-二氮杂草-1-基、六氢-1,3-二氮杂草-2-基、六氢-1,3-二氮杂草-4-基、六氢-1,4-二氮杂草-1-基或六氢-1,4-二氮杂草-2-基;

包含一个羰基或硫羰基环单元的不饱和杂环基的实例是:二氢呋喃-2-基、1,2-噁唑啉-3-基、1,2-噁唑啉-5-基、1,3-噁唑啉-2-基;

杂芳族化合物优选是5-或6-元的,例如:呋喃基如2-呋喃基和3-呋喃基、噻吩基如2-噻吩基和3-噻吩基、吡咯基如2-吡咯基和3-吡咯基、异噁唑基如3-异噁唑基、4-异噁唑基和5-异噁唑基、异噻唑基如3-异噻唑基、4-异噻唑基和5-异噻唑基、吡唑基如3-吡唑基、4-吡唑基和5-吡唑基、噁唑基如2-噁唑基、4-噁唑基和5-噁唑基、噻唑基如2-噻唑基、4-噻唑基和5-噻唑基、咪唑基如2-咪唑基和4-咪唑基、噁二唑基如1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基和1,3,4-噁二唑-2-基、噻二唑基如1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基和1,3,4-噻二唑-2-基、三唑基如1,2,4-三唑-1-基、1,2,4-三唑-3-基和1,2,4-三唑-4-基、吡啶基如2-吡啶基、3-吡啶基和4-吡啶基、哒嗪基如3-哒嗪基和4-哒嗪基、嘧啶基如2-嘧啶基、4-嘧啶基和5-嘧啶基,还有2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基和1,2,4-三嗪-3-基,特别是吡啶基、嘧啶基、呋喃基和噻吩基。

所有的苯环、碳环和杂环优选是未取代的或带有一个取代基。

对于本发明式I取代的吡唑-3-基苯并唑类作为除草剂或干燥剂/落叶剂的应用而言,优选的式I化合物是那些取代基(在每一种情况下是单独或组合的)具有下列含意的化合物:

$R^1$  是  $C_1-C_4$ -烷基,特别是甲基;

$R^2$  是  $C_1-C_4$ -卤代烷基、 $C_1-C_4$ -卤代烷氧基或  $C_1-C_4$ -烷基磺酰基，特别是三氟甲基、二氟甲氧基或甲基磺酰基，特别优选是二氟甲氧基；

$R^3$  是卤素，特别是氯；

$R^4$  是氢、氟或氯，特别是氟或氯；

$R^5$  是氰基、卤素或三氟甲基，特别是卤素，特别优选是氯；

A 是经氧或硫键合在 $\alpha$ 上的基团  $-N=C(XR^6) -O-$  或  $-N=C(XR^6) -S-$ ，特别是经硫键合在 $\alpha$ 上的基团  $-N=C(XR^6) -S-$ ；

X 是化学键、氧、硫、 $-NH-$  或  $-N(R^7)-$

$R^6$  和  $R^7$  相互独立地是  $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_6$ -卤代烷基、氰基- $C_1-C_4$ -烷基、羟基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_3-C_6$ -炔基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷基磺酰基- $C_1-C_4$ -烷基、( $C_1-C_4$ -烷氧基)羰基- $C_1-C_4$ -烷基、二( $C_1-C_4$ -烷基)氨基羰基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$ -环烷基、 $C_3-C_8$ -环烷基- $C_1-C_4$ -烷基、苯基、苯基- $C_1-C_4$ -烷基；

如果 X 是化学键、氧、硫、 $-NH-$  或  $-N(R^7)-$ ，那么  $R^6$  可以是 ( $C_1-C_4$ -烷基)羰基或  $C_1-C_4$ -烷基磺酰基；

如果 X 是化学键，那么此外  $R^6$  可以是氢、氰基、氨基、卤素或  $-CH=CH-R^8$ ；

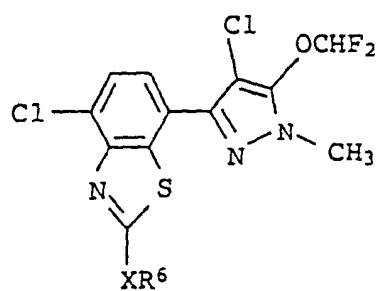
在每种情况下  $R^6$  和  $R^7$  特别是  $C_1-C_6$ -烷基、羟基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_6$ -链烯基、 $C_3-C_6$ -炔基或 ( $C_1-C_4$ -烷氧基)羰基- $C_1-C_4$ -烷基；

如果 X 是化学键，那么此外  $R^6$  尤其是氢或  $-CH=CH-R^8$ ；

$R^8$  是(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基)羰基。

非常特别优选的是式 Ia 的取代的吡唑-3-基苯并唑类( $\hat{=}$  I, 其中  $R^1$ =甲基,  $R^2$ =二氟甲氧基,  $R^3$  和  $R^5$ =氯,  $R^4$ =氢, Z=经硫键合在 $\alpha$ 上的基团-N=C(XR<sup>6</sup>)-S-), 特别是列于下表 1 中的化合物:

表 1



序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.001	-H
Ia.002	-CH <sub>3</sub>
Ia.003	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.004	-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.005	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.006	-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.007	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.008	-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.009	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.010	-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.011	-CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>3</sub>
Ia.012	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>

序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.013	-CH <sub>2</sub> -C≡CH
Ia.014	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.015	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.016	-CH <sub>2</sub> -CN
Ia.017	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F
Ia.018	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>
Ia.019	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> Cl
Ia.020	-CH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.021	-CH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.022	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.023	-CH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>3</sub> )
Ia.024	-CH <sub>2</sub> -CH(=N-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )
Ia.025	-CH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )]
Ia.026	-CH <sub>2</sub> -CH[=N-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
Ia.027	-CH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )]
Ia.028	-CH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> )
Ia.029	-环丁基
Ia.030	-环戊基
Ia.031	-环己基
Ia.032	-苯基
Ia.033	-CH <sub>2</sub> -环丁基
Ia.034	-CH <sub>2</sub> -环戊基
Ia.035	-CH <sub>2</sub> -环己基
Ia.036	-CH <sub>2</sub> -苯基
Ia.037	-NO <sub>2</sub>
Ia.038	-CN
Ia.039	-F
Ia.040	-Cl
Ia.041	-Br
Ia.042	-OCH <sub>3</sub>
Ia.043	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.044	-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.045	-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.046	-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.047	-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.048	-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.049	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.050	-OCH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.051	-OCH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>3</sub>

序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.052	-OCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.053	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH <sub>2</sub>
Ia.054	-OCH <sub>2</sub> -C≡CH
Ia.055	-OCH(CH <sub>3</sub> )-C≡CH
Ia.056	-OCH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.057	-OCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.058	-OCH <sub>2</sub> -CN
Ia.059	-OCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F
Ia.060	-OCH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>
Ia.061	-OCH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.062	-OCH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.063	-OCH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.064	-OCH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>3</sub> )
Ia.065	-OCH <sub>2</sub> -CH(=N-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )
Ia.066	-OCH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )]
Ia.067	-OCH <sub>2</sub> -CH[=N-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
Ia.068	-OCH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )]
Ia.069	-OCH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> )
Ia.070	-O-环丁基
Ia.071	-O-环戊基
Ia.072	-O-环己基
Ia.073	-O-苯基
Ia.074	-OCH <sub>2</sub> -环丁基
Ia.075	-OCH <sub>2</sub> -环戊基
Ia.076	-OCH <sub>2</sub> -环己基
Ia.077	-OCH <sub>2</sub> -苯基
Ia.078	-CH <sub>2</sub> -OH
Ia.079	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.080	-NH <sub>2</sub>
Ia.081	-NH-CH <sub>3</sub>
Ia.082	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.083	-NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.084	-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.085	-NH-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.086	-N(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.087	-NH-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.088	-N(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.089	-NH-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.090	-N[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>

序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.091	-NH-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.092	-N[CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>
Ia.093	-NH-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.094	-N(CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.095	-NH-CH <sub>2</sub> -C≡CH
Ia.096	-N(CH <sub>2</sub> -C≡CH) <sub>2</sub>
Ia.097	-CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.098	-SH
Ia.099	-SCH <sub>3</sub>
Ia.100	-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.101	-S(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.102	-S(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.103	-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.104	-SCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.105	-SCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.106	-SC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.107	-SCH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.108	-SCH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>3</sub>
Ia.109	-SCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.110	-SCH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH <sub>2</sub>
Ia.111	-SCH <sub>2</sub> -C≡CH
Ia.112	-SCH(CH <sub>3</sub> )-C≡CH
Ia.113	-SCH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.114	-SCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.115	-SCH <sub>2</sub> -CN
Ia.116	-SCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F
Ia.117	-SCH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>
Ia.118	-SCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> Cl
Ia.119	-SCH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.120	-SCH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.121	-SCH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.122	-SCH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>3</sub> )
Ia.123	-SCH <sub>2</sub> -CH(=N-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )
Ia.124	-SCH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )]
Ia.125	-SCH <sub>2</sub> -CH[=N-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
Ia.126	-SCH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )]
Ia.127	-SCH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> )
Ia.128	-S-环丁基
Ia.129	-S-环戊基

序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.130	-S-环己基
Ia.131	-S-苯基
Ia.132	-SCH <sub>2</sub> -环丁基
Ia.133	-SCH <sub>2</sub> -环戊基
Ia.134	-SCH <sub>2</sub> -环己基
Ia.135	-SCH <sub>2</sub> -苯基
Ia.136	-CH <sub>2</sub> -SCH <sub>3</sub>
Ia.137	-SO-CH <sub>3</sub>
Ia.138	-SO-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.139	-SO-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.140	-SO-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.141	-SO-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.142	-SO-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.143	-SO-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.144	-SO-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.145	-SO-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.146	-SO-CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>3</sub>
Ia.147	-SO-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.148	-SO-CH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH <sub>2</sub>
Ia.149	-SO-CH <sub>2</sub> -C≡CH
Ia.150	-SO-CH(CH <sub>3</sub> )-C≡CH
Ia.151	-SO-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.152	-SO-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.153	-SO-CH <sub>2</sub> -CN
Ia.154	-SO-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F
Ia.155	-SO-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>
Ia.156	-SO-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> Cl
Ia.157	-SO-CH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.158	-SO-CH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.159	-SO-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.160	-SO-CH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>3</sub> )
Ia.161	-SO-CH <sub>2</sub> -CH(=N-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )
Ia.162	-SO-CH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )]
Ia.163	-SO-CH <sub>2</sub> -CH[=N-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
Ia.164	-SO-CH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )]
Ia.165	-SO-CH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> )
Ia.166	-SO-环丁基
Ia.167	-SO-环戊基
Ia.168	-SO-环己基

序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.169	-SO-苯基
Ia.170	-SO-CH <sub>2</sub> -环丁基
Ia.171	-SO-CH <sub>2</sub> -环戊基
Ia.172	-SO-CH <sub>2</sub> -环己基
Ia.173	-SO-CH <sub>2</sub> -苯基
Ia.174	-CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>3</sub>
Ia.175	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>
Ia.176	-SO <sub>2</sub> -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.177	-SO <sub>2</sub> -(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.178	-SO <sub>2</sub> -(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.179	-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.180	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.181	-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.182	-SO <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.183	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.184	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>3</sub>
Ia.185	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.186	-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH <sub>2</sub>
Ia.187	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -C≡CH
Ia.188	-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-C≡CH
Ia.189	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.190	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
Ia.191	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN
Ia.192	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F
Ia.193	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>
Ia.194	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> Cl
Ia.195	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.196	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.197	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.198	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>3</sub> )
Ia.199	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(=N-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )
Ia.200	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )]
Ia.201	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH[=N-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]
Ia.202	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH[=N-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )]
Ia.203	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(=N-OCH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> )
Ia.204	-SO <sub>2</sub> -环丁基
Ia.205	-SO <sub>2</sub> -环戊基
Ia.206	-SO <sub>2</sub> -环己基
Ia.207	-SO <sub>2</sub> -苯基

序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.208	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -环丁基
Ia.209	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -环戊基
Ia.210	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -环己基
Ia.211	-SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -苯基
Ia.212	-CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>
Ia.213	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-OH
Ia.214	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.215	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.216	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.217	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.218	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.219	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.220	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.221	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.222	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-OH
Ia.223	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.224	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.225	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.226	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.227	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.228	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.229	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.230	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.231	-CH=CH-CO-OH
Ia.232	-CH=CH-CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.233	-CH=CH-CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.234	-CH=CH-CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.235	-CH=CH-CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.236	-CH=CH-CO-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.237	-CH=CH-CO-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.238	-CH=CH-CO-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.239	-CH=CH-CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.240	-CH=C(Cl)-CO-OH
Ia.241	-CH=C(Cl)-CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.242	-CH=C(Cl)-CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.243	-CH=C(Cl)-CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.244	-CH=C(Cl)-CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.245	-CH=C(Cl)-CO-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.246	-CH=C(Cl)-CO-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.247	-CH=C(Cl)-CO-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.248	-CH=C(Cl)-CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.249	-CH=C(Br)-CO-OH
Ia.250	-CH=C(Br)-CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.251	-CH=C(Br)-CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.252	-CH=C(Br)-CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.253	-CH=C(Br)-CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.254	-CH=C(Br)-CO-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.255	-CH=C(Br)-CO-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.256	-CH=C(Br)-CO-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.257	-CH=C(Br)-CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.258	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-NH <sub>2</sub>
Ia.259	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-NH-CH <sub>3</sub>
Ia.260	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.261	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.262	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.263	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-NH-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.264	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-N(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.265	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-NH-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.266	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-CO-N(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.267	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-NH <sub>2</sub>
Ia.268	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-NH-CH <sub>3</sub>
Ia.269	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.270	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.271	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.272	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-NH-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.273	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-N(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.274	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-NH-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.275	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-CO-N(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.276	-CH=CH-CO-NH <sub>2</sub>
Ia.277	-CH=CH-CO-NH-CH <sub>3</sub>
Ia.278	-CH=CH-CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.279	-CH=CH-CO-NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.280	-CH=CH-CO-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.281	-CH=CH-CO-NH-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.282	-CH=CH-CO-N(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.283	-CH=CH-CO-NH-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.284	-CH=CH-CO-N(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.285	-CH=C(Cl)-CO-NH <sub>2</sub>

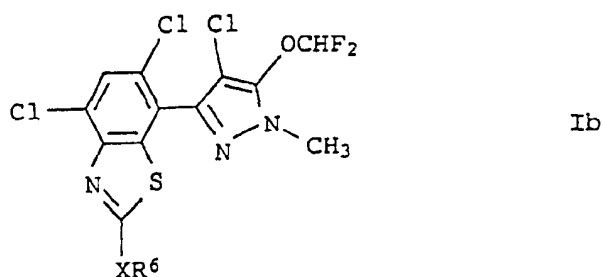
序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.286	-CH=C(Cl)-CO-NH-CH <sub>3</sub>
Ia.287	-CH=C(Cl)-CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.288	-CH=C(Cl)-CO-NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.289	-CH=C(Cl)-CO-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.290	-CH=C(Cl)-CO-NH-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.291	-CH=C(Cl)-CO-N(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.292	-CH=C(Cl)-CO-NH-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.293	-CH=C(Cl)-CO-N(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.294	-CH=C(Br)-CO-NH <sub>2</sub>
Ia.295	-CH=C(Br)-CO-NH-CH <sub>3</sub>
Ia.296	-CH=C(Br)-CO-NH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.297	-CH=C(Br)-CO-NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.298	-CH=C(Br)-CO-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.299	-CH=C(Br)-CO-NH-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.300	-CH=C(Br)-CO-N(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.301	-CH=C(Br)-CO-NH-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.302	-CH=C(Br)-CO-N(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.303	-CH(CH <sub>3</sub> )-OCH <sub>3</sub>
Ia.304	-CH <sub>2</sub> Cl
Ia.305	-CF <sub>3</sub>
Ia.306	-CH <sub>2</sub> OH
Ia.307	-CH(CH <sub>3</sub> )OH
Ia.308	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> OH
Ia.309	-O·苯基
Ia.310	-OCH <sub>2</sub> ·苯基
Ia.311	-OCH <sub>2</sub> -CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.312	-OCH <sub>2</sub> -CO-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.313	-OCH <sub>2</sub> -CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.314	-OCH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.315	-OCH <sub>2</sub> -CO-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.316	-OCH <sub>2</sub> -CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.317	-O-CO-CH <sub>3</sub>
Ia.318	-O-CO-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.319	-O-CO-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.320	-O-CO-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.321	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.322	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.323	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.324	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.325	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.326	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.327	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.328	-OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.329	-NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN
Ia.330	-N(CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN) <sub>2</sub>
Ia.331	-NH-CH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.332	-N(CH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.333	-NH-CH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.334	-N(CH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.335	-N(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.336	-N(CH <sub>3</sub> )-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.337	-N(CH <sub>3</sub> )-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.338	-N(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.339	-N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.340	-N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>
Ia.341	-N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -C≡CH
Ia.342	-N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN
Ia.343	-N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.344	-N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.345	-NH-CO-CH <sub>3</sub>
Ia.346	-NH-CO-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.347	-NH-CO-(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.348	-NH-CO-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.349	-NH-SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>
Ia.350	-NH-SO <sub>2</sub> -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.351	-NH-SO <sub>2</sub> -(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.352	-NH-SO <sub>2</sub> -(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.353	-S-苯基
Ia.354	-SCH <sub>2</sub> -苯基
Ia.355	-SCH <sub>2</sub> -CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.356	-SCH <sub>2</sub> -CO-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.357	-SCH <sub>2</sub> -CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.358	-SCH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.359	-SCH <sub>2</sub> -CO-OCH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.360	-SCH <sub>2</sub> -CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
Ia.361	-S-CO-CH <sub>3</sub>
Ia.362	-SCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.363	-SCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

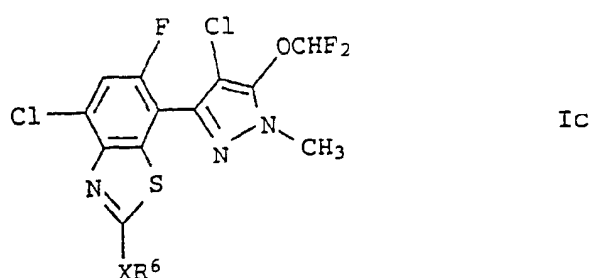
序号	-XR <sup>6</sup>
Ia.364	-SCH(CH <sub>3</sub> )-CO-O(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
Ia.365	-SCH(CH <sub>3</sub> )-CO-O(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )
Ia.366	-CH <sub>2</sub> -PO(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.367	-CH <sub>2</sub> -PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.368	-OCH <sub>2</sub> -PO(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.369	-OCH <sub>2</sub> -PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.370	-SCH <sub>2</sub> -PO(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.371	-SCH <sub>2</sub> -PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.372	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-PO(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.373	-CH <sub>2</sub> -CH(Cl)-PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.374	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-PO(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.375	-CH <sub>2</sub> -CH(Br)-PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.376	-CH=CH-PO(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.377	-CH=CH-PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.378	-CH(CO-OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.379	-CH(CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
Ia.380	-CH(CO-OCH <sub>3</sub> )[CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]
Ia.381	-CH(CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )[CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]
Ia.382	-CH(CN)-CO-OCH <sub>3</sub>
Ia.383	-CH(CN)-CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Ia.384	-CH(CN)-CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

此外，式 Ib 至 It 和 IA 至 IT 的取代的吡唑-3-基苯并唑类是特别优选的，特别是

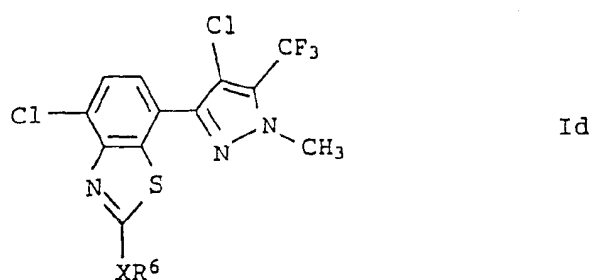
- 化合物 Ib. 001-Ib. 384，它们仅在  $R^4$  是氯这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同：



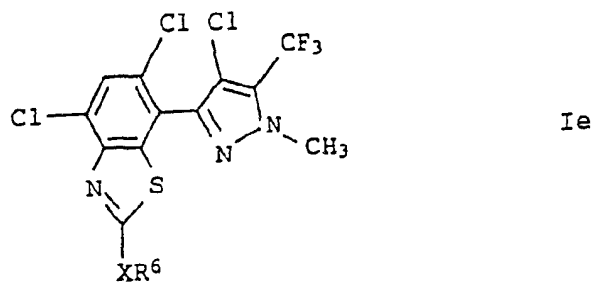
- 化合物 Ic. 001-Ic. 384，它们仅在  $R^4$  是氯这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同：



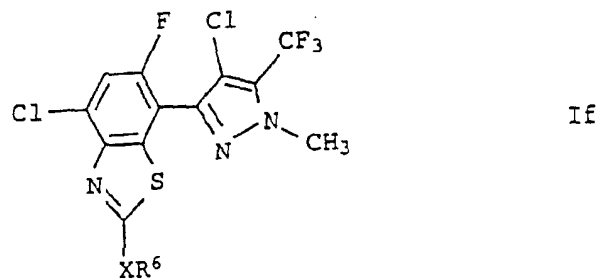
- 化合物 Id. 001-Id. 384，它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氯这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同：



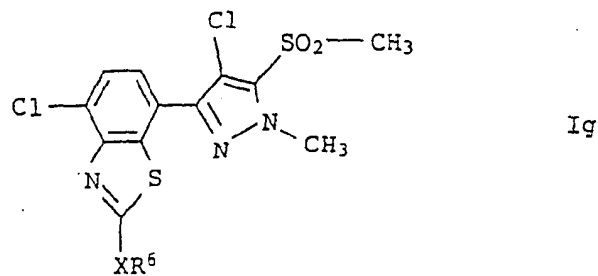
- 化合物 Ie. 001-Ie. 384，它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氯这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同：



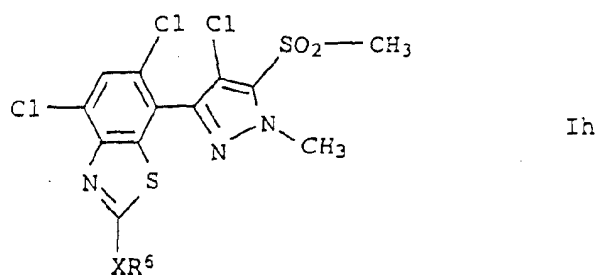
- 化合物 If. 001-If. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氟这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



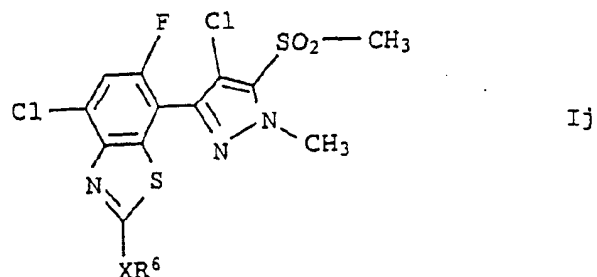
- 化合物 Ig. 001-Ig. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



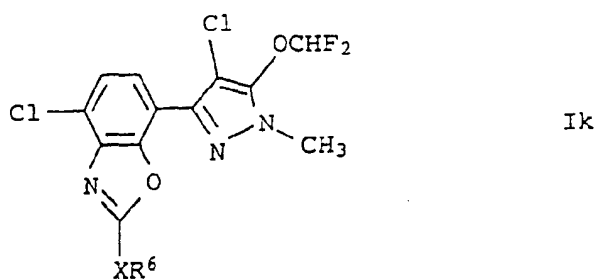
- 化合物 Ih. 001-Ih. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $R^4$  是氯这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



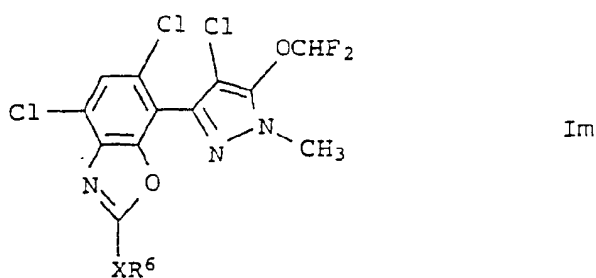
- 化合物 Ij. 001-Ij. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $R^4$  是氯这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



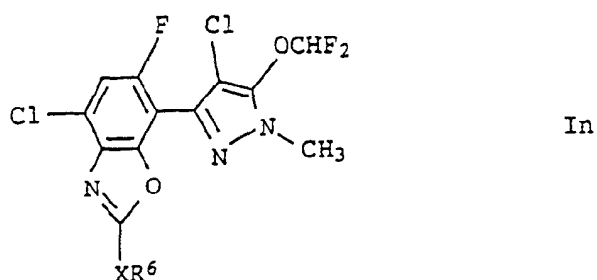
- 化合物 Ik. 001-Ik. 384, 它们仅在 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氧键合在  $\alpha$  上:



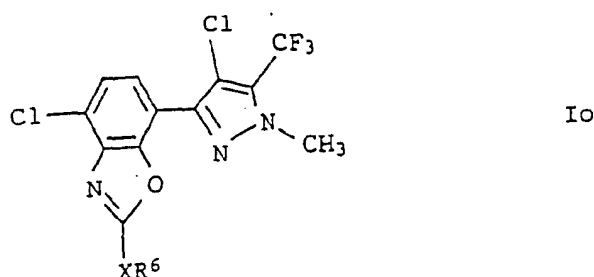
- 化合物 Im. 001-Im. 384, 它们仅在  $R^4$  是氯和 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氧键合在  $\alpha$  上:



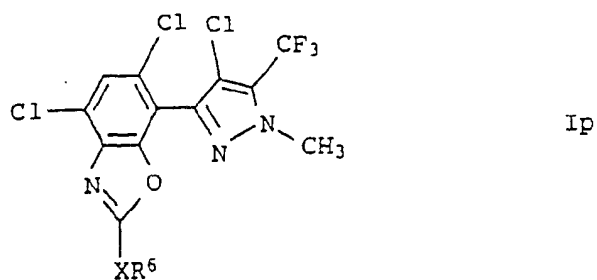
- 化合物 In. 001-In. 384, 它们仅在  $R^4$  是氯和 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氧键合在  $\alpha$  上:



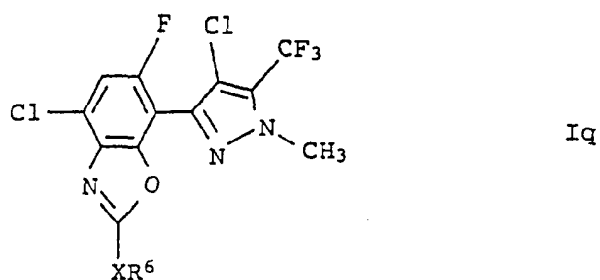
- 化合物 Io. 001-Io. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $Z$  是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中  $Z$  经氧键合在  $\alpha$  上:



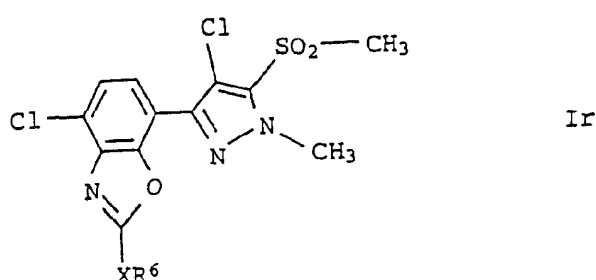
- 化合物 Ip. 001-Ip. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氯以及  $Z$  是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中  $Z$  经氧键合在  $\alpha$  上:



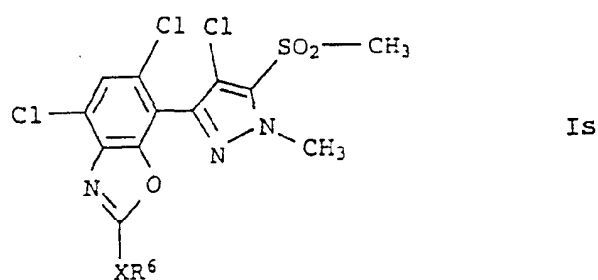
- 化合物 Iq. 001-Iq. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氯以及  $Z$  是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中  $Z$  经氧键合在  $\alpha$  上:



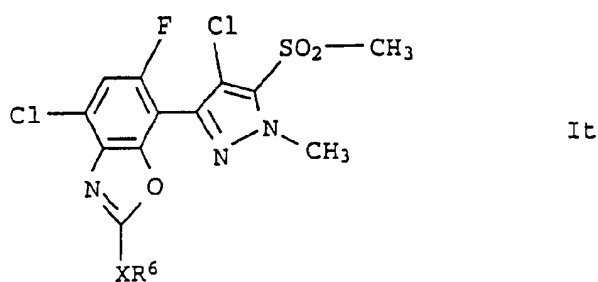
- 化合物 Ir. 001-Ir. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $Z$  是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中  $Z$  经氧键合在  $\alpha$  上:



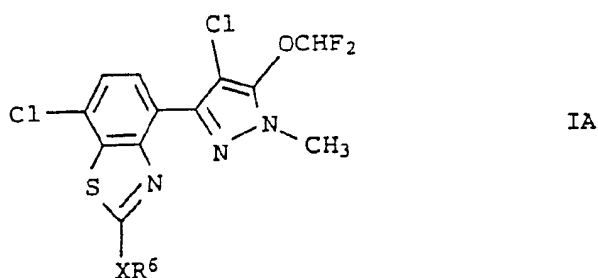
- 化合物 Is. 001-Is. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $R^4$  是氯以及  $Z$  是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中  $Z$  经氧键合在  $\alpha$  上:



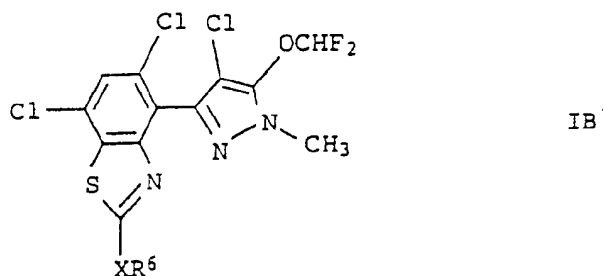
- 化合物 It. 001-It. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $R^4$  是氯以及  $Z$  是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中  $Z$  经氧键合在  $\alpha$  上:



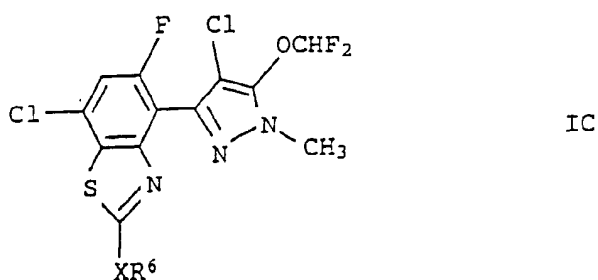
- 化合物 IA. 001-IA. 384, 它们仅在基团  $-N=C(XR^6)-S-$  经氮键合在  $\alpha$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



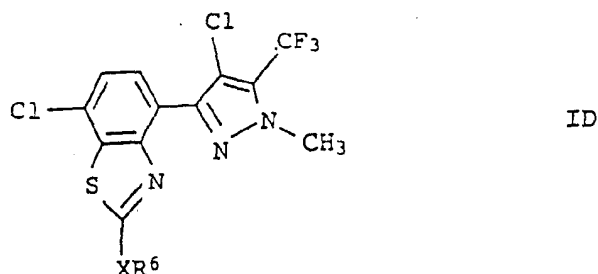
- 化合物 IB. 001-IB. 384, 它们仅在  $R^4$  是氯和基团  $-N=C(XR^6)-S-$  经氮键合在  $\alpha$  上这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



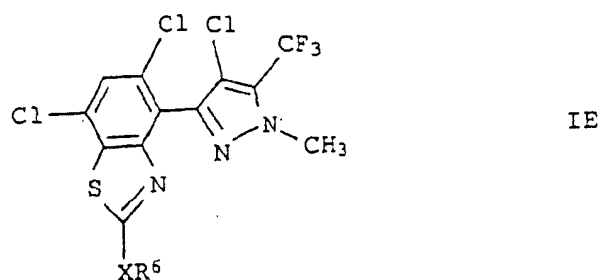
- 化合物 IC. 001-IC. 384, 它们仅在  $R^4$  是氟和基团  $-N=C(XR^6)-S-$  经氮键合在  $\alpha$  上这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



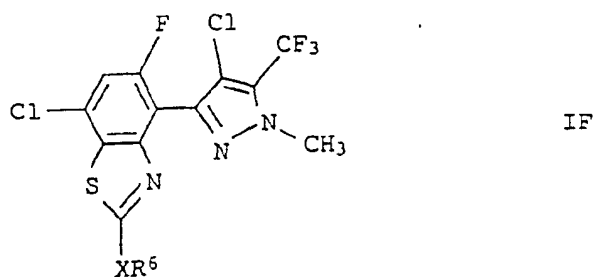
- 化合物 ID. 001-ID. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和基团  $-N=C(XR^6)$   $-S-$  经氮键合在  $\alpha$  上这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



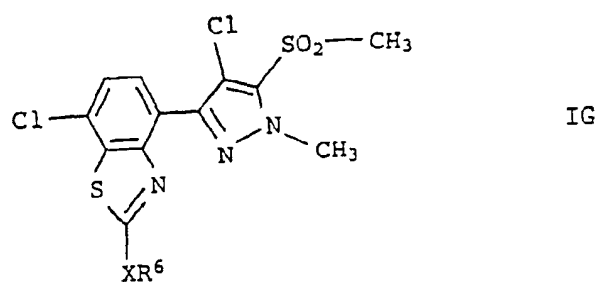
- 化合物 IE. 001-IE. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氯以及基团  $-N=C(XR^6)$   $-S-$  经氮键合在  $\alpha$  上这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



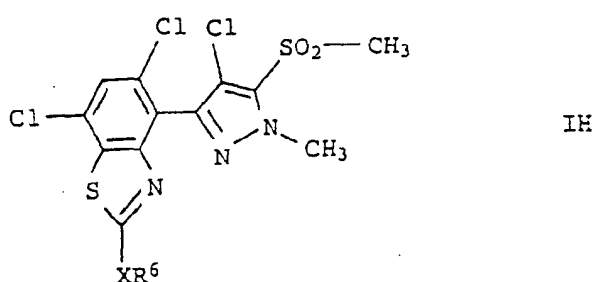
- 化合物 IF. 001-IF. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氟以及基团  $-N=C(XR^6)$   $-S-$  经氮键合在  $\alpha$  上这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



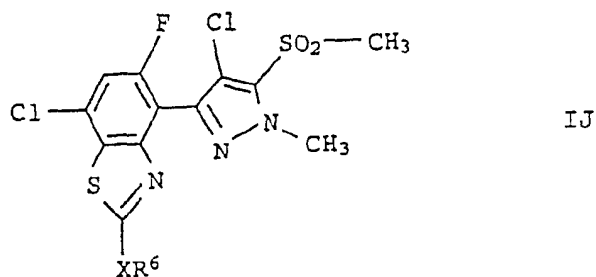
- 化合物 IG. 001-IG. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和基团  $-N=C(XR^6)$   $-S-$  经氮键合在  $\alpha$  上这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



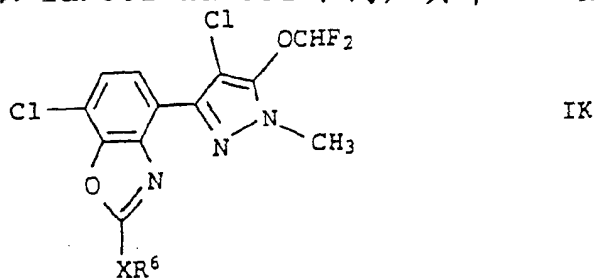
- 化合物 IH. 001-IH. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $R^4$  是氯以及基团  $-N=C(XR^6)-S-$  经氮键合在  $\alpha$  上这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



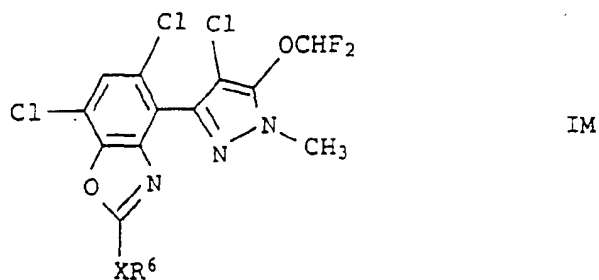
- 化合物 IJ. 001-IJ. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $R^4$  是氟以及基团  $-N=C(XR^6)-S-$  经氮键合在  $\alpha$  上这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同:



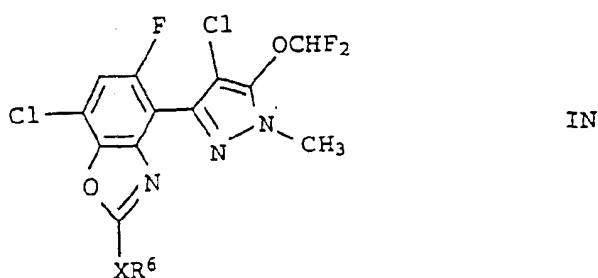
- 化合物 IK. 001-IK. 384, 它们仅在 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氮键合在  $\alpha$  上:



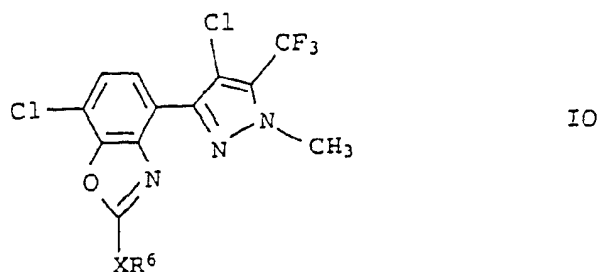
- 化合物 IM. 001-IM. 384, 它们仅在  $R^4$  是氯和 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氮键合在  $\alpha$  上:



- 化合物 IN. 001-IN. 384, 它们仅在  $R^4$  是氯和 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氮键合在  $\alpha$  上:

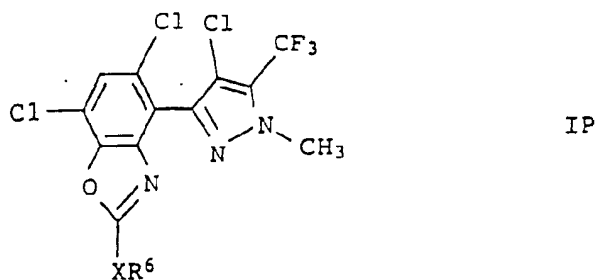


- 化合物 IO. 001-IO. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氮键合在  $\alpha$  上:

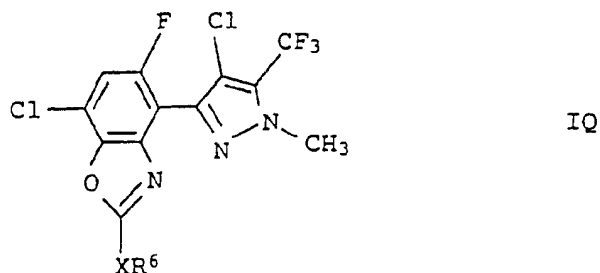


- 化合物 IP. 001-IP. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氯以及 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中

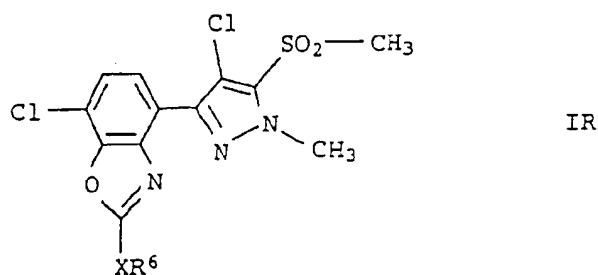
Z 经氮键合在 $\alpha$ 上:



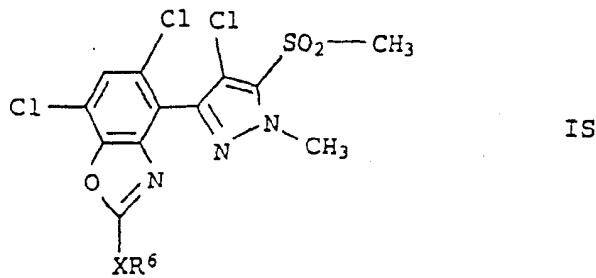
- 化合物 IQ. 001-IQ. 384, 它们仅在  $R^2$  是三氟甲基和  $R^4$  是氟以及 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氮键合在 $\alpha$ 上:



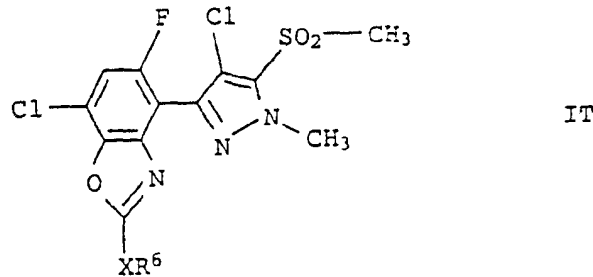
- 化合物 IR. 001-IR. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氮键合在 $\alpha$ 上:



- 化合物 IS. 001-IS. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $R^4$  是氯以及 Z 是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中 Z 经氮键合在 $\alpha$ 上:

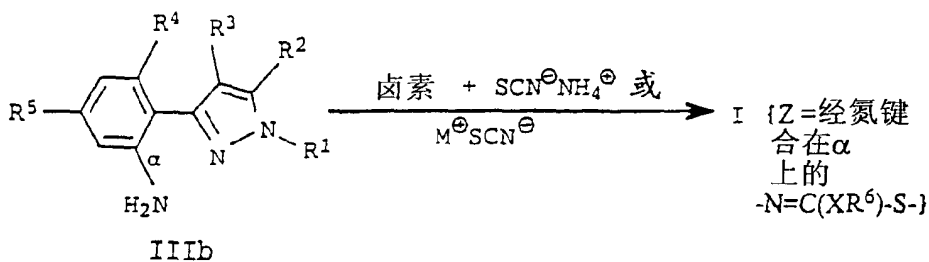
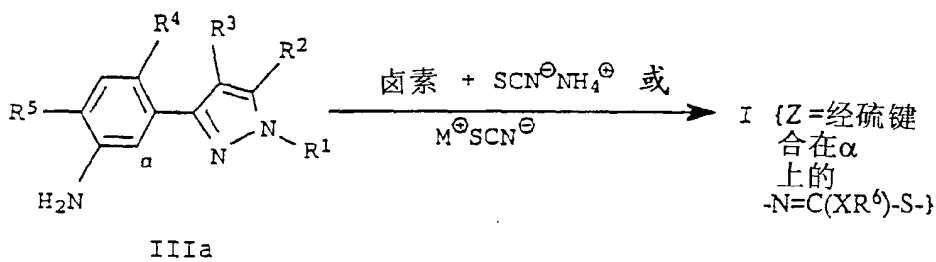


- 化合物 IT. 001-IT. 384, 它们仅在  $R^2$  是甲基磺酰基和  $R^4$  是氟以及  $Z$  是基团  $-N=C(XR^6)-O-$  这点上与相应的化合物 Ia. 001-Ia. 384 不同, 其中  $Z$  经氮键合在  $\alpha$  上:



式 I 的取代的吡唑-3-基苯并咪唑类可以通过各种途径获得, 特别是通过下列方法之一:

A) 式 IIIa 或 IIIb 的氨基苯基吡唑与卤素和硫氰酸铵或者与碱金属或碱土金属的硫氰酸盐反应:



$M^{\oplus}$ =碱金属离子或者 1/2 碱土金属离子

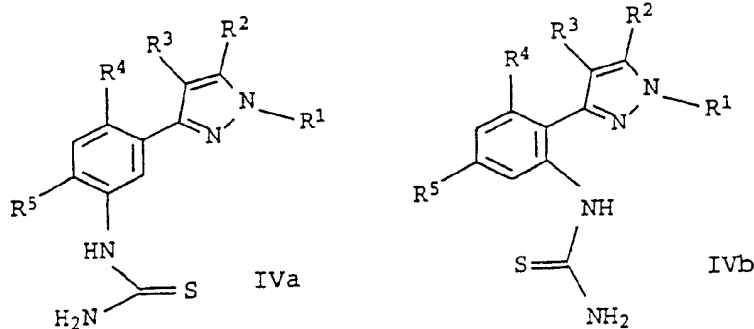
优选的卤素是氯或溴；碱金属/碱土金属硫氰酸盐优选是硫氰酸钠。

一般在惰性溶剂/稀释剂中，例如在烃如甲苯和己烷中，在卤代烃如二氯甲烷，在醚类如四氢呋喃，在醇如乙醇中，在羧酸如乙酸中，或者在非质子传递溶剂如二甲基甲酰胺、乙腈和二甲基亚砷中进行该反应。

反应温度通常在反应混合物的熔点和沸点之间，优选在约 0-150℃。

为了使产物具有尽可能高的产率，使用等摩尔量或过量，最高至约 5 倍摩尔量的卤素和硫氰酸铵或碱金属/碱土金属硫氰酸盐，以 IIIa 或 IIIb 为基准。

该方法的另一实施方案是，氨基苯基吡唑 IIIa 或 IIIb 首先与硫氰酸铵或碱金属或碱土金属的硫氰酸盐反应，获得硫脲 IVa 或 IVb

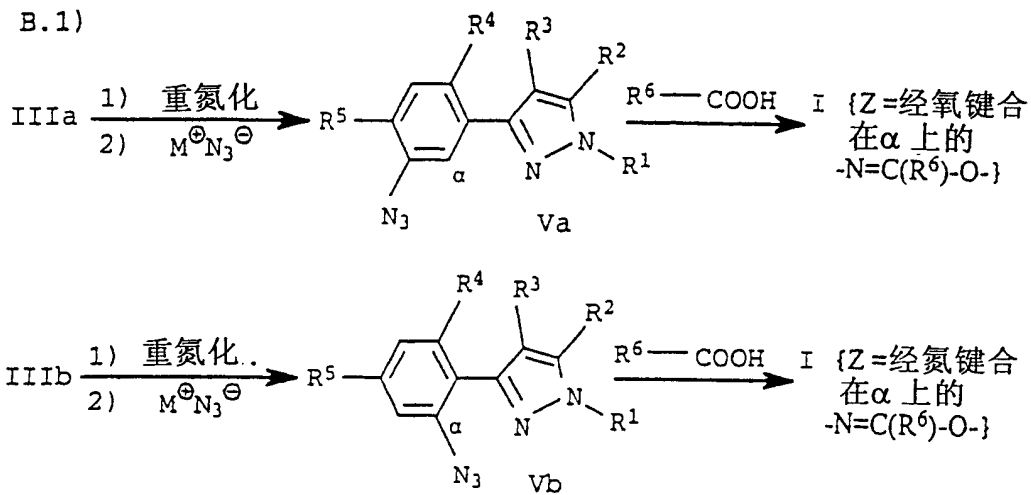


随后通过用卤素处理将 IVa 或 IVb 转化为其中  $Z = -N=C(XR^6)-S-$  的化合物 I。

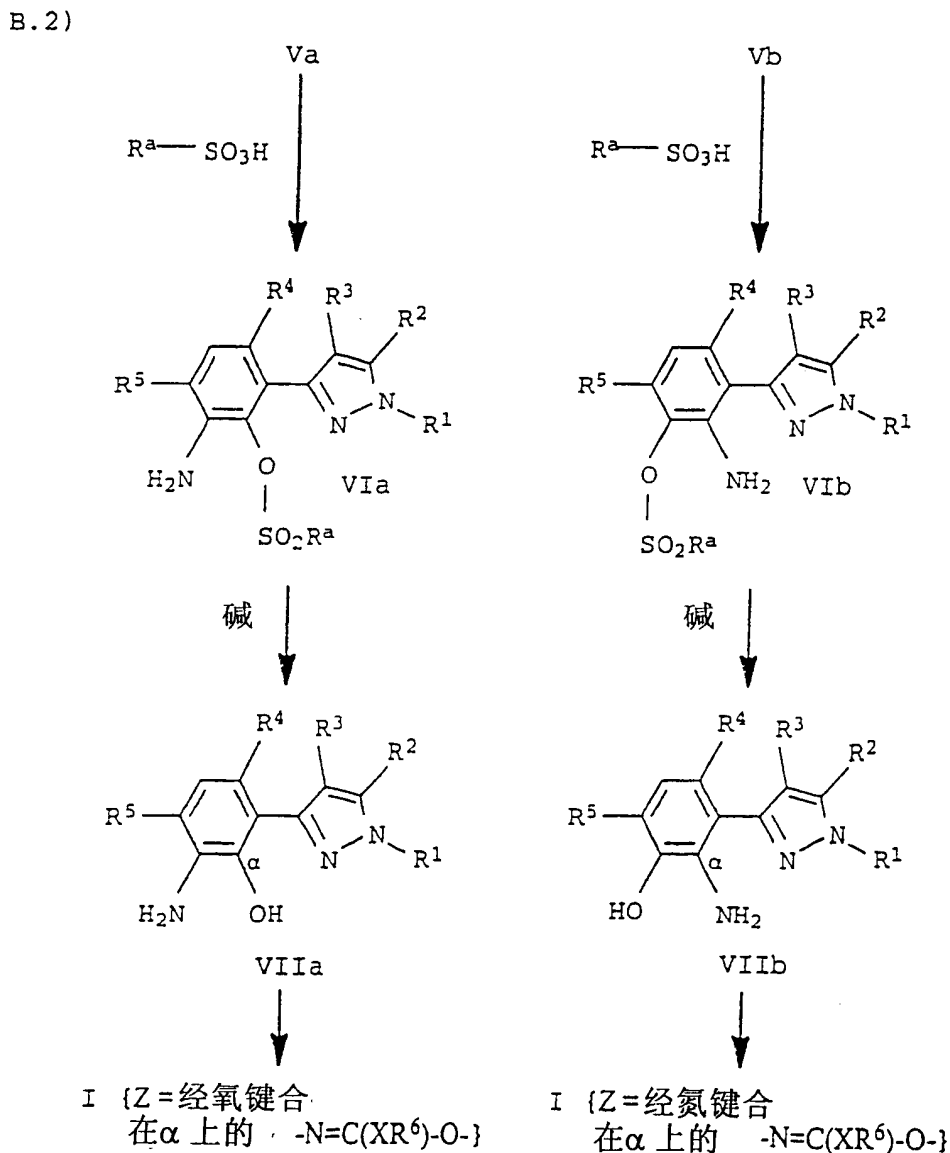
B) 式 IIIa 或 IIIb 的氨基苯基吡唑的重氮化反应，各自的重氮盐转化为式 Va 或 Vb 的叠氨基苯基吡唑，然后其或者

B. 1) 与羧酸反应，或者

B. 2) 首先与磺酸反应（获得 VIa 或 VIb），所形成的磺酸盐水解，获得氨基苯酚 VIIa 或 VIIb，然后其转化为 I:



M<sup>⊕</sup> 代表碱金属离子或 1/2 碱土金属离子



对于重氮化反应，方法 C) 中的说明同样适用。优选通过 IIIa 或 IIIb 与碱金属或碱土金属叠氮化物如叠氮化钠反应或通过与三甲基甲硅烷基叠氮化物反应而转化为芳基叠氮化物 Va 或 Vb。

在 B. 1) 下提及的与羧酸的反应或者在惰性溶剂例如醚如四氢呋喃和二噁烷、非质子传递溶剂如二甲基甲酰胺和乙腈、烃如甲苯和己烷、卤代烃如二氯甲烷中进行，或者在无溶剂下在过量的羧酸  $R^6$ -COOH 中进行。在后一种情况下，加入无机酸例如磷酸是有利的。

该反应优选在高温，例如反应混合物的沸点温度下进行。

上述对 Va/Vb 与  $R^6$ -COOH 的反应的说明同样适合于在 B. 2) 下首先提及的 Va/Vb 与  $R^a$ -SO<sub>3</sub>H (其中  $R^a$  是 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或者 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-卤代烷基，优选是甲基或三氟甲基) 的磺酸的反应。

接着的磺酸盐 VIa 或 VIb 的水解优选通过与含水碱如苛性钠和苛性钾水溶液反应来进行，其中如果需要可以加入溶剂例如醚类如二噁烷和四氢呋喃，或者醇类如甲醇和乙醇。

最后进行的向式 I 的转化本身是已知的，并且可以按照很多不同的方式进行。对此参阅 Houben-Weyl, [Methoden der Organischen Chemie] 《有机化学方法》，Georg Thieme Verlag, 斯图加特，第 E8a 卷，1993，第 1032 以下页中的说明

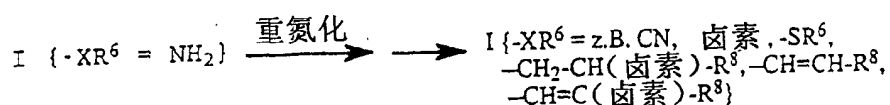
C) 其中  $XR^6$  表示氨基的式 I 的取代的吡唑-3-基苯并咪唑类的重氮化反应，随后该重氮盐转化为化合物 I，其中

-  $XR^6$  = 氰基或者卤素 {“Sandmeyer” 反应，参见，例如，Houben-Weyl, [Methoden der Organischen Chemie] 《有机化学方法》，第 5/4 卷，第 4 版，Georg Thieme Verlag, 斯图加特，第 4 版，1960，第 438 以下

页 }，

-X=硫 { 参见，例如，Houben-Weyl, [Methoden der Organischen Chemie] 《有机化学方法》，第 E11 卷，Georg Thieme Verlag, 斯图加特，1984，第 43 和 176 页 }：

-XR<sup>6</sup>=例如 -CH<sub>2</sub>-CH(卤素)-R<sup>8</sup>、-CH=CH-R<sup>8</sup>、-CH=CH(卤素)-R<sup>8</sup> (这里通常是米尔文芳基化反应的产物；对此例如参见 C. S. Rondstedt, [Org. React. ] 《有机反应》11, 189 (1960) 和 H. P. Doyle 等 [J. Org. Chem] 《有机化学杂志》42, 2431 (1977) )：



通常，重氮盐是通过本身已知的方式，通过在酸的水溶液中，例如在盐酸、氢溴酸或硫酸的水溶液中，使其中 -XR<sup>6</sup> 表示氨基的 I 与亚硝酸盐如亚硝酸钠或亚硝酸钾反应而获得的。

然而，也可以在水的条件下，例如在含有氯化氢的冰乙酸中，在无水乙醇中，在二噁烷或四氢呋喃中，在乙腈或在丙酮中进行反应，在上述情况下，起始化合物 (-XR<sup>6</sup>=NH<sub>2</sub> 的 I) 用亚硝酸酯如亚硝酸叔丁基酯和亚硝酸异戊基酯处理。

特别优选的是，通过用铜 (I) 盐 (如氰化铜 (I)、氯化铜 (I)、溴化铜 (I) 和碘化铜 (I)) 的溶液或悬浮液，或者用碱金属盐的溶液，将所得的重氮盐转化成其中 -XR<sup>6</sup>=氰基、氯、溴或碘的相应化合物 I。

其中 -X=硫化合物 I 通常通过重氮盐与二硫化二烷基如二硫化二甲基和二硫化二乙基反应，或者与例如二硫化二烯丙基或二硫化二苄基反应获得。

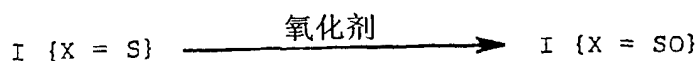
米尔文芳基化反应通常是重氮盐与链烯烃（这里是  $\text{H}_2\text{C}=\text{CH}-\text{R}^8$ ）或炔烃（这里是  $\text{HC}\equiv\text{C}-\text{R}^8$ ）反应。优选链烯烃或炔烃过量，以重氮盐的量为基准计过量最大至约 3000 摩尔%。

此重氮盐反应可以如下进行，例如，在水中，在含水盐酸或氢溴酸中，在酮如丙酮、二乙酮和甲基乙基酮中，在腈如乙腈中，在醚如二噁烷和四氢呋喃中，或在醇如甲醇和乙醇中进行。

除非另有说明，反应温度通常是  $-30$  至  $+50^\circ\text{C}$ 。

优选的是，所有的反应组分采用大致化学计算量，但一种或另一种组分过量，最高至约 3000 摩尔%或许会是有利的。

D) 以本身已知的方式，将其中 X 表示硫的取代的吡唑-3-基苯并唑类 I 氧化为其中  $\text{X}=-\text{SO}-$  的 I (参见，例如，Houben-Weyl, [Methoden der Organischen Chemie] 《有机化学方法》，Georg Thieme Verlag, 斯图加特，第 E11/1 卷，1985，第 702 页以下页，第 IX 卷，第 4 版，1955，第 211 页)：



适合的氧化剂例如是过氧化氢、有机过氧化物如过氧化乙酰、过氧化三氟乙酰、间氯过苯甲酸、叔丁基过氧化氢和叔丁基次氯酸盐，以及无机化合物如偏碘酸钠、铬酸和硝酸。

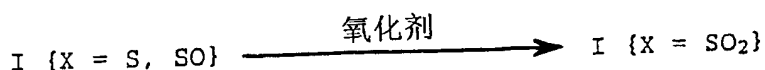
通常，根据氧化剂，在有机酸如乙酸和三氯乙酸、在氯代烃如二氯甲烷、氯仿和 1,2-二氯乙烷、在芳族烃如苯、氯苯和甲苯或在质子传递溶剂如甲醇和乙醇中进行该反应。同样可以使用上述溶剂的混合物。

反应温度一般是  $-30^\circ\text{C}$  至每种情况下的反应混合物的沸点温度，其中

通常优选较低温度范围的温度。

起始化合物和氧化剂宜采用约化学计算的比例，然而也可以过量使用这二种之一。

E) 以本身已知的方式，将其中 X 表示硫或-SO-的取代的吡唑-3-基苯并唑类 I 氧化为其中 X=-SO<sub>2</sub>-的 I (参见，例如，Houben-Weyl, [Methoden der Organischen Chemie] 《有机化学方法》，Georg Thieme Verlag, 斯图加特，第 E11/2 卷，1985，第 1132 页以下页，第 IX 卷，第 4 版，1955，第 222 页等)：



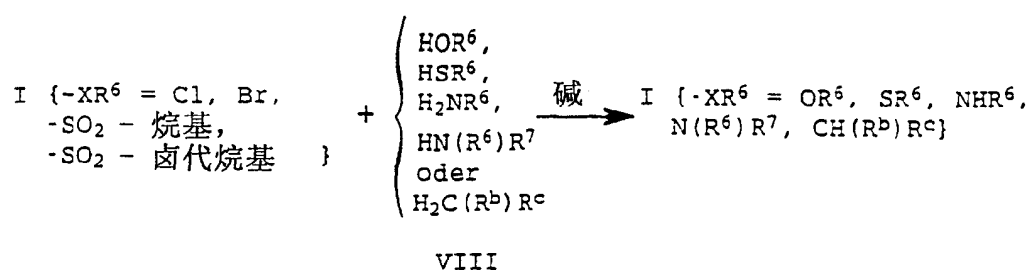
适合的氧化剂例如是过氧化氢、有机过氧化物如过氧化乙酰、过氧化三氯乙酰和间氯过苯甲酸，以及无机氧化剂如高锰酸钾。催化剂例如钨酸盐的存在有利于该反应过程。

一般该反应在惰性溶剂中进行，其中根据氧化剂例如可以使用有机酸如乙酸和丙酸，氯代烃如二氯甲烷、氯仿和 1,2-二氯乙烷、芳族烃和卤代烃如苯、氯苯和甲苯或者水。同样可以使用上述溶剂的混合物。

反应温度一般是-30℃至每种情况下的反应混合物的沸点温度，优选 10℃至沸点温度。

其中 X 表示硫或-SO-的起始化合物 I 和氧化剂宜采用约化学计算量。为了使起始化合物的转化最佳化，宜使用过量的氧化剂。

F) 在碱的存在下，使其中基团-XR<sup>6</sup> 是氯、溴、烷基磺酰基或卤代烷基磺酰基的取代的吡唑-3-基苯并唑类 I 与醇、硫醇、胺或 CH-酸性化合物反应 (VIII)：



$\text{R}^b$  和  $\text{R}^c$  相互独立地表示氰基或 ( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷氧基) 羰基。

该反应宜在惰性溶剂中进行，例如在醚如二乙醚、甲基叔丁基醚、二甲氧基乙烷、二甘醇二甲基醚、四氢呋喃和二恶烷中，在酮如丙酮、二乙基酮、乙基甲基酮和环己酮中，在偶极非质子传递溶剂如乙腈、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮和二甲基亚砷，在质子传递溶剂如甲醇和乙醇中，在芳族，如果需要，卤代烃如苯、氯苯和 1,2-二氯苯中，在杂芳族溶剂如吡啶和喹啉中或者在这些溶剂的混合物中进行。优选四氢呋喃、丙酮、二乙基酮和二甲基甲酰胺。

这里碱例如是碱金属和碱土金属的氢氧化物、氢化物、醇盐、碳酸盐或碳酸氢盐，脂族叔胺如三乙胺、N-甲基吗啉和 N-乙基-N,N-二异丙基胺、二和三环胺如二氮杂二环十一烷 (DBU) 和二氮杂二环辛烷 (DABCO)，或者芳族氮碱如吡啶、4-二甲基氨基吡啶和喹啉。同样可以使用不同碱的混合物。优选氯化钠、氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

胺  $\text{H}_2\text{NR}^6$  或  $\text{HN}(\text{R}^6)\text{R}^7$  可以作为反应组分，并同时作为碱，其中以起始化合物 I 的量为基准计胺至少二倍过量。当然较高的过量是可以的，其中以  $-\text{XR}^6$  是 Cl、Br、 $-\text{SO}_2$ -烷基或  $-\text{SO}_2$ -卤代烷基的 I 的量为基准计，过量至多约 10 倍摩尔量。

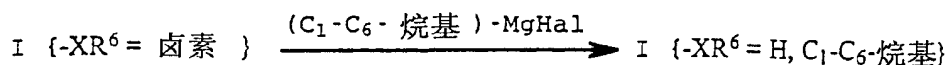
通常使用约化学计算量的起始化合物，然而同样根据反应过程或者为尽可能使起始化合物 I ( $-XR^6$  是 Cl、Br、 $-SO_2$ -烷基或  $-SO_2$ -卤代烷基) 完全反应可以使一种或另一种组分过量。

醇、硫醇、胺或 CH-酸性化合物 (VIII) 与碱的摩尔比例一般是 1:1 至 1:3。

在溶剂中起始化合物的浓度一般是 0.1 至 5.0 摩尔/升。

反应可以在 0°C 至每种情况下反应混合物的回流温度下进行。

G) 使其中基团  $-XR^6$  是卤素的取代的吡唑-3-基苯并唑类 I 与 ( $C_1$ - $C_6$ -烷基) 格利雅化合物反应:



Hal 表示氯化物或溴化物。

一般该反应在惰性溶剂/稀释剂，例如在烃如己烷和甲苯或者醚如二乙基醚、四氢呋喃和二噁烷中进行。

如果需要，可以使用 0.0001 至 10 摩尔% 的过渡金属催化剂。对此例如是镍和钨催化剂如二氯化镍、双(三苯基膦)二氯化镍、[双-(1,2-二苯基膦基)乙烷]二氯化镍、[双-(1,3-二苯基膦基)丙烷]二氯化镍、二氯化钨、四(三苯基膦)钨、双(三苯基膦)二氯化钨、[双-(1,2-二苯基膦基)乙烷]二氯化钨、[双-(1,3-二苯基膦基)丙烷]二氯化钨和[双(二苯基膦基)ferrocen]二氯化钨，同样可以使用二氯化钨或二氯化镍和膦如三苯基膦、双-1,2-(二苯基膦基)乙烷和双-1,3-(二苯

基磷基)丙烷的混合物。

根据反应, 获得其中基团 $-XR^6$  是氢或  $C_1-C_6$ -烷基的化合物 I 或者由以常规方法可分离的烷基化和未烷基化化合物 I 组成的混合物。

一般该反应在 $-100^\circ\text{C}$  至反应混合物沸点温度下进行。

格利雅试剂的量不是关键的; 一般使用等摩尔量的或过量的( $C_1-C_6$ -烷基)  $-MgHal$ , 以其中 $-XR^6$  是卤素的 I 的量为基准计, 过量至多约 10 倍摩尔量。

除非另作指明, 上面描述的所有方法宜在常压下进行或在所讨论的反应混合物的自生压力下进行。

一般而言, 反应混合物通过本身已知的方式处理。在上述方法中除非另有说明, 例如用水稀释反应溶液, 接着通过过滤、结晶或溶剂萃取, 或通过去除溶剂, 将残留物在水与适合的有机溶剂的混合物中分配, 并处理有机相, 从而获得产物。

在其制备中, 吡唑-3-基苯并唑类 I 可以以异构体混合物的形式获得, 如果需要, 它们可以通过用于此目的的通常方法如结晶或色谱分离, 还可以在光学活性吸附剂上, 分离成基本上纯的异构体。纯的光学活性异构体也可以由相应的光学活性原料制备。

化合物 I 的农业上可用的盐可以通过将它们与相应的阳离子的碱(优选碱金属氢氧化物或氢化物)反应, 或通过将它们与相应阴离子的酸(优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸)反应而形成。

其中金属离子不是碱金属离子的式 I 化合物的盐可以以常规的方

式，通过相应的碱金属盐的离子交换来制备，同样也可以通过氨、磷、铈、氧化铈的氢氧化物形成铵盐、磷盐、铈盐和氧化铈盐。

化合物 I 及其农业上有用的盐适合作为除草剂，它们可以是异构体混合物的形式和纯异构体的形式。包含 I 的除草组合物在控制非耕地的植物方面非常有效，特别是在高施用量的情况下。它们可以在作物如小麦、稻、玉米、大豆和棉花中防治阔叶杂草和禾本科杂草，而不对作物造成明显的伤害。这种效果特别是出现在低施用量的情况下。

根据施用方法的不同，化合物 I 或含有它的除草组合物也可以用于其它许多作物，用于消灭有害植物。适合的作物的实例是：洋葱、凤梨、花生、芦笋、甜菜 (*Beta vulgaris spec. altissima*)、芜菁甜菜 (*Beta vulgaris spec. rapa*)、*Brassica napus var. napus*、*Brassica napus var. napobrassica*、蔓菁 (*Brassica rapa var. silvestris*)、茶、红花、美洲山核桃、柠檬、甜橙、小果咖啡 (中果咖啡、大果咖啡)、黄瓜、狗牙根、胡萝卜、油棕、欧洲草莓、大豆、陆地棉、(鸡脚棉、草棉、*Gossypium vitifolium*)、向日葵、巴西橡胶、大麦、啤酒花、甘蓝、核桃、兵豆、亚麻、蕃茄、苹果属、木薯、紫花苜蓿、芭蕉属、烟草 (黄花烟草)、油橄榄、稻、雪豆、菜豆、欧洲云杉、松属、豌豆、欧洲甜樱桃、桃、西洋梨、红醋栗、蓖麻、甘蔗、黑麦、马铃薯、芦黍 (蜀黍)、可可、红车轴草、普通小麦、硬粒小麦、蚕豆、葡萄和玉米。

而且，化合物 I 也可以用在通过育种 (包括基因工程方法育种) 而耐除草剂作用的作物上。

此外，取代的吡唑-3-基苯并唑类 I 也适合用于使植物干燥和/或落叶。

作为干燥剂，它们特别适合于作物如马铃薯、油菜、向日葵和大豆地上部分的干燥。这样可使这些重要作物进行完全机械化收获。

由于短时的集中下落或对柑果、橄榄或其他种类的核果、干果和核果来说在树木上的附着强度的降低使收割更容易在经济上是很有意义的。同样的机理，即促进植物果实或叶片与茎之间分离组织的形成同样对于很好地控制经济作物，特别是棉花的落叶是重要的。

此外，缩短单个棉花植物成熟的时间间隔可导致在收获后有更高的纤维质量。

化合物 I 或含有它的组合物可以例如以可直接喷雾水溶液、粉末和悬浮液，或高浓度水悬剂、油悬剂或其它悬浮剂、或分散液、乳剂、油分散液、膏剂、喷粉组合物、撒施组合物或颗粒剂的形式，通过喷雾、弥雾、喷粉、撒施或浇泼使用。施用形式取决于使用的目的；在每一种情况下，应确保本发明的活性成分的分散尽可能的细微和均匀。

惰性辅助剂主要是：中至高沸点的矿物油馏份如煤油或柴油，煤焦油和动植物油，脂族烃、环烃和芳烃，例如，石蜡、四氢化萘、烷基化萘或其衍生物、烷基化苯及其衍生物，醇如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇和环己醇，酮如环己酮或强极性溶剂，例如胺，如 N-甲基吡咯烷酮和水。

含水的形式是由乳油、悬浮液、膏剂、可湿性粉末或可以用水分散的颗粒通过添加水而制备的。为了制备乳液、膏剂或油分散液，该物质本身或其溶解在油或溶剂中，借助于润湿剂、粘附剂、分散剂或乳化剂在水中均化。然而同样可以由活性物质、润湿剂、粘附剂、分散剂或乳化剂和可能的溶剂或油制备适合于用水稀释的浓缩物。

表面活性物质是芳族磺酸例如木质素磺酸、苯酚磺酸、萘磺酸和二

丁基萘磺酸以及脂肪酸的碱金属盐、碱土金属盐、铵盐，烷基磺酸盐和烷芳基磺酸盐，烷基-、十二烷基醚-和脂肪醇硫酸盐，以及硫酸化的十六烷基醇、十七烷基醇和十八烷基醇以及脂肪醇乙二醇醚的盐，磺化的萘和其衍生物与甲醛的缩合产物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合产物，聚氧乙烯辛基苯酚醚，乙氧基化异辛基-、辛基-或壬基苯酚，烷基苯基-、三丁基苯基聚乙二醇醚，烷芳基聚醚醇，异十三烷基醇、脂肪醇氧化乙烯缩合物，乙氧基化蓖麻油，聚氧乙烯或聚氧丙烯烷基醚，十二烷基醇聚乙二醇醚乙酸酯，山梨醇酯、木素亚硫酸盐废液或甲基纤维素。

粉剂、喷粉组合物和撒施组合物可以通过活性物质与固态载体的混合或混磨来制备。

颗粒剂例如包衣、浸渍和匀质颗粒可以通过将活性物质粘合在固态载体上来制备。固态载体是矿质土类如硅酸、硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、石灰石、石灰、白垩、红玄武土、黄土、陶土、白云石、硅藻土、硫酸钙和硫酸镁、氧化镁、磨细的塑料、肥料，如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素和植物产品如谷类作物粉末、树皮、木材和核桃壳粉，纤维素粉末或其他固态载体。

活性物质 I 在即可使用的制剂中的浓度可以在较宽的范围内变化。一般所使用的制剂包含约 0.001 ~ 98 重量%、优选 0.01 ~ 95 重量%的至少一种活性物质。活性物质 I 的纯度是 90 ~ 100%，优选 95 ~ 100%（根据 NMR - 光谱）。

下列剂型实施例说明这些制剂的制备：

I. 将 20 重量份的化合物 Ic.001 溶于如下组成的混合物：80 重量份的烷基化苯、10 重量份的 8 至 10 摩尔环氧乙烷与 1 摩尔油酸 N-单乙醇酰胺的加成物、5 重量份的十二烷基苯磺酸钙盐和 5 重量份的 40 摩尔

环氧乙烷与 1 摩尔蓖麻油的加成物。将溶液倒出，并将之细分散于 100,000 重量份的水中，获得含 0.02% (重量) 活性化合物的水分散液。

II. 将 20 重量份的化合物 Ic. 321 溶于如下组成的混合物：40 重量份的环己酮、30 重量份的异丁醇、20 重量份的 7 摩尔环氧乙烷与 1 摩尔异辛基酚的加成物和 10 重量份的 40 摩尔环氧乙烷与 1 摩尔蓖麻油的加成物。将溶液倒出，并将之细分散于 100,000 重量份的水中，获得含 0.02% (重量) 活性化合物的水分散液。

III. 将 20 重量份的活性化合物 Ic. 343 溶于如下组成的混合物：25 重量份的环己酮、65 重量份沸点为 210 至 280℃ 的矿物油馏份和 10 重量份的 40 摩尔环氧乙烷与 1 摩尔蓖麻油的加成物。将溶液倒出，并将之细分散于 100,000 重量份的水中，获得含 0.02% (重量) 活性化合物的水分散液。

IV. 将 20 重量份的活性化合物 If. 001 与 3 重量份的二异丁基萘- $\alpha$ -磺酸钠盐、17 重量份的来源于亚硫酸盐废液的木素磺酸钠盐和 60 重量份的粉状硅胶彻底混合，并在锤磨中磨碎。通过将混合物细分散于 20,000 重量份的水中，获得含有 0.1% (重量) 活性化合物的喷雾混合物。

V. 将 3 重量份的活性化合物 Ic. 099 与 97 重量份细分散的高岭土混合。以这种方式，获得含有 3% (重量) 活性化合物的喷粉组合物。

VI. 将 20 重量份的活性化合物 If. 061 与 2 重量份的十二烷基苯磺酸钙盐、8 重量份的脂肪醇聚乙二醇醚、2 重量份的酚-脲-甲醛缩合物的钠盐和 68 重量份的石蜡样矿物油均匀混合。获得稳定的油分散剂。

VII. 将 1 重量份的化合物 Ij. 043 溶于如下组成的混合物：70 重量份

的环己酮、20重量份的乙氧基化异辛基苯酚和10重量份的乙氧基化蓖麻油。接着可以用水将该混合物稀释至所希望的活性化合物浓度。得稳定的乳油。

VIII. 将1重量份的化合物 Iq. 003 溶于由80重量份的环己烷和20重量份的 Wettol<sup>®</sup> EM31 (=以乙氧基化的蓖麻油为基的非离子乳化剂; BASF AG) 所组成的混合物, 之后用水稀释至所希望的浓度。获得稳定的乳油。

活性化合物 I 或除草组合物的使用可以在苗前或苗后进行。如果这种活性化合物对某种农作物是较不耐受的, 那么可以采用这样施用技术, 其中在喷洒设备的帮助下喷洒该除草组合物, 以便尽可能地不要喷洒到敏感性农作物的叶片上, 同时活性物质到达生长于其下的不希望的植物的叶片上或到达未覆盖的土表上 (苗后直接处理、铺施)。

根据防治的目的、季节、靶体植物和生长期的不同, 活性成分 I 的施用剂量是 0.001 至 3.0, 优选 0.01 至 1.0 千克活性成分 (a. i.) / 公顷。

为了扩展作用谱和得到协同的效果, 取代的吡啶-3-基苯并噁唑/苯并噁唑 I 可以与众多的具有代表性的其他除草剂或生长调节活性物质混合和一起使用。例如可以作为混合组分的是 1, 2, 4-噁二唑类、1, 3, 4-噁二唑类, 酰胺类、氨基磷酸和其衍生物, 氨基三唑类, N-酰苯胺、芳氧基- / 杂芳基氧基链烷酸和其衍生物、苯甲酸类和其衍生物、苯并噁二嗪酮类、2- (杂芳酰基/芳酰基) - 1, 3-环己二酮类、杂芳基芳基酮、苄基异噁唑烷酮类、间-CF<sub>3</sub>-苯基衍生物、氨基甲酸酯类、喹啉羧酸和其衍生物、氯乙酰苯胺类、环己-1, 3-二酮衍生物、二嗪类、二氯丙酸和其衍生物、二氢苯并咪唑类、二氢咪唑-3-酮类、二硝基苯胺类、二硝基苯酚类、二苯基醚、联吡啶 (Dipyridyle)、卤代羧酸和其衍生物、脲类、3-苯基尿嘧啶类、咪唑类、咪唑啉酮类、N-苯基-3, 4, 5, 6-四氢邻苯二甲酰亚胺类、噁二唑类、环氧乙烷类、苯酚

类、芳氧基-和杂芳氧基苯氧基丙酸酯、苯基乙酸和其衍生物、2-苯基丙酸和其衍生物、吡唑类、苯基吡唑类、哒嗪类、吡啶羧酸和其衍生物、嘧啶基醚、磺酰胺类、磺酰脲类、三嗪类、三嗪酮类、三唑啉酮类、三唑甲酰胺类和尿嘧啶类。

此外，有利的是化合物I单独或与其他的除草剂一起与其他的作物保护剂混合使用，例如与灭害虫或植物病原真菌或细菌的制剂一起使用。此外，有意义的是与无机盐溶液的可混合性，该无机盐溶液可用来消除营养和微量元素的缺乏。同样可以加入无植物毒性的油和油的浓缩物。

### 具体实施方案

#### 制备实施例

##### 实施例 1

2-氨基-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑 (Ic. 080) :

将 29 克 (0.36 摩尔) 硫氰酸钠加入至于 500 毫升乙酸中的 29.3 克 (90 毫摩尔) 2-氯-5-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-4-氟苯胺中。搅拌 10 分钟之后，在反应混合物中加入 28.7 克 (0.18 摩尔) 的溴。接着再搅拌 16 小时。之后，将混合物搅拌入 2 升水中。将形成的固体产物滤出，用水洗涤并干燥。收率：定量的；

$^1\text{H}$  NMR (270MHz, 于  $\text{CDCl}_3$  中) :  $\delta$  [ppm]=3.86 (s, 3H), 5.44 (s, 2H), 6.74 (t, 1H), 7.24 (d, 1H)。

##### 实施例 2

4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟-2-(甲硫基)苯并噻唑 (Ic. 099) :

将 0.4 克 (3.9 毫摩尔) 二硫化二甲基和 1.3 克 (12.7 毫摩尔) 亚硝酸

叔丁基酯加入到 0.5 克 (1.3 毫摩尔) 2-氨基-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑于 50 毫升二氯甲烷的溶液中。搅拌 16 小时之后，浓缩反应混合物。粗产物通过在硅胶上柱色谱 (洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=4:1) 的方式纯化。收率: 0.3 克;

$^1\text{H NMR}$  (270MHz, 于  $\text{CDCl}_3$  中):  $\delta$  [ppm]=2.81 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 6.75 (t, 1H), 7.35 (d, 1H).

### 实施例 3

2-溴-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑 (Ic.041):

在 26.4 克 (68 毫摩尔) 2-氨基-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑于 1 升乙腈的溶液中首先加入 35.2 克 (0.34 摩尔) 溴化钠和 19.6 克 (0.14 摩尔) 溴化铜 (I)，然后滴加 9.2 克 (89 毫摩尔) 亚硝酸叔丁基酯。搅拌 16 小时之后，在反应混合物中加入 0.2 升稀释的盐酸。接着过滤出固体部分，用 200 毫升乙酸乙酯洗涤，再用 200 毫升乙酸乙酯萃取水相中残余的产物。用水洗涤合并的有机相，经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱 (洗脱液: 乙酸乙酯) 的方式纯化。收率: 17.3 克。

### 实施例 4:

2-氨基-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-4,6-二氯苯并噻唑 (Ib.080):

类似于实施例 1，使 4.4 克 (13 毫摩尔) 5-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-2,4-二氯苯胺、4.2 克 (52 毫摩尔) 硫氰酸钠和 4.1 克 (26 毫摩尔) 溴反应，收率: 定量的。

### 实施例 5:

7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-4,6-二氯-2-(乙硫基)苯并噻唑 (Ib. 100) :

类似于实施例 2, 使 0.8 克 (2 毫摩尔) 2-氨基-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-4,6-二氯苯并噻唑、0.7 克 (6 毫摩尔) 二硫化二乙基和 0.3 克 (3 毫摩尔) 亚硝酸叔丁基酯反应, 收率: 0.2 克。

实施例 6:

2-溴-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-4,6-二氯苯并噻唑 (Ib. 041) :

类似于实施例 3, 使 3.6 克 (9 毫摩尔) 2-氨基-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-4,6-二氯苯并噻唑、4.6 克 (45 毫摩尔) 溴化钠、2.6 克 (18 毫摩尔) 溴化铜 (I) 和 1.2 克 (12 毫摩尔) 亚硝酸叔丁基酯反应, 收率: 1.8 克。

实施例 7:

7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-4,6-二氯苯并噻唑 (Ib. 001) :

将 3 毫升丙基氯化镁于二乙醚中的 2 摩尔溶液 (等于 6 毫摩尔  $C_3H_7MgCl$ ) 加入 0.45 克 (1 毫摩尔) 2-溴-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-4,6-二氯苯并噻唑于 6 毫升二乙醚的溶液中。在搅拌 5 小时之后, 加入 10 毫升稀释的盐酸。接着分离有机相, 用水洗涤二次, 之后经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱 (洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=1:1) 的方式纯化。收率: 0.3 克;

实施例 8:

2-氨基-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲氧基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并

噻唑 (If. 080) :

类似于实施例 1, 使 80 克 (0.24 摩尔) 2-氯-5-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-4-氟苯胺、79 克 (0.98 摩尔) 硫氰酸钠和 78 克 (0.49 摩尔) 溴反应, 收率: 定量的。

实施例 9:

4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟-2-(甲硫基) 苯并噻唑 (If. 099) :

类似于实施例 2, 使 0.7 克 (1.8 毫摩尔) 2-氨基-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑、0.5 克 (5.4 毫摩尔) 二硫化二甲基和 0.33 克 (2.7 毫摩尔) 亚硝酸叔丁基酯反应, 收率: 0.3 克。

实施例 10:

2-溴-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑 (If. 041) :

类似于实施例 3, 使 73 克 (0.12 摩尔) 2-氨基-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑、126 克 (1.22 毫摩尔) 溴化钠、35 克 (0.24 摩尔) 溴化铜 (I) 和 16.3 克 (0.16 摩尔) 亚硝酸叔丁基酯反应, 收率: 18.2 克。

实施例 11

N-(4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑-2-基) 乙酰胺 (If. 345)

在 0.38 克 (6.4 毫摩尔) 的乙酰胺于 20 毫升四氢呋喃的溶液中首

先加入 0.12 克 (4.7 毫摩尔) 的氯化钠, 然后加入 0.7 克 (1.6 毫摩尔) 的 2-溴-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑。搅拌 16 小时, 之后浓缩反应混合物。所获得的粗产物通过在硅胶上柱色谱 (洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=4:1 和 1:1) 的方式纯化。收率: 0.4 克。

### 实施例 12

3-(4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑-2-基) 丙烯酸甲酯 (Ic. 232)

将 1 克 (3.1 毫摩尔) 2-氨基-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑、5.5 克 (64 毫摩尔) 的丙烯酸甲酯、0.45 克 (3.4 毫摩尔) 的氯化铜 (II) 和 0.33g (3.2 毫摩尔) 亚硝酸叔丁基酯先后溶解在 30 毫升乙腈中。接着搅拌 16 小时, 之后在反应混合物中加入 100 毫升稀释的盐酸。然后用 200 毫升甲基叔丁基醚萃取生成的产物。用水洗涤合并的有机相二次, 经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱 (洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=4:1) 的方式纯化。收率: 0.13 克。

### 实施例 13

4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑 (Ic. 001) 和 4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟-2-甲基苯并噻唑 (Ic. 002)

将 2.9 毫升甲基氯化镁于四氢呋喃中的 3M 溶液 (等于 8.7 毫摩尔  $H_3CMgCl$ ) 滴加到加热至回流温度的 2 克 (4.4 毫摩尔) 2-溴-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑和 0.15 克 (0.22 毫摩尔) 双(三苯基膦)二氯化镍于 20 毫升四氢呋喃的溶液中。接着在回流温度下搅拌 12 小时, 之后在反应混合物中加入 40 毫升稀释

的盐酸。然后用 100 毫升乙酸乙酯从含水相中萃取生成的产物。用水洗涤合并的有机相二次，经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱(洗脱液：己烷/乙酸乙酯=4:1)的方式纯化。接着在硅胶上借助于 MPLC(洗脱液：环己烷/乙酸乙酯=20:1)分离这二种产物。收率：0.11 克(化合物 Ic.001)和 0.28 克(化合物 Ic.002)。

#### 实施例 14

4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟-2-丙基苯并噻唑 (Ic.004)

0.65 毫升丙基氯化镁于二乙醚中的 2M 溶液(等于 1.3 毫摩尔  $C_3H_7MgCl$ )滴加到 0.4 克(0.9 毫摩尔)2-溴-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑于 30 毫升二乙醚的溶液中。接着搅拌 16 小时，之后在反应混合物中加入 40 毫升稀释的盐酸。用 100 毫升乙酸乙酯从含水相中萃取生成的产物。收集的有机相经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱(洗脱液：己烷/乙酸乙酯=9:1)的方式纯化。收率：0.1 克。

#### 实施例 15

4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟-2-甲氧基苯并噻唑 (Ic.042)

将 0.1 克(4.4 毫摩尔)的氢化钠溶解在 20 毫升甲醇中。在气体停止产生之后，在该溶液中加入 0.7 克(1.6 毫摩尔)2-溴-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑。接着搅拌反应混合物 16 小时。之后浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱(洗脱液：己烷/乙酸乙酯=1:1)的方式纯化。收率：0.5 克。

#### 实施例 16

4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-2-二甲基氨基-6-氟苯并噻唑 (Ic. 082)

在加热至 70-80℃ 的 0.7 克 (1.6 毫摩尔) 的 2-溴-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑于 50 毫升二甲基甲酰胺的溶液中缓慢地通入呈气态的二甲胺, 直至反应完全 (约 30 分钟)。接着浓缩, 之后在残渣中加入 50 毫升水。用 100 毫升乙酸乙酯从含水相中萃取所产生的产物。收集的有机相用水洗涤二次, 然后经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱 (洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=4:1) 的方式纯化。收率: 0.46 克。

实施例 17

N-甲基-N-(4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑-2-基) 氨基乙酸甲酯 (Ic. 343)

将 0.7 克 (1.6 毫摩尔) 2-溴-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑、0.43 克 (3.1 毫摩尔) 碳酸钾和 0.43 克 (3.1 毫摩尔) 肌氨酸甲酯盐酸盐在 30 毫升二甲基甲酰胺中在 100℃ 加热 2 小时。接着浓缩, 之后在残渣中加入 50 毫升水。用 100 毫升乙酸乙酯从含水相中萃取所产生的产物。收集的有机相用水洗涤二次, 然后经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱 (洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=4:1) 的方式纯化。收率: 0.18 克。

实施例 18

2-(4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑-2-基氧基) 丙酸甲酯 (Ic. 321)

在 0.65 克 (6.2 毫摩尔) 2-羟基丙酸甲酯于 20 毫升四氢呋喃的溶液中加入 0.11 克 (4.7 毫摩尔) 氯化钠。在停止产生气体之后, 在该

混合物中加入 0.7 克 (1.6 毫摩尔) 2-溴-4-氯-7-(4-氯-5-二氯甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑。接着搅拌该混合物 3 天, 并加入 50 毫升水。用 100 毫升乙酸乙酯从含水相中萃取所产生的产物。收集的有机相用水洗涤二次, 经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上柱色谱(洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=4:1)的方式纯化。收率: 0.3 克。

#### 实施例 19:

2-氨基-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-甲基磺酰基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑 (Ij. 080):

类似于实施例 1, 使 7.5 克 (21 毫摩尔) 2-氯-5-(4-氯-1-甲基-5-甲基磺酰基-1H-吡唑-3-基)-4-氟苯胺、6.9 克 (85 毫摩尔) 硫氰酸钠和 6.9 克 (43 毫摩尔) 溴反应, 收率: 定量的。

#### 实施例 20:

4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-甲基磺酰基-1H-吡唑-3-基)-2-乙硫基-6-氟苯并噻唑 (Ij. 100):

类似于实施例 2, 使 1 克 (2.5 毫摩尔) 2-氨基-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-甲基磺酰基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑、0.66 克 (7.3 毫摩尔) 二硫化二乙基和 0.37 克 (3.7 毫摩尔) 亚硝酸叔丁基酯反应, 收率: 0.4 克。

#### 实施例 21:

2-溴-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-甲基磺酰基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑 (Ij. 041):

类似于实施例 3, 使 6 克 (14 毫摩尔) 2-氨基-4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-甲基磺酰基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑、7.6 克 (70 毫摩尔)

溴化钠、4.2克(30毫摩尔)溴化铜(I)和2.2克(22毫摩尔)亚硝酸叔丁基酯反应,收率:3.6克。

#### 实施例 22

2-(4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑-2-基)丙二酸一乙基一叔丁基酯(Ic. 381)

在0.9克(5毫摩尔)丙二酸一乙基一叔丁基酯于10毫升二甲基甲酰胺的溶液中加入0.1克(4.7毫摩尔)氯化钠。在停止产生气体之后,在该混合物中加入1.5克(3.3毫摩尔)2-溴-4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑。接着搅拌该混合物1小时,之后浓缩反应混合物。在残渣中加入50毫升水。用100毫升乙酸乙酯从含水相中萃取所产生的产物。提取物经硫酸镁干燥并浓缩。收率:1克。

#### 实施例 23

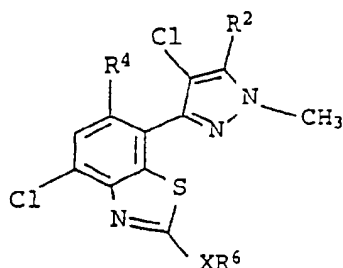
2-(4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑-2-基)乙酸乙酯(Ic. 021)

在1克(1.8毫摩尔)2-(4-氯-7-(4-氯-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基)-6-氟苯并噻唑-2-基)丙二酸一乙基一叔丁基酯于10毫升二氯甲烷中的溶液中加入0.30克(2毫摩尔)三氟甲磺酸。接着搅拌1小时,之后浓缩该混合物。在残渣中加入10毫升乙酸。然后回流加热8小时。接着浓缩反应混合物。在残渣中加入50毫升水。用100毫升乙酸乙酯从含水相中萃取产物。用稀释的碳酸氢钠水溶液和水洗涤提取物,经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上色谱(洗脱液:己烷/乙酸乙酯=4:1)的方式纯化。收率:0.4克。

除了上面描述的活性化合物外,下文的表2中给出其它的吡唑-3-

基苯并咪唑类 I, 它们可用相似的方式制备或是可制备的:

表 2



I {R<sup>1</sup> = CH<sub>3</sub>; R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> = Cl;  
Z = 经硫键  
合在α上的 -N=C(XR<sup>6</sup>)-S-}

序号	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	XR <sup>6</sup>	Smp. / <sup>1</sup> H-NMR [ppm] / MS [m/z]
Ib.001	OCHF <sub>2</sub>	Cl	H	3,89 (s,3H), 6,77 (t,1H), 7,71 (s,1H), 9,07 (s,1H)
Ib.002	OCHF <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	2,85 (s,3H), 3,88 (s,3H), 6,76 (t,1H), 7,63 (s,1H)
Ib.041	OCHF <sub>2</sub>	Cl	Br	3,88 (s,3H), 6,74 (t,1H), 7,66 (s,1H)
Ib.080	OCHF <sub>2</sub>	Cl	NH <sub>2</sub>	3,82 (s,3H), 7,41 (t,1H), 7,60 (s,1H), 8,04 (s,2H) {in (CD <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> SO}
Ib.099	OCHF <sub>2</sub>	Cl	SCH <sub>3</sub>	105-110°C
Ib.100	OCHF <sub>2</sub>	Cl	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	76-77°C
Ic.001	OCHF <sub>2</sub>	F	H	3,88 (s,3H), 6,76 (t,1H), 7,47 (d,1H), 9,06 (s,1H)
Ic.002	OCHF <sub>2</sub>	F	CH <sub>3</sub>	108-110°C
Ic.004	OCHF <sub>2</sub>	F	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	1,06 (t,3H), 1,90 (sext.,2H), 3,10 (t,2H), 3,89 (s,3H), 6,76 (t,1H), 7,39 (d,1H)
Ic.021	OCHF <sub>2</sub>	F	CH <sub>2</sub> -CO-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,32 (t,3H), 4,10 (s,2H), 4,11 (s,3H), 4,26 (q,2H), 7,42 (d,1H)
Ic.041	OCHF <sub>2</sub>	F	Br	445 [M] <sup>+</sup> , 366 [M-Br] <sup>+</sup>
Ic.042	OCHF <sub>2</sub>	F	OCH <sub>3</sub>	120°C
Ic.054	OCHF <sub>2</sub>	F	OCH <sub>2</sub> -C≡CH	117-118°C
Ic.080	OCHF <sub>2</sub>	F	NH <sub>2</sub>	3,82 (s,3H), 7,41 (t,1H), 7,49 (d,1H), 7,89 (s,2H) {in (CD <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> SO}
Ic.082	OCHF <sub>2</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	150°C
Ic.099	OCHF <sub>2</sub>	F	SCH <sub>3</sub>	96-98°C
Ic.232	OCHF <sub>2</sub>	F	CH=CH-CO-OCH <sub>3</sub>	158-160°C
Ic.307	OCHF <sub>2</sub>	F	CH(CH <sub>3</sub> )-OH	1,72 (d,3H), 3,11 (s,1H), 3,90 (s,3H), 5,29 (q,1H), 6,76 (t,1H), 7,41 (d,1H)
Ic.321	OCHF <sub>2</sub>	F	OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OCH <sub>3</sub>	1,69 (d,3H), 3,80 (s,3H), 3,86 (s,3H), 5,63 (q,1H), 6,76 (t,1H), 7,25 (d,1H)
Ic.335	OCHF <sub>2</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> )-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,27 (t,3H), 3,19 (s,3H), 3,58 (q,2H), 3,87 (s,3H), 6,74 (t,1H), 7,20 (d,1H)

序号	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	XR <sup>6</sup>	Smp. / <sup>1</sup> H-NMR [ppm] / MS [m/z]
Ic.340	OCHF <sub>2</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	3,15 (s,3H), 3,86 (s,3H), 4,14 (d,2H), 5,25 (d,1H), 5,26 (d,1H), 5,84 (m,1H), 6,75 (t,1H), 7,20 (d,1H)
Ic.341	OCHF <sub>2</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -C≡CH	113°C
Ic.343	OCHF <sub>2</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>	3,23 (s,3H), 3,78 (s,3H), 3,89 (s,3H), 4,41 (s,2H), 6,74 (t,1H), 7,21 (d,1H)
Ic.381	OCHF <sub>2</sub>	F	CH(COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )CO-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Sirup
If.001	CF <sub>3</sub>	F	H	4,13 (s,3H), 7,48 (d,1H), 9,07 (s,1H)
If.002	CF <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	2,87 (s,3H), 4,11 (s,3H), 7,40 (d,1H)
If.041	CF <sub>3</sub>	F	Br	4,12 (s,3H), 7,44 (d,1H)
If.042	CF <sub>3</sub>	F	OCH <sub>3</sub>	399 [M] <sup>+</sup>
If.043	CF <sub>3</sub>	F	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,48 (t,3H), 4,10 (s,3H), 4,67 (q,2H), 7,30 (d,1H)
If.054	CF <sub>3</sub>	F	OCH <sub>2</sub> -C≡CH	2,63 (t,1H), 4,09 (s,3H), 5,24 (d,2H), 7,30 (d,1H)
If.061	CF <sub>3</sub>	F	OCH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>	3,82 (s,3H), 4,10 (s,3H), 5,16 (s,2H), 7,31 (d,1H)
If.080	CF <sub>3</sub>	F	NH <sub>2</sub>	4,11 (s,3H), 7,51 (d,1H), 7,93 (s,2H) (in (CD <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> SO)
If.082	CF <sub>3</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3,21 (s,6H), 4,10 (s,3H), 7,22 (d,1H)
If.099	CF <sub>3</sub>	F	SCH <sub>3</sub>	2,81 (s,3H), 4,11 (s,3H), 7,35 (d,1H)
If.100	CF <sub>3</sub>	F	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,51 (t,3H), 3,37 (q,2H), 4,10 (s,3H), 7,35 (d,1H)
If.232	CF <sub>3</sub>	F	CH=CH-CO-OCH <sub>3</sub>	3,86 (s,3H), 4,12 (s,3H), 6,68 (d,1H), 7,47 (d,1H), 7,91 (d,1H)
If.321	CF <sub>3</sub>	F	OCH(CH <sub>3</sub> )-CO-OCH <sub>3</sub>	1,70 (d,3H), 3,80 (s,3H), 4,10 (s,3H), 5,63 (q,1H), 7,29 (d,1H)
If.335	CF <sub>3</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1,27 (t,3H), 3,19 (s,3H), 3,57 (q,2H), 4,10 (s,3H), 7,21 (d,1H)
If.340	CF <sub>3</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	3,17 (s,3H), 4,09 (s,3H), 4,15 (d,2H), 5,26 (d,1H), 5,28 (d,1H), 5,85 (m,1H), 7,2 (d,1H)
If.341	CF <sub>3</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -C≡CH	126°C
If.343	CF <sub>3</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CO-OCH <sub>3</sub>	3,22 (s,3H), 3,78 (s,3H), 4,10 (s,3H), 4,41 (s,2H), 7,22 (d,1H)
If.345	CF <sub>3</sub>	F	NH-CO-CH <sub>3</sub>	2,31 (s,3H), 4,12 (s,1H), 7,40 (d,1H), 9,25 (s,1H)
Ij.001	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	H	379 [M] <sup>+</sup>
Ij.041	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	Br	3,36 (s,3H), 4,30 (s,3H), 7,45 (d,1H)
Ij.042	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	OCH <sub>3</sub>	3,35 (s,3H), 4,25 (s,3H), 4,28 (s,3H), 7,30 (d,1H)
Ij.043	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,48 (t,3H), 3,34 (s,3H), 4,26 (s,3H), 4,68 (q,2H), 7,29 (d,1H)

序号	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	XR <sup>6</sup>	Smp. / <sup>1</sup> H-NMR [ppm] / MS [m/z]
Ij.054	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	OCH <sub>2</sub> -C≡CH	2,67 (t,1H), 3,34 (s,3H), 4,27 (s,3H), 5,15 (d,2H), 7,31 (d,1H)
Ij.082	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3,22 (s,6H), 3,35 (s,3H), 4,29 (s,3H), 7,22 (d,1H)
Ij.080	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	NH <sub>2</sub>	3,54 (s,3H), 4,20 (s,3H), 7,51 (d,1H), 7,95 (s,2H) {in (CD <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> SO}
Ij.099	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	SCH <sub>3</sub>	425 [M] <sup>+</sup>
Ij.100	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,51 (t,3H), 3,34 (s,3H), 3,38 (q,2H), 4,18 (s,3H), 7,35 (d,1H)
Ij.232	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	CH=CH-CO-OCH <sub>3</sub>	3,36 (s,3H), 3,86 (s,3H), 4,31 (s,3H), 6,79 (d,1H), 7,47 (d,1H), 7,90 (d,1H)
Ij.345	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	F	NH-CO-CH <sub>3</sub>	2,31 (s,3H), 3,36 (s,3H), 4,30 (s,3H), 7,40 (d,1H), 9,71 (s,1H)

#### 实施例 24

4-氯-7-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-2-乙基-6-氟苯并噁唑 (Iq.003) :

将 0.5 克 (1.4 毫摩尔) 2-氯-5-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-4-氟苯基叠氮化物于 100 毫升丙酸中的溶液回流加热 20 小时, 然后浓缩。在残渣中加入 100 毫升乙酸乙酯。用饱和的碳酸氢钠水溶液洗涤有机相, 然后经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上色谱 (洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=15:1) 的方式纯化。收率: 0.3 克。

<sup>1</sup>H NMR (400MHz, 于 CDCl<sub>3</sub> 中): δ [ppm]=1.44 (t, 3H), 2.98 (q, 2H), 4.12 (s, 3H), 7.25 (d, 1H)。

前体: 2-氯-5-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-4-氟苯基叠氮化物

在 1 克 (3 毫摩尔) 2-氯-5-(4-氯-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基)-4-氟苯胺于 20 毫升三氟乙酸的溶液中加入 0.46 克 (4.5 毫摩尔)

亚硝酸叔丁酯和 0.3 克 (4.5 毫摩尔) 叠氮化钠。接着搅拌 2 小时, 之后在该混合物中加入 50 毫升水。用 100 毫升甲基叔丁基醚从含水相中萃取所形成的产物。用 10% 的苛性钠溶液洗涤提取物, 经硫酸镁干燥并浓缩。粗产物通过在硅胶上色谱(洗脱液: 己烷/乙酸乙酯=1:1)的方式纯化。收率: 0.7 克。

$^1\text{H NMR}$  (400MHz, 于  $(\text{CD}_3)_2\text{SO}$  中):  $\delta$  [ppm]=4.10 (s, 3H), 7.53 (d, H), 7.77 (d, 1H)。

### 应用实施例(除草活性)

由下列温室试验可以显示取代的吡唑-3-基苯并唑类 I 的除草作用:

所用的栽培容器是塑料花盆, 盆中装有腐殖质含量约为 3.0% 的壤砂土作为基质。根据不同的种类, 分别播种不同试验植物的种子。

在苗前处理的情况下, 在播种后, 将悬浮或乳化于水中的活性化合物用分布性能良好的喷嘴直接施用。花盆稍微浇些水, 以促使萌发和生长, 然后, 覆盖上透明塑料地膜, 直到植物生根。如果不是受活性化合物影响的话, 覆盖应会使试验植物均匀的萌发。

进行苗后处理时, 先让试验植物长出, 根据不同的生长形式, 让其长到 3 至 15cm 高, 此时方用悬浮或乳化于水中的活性化合物处理。为此, 试验植物或是直接播种并在同一花盆中生长, 或是先以秧苗分开生长, 再在处理前几天, 将它们移栽到试验花盆中。苗后处理的施用量是 31.2 或 15.6g/ha a. S. (活性物质)。

根据种类的不同, 将植物维持在 10-25℃ 或 20-35℃ 下。试验期历经 2 至 4 周。在此期间, 悉心照料植物, 并评价它们对各处理的反应。

以 0 至 100 的等级进行评分。在此情况下, 100 是指没有植物出苗或至少完全毁灭地上部分, 而 0 是指无伤害或生长正常。

用在温室实验中的植物由下列的种类组成:

拉丁名	德语名	中文名
Abutilon theophrasti	Chinesischer Hanf	苘麻
Amaranthus retroflexus	Zurückgekrümmter Fuchsschwanz	反枝苋
Polygonum persicaria	Flohknöterich	春蓼
Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	龙葵
Veronica subspecies	Ehrenpreisarten	婆婆纳

在 31.2 和 15.6 克 (a. S.) / 公顷的施用量下, 在苗后处理的方法中, 化合物 Ic. 099 显示出对上面提到的阔叶植物有非常好的作用。

应用实施例 (干燥/落叶活性)

所用的试验植物是 4 叶的棉苗 (无子叶), 该棉苗在温室条件下生长 (相对湿度 50-70%: 白昼/黑夜温度 = 27/20°C)。

将棉苗的叶片用活性成分的含水制剂 (以喷雾液为基准加入按重量计 0.15% 的脂肪醇烷氧基化物 Plurafac<sup>®</sup> LF 700<sup>1)</sup>) 喷雾至喷雾液向下滴流。水的施用量相当于 1000 升/公顷。13 天后, 确定脱落的叶片数和落叶的程度, 以 % 计。

在未处理的对照植物的情况下, 未出现叶片脱落。