

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.

C07F 7/08 (2006.01)

A01N 55/00 (2006.01)



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 200480026945.5

[45] 授权公告日 2008年9月3日

[11] 授权公告号 CN 100415749C

[22] 申请日 2004.9.8

[21] 申请号 200480026945.5

[30] 优先权

[32] 2003.9.19 [33] GB [31] 0322012.6

[86] 国际申请 PCT/EP2004/010009 2004.9.8

[87] 国际公布 WO2005/028485 英 2005.3.31

[85] 进入国家阶段日期 2006.3.17

[73] 专利权人 辛根塔参与股份公司

地址 瑞士巴塞尔

[72] 发明人 J·赫恩弗伦德 C·拉姆比尔斯

H·托布勒 H·瓦尔特

[56] 参考文献

CN1444564 2003.9.24

审查员 陈真

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利
商标事务所

代理人 张敏

权利要求书 2 页 说明书 53 页

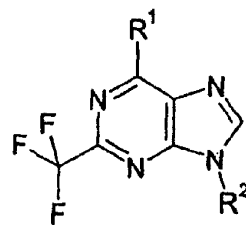
[54] 发明名称

具有杀微生物活性的硅化合物

[57] 摘要

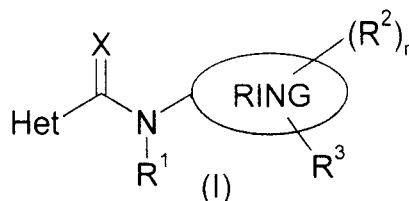
杀真菌的式 (I) 化合物: 其中 X 是 O 或 S; RING 是苯基或噻吩基; Het 是含有一至三个各自独立选自氧、氮和硫的杂原子的 5-或 6-元杂环, 该环被一至四个 R⁴ 基团取代; R¹ 是氢, 任选取代的 (C₁₋₄) 烷基, 甲酰基, 任选取代的 (C₁₋₄) 烷基 C(=O), 任选取代的 (C₁₋₄) 烷基 C(=O)O, 任选取代的 (C₁₋₄) 烷氧基 (C₁₋₄) 烷基, 任选取代的烯丙基, 任选取代的炔丙基或任选取代的丙二烯基; 各 R² 独立是卤原子, 任选取代的 (C₁₋₄) 烷基, 任选取代的 (C₁₋₄) 烷氧基或任选取代的 (C₁₋₄) 烷氧基 (C₁₋₄) 烷基; R³ 是 (CR^aR^b)_m - Cy - (CR^cR^d)_n - Y; 各 R⁴ 独立选自卤原子, C₁₋₃ 烷基, C₁₋₃ 卤烷基, C₁₋₃ 烷氧基 (C₁₋₃) 烷基和氰基; R^a、R^b、R^c 和 R^d 各自独立是卤原子或任选取代的 (C₁₋₄) 烷基; Cy 是任选取代的碳环或杂环 3-7 元环, 其可以是饱和的、不饱和的或芳香的且其任选含有硅原子作为环成员; (CR^aR^b)_m

和 (CR^cR^d)_n 可以连接于 Cy 的同一个碳或硅原子或连接于被 1、2 或 3 个环成员分隔的不同原子; Y 是 Si(O_pZ¹)(O_qZ²)(O_sZ) 且条件是 Cy 含有硅原子作为环成员那么 Y 也可以是氢; Z 是 C₁₋₄ 烷基或 C₂₋₄ 链烯基 (其各自任选被一个选自 O、S 和 N 的杂原子隔断且任选被一至三个独立选择的卤原子取代); Z¹ 和 Z² 独立是甲基或乙基; m 和 n 各自独立是 0, 1, 2 或 3; p、q 和 s 各自独立是 0 或 1; 以及 r 是 0, 1 或 2; 或其 N-氧化物; 用于制备这些化合物的新型中间体, 包含至少一种该新型化合物作为活性成分的农用化学组合物以及这些活性成分或组合物在农业或园艺中用于控制或预防植物受病原微生物优选真菌感染的应用。



(I)

1. 式(I)化合物：



其中 X 是 O 或 S；RING 是苯基或噻吩基；Het 是含有一至三个各自独立选自氧、氮和硫的杂原子的 5-或 6-元杂环，该环被一至四个 R^4 基团取代； R^1 是氢，任选取代的 (C_{1-4}) 烷基，甲酰基，任选取代的 (C_{1-4}) 烷基 $C(=O)$ ，任选取代的 (C_{1-4}) 烷基 $C(=O)O$ ，任选取代的 (C_{1-4}) 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基，任选取代的烯丙基，任选取代的炔丙基或任选取代的丙二烯基；各 R^2 独立是卤原子，任选取代的 (C_{1-4}) 烷基，任选取代的 (C_{1-4}) 烷氧基或任选取代的 (C_{1-4}) 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基； R^3 是 $(CR^aR^b)_m-Cy-(CR^cR^d)_n-Y$ ；各 R^4 独立选自卤原子， C_{1-3} 烷基， C_{1-3} 卤烷基， C_{1-3} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基和氰基； R^a 、 R^b 、 R^c 和 R^d 各自独立是氢原子或任选取代的 (C_{1-4}) 烷基；Cy 是任选取代的碳环或杂环 3-7 元环，其可以是饱和的、不饱和的或芳香的且其任选含有硅原子作为环成员； $(CR^aR^b)_m$ 和 $(CR^cR^d)_n$ 可以连接于 Cy 的同一个碳或硅原子或连接于被 1、2 或 3 个环成员分隔的不同原子；Y 是 $Si(O_pZ^1)(O_qZ^2)(O_sZ)$ ，条件是 Cy 含有硅原子作为环成员那么 Y 也可以是氢；Z 是 C_{1-4} 烷基或 C_{2-4} 链烯基（其各自任选被一个选自 O、S 和 N 的杂原子隔断且任选被一至三个独立选择的卤原子取代）； Z^1 和 Z^2 独立是甲基或乙基；m 和 n 各自独立是 0, 1, 2 或 3；p、q 和 s 各自独立是 0 或 1；以及 r 是 0, 1 或 2；或其 N-氧化物；条件是当 m 和 n 均是 0 且 RING 和 Cy 均是苯基时，Y 不是三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基。

2. 权利要求 1 的式(I)化合物，其中 X 是氧。

3. 权利要求 1 或 2 的式(I)化合物，其中 Het 是吡唑基、吡咯基、

噻吩基、呋喃基、噻唑基、异噻唑基、噁唑基、异噁唑基、三唑基、吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、5,6-二氢吡喃基或5,6-二氢-1,4-氧硫杂环己二烯基,各自被一至三个 R^4 基团取代且通过碳原子与 $C(=X)-N(R^1)$ 基团相连。

4. 权利要求1的式(I)化合物,其中 R^1 是氢、炔丙基、丙二烯基、甲酰基、 $CH_3C(=O)$ 、 $C_2H_5C(=O)$ 或 $CH_3OCH_2C(=O)$ 。

5. 权利要求1的式(I)化合物,其中 R^2 独立选自卤原子、甲基、三氟甲基和三氟甲氧基。

6. 权利要求1的式(I)化合物,其中 $(CR^aR^b)_m-Cy-(CR^cR^d)_n-Y$ 在与带有 $N(R^1)C(=X)Het$ 基团的碳原子相邻的碳原子上与“RING”相连。

7. 权利要求1的式(I)化合物,其中 r 是0或1。

8. 一种用于控制微生物以及预防其对于植物的侵袭和感染的组合物,其中活性成分是权利要求1的式(I)化合物,同时存在适当载体。

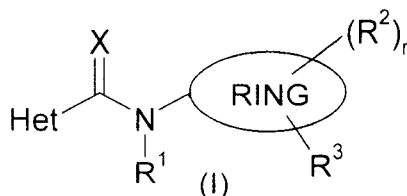
9. 一种控制或预防病源性微生物侵染栽培植物的方法,该方法包括向植物、其部分或其环境施用权利要求1所述的式(I)化合物或权利要求8所述的组合物。

具有杀微生物活性的硅化合物

本发明涉及新型含硅的酰胺衍生物，其具有杀微生物活性，特别是杀真菌活性。本发明还涉及用于制备这些化合物的新型中间体，包含至少一种该新型化合物作为活性成分的农用化学组合物以及这些活性成分或组合物在农业或园艺中用于控制或预防植物受病原微生物、特别是真菌感染的应用。

下述的某些被含硅取代基取代的苯基酰胺和噻吩酰胺公开于 W098/52944 中。

本发明提供了式 (I) 化合物：



其中 X 是 O 或 S；RING 是苯基或噻吩基；Het 是含有一至三个各自独立选自氧、氮和硫的杂原子的 5-或 6-元杂环，该环被一至四个 R^4 基团取代； R^1 是氢，任选取代的 (C_{1-4}) 烷基，甲酰基，任选取代的 (C_{1-4}) 烷基 $C(=O)$ ，任选取代的 (C_{1-4}) 烷基 $C(=O)O$ ，任选取代的 (C_{1-4}) 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基，任选取代的烯丙基，任选取代的炔丙基或任选取代的丙二烯基；各 R^2 独立是卤原子，任选取代的 (C_{1-4}) 烷基，任选取代的 (C_{1-4}) 烷氧基或任选取代的 (C_{1-4}) 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基； R^3 是 $(CR^aR^b)_m-Cy-(CR^cR^d)_n-Y$ ；各 R^4 独立选自卤原子， C_{1-3} 烷基， C_{1-3} 卤烷基， C_{1-3} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基和氰基； R^a 、 R^b 、 R^c 和 R^d 各自独立是氢原子或任选取代的 (C_{1-4}) 烷基；Cy 是任选取代的碳环或杂环 3-7 元环，其可以是饱和的、不饱和的或芳香的且其任选含有硅原子作为环成员； $(CR^aR^b)_m$ 和 $(CR^cR^d)_n$ 可以连接于 Cy 的同一个碳或硅原子或连接于被 1、2 或 3 个环成员分隔的不同原子；Y 是 $Si(O_pZ^1)(O_qZ^2)(O_sZ)$ 且条件是 Cy 含有硅原子作为环成员那么 Y 也可以是氢；Z 是 C_{1-4} 烷基或 C_{2-4} 链烯基（其

各自任选被一个选自 O、S 和 N 的杂原子隔断且任选被一至三个独立选择的卤原子取代); Z^1 和 Z^2 独立是甲基或乙基; m 和 n 各自独立是 0, 1, 2 或 3; p、q 和 s 各自独立是 0 或 1; 以及 r 是 0, 1 或 2; 或其 N-氧化物; 条件是当 m 和 n 均是 0 且 RING 和 Cy 均是苯基时, Y 不是三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基。

卤原子是氟、氯、溴或碘, 优选氟、氯或溴。

各烷基部分是支链的或直链的且例如是甲基、乙基、正丙基、正丁基、异丙基、仲丁基、异丁基或叔丁基。

各链烯基部分是支链的或直链的。

如果适当, 各链烯基部分可以是 (E)-或 (Z)-构型。

如果存在, 烷基部分、烯丙基、炔丙基和丙二烯基上的各任选取取代基独立选自卤原子、羟基、氰基、羧基、甲氧羰基、乙氧羰基、甲氧基、乙氧基、甲磺酰基、乙磺酰基、二氟甲氧基、三氟甲氧基和三氟甲基硫基; 在本发明一个可替换的方面, 如果存在, 烷基部分、烯丙基、炔丙基和丙二烯基上的各任选取取代基独立选自卤原子、羟基、氰基、羧基、甲氧羰基、乙氧羰基、甲氧基、乙氧基、甲磺酰基、乙磺酰基、二氟甲氧基、三氟甲氧基和三氟硫代甲氧基。

如果存在, Cy 上的各任选任选取取代基独立选自卤原子, (C_{1-4}) 烷基, (C_{2-4}) 链烯基, (C_{1-4}) 卤烷基, (C_{1-4}) 烷氧基和卤 (C_{1-4}) 烷氧基。

优选地, X 是氧。

优选地, 当 “RING” 是噻吩基时, $N(R^1)CXHet$ 基团连接于 3 位。

优选的 Het 是吡唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、噻唑基、异噻唑基、噁唑基、异噁唑基、三唑基、吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、5,6-二氢吡喃或 5,6-二氢-1,4-氧硫杂环己二烯基 (更优选吡唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、噻唑基、噁唑基、1,2,3-三唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、5,6-二氢吡喃基、或 5,6-二氢-1,4-氧硫杂环己二烯基; 最优选吡唑基、吡咯基、噻唑基、1,2,3-三唑基或吡啶基) 各自被一至三个 R^4 基团取代且与 $C(=X)-N(R^1)$ 基团经由碳原子相连。

优选地, R^1 是氢、炔丙基、丙二烯基、甲酰基、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{C}_2\text{H}_5\text{C}(=\text{O})$ 或 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{C}(=\text{O})$; 更优选氢、炔丙基、丙二烯基、甲酰基、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})$ 或 $\text{C}_2\text{H}_5\text{C}(=\text{O})$ 。

最优选的 R^1 是氢。

优选地, 各 R^2 独立选自卤原子、甲基、三氟甲基和三氟甲氧基。

优选地, 各 R^4 独立选自卤原子、甲基、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2F 、 CF_2Cl 和 CH_2OCH_3 。

优选地, Het 环中不通过双键与其相邻原子之一相连的氮原子独立是未取代的或被 R^4 取代 (更优选地, 它们独立被 R^4 取代); 其中各 R^4 独立选自 C_{1-3} 烷基、 C_{1-3} 卤烷基和甲氧基亚甲基; 更优选 C_{1-2} 烷基、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 和甲氧基亚甲基; 更加优选甲基、 CHF_2 和甲氧基亚甲基; 且最优选为甲基。

优选地, Het 环中不与被 $\text{C}(=\text{X})-\text{N}(R^1)$ 基团取代的原子相连的碳原子各自独立是未取代的或被 R^4 取代; 其中各 R^4 独立选自卤原子、 C_{1-3} 烷基、 C_{1-3} 卤烷基和甲氧基亚甲基; 更优选氟、甲氧基亚甲基、 CH_3 、 CHF_2 和 CF_3 ; 且更加优选 CH_3 、 CHF_2 和 CF_3 。

Het 环中可以有一个或两个碳原子与被 $\text{C}(=\text{X})-\text{N}(R^1)$ 基团取代的原子相连, 优选这些碳原子之一被 R^4 取代, 该 R^4 独立选自卤原子、 C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 卤烷基; 更优选氟、氟、溴、 C_{1-2} 烷基、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 和 CH_2F ; 且更加优选氟、氟、溴、甲基、 CF_3 、 CHF_2 和 CH_2F 。如果存在, 连接于被 CXNR^1 取代的原子的第二个碳优选是未取代的或被 R^4 取代, 该 R^4 独立选自卤原子; 更优选氟和氯。

优选地, $(\text{CR}^a\text{R}^b)_m-\text{Cy}-(\text{CR}^c\text{R}^d)_n-\text{Y}$ 在与带有 $\text{N}(R^1)\text{C}(=\text{X})\text{Het}$ 基团的碳原子相邻 (邻位) 的碳上与 “RING” 相连。

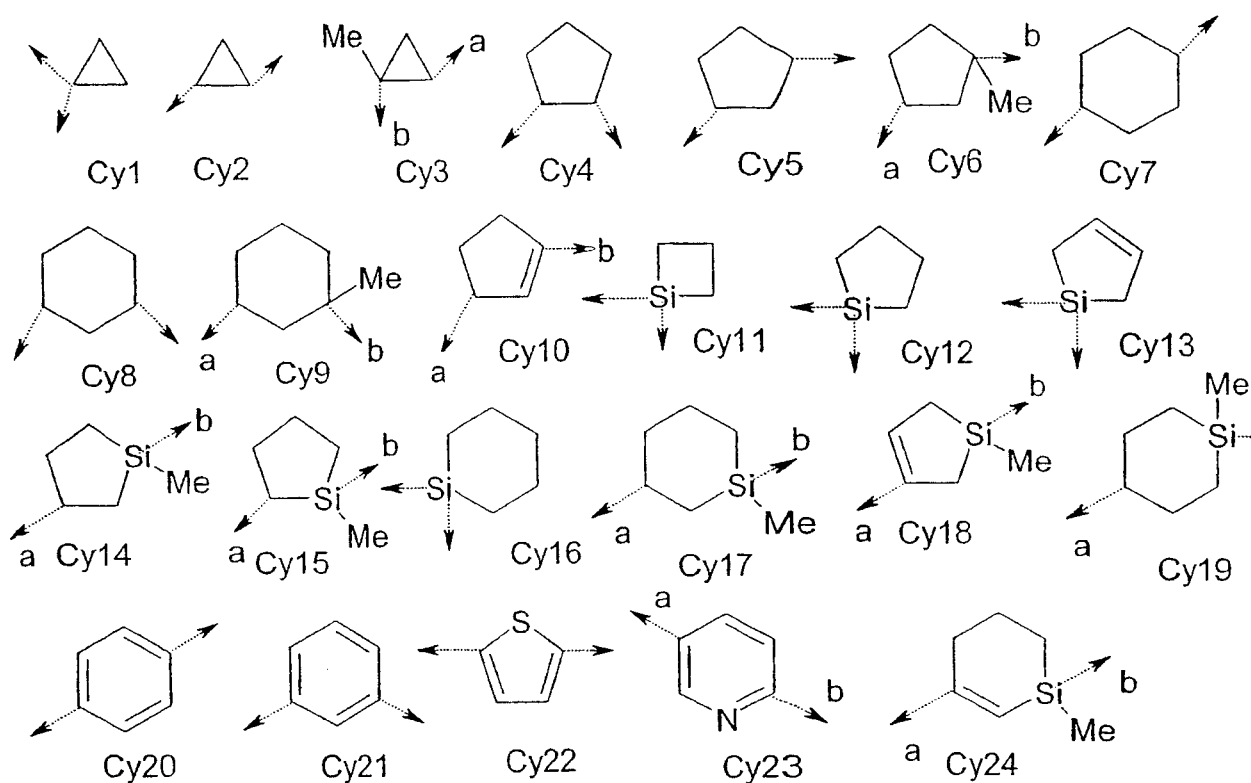
优选地, R^a 、 R^b 、 R^c 和 R^d 各自独立是氢或甲基、最优选氢。

当 Cy 是硅环 [即, 它含有硅原子作为环成员] 时, 优选 m 是 0 或 1 (更优选 0), n 是 1 或 2 (更优选 1) 且 Y 是氢。

当 Cy 不是硅环时, 优选 m 是 0 或 1 (更优选 0) 且 n 优选 0、1 或 2。

优选地, Cy 是任选被至多 4 个取代基(优选地, 各取代基独立选自 C_{1-4} 烷基; 更优选各自是甲基)取代的饱和 3-7 元碳环, 含有一个双键任选被至多 4 个取代基(优选地, 各取代基独立选自 C_{1-4} 烷基; 更优选各自是甲基)取代的 5-7 元碳环, 任选被至多 4 个取代基(优选地, 各取代基独立选自 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 链烯基和 C_{1-4} 烷氧基; 更优选甲基、乙基、丙基、异丙基、烯丙基、乙烯基、甲氧基和乙氧基)取代的 4-7 元饱和或不饱和硅环, 或者 Cy 是苯基、噻吩基、呋喃基或吡啶基, 各自任选被至多 4 个取代基取代(其各自优选是卤原子、甲基、甲氧基或三氟甲氧基)。

更加优选地, Cy 为选自下面的环:



Cy1、Cy2、Cy4、Cy5、Cy7、Cy8、Cy11、Cy12、Cy13、Cy16、Cy20、Cy21 和 Cy22 的对称性使得不必在意哪一箭头代表与 $(CR^aR^b)_n$ 部分相连的键和哪一箭头代表与 $(CR^cR^d)_n$ 部分相连的键。但是, Cy3、Cy6、Cy9、Cy10、Cy14、Cy15、Cy17、Cy18、Cy19、Cy23 和 Cy24 是不对称的, 因此有哪一箭头代表与 $(CR^aR^b)_n$ 部分相连的键和哪一箭头代表与

$(CR^cR^d)_n$ 部分相连的键的问题, 对于这些 Cy 值, 优选标记 “a” 的箭头代表与 $(CR^aR^b)_m$ 部分相连的键 [因此, 标记 “b” 的箭头代表与 $(CR^cR^d)_n$ 部分相连的键]。在本说明书中 Cy3a 是其中箭头 “a” 代表与 $(CR^aR^b)_m$ 部分相连的键的 Cy3 基团; 而 Cy3b 是其中箭头 “b” 代表与 $(CR^cR^d)_n$ 部分相连的键的 Cy3 基团。同样的标记解释适用于 Cy6、Cy9、Cy10、Cy14、Cy15、Cy17、Cy18、Cy19、Cy23 和 Cy24。在所有情况下, “a” 基团优于相应的 “b” 基团。

优选地, Z^1 是甲基。

优选地, Z^2 是甲基。

优选地, Z 是 C_{1-4} 烷基; 更优选甲基。

优选地, p 是 0。

优选地, q 是 0。

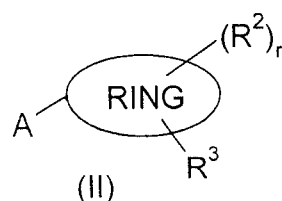
优选地, r 是 0 或 1; 更优选 r 是 0。

优选地, s 是 0。

当式 (I) 化合物是 N-氧化物时, 那么优选 Het 是被一至三个 R^4 基团取代的吡啶基。

在本说明书全文中, Me 用于代表甲基。类似地, Et 代表乙基。

式 (II) 化合物



其中 RING、r、 R^2 和 R^3 如上所定义且 A 是 NH_2 、 $NHCH(O)$ 、任选取代的 (C_{1-4}) 烷基 $C(=O)NH$ 、任选取代的 (C_{1-4}) 烷基 $OC(=O)NH$ 、卤原子、 NO_2 、 OSO_2CF_3 或 $N=C(C_6H_5)_2$, 其适用作制备式 (I) 化合物的中间体。

其中 R^3 连接于 A 邻位碳原子的式 (II) 化合物是新颖的并优选作为制备式 (I) 化合物的中间体。

因此, 本发明另一方面提供了式 (II) 化合物, 其中 RING、r、 R^2 和 R^3 如上定义且 A 是 NH_2 、 $NHCH(O)$ 、任选取代的 (C_{1-4}) 烷基 $C(=O)NH$ 、任选取代的 (C_{1-4}) 烷基 $OC(=O)NH$ 、Br、I、 NO_2 、 OSO_2CF_3 或 $N=C(C_6H_5)_2$,

以及 R^3 连接于 A 邻位的碳原子。

式 (I) 和 (II) 化合物可以以不同的几何或光学异构体或不同的互变异构体形式存在。本发明包括所有这些异构体和互变异构体及其所有比例的混合物以及同位素形式比如氘化形式。

下面表 1 至 29 中的化合物具体说明了本发明的优选化合物, 其中 R^5 、 R^6 和 R^7 各自独立是如上定义的 R^4 的例子。

表 Aa 代表表 1a (当 A 是 1 时), 代表表 2a (当 A 是 2 时), 代表表 3a (当 A 是 3 时) 和代表表 4a (当 A 是 4 时)。

表 Aa

化合物号	R^1	m	n	Cy	Y	R^5	R^6	R^7	X
A. 1	H	0	0	Cy1	Me_3Si	H	Me	CF_3	0
A. 2	H	0	0	Cy1	Me_3Si	H	Me	CF_2H	0
A. 3	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_3	0
A. 4	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_2H	0
A. 5	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_2Cl	0
A. 6	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_3	S
A. 7	炔丙基	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_3	0
A. 8	丙二烯基	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_3	0
A. 9	$COCH_3$	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_3	0
A. 10	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	CH_2OMe	CF_3	0
A. 11	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_2H	S
A. 12	炔丙基	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_2H	0
A. 13	丙二烯基	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_2H	0
A. 14	$COCH_3$	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_2H	0
A. 15	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	CH_2OMe	CF_2H	0
A. 16	H	0	0	Cy2	Me_3Si	F	Me	Me	0
A. 17	H	0	0	Cy2	Me_3Si	F	Me	CF_3	0
A. 18	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CH_2F	0
A. 19	H	0	0	Cy2	Me_3Si	Cl	Me	Me	0
A. 20	H	0	0	Cy2	Me_2SiEt	H	Me	CF_3	0
A. 21	H	0	0	Cy2	Me_2SiEt	H	Me	CF_2H	0
A. 22	H	0	0	Cy2	$Me_2SiCHMe_2$	H	Me	CF_3	0
A. 23	H	0	0	Cy2	$Me_2SiCHMe_2$	H	Me	CF_2H	0
A. 24	H	1	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_3	0

A. 25	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 26	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 27	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 28a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 29a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 30	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 31	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 32	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 33	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 34a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 35a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 36	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 37	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 38	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 39	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 40a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 41a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 42a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 43a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 44	H	0	1	Cy11	H	H	Me	CF ₃	0
A. 45	H	0	1	Cy11	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 46	H	0	1	Cy12	H	H	Me	CF ₃	0
A. 47	H	0	1	Cy12	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 48	H	0	1	Cy13	H	H	Me	CF ₃	0
A. 49	H	0	1	Cy13	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 50a	H	0	1	Cy14a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 51a	H	0	1	Cy14a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 52a	炔丙基	0	1	Cy14a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 53a	丙二烯基	0	1	Cy14a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 54a	炔丙基	0	1	Cy14a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 55a	丙二烯基	0	1	Cy14a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 56a	H	0	1	Cy15a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 57a	H	0	1	Cy15a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 58	H	0	1	Cy16	H	H	Me	CF ₃	0
A. 59	H	0	1	Cy16	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 60a	H	0	1	Cy17a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 61a	H	0	1	Cy17a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 62a	炔丙基	0	1	Cy17a	H	H	Me	CF ₃	0

A. 63a	丙二烯基	0	1	Cy17a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 64a	炔丙基	0	1	Cy17a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 65a	丙二烯基	0	1	Cy17a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 66a	H	0	1	Cy17a	H	H	Me	CH ₂ F	0
A. 67a	H	0	1	Cy17a	H	F	Me	Me	0
A. 68a	H	0	1	Cy18a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 69a	H	0	1	Cy18a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 70a	H	0	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 71a	H	0	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 72a	炔丙基	0	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 73a	丙二烯基	0	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 74a	炔丙基	0	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 75a	丙二烯基	0	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 76a	H	0	1	Cy19a	H	H	Me	CH ₂ F	0
A. 77a	H	0	1	Cy19a	H	F	Me	Me	0
A. 78a	H	0	2	Cy17a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 79	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	H	CF ₂ H	CF ₃	0
A. 80	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	H	Me	CF ₃	0
A. 81	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	H	Me	CF ₂ H	0
A. 82	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 83	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 84	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 85	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 86	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 87	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 88	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 89	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 90	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 91	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 92a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 93a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 94a	H	0	1	Cy24a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 95a	H	0	1	Cy24a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 96a	H	0	2	Cy17a	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 97a	H	1	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₃	0
A. 98a	H	1	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₂ H	0

表 Ab 代表表 1b (当 A 是 1 时), 代表表 2b (当 A 是 2 时), 代表表 3b (当 A 是 3 时) 和代表表 4b (当 A 是 4 时)。

表 Ab

化合物号	R ¹	m	n	Cy	Y	R ⁵	R ⁶	R ⁷	X
A. 28b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 29b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 34b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 35b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 40b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 41b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 42b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 43b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 50b	H	0	1	Cy14b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 51b	H	0	1	Cy14b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 52b	炔丙基	0	1	Cy14b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 53b	丙二烯基	0	1	Cy14b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 54b	炔丙基	0	1	Cy14b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 55b	丙二烯基	0	1	Cy14b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 56b	H	0	1	Cy15b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 57b	H	0	1	Cy15b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 60b	H	0	1	Cy17b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 61b	H	0	1	Cy17b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 62b	炔丙基	0	1	Cy17b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 63b	丙二烯基	0	1	Cy17b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 64b	炔丙基	0	1	Cy17b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 65b	丙二烯基	0	1	Cy17b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 66b	H	0	1	Cy17b	H	H	Me	CH ₂ F	0
A. 67b	H	0	1	Cy17b	H	F	Me	Me	0
A. 68b	H	0	1	Cy18b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 69b	H	0	1	Cy18b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 70b	H	0	1	Cy19b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 71b	H	0	1	Cy19b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 72b	炔丙基	0	1	Cy19b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 73b	丙二烯基	0	1	Cy19b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 74b	炔丙基	0	1	Cy19b	H	H	Me	CF ₂ H	0
A. 75b	丙二烯基	0	1	Cy19b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 76b	H	0	1	Cy19b	H	H	Me	CH ₂ F	0
A. 77b	H	0	1	Cy19b	H	F	Me	Me	0
A. 78b	H	0	2	Cy17b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 92b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
A. 93b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
A. 94b	H	0	1	Cy24b	H	H	Me	CF ₃	0
A. 95b	H	0	1	Cy24b	H	H	Me	CF ₂ H	0

表 1a 提供了 98 个式 (Ia) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 1a 中定义。

表 1b 提供了 39 个式 (Ia) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 1b 中定义。

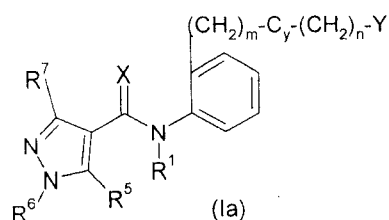


表 2a 提供了 98 个式 (Iaa) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 2a 中定义。

表 2b 提供了 39 个式 (Iaa) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 2b 中定义。

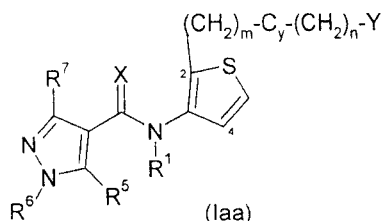


表 3a 提供了 98 个式 (Ib) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 3a 中定义。

表 3b 提供了 39 个式 (Ib) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 3b 中定义。

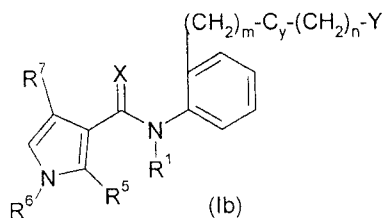


表 4a 提供了 98 个式 (Ibb) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 4a 中定义。

表 4b 提供了 39 个式 (Ibb) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 4b 中定义。

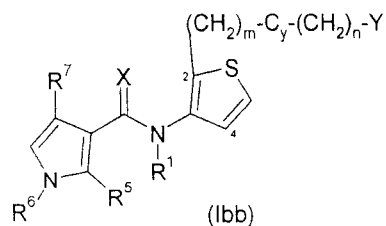


表 Ba 代表表 5a (当 B 是 5 时), 代表表 6a (当 B 是 6 时), 代表表 7a (当 B 是 7 时), 代表表 8a (当 B 是 8 时), 代表表 9a (当 B 是 9 时) 和代表表 10a (当 B 是 10 时)。

表 Ba

化合物号	R ¹	m	n	Cy	Y	R ⁵	R ⁶	X
B. 1	H	0	0	Cy1	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 2	H	0	0	Cy1	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 3	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 4	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 5	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₂ Cl	0
B. 6	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₃	S
B. 7	炔丙基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 8	丙二烯基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 9	COCH ₃	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 10	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CH ₂ OMe	CF ₃	0
B. 11	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	S
B. 12	炔丙基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 13	丙二烯基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 14	COCH ₃	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 15	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CH ₂ OMe	CF ₂ H	0
B. 16	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	Me	0
B. 17	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	Me	0
B. 18	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CH ₂ F	0
B. 19	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CH ₂ F	0
B. 20	H	0	0	Cy2	Me ₂ SiEt	Me	CF ₃	0
B. 21	H	0	0	Cy2	Me ₂ SiEt	Me	CF ₂ H	0
B. 22	H	0	0	Cy2	Me ₂ SiCHMe ₂	Me	CF ₃	0
B. 23	H	0	0	Cy2	Me ₂ SiCHMe ₂	Me	CF ₂ H	0
B. 24	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 25	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 26	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 27	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0

B. 28a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 29a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 30	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 31	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 32	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 33	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 34a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 35a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 36	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 37	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 38	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 39	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 40a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 41a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 42a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 43a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 44	H	0	1	Cy11	H	Me	CF ₃	0
B. 45	H	0	1	Cy11	H	Me	CF ₂ H	0
B. 46	H	0	1	Cy12	H	Me	CF ₃	0
B. 47	H	0	1	Cy12	H	Me	CF ₂ H	0
B. 48	H	0	1	Cy13	H	Me	CF ₃	0
B. 49	H	0	1	Cy13	H	Me	CF ₂ H	0
B. 50a	H	0	1	Cy14a	H	Me	CF ₃	0
B. 51a	H	0	1	Cy14a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 52a	炔丙基	0	1	Cy14a	H	Me	CF ₃	0
B. 53a	丙二烯基	0	1	Cy14a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 54a	炔丙基	0	1	Cy14a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 55a	丙二烯基	0	1	Cy14a	H	Me	CF ₃	0
B. 56a	H	0	1	Cy15a	H	Me	CF ₃	0
B. 57a	H	0	1	Cy15a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 58	H	0	1	Cy16	H	Me	CF ₃	0
B. 59	H	0	1	Cy16	H	Me	CF ₂ H	0
B. 60a	H	0	1	Cy17a	H	Me	CF ₃	0
B. 61a	H	0	1	Cy17a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 62a	炔丙基	0	1	Cy17a	H	Me	CF ₃	0
B. 63a	丙二烯基	0	1	Cy17a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 64a	炔丙基	0	1	Cy17a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 65a	丙二烯基	0	1	Cy17a	H	Me	CF ₃	0

B. 66a	H	0	1	Cy17a	H	Me	CH ₂ F	0
B. 67a	H	0	1	Cy17a	H	Me	Me	0
B. 68a	H	0	1	Cy18a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 69a	H	0	1	Cy18a	H	Me	CF ₃	0
B. 70a	H	0	1	Cy19a	H	Me	CF ₃	0
B. 71a	H	0	1	Cy19a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 72a	炔丙基	0	1	Cy19a	H	Me	CF ₃	0
B. 73a	丙二烯基	0	1	Cy19a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 74a	炔丙基	0	1	Cy19a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 75a	丙二烯基	0	1	Cy19a	H	Me	CF ₃	0
B. 76a	H	0	1	Cy19a	H	Me	CH ₂ F	0
B. 77a	H	0	1	Cy19a	H	Me	Me	0
B. 78a	H	0	2	Cy17a	H	Me	CF ₃	0
B. 79a	H	0	2	Cy17a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 80	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	Me	CF ₃	0
B. 81	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	Me	CF ₂ H	0
B. 82	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 83	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 84	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 85	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 86	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 87	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 88	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 89	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 90	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 91	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 92a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 93a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 94a	H	0	1	Cy24a	H	Me	CF ₃	0
B. 95a	H	0	1	Cy24a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 96a	H	0	2	Cy17a	H	Me	CF ₂ H	0
B. 97a	H	1	1	Cy19a	H	Me	CF ₃	0
B. 98a	H	1	1	Cy19a	H	Me	CF ₂ H	0

表 Bb 代表表 5b (当 B 是 5 时), 代表表 6b (当 B 是 6 时), 代表表 7b (当 B 是 7 时), 代表表 8b (当 B 是 8 时), 代表表 9b (当 B 是 9 时) 和代表表 10b (当 B 是 10 时)。

表 Bb

化合物号	R ¹	m	n	Cy	Y	R ⁵	R ⁶	X
B. 28b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 29b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 34b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 35b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 40b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 41b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 42b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 43b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 50b	H	0	1	Cy14b	H	Me	CF ₃	0
B. 51b	H	0	1	Cy14b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 52b	炔丙基	0	1	Cy14b	H	Me	CF ₃	0
B. 53b	丙二烯基	0	1	Cy14b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 54b	炔丙基	0	1	Cy14b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 55b	丙二烯基	0	1	Cy14b	H	Me	CF ₃	0
B. 56b	H	0	1	Cy15b	H	Me	CF ₃	0
B. 57b	H	0	1	Cy15b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 60b	H	0	1	Cy17b	H	Me	CF ₃	0
B. 61b	H	0	1	Cy17b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 62b	炔丙基	0	1	Cy17b	H	Me	CF ₃	0
B. 63b	丙二烯基	0	1	Cy17b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 64b	炔丙基	0	1	Cy17b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 65b	丙二烯基	0	1	Cy17b	H	Me	CF ₃	0
B. 66b	H	0	1	Cy17b	H	Me	CH ₂ F	0
B. 67b	H	0	1	Cy17b	H	Me	Me	0
B. 68b	H	0	1	Cy18b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 69b	H	0	1	Cy18b	H	Me	CF ₃	0
B. 70b	H	0	1	Cy19b	H	Me	CF ₃	0
B. 71b	H	0	1	Cy19b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 72b	炔丙基	0	1	Cy19b	H	Me	CF ₃	0
B. 73b	丙二烯基	0	1	Cy19b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 74b	炔丙基	0	1	Cy19b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 75b	丙二烯基	0	1	Cy19b	H	Me	CF ₃	0
B. 76b	H	0	1	Cy19b	H	Me	CH ₂ F	0
B. 77b	H	0	1	Cy19b	H	Me	Me	0
B. 78b	H	0	2	Cy17b	H	Me	CF ₃	0
B. 79b	H	0	2	Cy17b	H	Me	CF ₂ H	0
B. 92b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	Me	CF ₃	0
B. 93b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	Me	CF ₂ H	0
B. 94b	H	0	1	Cy24b	H	Me	CF ₃	0
B. 95b	H	0	1	Cy24b	H	Me	CF ₂ H	0

表 5a 提供了 98 个式 (Ic) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 5a 中定义。

表 5b 提供了 40 个式 (Ic) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 5b 中定义。

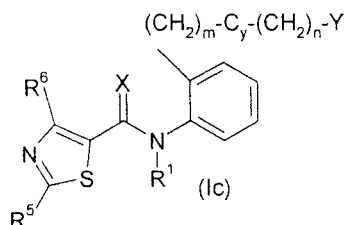


表 6a 提供了 98 个式 (Icc) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 6a 中定义。

表 6b 提供了 40 个式 (Icc) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 6b 中定义。

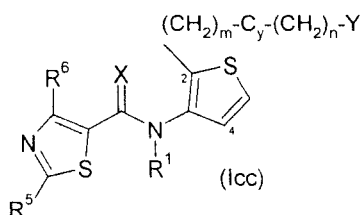


表 7a 提供了 98 个式 (Id) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 7a 中定义。

表 7b 提供了 40 个式 (Id) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 7b 中定义。

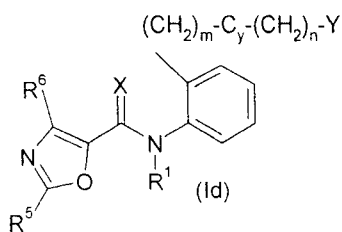


表 8a 提供了 98 个式 (Idd) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 8a 中定义。

表 8b 提供了 40 个式 (Idd) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 8b 中定义。

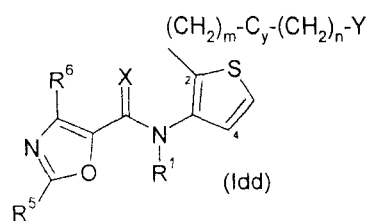


表 9a 提供了 98 个式 (Ie) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 9a 中定义。

表 9b 提供了 40 个式 (Ie) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 9b 中定义。

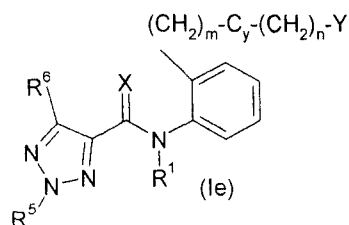


表 10a 提供了 98 个式 (Iee) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 10a 中定义。

表 10b 提供了 40 个式 (Iee) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 Y 和 X 如表 10b 中定义。

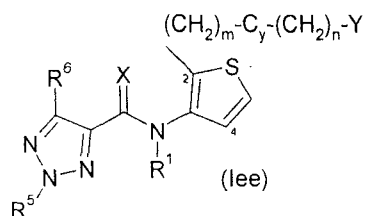


表 Ca 代表表 11a (当 C 是 11 时)、代表表 12a (当 C 是 12 时)、代表表 13a (当 C 是 13 时)和代表表 14a (当 C 是 14 时)。

表 Ca

化合物号	R^1	m	n	Cy	Y	R^5	R^6	R^7	X
C. 1	H	0	0	Cy1	Me_3Si	H	Me	CF_3	0
C. 2	H	0	0	Cy1	Me_3Si	H	Me	CF_2H	0
C. 3	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_3	0
C. 4	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_2H	0
C. 5	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_2Cl	0
C. 6	H	0	0	Cy2	Me_3Si	H	Me	CF_3	S
C. 7	H	0	0	Cy2	Me_3Si	Me	Me	CF_3	0

C. 8	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	H	H	CF ₃	0
C. 9	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	H	CF ₃	0
C. 10	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	Me	Me	0
C. 11	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	Me	H	0
C. 12	炔丙基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 13	丙二烯基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 14	COCH ₃	0	0	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 15	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CH ₂ F	0
C. 16	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 17	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 18	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 19	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 20a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 21a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 22	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 23	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 24	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 25	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 26a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 27a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 28	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 29	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 30	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 31	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 32a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 33a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 34a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 35a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 36	H	0	1	Cy11	H	H	Me	CF ₃	0
C. 37	H	0	1	Cy11	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 38	H	0	1	Cy12	H	H	Me	CF ₃	0
C. 39	H	0	1	Cy12	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 40	H	0	1	Cy13	H	H	Me	CF ₃	0
C. 41	H	0	1	Cy13	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 42a	H	0	1	Cy14a	H	H	Me	CF ₃	0
C. 43a	H	0	1	Cy14a	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 44a	H	0	1	Cy14a	H	Me	Me	CF ₃	0
C. 45a	H	0	1	Cy14a	H	H	H	CF ₃	0

C. 46a	H	0	1	Cy14a	H	Me	H	CF ₃	0
C. 47a	H	0	1	Cy14a	H	Me	Me	Me	0
C. 48a	H	0	1	Cy14a	H	Me	Me	H	0
C. 49a	H	0	1	Cy15a	H	Me	Me	CF ₃	0
C. 50a	H	0	1	Cy15a	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 51	H	0	1	Cy16	H	H	Me	CF ₃	0
C. 52	H	0	1	Cy16	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 53a	H	0	1	Cy17a	H	H	Me	CF ₃	0
C. 54a	H	0	1	Cy17a	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 55a	H	0	1	Cy17a	H	Me	Me	CF ₃	0
C. 56a	H	0	1	Cy17a	H	H	H	CF ₃	0
C. 57a	H	0	1	Cy17a	H	Me	H	CF ₃	0
C. 58a	H	0	1	Cy17a	H	Me	Me	Me	0
C. 59a	H	0	1	Cy17a	H	Me	Me	H	0
C. 60a	H	0	1	Cy18a	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 61a	H	0	1	Cy18a	H	H	Me	CF ₃	0
C. 62a	H	0	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₃	0
C. 63a	H	0	1	Cy19a	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 64a	H	0	1	Cy19a	H	Me	Me	CF ₃	0
C. 65a	H	0	1	Cy19a	H	H	H	CF ₃	0
C. 66a	H	0	1	Cy19a	H	Me	H	CF ₃	0
C. 67a	H	0	1	Cy19a	H	Me	Me	Me	0
C. 68a	H	0	1	Cy19a	H	Me	Me	H	0
C. 69a	H	0	2	Cy17a	H	H	Me	CF ₃	0
C. 70a	H	0	2	Cy17a	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 71	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	H	Me	CF ₃	0
C. 72	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	H	Me	CF ₂ H	0
C. 73	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 74	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 75	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 76	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 77	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 78a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 79a	H	0	1	Cy24a	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 80a	H	0	1	Cy24a	H	Me	Me	CF ₃	0

表 Cb 代表表 11b (当 C 是 11 时), 代表表 12b (当 C 是 12 时),

代表表 13b (当 C 是 13 时)和代表表 14b (当 C 是 14 时)。

表 Cb

化合物号	R ¹	m	n	Cy	Y	R ⁵	R ⁶	R ⁷	X
C. 20b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 21b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 26b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 27b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 32b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 33b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 34b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 35b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₂ H	0
C. 42b	H	0	1	Cy14b	H	H	Me	CF ₃	0
C. 43b	H	0	1	Cy14b	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 44b	H	0	1	Cy14b	H	Me	Me	CF ₃	0
C. 45b	H	0	1	Cy14b	H	H	H	CF ₃	0
C. 46b	H	0	1	Cy14b	H	Me	H	CF ₃	0
C. 47b	H	0	1	Cy14b	H	Me	Me	Me	0
C. 48b	H	0	1	Cy14b	H	Me	Me	H	0
C. 49b	H	0	1	Cy15b	H	Me	Me	CF ₃	0
C. 50b	H	0	1	Cy15b	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 53b	H	0	1	Cy17b	H	H	Me	CF ₃	0
C. 54b	H	0	1	Cy17b	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 55b	H	0	1	Cy17b	H	Me	Me	CF ₃	0
C. 56b	H	0	1	Cy17b	H	H	H	CF ₃	0
C. 57b	H	0	1	Cy17b	H	Me	H	CF ₃	0
C. 58b	H	0	1	Cy17b	H	Me	Me	Me	0
C. 59b	H	0	1	Cy17b	H	Me	Me	H	0
C. 60b	H	0	1	Cy18b	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 61b	H	0	1	Cy18b	H	H	Me	CF ₃	0
C. 62b	H	0	1	Cy19b	H	H	Me	CF ₃	0
C. 63b	H	0	1	Cy19b	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 64b	H	0	1	Cy19b	H	Me	Me	CF ₃	0
C. 65b	H	0	1	Cy19b	H	H	H	CF ₃	0
C. 66b	H	0	1	Cy19b	H	Me	H	CF ₃	0
C. 67b	H	0	1	Cy19b	H	Me	Me	Me	0
C. 68b	H	0	1	Cy19b	H	Me	Me	H	0
C. 69b	H	0	2	Cy17b	H	H	Me	CF ₃	0
C. 70b	H	0	2	Cy17b	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 78b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	H	Me	CF ₃	0
C. 79b	H	0	1	Cy24b	H	H	Me	CF ₂ H	0
C. 80b	H	0	1	Cy24b	H	Me	Me	CF ₃	0

表 11a 提供了 80 个式 (If) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 11a 中定义。

表 11b 提供了 38 个式 (If) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 11b 中定义。

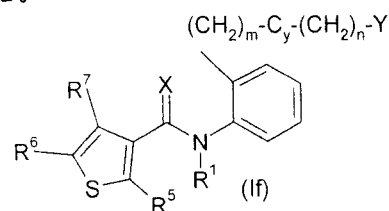


表 12a 提供了 80 个式 (If) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 12a 中定义。

表 12b 提供了 38 个式 (If) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 12b 中定义。

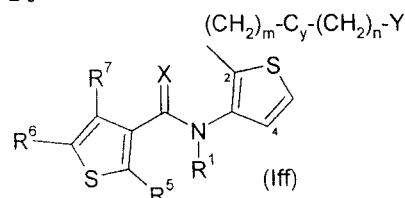


表 13a 提供了 80 个式 (Ig) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 13a 中定义。

表 13b 提供了 38 个式 (Ig) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 13b 中定义。

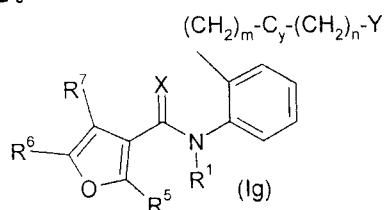


表 14a 提供了 80 个式 (Igg) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 14a 中定义。

表 14b 提供了 38 个式 (Igg) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 和 X 如表 14b 中定义。

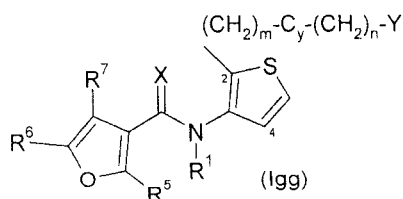


表 Da 代表表 15a (当 D 是 15 时), 代表表 16a (当 D 是 16 时), 代表表 17a (当 D 是 17 时), 代表表 18a (当 D 是 18 时), 代表表 19a (当 D 是 19 时) 和代表表 20a (当 D 是 20 时)。

表 Da

化合物号	R ¹	m	n	Cy	Y	R ⁵	X
D. 1	H	0	0	Cy1	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 2	H	0	0	Cy1	Me ₃ Si	Me	0
D. 2	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 3	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	0
D. 4	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₂ Cl	0
D. 5	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	S
D. 7	炔丙基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 8	丙二烯基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 9	COCH ₃	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 10	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	S
D. 11	炔丙基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	0
D. 12	丙二烯基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	0
D. 13	COCH ₃	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	0
D. 14	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 15	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	Me	0
D. 16	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 17	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	Me	0
D. 18a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 19a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	Me	0
D. 20	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 21	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	CF ₂ H	0
D. 22	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 23	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	Me	0
D. 24a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 25a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	Me	0
D. 26	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 27	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	Me	0
D. 28	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	CF ₃	0

D. 29	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	Me	0
D. 30a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 31a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	Me	0
D. 32a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 33a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	Me	0
D. 34	H	0	1	Cy11	H	CF ₃	0
D. 35	H	0	1	Cy11	H	Me	0
D. 36	H	0	1	Cy12	H	CF ₃	0
D. 37	H	0	1	Cy12	H	Me	0
D. 38	H	0	1	Cy13	H	CF ₃	0
D. 39	H	0	1	Cy13	H	Me	0
D. 40a	H	0	1	Cy14a	H	CF ₃	0
D. 41a	H	0	1	Cy14a	H	Me	0
D. 42a	炔丙基	0	1	Cy14a	H	CF ₃	0
D. 43a	丙二烯基	0	1	Cy14a	H	Me	0
D. 44a	炔丙基	0	1	Cy14a	H	Me	0
D. 45a	丙二烯基	0	1	Cy14a	H	CF ₃	0
D. 46a	H	0	1	Cy15a	H	CF ₃	0
D. 47a	H	0	1	Cy15a	H	Me	0
D. 48	H	0	1	Cy16	H	CF ₃	0
D. 49	H	0	1	Cy16	H	Me	0
D. 50a	H	0	1	Cy17a	H	CF ₃	0
D. 51a	H	0	1	Cy17a	H	Me	0
D. 52a	炔丙基	0	1	Cy17a	H	CF ₃	0
D. 53a	丙二烯基	0	1	Cy17a	H	Me	0
D. 54a	炔丙基	0	1	Cy17a	H	Me	0
D. 55a	丙二烯基	0	1	Cy17a	H	CF ₃	0
D. 56a	H	0	1	Cy18a	H	Me	0
D. 57a	H	0	1	Cy18a	H	CF ₃	0
D. 58a	H	0	1	Cy19a	H	CF ₃	0
D. 59a	H	0	1	Cy19a	H	Me	0
D. 60a	炔丙基	0	1	Cy19a	H	CF ₃	0
D. 61a	丙二烯基	0	1	Cy19a	H	Me	0
D. 62a	炔丙基	0	1	Cy19a	H	Me	0
D. 63a	丙二烯基	0	1	Cy19a	H	CF ₃	0
D. 64a	H	0	2	Cy17a	H	CF ₃	0
D. 65a	H	0	2	Cy17a	H	Me	0
D. 66	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	CF ₃	0

D. 67	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	Me	0
D. 68	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 69	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	Me	0
D. 70	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 71	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	Me	0
D. 72	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 73	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	Me	0
D. 74	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 75	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	Me	0
D. 76	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 77	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	Me	0
D. 78a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 79a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	Me	0
D. 80a	H	0	1	Cy24a	H	CF ₃	0
D. 81a	H	0	1	Cy24a	H	Me	0

表 Db 代表表 15b (当 D 是 15 时), 代表表 16b (当 D 是 16 时), 代表表 17b (当 D 是 17 时), 代表表 18b (当 D 是 18 时), 代表表 19b (当 D 是 19 时) 和代表表 20b (当 D 是 20 时)。

表 Db

化合物号	R ¹	m	n	Cy	Y	R ⁵	X
D. 18b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 19b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	Me	0
D. 24b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 25b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	Me	0
D. 30b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 31b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	Me	0
D. 32b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 33b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	Me	0
D. 40b	H	0	1	Cy14b	H	CF ₃	0
D. 41b	H	0	1	Cy14b	H	Me	0
D. 42b	炔丙基	0	1	Cy14b	H	CF ₃	0
D. 43b	丙二烯基	0	1	Cy14b	H	Me	0
D. 44b	炔丙基	0	1	Cy14b	H	Me	0
D. 45b	丙二烯基	0	1	Cy14b	H	CF ₃	0
D. 46b	H	0	1	Cy15b	H	CF ₃	0

D. 47b	H	0	1	Cy15b	H	Me	0
D. 50b	H	0	1	Cy17b	H	CF ₃	0
D. 51b	H	0	1	Cy17b	H	Me	0
D. 52b	炔丙基	0	1	Cy17b	H	CF ₃	0
D. 53b	丙二烯基	0	1	Cy17b	H	Me	0
D. 54b	炔丙基	0	1	Cy17b	H	Me	0
D. 55b	丙二烯基	0	1	Cy17b	H	CF ₃	0
D. 56b	H	0	1	Cy18b	H	Me	0
D. 57b	H	0	1	Cy18b	H	CF ₃	0
D. 58b	H	0	1	Cy19b	H	CF ₃	0
D. 59b	H	0	1	Cy19b	H	Me	0
D. 60b	炔丙基	0	1	Cy19b	H	CF ₃	0
D. 61b	丙二烯基	0	1	Cy19b	H	Me	0
D. 62b	炔丙基	0	1	Cy19b	H	Me	0
D. 63b	丙二烯基	0	1	Cy19b	H	CF ₃	0
D. 64b	H	0	2	Cy17b	H	CF ₃	0
D. 65b	H	0	2	Cy17b	H	Me	0
D. 78b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	CF ₃	0
D. 79b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	Me	0
D. 80b	H	0	1	Cy24b	H	CF ₃	0
D. 81b	H	0	1	Cy24b	H	Me	0

表 15a 提供了 81 个式 (Ih) 化合物, 其中 R¹、m、n、Cy、R⁵、Y 和 X 如表 15a 中定义。

表 15b 提供了 36 个式 (Ih) 化合物, 其中 R¹、m、n、Cy、R⁵、Y 和 X 如表 15b 中定义。

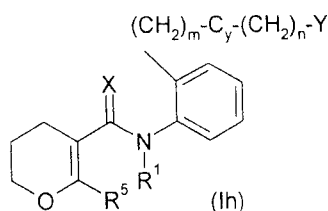


表 16a 提供了 81 个式 (Ihh) 化合物, 其中 R¹、m、n、Cy、R⁵、Y 和 X 如表 16a 中定义。

表 16b 提供了 36 个式 (Ihh) 化合物, 其中 R¹、m、n、Cy、R⁵、Y 和 X 如表 16b 中定义。

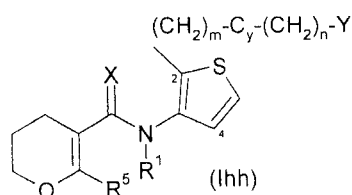


表 17a 提供了 81 个式 (Ij) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 17a 中定义。

表 17b 提供了 36 个式 (Ij) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 17b 中定义。

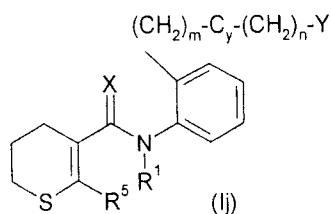


表 18a 提供了 81 个式 (Ijj) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 18a 中定义。

表 18b 提供了 36 个式 (Ijj) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 18b 中定义。

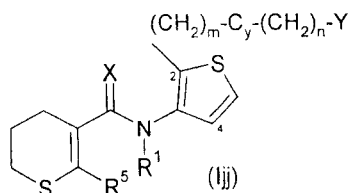


表 19a 提供了 81 个式 (Ik) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 19a 中定义。

表 19b 提供了 36 个式 (Ik) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 19b 中定义。

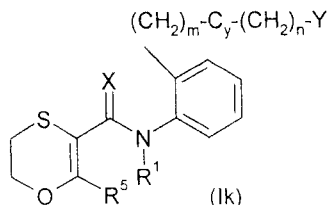


表 20a 提供了 81 个式 (Ikk) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 20a 中定义。

表 20b 提供了 36 个式 (Ikk) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y

和 X 如表 20b 中定义。

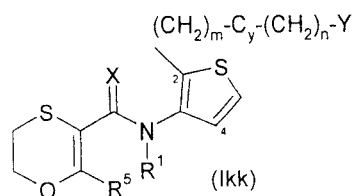


表 Ea 代表表 21a (当 E 是 21 时), 代表表 22a (当 E 是 22 时), 代表表 23a (当 E 是 23 时), 代表表 24a (当 E 是 24 时), 代表表 25a (当 E 是 25 时) 和代表表 26a (当 E 是 26 时)。

表 Ea

化合物号	R ¹	m	n	Cy	Y	R ⁵	X
E. 1	H	0	0	Cy1	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 2	H	0	0	Cy1	Me ₃ Si	Cl	0
E. 3	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Cl	0
E. 4	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₂ Cl	0
E. 5	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 7	炔丙基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 8	丙二烯基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 9	COCH ₃	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 10	H	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Cl	S
E. 11	炔丙基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Cl	0
E. 12	丙二烯基	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Cl	0
E. 13	COCH ₃	0	0	Cy2	Me ₃ Si	Cl	0
E. 14	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 15	H	1	0	Cy2	Me ₃ Si	Cl	0
E. 16	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 17	H	0	1	Cy2	Me ₃ Si	Cl	0
E. 18a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 19a	H	0	0	Cy3a	Me ₃ Si	Cl	0
E. 20	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 21	H	0	0	Cy4	Me ₃ Si	Cl	0
E. 22	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 23	H	0	0	Cy5	Me ₃ Si	Cl	0
E. 24a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 25a	H	0	0	Cy6a	Me ₃ Si	Cl	0
E. 26	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 27	H	0	0	Cy7	Me ₃ Si	Cl	0

E. 28	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 29	H	0	0	Cy8	Me ₃ Si	Cl	0
E. 30a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 31a	H	0	0	Cy9a	Me ₃ Si	Cl	0
E. 32a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 33a	H	0	0	Cy10a	Me ₃ Si	Cl	0
E. 34	H	0	1	Cy11	H	CF ₃	0
E. 35	H	0	1	Cy11	H	Cl	0
E. 36	H	0	1	Cy12	H	CF ₃	0
E. 37	H	0	1	Cy12	H	Cl	0
E. 38	H	0	1	Cy13	H	CF ₃	0
E. 39	H	0	1	Cy13	H	Cl	0
E. 40a	H	0	1	Cy14a	H	CF ₃	0
E. 41a	H	0	1	Cy14a	H	Cl	0
E. 42a	炔丙基	0	1	Cy14a	H	CF ₃	0
E. 43a	丙二烯基	0	1	Cy14a	H	Cl	0
E. 44a	炔丙基	0	1	Cy14a	H	Cl	0
E. 45a	丙二烯基	0	1	Cy14a	H	CF ₃	0
E. 46a	H	0	1	Cy15a	H	CF ₃	0
E. 47a	H	0	1	Cy15a	H	Cl	0
E. 48	H	0	1	Cy16	H	CF ₃	0
E. 49	H	0	1	Cy16	H	Cl	0
E. 50a	H	0	1	Cy17a	H	CF ₃	0
E. 51a	H	0	1	Cy17a	H	Cl	0
E. 52a	炔丙基	0	1	Cy17a	H	CF ₃	0
E. 53a	丙二烯基	0	1	Cy17a	H	Cl	0
E. 54a	炔丙基	0	1	Cy17a	H	Cl	0
E. 55a	丙二烯基	0	1	Cy17a	H	CF ₃	0
E. 56a	H	0	1	Cy18a	H	Cl	0
E. 57a	H	0	1	Cy18a	H	CF ₃	0
E. 58a	H	0	1	Cy19a	H	CF ₃	0
E. 59a	H	0	1	Cy19a	H	Cl	0
E. 60a	炔丙基	0	1	Cy19a	H	CF ₃	0
E. 61a	丙二烯基	0	1	Cy19a	H	Cl	0
E. 62a	炔丙基	0	1	Cy19a	H	Cl	0
E. 63a	丙二烯基	0	1	Cy19a	H	CF ₃	0
E. 64a	H	0	2	Cy17a	H	CF ₃	0
E. 65a	H	0	2	Cy17a	H	Cl	0

E. 66	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	CF ₃	0
E. 67	H	0	0	Cy20	Me ₂ SiCMe ₃	C1	0
E. 68	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 69	H	0	1	Cy20	Me ₃ Si	C1	0
E. 70	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 71	H	0	2	Cy20	Me ₃ Si	C1	0
E. 72	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 73	H	0	0	Cy21	Me ₃ Si	C1	0
E. 74	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 75	H	0	0	Cy22	Me ₃ Si	C1	0
E. 76	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 77	CHO	0	0	Cy22	Me ₃ Si	C1	0
E. 78a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 79a	H	0	0	Cy23a	Me ₃ Si	C1	0
E. 80a	H	0	1	Cy24a	H	CF ₃	0
E. 81a	H	0	1	Cy24a	H	C1	0
E. 82a	H	0	2	Cy17a	H	C1	0
E. 83a	H	1	1	Cy19a	H	C1	0

表 Eb 代表表 21b (当 E 是 21 时), 代表表 22b (当 E 是 22 时), 代表表 23b (当 E 是 23 时), 代表表 24b (当 E 是 24 时), 代表表 25b (当 E 是 25 时) 和代表表 26b (当 E 是 26 时)。

表 Eb

化合物号	R ¹	m	n	Cy	Y	R ⁵	X
E. 18b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 19b	H	0	0	Cy3b	Me ₃ Si	C1	0
E. 24b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 25b	H	0	0	Cy6b	Me ₃ Si	C1	0
E. 30b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 31b	H	0	0	Cy9b	Me ₃ Si	C1	0
E. 32b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 33b	H	0	0	Cy10b	Me ₃ Si	C1	0
E. 40b	H	0	1	Cy14b	H	CF ₃	0
E. 41b	H	0	1	Cy14b	H	C1	0
E. 42b	炔丙基	0	1	Cy14b	H	CF ₃	0
E. 43b	丙二烯基	0	1	Cy14b	H	C1	0

E. 44b	炔丙基	0	1	Cy14b	H	C1	0
E. 45b	丙二烯基	0	1	Cy14b	H	CF ₃	0
E. 46b	H	0	1	Cy15b	H	CF ₃	0
E. 47b	H	0	1	Cy15b	H	C1	0
E. 50b	H	0	1	Cy17b	H	CF ₃	0
E. 51b	H	0	1	Cy17b	H	C1	0
E. 52b	炔丙基	0	1	Cy17b	H	CF ₃	0
E. 53b	丙二烯基	0	1	Cy17b	H	C1	0
E. 54b	炔丙基	0	1	Cy17b	H	C1	0
E. 55b	丙二烯基	0	1	Cy17b	H	CF ₃	0
E. 56b	H	0	1	Cy18b	H	C1	0
E. 57b	H	0	1	Cy18b	H	CF ₃	0
E. 58b	H	0	1	Cy19b	H	CF ₃	0
E. 59b	H	0	1	Cy19b	H	C1	0
E. 60b	炔丙基	0	1	Cy19b	H	CF ₃	0
E. 61b	丙二烯基	0	1	Cy19b	H	C1	0
E. 62b	炔丙基	0	1	Cy19b	H	C1	0
E. 63b	丙二烯基	0	1	Cy19b	H	CF ₃	0
E. 64b	H	0	2	Cy17b	H	CF ₃	0
E. 65b	H	0	2	Cy17b	H	C1	0
E. 78b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	CF ₃	0
E. 79b	H	0	0	Cy23b	Me ₃ Si	C1	0
E. 80b	H	0	1	Cy24b	H	CF ₃	0
E. 81b	H	0	1	Cy24b	H	C1	0

表 21a 提供了 83 个式 (Im) 化合物, 其中 R¹、m、n、Cy、R⁵、Y 和 X 如表 21a 中定义。

表 21b 提供了 36 个式 (Im) 化合物, 其中 R¹、m、n、Cy、R⁵、Y 和 X 如表 21b 中定义。

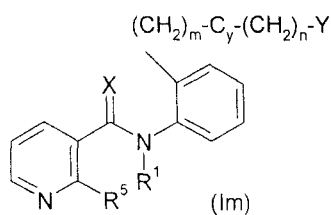


表 22a 提供了 83 个式 (Imm) 化合物, 其中 R¹、m、n、Cy、R⁵、Y 和 X 如表 22a 中定义。

表 22b 提供了 36 个式 (Imm) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 22b 中定义。

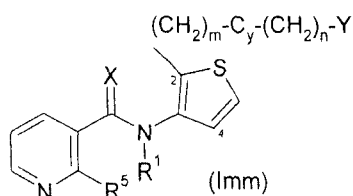


表 23a 提供了 83 个式 (In) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 23a 中定义。

表 23b 提供了 36 个式 (In) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 23b 中定义。

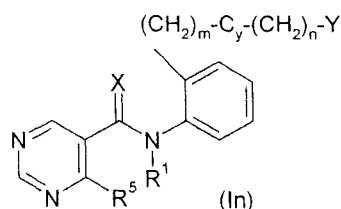


表 24a 提供了 83 个式 (Inn) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 24a 中定义。

表 24b 提供了 36 个式 (Inn) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 24b 中定义。

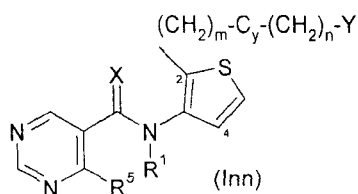


表 25a 提供了 83 个式 (Io) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 25a 中定义。

表 25b 提供了 36 个式 (Io) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 25b 中定义。

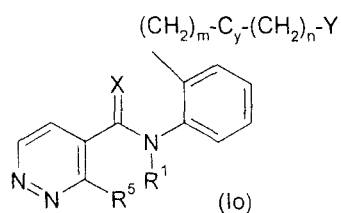


表 26a 提供了 83 个式 (Ioo) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 26a 中定义。

表 26b 提供了 36 个式 (Ioo) 化合物, 其中 R^1 、 m 、 n 、 Cy 、 R^5 、 Y 和 X 如表 26b 中定义。

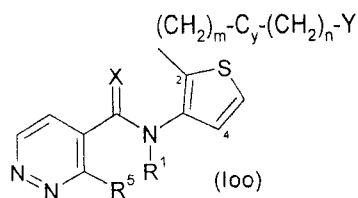


表 27a 提供了 72 个式 (Ip) 化合物, 其中 m 、 n 、 Cy 、 R^2 、 R^7 和 Y 如表 27a 中定义。

表 27b 提供了 24 个式 (Ip) 化合物, 其中 m 、 n 、 Cy 、 R^2 、 R^7 和 Y 如表 27b 中定义。

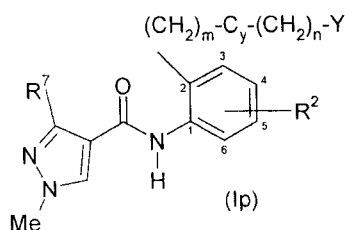


表 27a

化合物号	R^2	m	n	Cy	Y	R^7
27.1	3-F	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3
27.2	4-F	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3
27.3	5-F	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3
27.4	6-F	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3
27.5	3-F	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_2H
27.6	4-F	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_2H
27.7	5-F	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_2H
27.8	6-F	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_2H
27.9	3-Cl	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3
27.10	4-Cl	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3
27.11	5-Cl	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3
27.12	6-Cl	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3
27.13	3-Cl	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_2H
27.14	4-Cl	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_2H
27.15	5-Cl	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_2H
27.16	6-Cl	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_2H
27.17	3-Br	0	0	Cy2	Me_3Si	CF_3

27.18	4-Br	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃
27.19	5-Br	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃
27.20	6-Br	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₃
27.21	3-Br	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₂ H
27.22	4-Br	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₂ H
27.23	5-Br	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₂ H
27.24	6-Br	0	0	Cy2	Me ₃ Si	CF ₂ H
27.25a	3-F	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.26a	4-F	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.27a	5-F	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.28a	6-F	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.29a	3-F	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.30a	4-F	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.31a	5-F	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.32a	6-F	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.33a	3-Cl	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.34a	4-Cl	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.35a	5-Cl	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.36a	6-Cl	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.37a	3-Cl	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.38a	4-Cl	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.39a	5-Cl	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.40a	6-Cl	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.41a	3-Br	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.42a	4-Br	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.43a	5-Br	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.44a	6-Br	0	1	Cy17a	H	CF ₃
27.45a	3-Br	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.46a	4-Br	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.47a	5-Br	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.48a	6-Br	0	1	Cy17a	H	CF ₂ H
27.49a	3-F	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.50a	4-F	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.51a	5-F	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.52a	6-F	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.53a	3-F	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.54a	4-F	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.55a	5-F	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H

27.56a	6-F	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.57a	3-Cl	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.58a	4-Cl	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.59a	5-Cl	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.60a	6-Cl	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.61a	3-Cl	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.62a	4-Cl	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.63a	5-Cl	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.64a	6-Cl	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.65a	3-Br	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.66a	4-Br	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.67a	5-Br	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.68a	6-Br	0	1	Cy19a	H	CF ₃
27.69a	3-Br	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.70a	4-Br	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.71a	5-Br	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H
27.72a	6-Br	0	1	Cy19a	H	CF ₂ H

表 27b

化合物号	R ²	m	n	Cy	Y	R ⁷
27.25b	3-F	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.26b	4-F	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.27b	5-F	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.28b	6-F	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.29b	3-F	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.30b	4-F	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.31b	5-F	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.32b	6-F	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.33b	3-Cl	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.34b	4-Cl	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.35b	5-Cl	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.36b	6-Cl	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.37b	3-Cl	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.38b	4-Cl	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.39b	5-Cl	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.40b	6-Cl	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.41b	3-Br	0	1	Cy17b	H	CF ₃

27.42b	4-Br	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.43b	5-Br	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.44b	6-Br	0	1	Cy17b	H	CF ₃
27.45b	3-Br	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.46b	4-Br	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.47b	5-Br	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H
27.48b	6-Br	0	1	Cy17b	H	CF ₂ H

表 Fa 代表表 28a (当 F 是 28 时)和代表表 29a (当 F 是 29 时)。

表 Fa

化合物号	A	m	n	Cy	Y
F. 1	NH ₂	0	0	Cy1	Me ₃ Si
F. 2	NH ₂	0	0	Cy2	Me ₃ Si
F. 3	NO ₂	0	0	Cy2	Me ₃ Si
F. 4	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy2	Me ₃ Si
F. 5	N=CH(C ₆ H ₅) ₂	0	0	Cy2	Me ₃ Si
F. 7	Br	0	0	Cy2	Me ₃ Si
F. 18a	NH ₂	0	0	Cy3a	Me ₃ Si
F. 19a	NO ₂	0	0	Cy3a	Me ₃ Si
F. 20a	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy3a	Me ₃ Si
F. 21	NH ₂	0	0	Cy4	Me ₃ Si
F. 22	NO ₂	0	0	Cy4	Me ₃ Si
F. 23	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy4	Me ₃ Si
F. 24	NH ₂	0	0	Cy5	Me ₃ Si
F. 25	NO ₂	0	0	Cy5	Me ₃ Si
F. 26	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy5	Me ₃ Si
F. 27	N=CH(C ₆ H ₅) ₂	0	0	Cy5	Me ₃ Si
F. 28a	NH ₂	0	0	Cy6a	Me ₃ Si
F. 29a	NO ₂	0	0	Cy6a	Me ₃ Si
F. 30a	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy6a	Me ₃ Si
F. 31	NH ₂	0	0	Cy7	Me ₃ Si
F. 32	NO ₂	0	0	Cy7	Me ₃ Si
F. 33	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy7	Me ₃ Si
F. 34	N=CH(C ₆ H ₅) ₂	0	0	Cy7	Me ₃ Si
F. 35	NH ₂	0	0	Cy8	Me ₃ Si
F. 36	NO ₂	0	0	Cy8	Me ₃ Si
F. 37	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy8	Me ₃ Si

F. 38	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	0	Cy8	Me_3Si
F. 39a	NH_2	0	0	Cy9a	Me_3Si
F. 40a	NH_2	0	0	Cy10a	Me_3Si
F. 41a	NO_2	0	0	Cy10a	Me_3Si
F. 42a	OSO_2CF_3	0	0	Cy10a	Me_3Si
F. 43a	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	0	Cy10a	Me_3Si
F. 44	NH_2	0	0	Cy11	H
F. 45	NO_2	0	1	Cy11	H
F. 46	NH_2	0	1	Cy12	H
F. 47	OSO_2CF_3	0	1	Cy12	H
F. 48	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	1	Cy12	H
F. 49	NH_2	0	1	Cy13	H
F. 50	OSO_2CF_3	0	1	Cy13	H
F. 51	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	1	Cy13	H
F. 52a	NO_2	0	1	Cy14a	H
F. 53a	NH_2	0	1	Cy14a	H
F. 54a	OSO_2CF_3	0	1	Cy14a	H
F. 55a	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	1	Cy14a	H
F. 56a	NH_2	0	1	Cy15a	H
F. 57a	OSO_2CF_3	0	1	Cy15a	H
F. 58a	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	1	Cy15a	H
F. 59	NH_2	0	1	Cy16	H
F. 60	OSO_2CF_3	0	1	Cy16	H
F. 61	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	1	Cy16	H
F. 62a	NO_2	0	1	Cy17a	H
F. 63a	NH_2	0	1	Cy17a	H
F. 64a	OSO_2CF_3	0	1	Cy17a	H
F. 65a	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	1	Cy17a	H
F. 66a	NO_2	0	1	Cy18a	H
F. 67a	NH_2	0	1	Cy18a	H
F. 68a	OSO_2CF_3	0	1	Cy18a	H
F. 69a	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	1	Cy18a	H
F. 70a	NO_2	0	1	Cy19a	H
F. 71a	NH_2	0	1	Cy19a	H
F. 72a	OSO_2CF_3	0	1	Cy19a	H
F. 73a	$\text{N}=\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)_2$	0	1	Cy19a	H
F. 74	NO_2	0	0	Cy1	Me_3Si
F. 75	OSO_2CF_3	0	0	Cy1	Me_3Si

F. 76	NO ₂	0	0	Cy21	Me ₃ Si
F. 77	NH ₂	0	0	Cy21	Me ₃ Si
F. 78	NO ₂	0	0	Cy22	Me ₃ Si
F. 79	NH ₂	0	0	Cy22	Me ₃ Si
F. 80a	NO ₂	0	0	Cy23a	Me ₃ Si
F. 81a	NH ₂	0	0	Cy23a	Me ₃ Si
F. 82a	NH ₂	0	1	Cy24a	H
F. 83a	NO ₂	0	1	Cy24a	H
F. 84a	NH ₂	1	1	Cy19a	H
F. 85a	NO ₂	1	1	Cy19a	H
F. 86a	NH ₂	0	2	Cy17a	H
F. 87a	NO ₂	0	2	Cy17a	H
F. 88	OSO ₂ CF ₃	0	1	Cy2	H
F. 89	N=CH(C ₆ H ₅) ₂	0	1	Cy2	H
F. 90	NH ₂	0	1	Cy2	H

表 Fb 代表表 28b (当 F 是 28 时)和代表表 29b (当 F 是 29 时)。

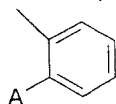
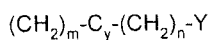
表 Fb

化合物号	A	m	n	Cy	Y
F. 18b	NH ₂	0	0	Cy3b	Me ₃ Si
F. 19b	NO ₂	0	0	Cy3b	Me ₃ Si
F. 20b	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy3b	Me ₃ Si
F. 28b	NH ₂	0	0	Cy6b	Me ₃ Si
F. 29b	NO ₂	0	0	Cy6b	Me ₃ Si
F. 30b	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy6b	Me ₃ Si
F. 39b	NH ₂	0	0	Cy9b	Me ₃ Si
F. 40b	NH ₂	0	0	Cy10b	Me ₃ Si
F. 41b	NO ₂	0	0	Cy10b	Me ₃ Si
F. 42b	OSO ₂ CF ₃	0	0	Cy10b	Me ₃ Si
F. 43b	N=CH(C ₆ H ₅) ₂	0	0	Cy10b	Me ₃ Si
F. 52b	NO ₂	0	1	Cy14b	H
F. 53b	NH ₂	0	1	Cy14b	H
F. 54b	OSO ₂ CF ₃	0	1	Cy14b	H
F. 55b	N=CH(C ₆ H ₅) ₂	0	1	Cy14b	H
F. 56b	NH ₂	0	1	Cy15b	H
F. 57b	OSO ₂ CF ₃	0	1	Cy15b	H
F. 58b	N=CH(C ₆ H ₅) ₂	0	1	Cy15b	H

F. 62b	NO ₂	0	1	Cy17b	H
F. 63b	NH ₂	0	1	Cy17b	H
F. 64b	OSO ₂ CF ₃	0	1	Cy17b	H
F. 65b	N=CH (C ₆ H ₅) ₂	0	1	Cy17b	H
F. 66b	NO ₂	0	1	Cy18b	H
F. 67b	NH ₂	0	1	Cy18b	H
F. 68b	OSO ₂ CF ₃	0	1	Cy18b	H
F. 69b	N=CH (C ₆ H ₅) ₂	0	1	Cy18b	H
F. 70b	NO ₂	0	1	Cy19b	H
F. 71b	NH ₂	0	1	Cy19b	H
F. 72b	OSO ₂ CF ₃	0	1	Cy19b	H
F. 73b	N=CH (C ₆ H ₅) ₂	0	1	Cy19b	H
F. 80b	NO ₂	0	0	Cy23b	Me ₃ Si
F. 81b	NH ₂	0	0	Cy23b	Me ₃ Si
F. 82b	NH ₂	0	1	Cy24b	H
F. 83b	NO ₂	0	1	Cy24b	H

表 28a 提供了 90 个式 (IIa) 化合物, 其中 A、m、n、Cy 和 Y 如表 28a 中定义。

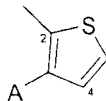
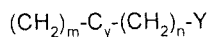
表 28b 提供了 34 个式 (IIa) 化合物, 其中 A、m、n、Cy 和 Y 如表 28b 中定义。



(IIa)

表 29a 提供了 90 个式 (IIb) 化合物, 其中 A、m、n、Cy 和 Y 如表 29a 中定义。

表 29b 提供了 34 个式 (IIb) 化合物, 其中 A、m、n、Cy 和 Y 如表 29b 中定义。



(IIb)

在该说明书全文内, 所给出的温度为摄氏度; "NMR" 意指核磁共振波谱; MS 代表质谱; 除非以其它单位标示相应的浓度, "%" 是重量百分

比；在钠线波长下以度数给出了比旋光度，其以比浓度(c)表示，除非另有说明溶剂为四氢呋喃。

本说明书通篇中使用以下缩写：

m. p. = 熔点	b. p. = 沸点
s = 单峰	br = 宽峰
d = 双重峰	dd = 双二重峰
t = 三重峰	q = 四重峰
m = 多重峰	ppm = 百万分之一
qd = 四二重峰	sext = 六重峰

表 30 示出了表 1 至 29 化合物的所选的熔点和所选的 NMR 数据，均以 CDCl_3 作为溶剂（除非另有说明，如果存在混合溶剂，其表示为，例如， $(\text{CDCl}_3/d_6\text{-DMSO})$ ），以及特征性的质谱信号（在所有情况中不试图列出所有特征数据）。

表 30

化合物号	$^1\text{H-NMR}$ 数据: (ppm/峰的多重性/氢的数目) 或质谱信号	m. p. / ($^{\circ}\text{C}$)
1.3		107-111
1.4	0.0 (s, 9); 0.25 (m, 1); 0.7 (m, 1); 0.9 (m, 1); 1.7 (m, 1); 3.95 (s, 3); 6.85 (t, 1); 7.05 (m, 2), 7.2 (m, 2), 8.0 (s, 1); 8.1 (d, 1), 8.35 (s, 1).	94-95
1.4A - 参见实施 例 7	0.0 (s, 9); 0.25 (m, 1); 0.7 (m, 1); 0.9 (m, 1); 1.7 (m, 1); 3.95 (s, 3); 6.85 (t, 1); 7.05 (m, 2), 7.2 (m, 2), 8.0 (s, 1); 8.1 (d, 1), 8.35 (s, 1).	油状物
1.4B - 参见实施 例 7	0.0 (s, 9); 0.25 (m, 1); 0.7 (m, 1); 0.9 (m, 1); 1.7 (m, 1); 3.95 (s, 3); 6.85 (t, 1); 7.05 (m, 2), 7.2 (m, 2), 8.0 (s, 1); 8.1 (d, 1), 8.35 (s, 1).	油状物
1.12	-0.18 (s, 1.5); 0.0 (s, 1.5); 0.0-0.2 (m, 1); 0.7 (m, 0.5); 0.8 (m, 0.5); 0.95 (m, 1); 1.8 (m, 1); 2.3 (m, 1); 3.65 (s, 3); 4.2-4.35 和 4.8-4.95 (m, 2); 5.85 (s, 0.5); 5.95 (s, 0.5); 6.9-7.6 (m, 5).	

1.13	-0.18 (s, 1.5); 0.0 (s, 1.5); -0.1-0.2 (m, 1); 0.75 (m, 1); 0.9 (m, 0.5); 1.0 (m, 0.5); 1.75 (m, 1); 3.7 (s, 3); 5.1 (m, 2); 5.75 (s, 0.5); 5.9 (s, 0.5); 6.9-7.6 (m, 5); 7.85 (t, 1).	
1.27	质谱: 378 (M+1; 相应于 M+H ⁺); 441 (M+64; 相应于 M+MeCN+Na ⁺)	
1.60a		132-135
1.61a		117-119
1.63a	质谱: 416 (M+1; 相应于 M+H ⁺).	
1.78a		140-141
1.84		119-121
1.85		131-133
1.94a		74-77
1.96a	0.0 (d, 3); 0.4-2.1 (m, 13); 2.9 (m, 1); 3.9 (s, 3); 6.85 (t, 1); 7.1-7.2 (m, 2); 7.3 (m, 1); 7.6 (br. 1); 7.8 (br. 1); 8.0 (br. 1)	
1.98a	0.0 (s, 3); 0.05 (s, 3); 0.45 (m, 2); 0.75 (m, 2); 1.2-2.0 (m, 5); 2.55 (d, 2); 4.0 (s, 3); 6.9 (t, 1); 7.1-7.3 (m, 3); 7.9-8.0 (m, br, 2); 8.1 (br. s, 1)	
3.3	0.0 (s, 9); 0.22 (m, 1); 0.7 (m, 1); 1.8 (m, 1); 7.15 (m, 2), 7.3 (m, 1), 7.45 (m, 1); 8.2 (d, 1), 8.3 (d, 1); 8.55 (broad s + m, 2).	
5.3		61-64
5.60a		118-119
13.3		98-99
21.3	0.0 (s, 9); 0.22 (m, 1); 0.9 (m, 2); 0.9 (m, 1); 1.7 (m, 1); 3.72 (s, 3); 6.95 (s, 1); 7.05 (m, 2), 7.2 (m, 1), 7.3 (s, 1); 8.05 (broad s, 1); 8.15 (d, 1).	
21.51a		88-92
28.2	-0.1 (m, 1); 0.0 (s, 9); 0.75 (m, 2), 1.6 (m, 1); 3.95 (broad, 2); 6.65 (m, 2); 7.0 (m, 2).	
28.4	0.0 (s, 9); 0.1 (m, 1); 0.9 (m, 2); 2.0 (m, 1), 6.9 (d, 1); 7.2 (m, 3).	
28.5	0.0 (s, 9); 0.1 (m, 1); 0.9 (m, 1); 1.1 (m, 1); 2.0 (m, 1); 6.5 (m, 1); 6.9 (m, 3); 7.2 (m, 2); 7.3 (m, 3); 7.5 (m, 3); 7.9 (d, 2).	
28.24a	质谱: 234 (M+1; 相应于 M + H ⁺);	

	275 (M+42; 相应于 M+MeCN+H ⁺).	
28.63a	0.0 (s, 3); 0.1 (s, 3); 0.45 (t of d, 1); 0.7 (t, 2); 0.9 (m, 1); 1.2 (m, 1); 1.5 (m, 1); 1.85 (m, 1); 2.1 (m, 1), 2.5 (m, 1); 3.65 (broad s, 2); 6.65 (d, 1); 6.75 (t, 1); 6.95 (t, 1); 7.1 (d, 1).	
28.82a	0.0 (s, 6); 0.6 (m, 2); 1.8 (m, 2); 2.2 (m, 2); 3.9 (very broad s, 2); 5.6 (s, 1); 6.6 (m, 2); 6.85 (m, 1); 6.95 (m, 1).	
28.83a	0.0 (s, 6); 0.6 (m, 2); 1.8 (m, 2); 2.2 (m, 2); 5.4 (s, 1); 7.15-7.8 (m, 4).	
28.86a	-0.1 (s, 1.5); 0.0 (s, 1.5), 0.4-2.1 (m, 13); 2.6 (m, 1); 3.4 (br, 2); 6.6 (d, 1), 6.7 (t, 1); 6.9 (t, 1); 7.1 (d, 1).	
28.88		黄色油状物
28.89	质谱: 384 (M+1 ; 相应于 M+H ⁺).	黄色油状物
28.90	质谱: 220 (M+1 ; 相应于 M+H ⁺).	黄色油状物

本发明的化合物可以根据下面的反应流程制备, 其中除非另有说明, 各变量的定义如上面对于式 (I) 化合物的定义。

存在大量可供选择的制备式 (I) 化合物的方法。

方法 A

在强碱[例如 NaH 或六甲基二硅氮烷基钠]存在下, 在干燥极性溶剂[优选 THF]中以及在-10°C 至溶剂沸点的温度[优选环境温度]下, 通过式 (II) 化合物[其中 A 是 NH₂、NHCH(O)、任选取代的 (C₁₋₄) 烷基 C(=O)NH 或任选取代的 (C₁₋₄) 烷基 OC(=O)NH]与式 Het-C(=O)OR' 化合物[其中 R' 是 C₁₋₅ 烷基]反应可制备式 (I) 化合物。J. Wang 等 [Synlett 2001, 1485] 的文献详细描述了类似制备法。当 A 是 NHCH(O)、任选取代的 (C₁₋₄) 烷基 C(=O)NH 或任选取代的 (C₁₋₄) 烷基 OC(=O)NH; 且需要其中 R¹ 是 H 的式 (I) 化合物时, 那么必需随后根据方法 E 进行水解。

方法 B

在惰性有机溶剂[如乙酸乙酯、二氯甲烷、二氧六环、THF 或 DMF]以及-10°C 至溶剂沸点的温度[优选环境温度]下, 可通过式 (II) 化合物[其中 A 如上方法 A 中定义]与式 Het-C(=O)R'' 化合物[其中 R'' 是 OH 或离去基团, 如 Cl、Br、F 或 OC(=O)C₁₋₄ 烷基]反应而制备式 (I) 化

合物。如果 R¹ 是 OH，那么在活化剂 [例如 BOP-Cl] 和两当量碱 [比如叔胺、无机碳酸盐或碳酸氢盐] 存在下进行反应。可供选择的是，如果 R¹ 是离去基团，那么该反应在至少一当量碱 [例如吡啶、叔胺、无机碳酸盐或碳酸氢盐；当 A 是 NHCH(O)、任选取代的 (C₁₋₄) 烷基 C(=O)NH 或任选取代的 (C₁₋₄) 烷基 OC(=O)NH 时，强碱如 NaH 或六甲基二硅氮烷基钠] 存在下进行。如果需要其中 R¹ 是 H 的式 (I) 化合物，那么必需随后根据方法 B 进行水解。

方法 C

在溶剂 [比如卤化溶剂 (例如二氯甲烷)、醚、乙酸乙酯、DMF 或甚至水 (作为两相混合物，任选在相转移催化剂比如硫酸氢四丁基铵存在下)] 中，在碱 [比如叔胺、碱金属碳酸盐、碱金属碳酸氢盐、碱金属氢氧化物或 NaH；尽管当 L¹ 是 O(CO)C₁₋₄ 烷基时，无需碱仅简单加热即可] 存在下，通过式 (I) 化合物 [其中 R¹ 是氢] 与式 R¹-L¹ [其中 R¹ 如上定义但不是氢；以及 L¹ 是离去基团比如 Cl、Br、I、磺酸酯 (例如甲磺酸酯或对甲苯磺酸酯) 或 OC(O)C₁₋₄ 烷基] 化合物反应而制备式 (I) 化合物 [其中 R¹ 如上定义但是不氢]。

方法 D

在 Cu(I) 化合物和非质子性溶剂 [比如环醚，如二氧六环] 存在下，升温且优选回流，通过式 (II) 化合物 [其中 A 是卤原子，优选溴或碘] 与式 Het-C(=O)NH₂ 化合物反应而制备式 (I) 化合物。优选使用的 CuI 相对于式 (II) 化合物为 2% 至 100% 摩尔/摩尔，存在 1,2-二胺 (比如 1,2-二氨基环己烷或乙二胺) 作为配体-形成物且存在至少一当量的碱 (比如碱金属碳酸盐或碱金属磷酸盐)。A. Klapars 等的文献 J. Am. Chem. Soc. 123, 7727 (2001) 详细描述了类似的制备法。

方法 E

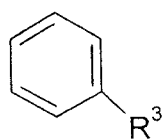
可由式 (I) 化合物 [其中 R¹ 如上定义但不是氢] 经酸或碱水解制备式 (I) 化合物 [其中 R¹ 是氢]。为了此目的，在适当溶剂、优选可与水混溶的溶剂 [例如 THF、二氧六环、低级醇或水自身] 中在环境温度或升温下，用含水酸或碱例如 HCl, HBr 或有机氢氧化物 [比如钠-、钾-

钙-或钡-氢氧化物]处理化合物。

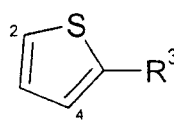
方法 F

由式(II)化合物[其中 A 是 $N=C(C_6H_5)_2$]通过将 A 转化 NH_2 为可制备式(I)化合物[其中 R^1 是氢], 例如根据 J. Ahman 等 Tetrahedron Letters 38, 6363 (1997)描述的方法并进行方法 A 或方法 B, 优选不必分离或纯化中间体。

文献中公开了在苯环或噻吩环上没有额外取代基的许多式(III)或(IV)化合物(R^3 如上定义)。

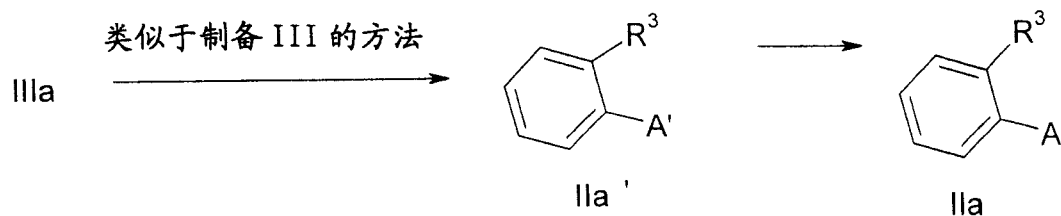


(III)



(IV)

可通过将适当的官能团 A' 引入式(III)或(IV)化合物以及如果需要将其转化为所需的官能团 A 而制备式(II)化合物。可供选择和优选地, 式(II)化合物可通过类似于文献中制备化合物(III)和(IV)的方法而制备, 其中起始原料在适当位置已具有取代基 A' ; 这些化合物优选为(IIIa)和(IVa)。通常必须修饰反应条件和试剂的化学计量以适应所述额外的取代基 A' 。之后, 根据已知方法将 A' (需要的话) 转化为 A 以生成式(II)化合物。下面的流程图图示了优选的合成策略并进一步描述如下:



步骤 1:

下面文献中描述了一些制备式(III)化合物的适当方法, 式(III)化合物可在修改的条件下与适当起始物一起用于制备式(IIa')化合

物: :

J. Org. Chem. 65, 8919 (2000); Tetrahedron 49, 8487 (1993); J. Org. Chem. 51, 2206 (1986), J. Org. Chem. 56, 3109 (1991); Acta chem. Scand. 53, 493 (1999); J. Am. Chem. Soc. 123, 10899 (2001); Org. Lett. 4, 2225 (2002); Tetrahedron 57, 2847 (2001); Tetrahedron Letters 42, 6137 (2001); Tetrahedron Letters 36, 3119 (1995); EP 696592; EP 713878; FR 2689893; Bull. Chem. Soc. Jpn. 64, 1461 (1991); W09214692; J. Org. Chem. 67, 6869 (2002); Pesticide Science 52, 138 (1998); Izv. Akad. Nauk, Ser. Khim. 1996, 955; 1995, 2475;); Tetrahedron Letters 33, 2295 (1992); Organometallics 11, 1428 (1992); 10, 528 (1991); Ann. Chem. 1979, 1915; J. Orgmet. Chem. 341, 133 (1988); Zeitschrift f. Anorg. Allg. Chem. 459, 37 (1979); Tetrahedron Letters 22, 4449 (1981); US3125637; J. Org. Chem. 65, 3135 (2000)。

A'是A基团, 如上定义, 或A基团的前体, 其与步骤1的反应条件相兼容并可通过已知的化学方法转化为A。特别有价值的前体基团是游离的或被保护的羟基或被保护的氨基。有用的酚和苯胺的保护基参见例如 T. W. Green and P. G. M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis 3rd edition p. 503-614 (Wiley 1999)。

步骤 2: 根据 A'的性质, 可将式(IIa')化合物转化为式(IIa)化合物(其中 A=NH₂) [例如催化氢化或化学还原(A'是硝基)或脱保护(A'是被保护的氨基)]。式(IIa)化合物(A=OSO₂CF₃)可通过脱去被保护的OH的保护基(如果A'是被保护的OH)并将所得化合物(IIa') (A=OH)与三氟甲磺酸酐和适宜的碱一起转化为三氟甲磺酸酯而制备。式(IIa)化合物(A是OSO₂CF₃或卤原子)可在进一步的步骤中通过使用描述于J. Ahman 等 Tetrahedron Letters 38, 6363 (1997)和 X. Huang 等, Org. Lett. 3, 3417 (2001)及其中所引用的文献中的方法转化为式(IIa)化合物(A=NH₂)。

令人惊奇地, 现已发现, 为了实践的目的, 新型的式(I)化合物对

于保护植物抵抗由真菌以及细菌和病毒引起的病害具有有利的活性谱。

式(I)化合物可以用于农业部门和相关领域用作控制植物虫害的活性成分。这些新颖的化合物以低施用率、植物的良好耐受性和环境安全性而著称。它们具有非常有效的治疗、预防和内吸性的性质并用于保护许多栽培植物。式I化合物可以用于抑制或消灭那些存在于不同的有用植物作物或植物部分(果实、花、叶、茎、块茎、根)上的害虫,同时保护那些后来生长的植物部分免受植物病源性微生物的侵害。

还可使用式(I)化合物作为处理植物繁殖材料(特别是种子(果实、块茎、谷粒)和植物插条(例如稻))的拌种剂以防止真菌侵染和抵抗土壤中存在的植物病源性真菌。

此外,根据本发明的化合物可以用来控制相关领域的真菌,例如在工业材料的保护中,包括木材和与木材相关的工业品,在食品贮藏中,在卫生管理中等。

式(I)化合物例如可有效抵抗下列类型的植物病源性真菌:半知菌纲(例如葡萄孢属、稻梨孢(*pyricularia*)、长蠕孢属、镰孢属、壳针孢属、尾孢属和链格孢属)和担子菌纲(例如丝核菌属、驼孢锈菌属、柄锈菌属)。此外,它们还有效地抵抗子囊菌纲(例如黑星菌属和白粉菌属、叉丝单囊壳属、链核盘菌属、钩丝壳属)和卵菌纲(例如疫霉属、腐霉属、单轴霉属)。已经观察到抗白粉菌(白粉菌属)的突出活性。此外,式I的新型化合物有效地抵抗致植物病源性细菌和病毒(例如抗黄单孢菌属、假单胞菌属、解淀粉欧文氏菌和抗烟草花叶病毒)。

在本发明范围内,所保护的目标作物通常包含下列植物物种:谷类(小麦、大麦、黑麦、燕麦、米、玉米、高粱和相关物种);甜菜(糖用甜菜和饲用甜菜);梨果、核果和浆果(苹果、梨子、李子、桃子、杏仁、油嘴、草莓、覆盆子和黑莓);豆类植物(豆、小扁豆、豆类、大豆);油料植物(油菜、芥末、罌粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆、落花生);黄瓜植物(南瓜、黄瓜、甜瓜);纤维植物(棉花、亚麻、大麻纤维、黄麻);柑桔类水果(桔子、柠檬、柚子、中国柑桔);

蔬菜(菠菜、莴苣、芦笋、卷心菜、胡萝卜、洋葱、番茄、马铃薯、辣椒粉);樟科(鳄梨、樟属、樟脑)或植物比如烟草、坚果、咖啡、茄子、甘蔗、茶叶、胡椒、藤、酒花、香蕉和天然橡胶植物以及观赏植物。

式(I)化合物直接或优选地与制剂领域常用助剂一起使用。为此目的,它们被方便地经已知方法配制成浓缩乳剂、可涂覆糊剂、可直接喷雾的或可稀释的溶液、稀释乳剂、可湿性粉剂、可溶性粉剂、粉剂、颗粒以及还有例如在聚合物中的胶囊。与组合物的类型一样,根据预定目的和流行情况选择施用方法,比如喷雾、雾化、喷粉、分散、涂雾或浇泼。该组合物还可包含其它助剂比如稳定剂、消泡器、粘度调节剂、粘合剂或增粘剂以及肥料、微量营养素供体或可获得特殊效果的其它制剂。

合适的载体和助剂可以是固体或液体以及制剂工艺中有用的物质,例如天然的或再生矿物质、溶剂、分散剂、润湿剂、增粘剂、增稠剂、粘合剂或肥料。这些载体例如描述于W097/33890中。

式(I)化合物通常以组合物形式使用并可以施用于所处理的作物区域或植物,同时或先后使用其它化合物。这些其它化合物例如可以是肥料或微量营养素供体或影响植物生长的其它制剂。它们还可以是选择性除草剂和杀虫剂、杀真菌剂、杀菌剂、杀线虫剂、杀软体动物剂或若干这些制剂的混合,如果需要还可含有其它载体、表面活性剂或制剂领域常规采用的施用促进助剂。

式(I)化合物可以与其它杀真菌剂混合,在一些情况下导致意外的协同活性。特别优选的混用组分为唑类如戊环唑、BAY 14120、双苯三唑醇、糠菌唑、环唑醇、噁醚唑、烯唑醇、氟环唑、腈苯唑、氟唑唑、氟硅唑、粉唑醇、己唑醇、抑霉唑、酰胺唑、种菌唑、叶菌唑、腈菌唑、稻瘟酯(penfurazoate)、戊菌唑、啉斑肟、咪鲜胺、丙环唑、硅氟唑,戊唑醇、氟醚唑、三唑酮、三唑醇、氟菌唑、灭菌唑;嘧啶甲醇类如三环苯嘧醇、氯苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇;2-氨基嘧啶类如乙嘧啶磺酸酯、二甲嘧啶、乙嘧啶;吗啉类如十二环吗啉、苯锈啉、丁苯吗啉、螺环菌胺,十三吗啉;苯胺基嘧啶类如嘧菌环胺、嘧菌胺、嘧霉

胺；吡咯类如拌种咯、咯菌腈；苯基酰胺类如苯霜灵、咪霜灵、甲霜灵、R-甲霜灵(R-metalaxyl)、甲咪酰胺、噁霜灵；苯并咪唑类如苯菌灵、多菌灵、咪菌威、麦穗宁、噻菌灵；二甲酰亚胺如乙菌利、菌核利、异菌脲、甲菌利、腐霉利、乙烯菌核利；甲酰胺类如萎锈灵、甲咪酰苯胺、氟酰胺、灭锈胺、氧化萎锈灵、噻咪菌胺；胍类如谷种定、多果定、双胍辛醋酸盐；嗜球果伞素如啞菌酯(azoxystrobin)、醚菌酯(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metominostrobin)、二甲苯氧菌胺、肟菌酯(trifloxystrobin)、吡菌酯(picoxystrobin)、BAS 500F(推荐名：吡克菌酯(pyraclostrobin))、BAS 520；二硫代氨基甲酸酯类如福美铁、代森锰锌、代森锰、代森联、丙森锌、福美双、代森锌、福美锌；N-卤代甲基硫代四氢邻苯二甲酰亚胺类如敌菌丹、克菌丹、苯氟磺胺、氟菌核利、灭菌丹、甲苯氟磺胺；铜化合物如波尔多液、氢氧化铜、王铜、硫酸铜、氧化低铜、代森锰铜、喹啉铜；硝基苯酚衍生物如二硝巴豆酸酯、间硝酞异丙酯；有机磷衍生物如克瘟散、异稻瘟净、稻瘟灵、稻病磷、吡啶磷、甲基立枯磷；各种其它化合物如甲基噻二唑素(活化酯-S-methyl)，敌菌灵、benthiavalicarb、灭瘟素-S、灭螨猛、地茂散、百菌清、cyflufenamid、霜脲氟、二氯萘醌、啞菌清、氟硝胺、乙霉威、烯酰吗啉、SYP-LI90(推荐名：flumorph)、二噻农、噻唑菌胺、土菌灵、噁唑菌酮(famoxadone)、咪唑菌酮、氟菌胺、毒菌锡、啞菌脲、氟啶胺、磺菌胺、环酰菌胺、乙磷铝、噁霉灵、异丙菌胺(iprovalicarb)、IKF-916(氟唑磺菌胺(cyazofamid))、春雷霉素、磺菌威、metrafenone、nicobifen、戊菌隆、四氯苯酞、多氧霉素、烯丙异噻唑、丙酰胺、咯喹酮、苯氧喹啉、五氯硝基苯、硫磺、啞菌嗪、三环唑、嗪胺灵、稻纹散、苯酰菌胺(zoxamide)(RH7281)。

施用式(I)化合物或包含至少一种所述化合物的农药组合物的优选方法是叶面施用。施用的频率和施用量取决于相应病原的侵害风险。然而，式I化合物也可以通过用液体制剂浸湿植物的生长地，或通过将其固体形式例如颗粒形式的化合物施用于土壤(土壤施用)，经土壤通过根部渗透到植物(内吸作用)。在水稻作物中，颗粒可以施用于灌水

的稻田。也可以通过用杀真菌剂的液体制剂浸渍种子或块茎，或用固体制剂涂覆它们，将式 I 化合物施用于种子(包衣)。

制剂[即，包含式(I)化合物的组合物]以及如果需要固体或液体助剂根据已知方式制备，典型地，通过紧密混合和/或研磨化合物与填充剂例如溶剂、固体载体和任意的表面活性化合物(表面活性剂)来制备。

农药制剂通常包含 0.1 至 99%重量、优选 0.1 至 95%重量的式 I 化合物，99.9 至 1%重量、优选 99.8 至 5%重量的固体或液体助剂，0 至 25%重量、优选 0.1 至 25%重量的表面活性剂。

有利的施用量通常为 5g 至 2kg 活性成分(a.i.)每公顷(ha)，优选 10g 至 1kg a. i. /ha，最优选 20g 至 600g a. i. /ha。当用作拌种剂时，方便的剂量为 10mg 至 1g 活性物质每 kg 种子。

尽管优选将商业产品配制成浓缩物，但最终用户通常将使用稀释制剂。

下面非限定实施例更详细地举例说明了上述发明。

实施例 1

本实施例举例说明了化合物 No. 28.83a、28.63a 和 1.61a 的制备。

步骤 A: 1,1-二甲基-3-(2'-硝基)苯基-硅杂环己烯-2 [化合物 28.83a]。

氮氛中，将 2-硝基-苯基乙炔(根据 Synthesis 1980,627 制备)(25g)、1,1-二甲基-1-硅杂环丁烷(21.9ml)和 PdCl₂((Ph₃P)₂ (9.5g) 在 450 ml 干燥甲苯中回流 3 小时。冷却至室温后蒸发溶剂并在 1.3kg 硅胶上层析残留物(51.8g)(洗脱剂: 己烷: 乙酸乙酯:: 39:1)。分离出橄榄绿色油状物(19.9g)，其含有(根据 nmr) 60% 的化合物 28.83a。该物质直接用于下面步骤中。

步骤 B: 1,1-二甲基-3-(2'-氨基)苯基-硅杂环己烷 [化合物 28.63a]。

大气压和室温下，将步骤 A 的产物在 THF 中经 Pd (10%负载于碳上)氢化。滤除催化剂，蒸发溶剂并在硅胶上层析(洗脱剂: 己烷: 乙酸

乙酯::19:1)得到化合物 28.63a (5.75g)。

步骤 C: 化合物号 1.61a

将化合物号 28.63a (0.17g)溶于 THF (5ml)中。冰冷却下,加入 N-甲基-3-二氟甲基-4-氯羰基-吡唑(0.15g)然后加入吡啶(0.062ml)。搅拌所得白色悬浮物过夜,倾至水上,使用乙酸乙酯萃取并经硫酸钠干燥。蒸发溶剂,残留物(0.3g)在硅胶上层析(洗脱剂:己烷:乙酸乙酯::2:1)得到化合物 No.1.61a (0.26g)。于 117-119°C 融化。

使用类似的反应步骤[但起始使用 1-甲基-1-乙基-硅杂环丁烷或 1-甲基-1-乙烯基-硅杂环丁烷替代 1,1-二甲基-1-硅杂环丁烷]制备化合物号 28.87a、28.86a 和 1.96a。

实施例 2

本实施例举例说明了化合物 No.28.82a 和 1.94a 的制备

步骤 A: 1,1-二甲基-3-(2'-氨基)苯基-硅杂环己烯-2 [化合物 28.82a]。

将实施例 1 步骤 A 的产物(1.5g)溶于乙醇(50ml;50%体积)中并加入铁粉(1.5g)。加热所得悬浮液至回流。于此温度下,在 10 分钟内加入溶于乙醇(3.5ml,50%体积)中的 HCl (0.35ml; 2N), 所得混合物回流过夜。冷至室温后,过滤悬浮液,使用碳酸氢盐中和、乙酸乙酯萃取并经硫酸钠干燥。蒸发溶剂并在硅胶上层析(洗脱剂:己烷:乙酸乙酯::9:1)得到化合物 28.82a (0.14g)。

还分离出 2-氨基-苯乙烯(0.06g)和 1-烯丙基-二甲基甲硅烷基-2-(2'-氨基苯基)-乙烯(0.12g)为副产物。

步骤 B: 化合物 1.94a。

如实施例 1 步骤 C 所述,由 1,1-二甲基-3-(2'-氨基)苯基-硅杂环己烯-2 [化合物 28.83a] (0.12g)和 N-甲基-3-三氟甲基-4-氯羰基-吡唑(0.12g)制备该化合物。得到 0.17g 灰白色结晶,于 74-77°C 融化。

实施例 3

本实施例举例说明了化合物 No. 28.4、28.5、28.2 和 5.3 的制备。

步骤 A: 反式-1-(2'-三氟甲磺酰氧基-苯基)-2-三甲基甲硅烷基-环丙烷 [化合物 28.4]。

于 0-5°C, 将反式-1-(羟基-苯基)-2-三甲基甲硅烷基-环丙烷 (2.9g) [根据 Org. Letters 4, 2225 (2002) 制备] 于吡啶中 (15ml) 用三氟甲磺酐处理 (2.55ml)。首先于此温度搅拌该混合物 90 分钟, 然后再于室温搅拌 90 分钟。用水后处理, 乙酸乙酯萃取, 硫酸钠干燥, 除去溶剂并在硅胶上层析 (洗脱剂: 己烷: 乙酸乙酯:: 19: 1), 得到化合物 28.4 (4.4g), 其用于下一步骤。

步骤 B: 反式-1-(2'-二苯基亚甲基亚氨基-苯基)-2-三甲基甲硅烷基-环丙烷 [化合物 28.5]。

通过氮气鼓泡 15 分钟小心地使干燥的 THF (40ml) 脱气。氮氛中, 依次加入二乙酸铯 (0.15g)、rac. BINAP (0.65g) 和二苯酮亚胺 (2.3ml)。室温搅拌 30 分钟后, 加入碳酸铯 (5.1g) 并回流该混合物过夜。冷却后, 将悬浮液倾至水 (80ml) 上, 使用乙酸乙酯萃取两次, 经硫酸钠干燥并除去溶剂。残留物 (6.05g 深绿色油状物) 在硅胶上层析 (洗脱剂: 己烷: 乙酸乙酯:: 19: 1) 得到化合物 28.5 (3.55g), 其用于下一步骤。

步骤 C: 反式-1-(2'-氨基-苯基)-2-三甲基甲硅烷基-环丙烷 化合物 28.2

将化合物 28.5 (3.5g) 溶于甲醇 (95ml) 中, 然后依次加入乙酸钠 (1.9g) 和盐酸羟胺 (1.2g)。室温搅拌 75 分钟后, 将该混合物倾至氢氧化钠 (500ml, 0.1N 水溶液) 中并使用乙酸乙酯萃取两次。如步骤 B 后处理并将半固态残留物 (3.8g) 于硅胶上层析 (洗脱剂: 己烷: 乙酸乙酯:: 9: 1) 得到化合物 28.2 (1.9g), 为油状物。

步骤 D: 化合物 5.3

如实施例 1 步骤 C 所述, 由反式-1-(2'-氨基-苯基)-2-三甲基甲硅烷基-环丙烷 [化合物 28.2] (0.25g) 和 2-甲基-4-三氟甲基-4-氯羰基-噻唑 (0.28g) 制备该化合物。得到 0.45g 灰白色结晶, 于 61-64

℃融化。

实施例 4

本实施例举例说明了化合物 No. 3.3 的制备。

将 N-甲基-4-三氟甲基-3-吡咯甲酸 (0.24g)、化合物 28.2 (0.25g) 和三乙胺 (0.34ml) 溶于干燥的二氯甲烷 (25ml) 中, 使用冰冷却并用二-(2-氧代-3 噁唑烷基-次膦酰氯 (0.31g) 处理。在冰浴中搅拌所得悬浮液 1h 并于室温搅拌 15 小时。然后使用乙酸乙酯 (250ml) 稀释并加入饱和碳酸氢钠溶液 (125ml)。分离有机相并使用硫酸钠干燥。除去溶剂并在硅胶上层析 (洗脱剂: 己烷: 乙酸乙酯:: 2: 1) 残留物 (0.45g 黄色油状物) 得到化合物 2.3 (0.2g), 为油状物。

实施例 5

本实施例举例说明化合物 No. 1.84 的制备。

根据类似于 Sonagashira (Synthesis 1980, 627) 所述的方法由 2-氨基-4'-溴联苯制备 2-氨基-(4'-三甲基甲硅烷基乙炔基) 联苯。该化合物与 N-甲基-3-三氟甲基-4-羧基-吡唑以类似于实施例 1 步骤 C 所述的方法反应得到酰胺 (m. p. 151-153°C)。然后将该酰胺 (0.5g) 溶于 THF (10ml) 中并在室温和大气压于 Pd (0.1g; 10%负载于碳上) 上氢化。过滤该反应混合物除去催化剂并蒸发溶剂。残留物 (0.52g 灰白色结晶) 于硅胶上层析 (洗脱剂: 己烷: 乙酸乙酯:: 2: 1) 得到化合物 1.84 (0.43g) (mp. 119-121°C)。

实施例 6

本实施例举例说明书化合物 No. 1.12 和 1.13 的制备。

将化合物 No. 1.4 (1g) [以类似于实施例 3 步骤 D 的方式通过使用 N-甲基-3-二氟甲基-4-羧基吡唑作为化合物 No. 28.2 的偶联部分而制备] 溶解于干燥的 THF (50ml) 并小心加入氢氧化钠 (0.13g, 为在矿油中的 55% 悬浮液)。于环境温度搅拌该反应混合物 2.5 小时, 然后在加入炔丙基溴 (0.23g) 并于氮氛中搅拌该混合物过夜。所得悬浮液经乙酸乙酯 (200ml) 稀释并使用水洗涤, 硫酸钠干燥然后蒸发溶剂。残余物 (1.25g 黄色油状物) 在硅胶上层析 (洗脱剂: 己烷: 乙酸乙酯:: 2: 1) 得

到化合物 No. 1.12 (0.47g) 和化合物 No. 1.13 (0.52g), 均为浅黄色油状物。

实施例 7

本实施例举例说明化合物 No. 1.4 纯对映体的制备。

将外消旋化合物 No. 1.4 [参见实施例 6 制备] (0.1g 每次进样) 在制备型手性 HPLC 柱上分离, 条件如下: 柱: Chiracel™ OD (Daicel™) 5x50; 洗脱剂: 正己烷/2-丙醇 70:30; 流速: 30 ml/min。人工分离 2 个峰后蒸发溶剂。残留物置于异丙醇中并过滤。蒸发溶剂得到纯对映体; 化合物 No. 1.4A [比旋光度: -89.1 (c=12.4g/l)] 和化合物 No. 1.4B [比旋光度: +87.7 (c=11.1g/l)], 各自为无色油状物。

式(I)化合物的制剂实施例

制备式 I 化合物的制剂比如乳油、溶液、颗粒剂、粉剂和可湿性粉剂的工艺方法描述于 W097/33890 中。

生物实施例: 杀真菌作用

实施例 B-1: 抵抗隐匿柄锈菌/小麦的活性(小麦叶锈病(Brownrust))

在喷雾室中, 使用配制的测试化合物 (0.02% 活性化合物) 处理一周龄小麦植株 cv. Arina。施用一天后, 该小麦植株通过在测试植株上喷雾孢子悬浮液 (1×10^5 个夏孢子/ml) 接种。于 20°C 和 95% r.h. 温育 2 天后, 将该植物置于 (20°C 和 60%) 温室中 8 天。评价接种后 10 天的发病率。

各自使用化合物 1.3、1.4、1.60a、1.61a、1.84、5.3 和 21.3 均基本上完全抑制了侵染 (0-5% 侵染)。

实施例 B-2: 抵抗苹果白粉病菌/苹果的活性(苹果白粉病)

使用配制的测试化合物 (0.02% 活性成分) 处理 5 周龄苹果幼苗 cv. McIntosh。一天后, 通过在测试植株上振摇感染白粉菌的植物而接种所施药的苹果植株。于 22°C 和 60% r.h.、14/10 小时 (光照/黑暗) 的光照方案温育 12 天后, 评价发病率。

化合物 1.3、1.4、1.60a、1.61a、1.84、5.3 和 21.3 各自显示了

强效力 (<20% 感染)。

实施例 B-3: 抵抗禾白粉菌/大麦的活性(大麦白粉病)

在喷雾室中, 使用配制的测试化合物 (0.02% 活性化合物) 处理一周龄大麦植株 cv. Regina。施用一天后, 通过在测试植株上振摇感染白粉菌的植物而接种该大麦植株。在温室中于 20°C / 18°C (白天/黑夜) 和 60% r. h. 培养 6 天后评价发病率。

化合物 1.3、1.4、1.60a、1.61a、1.84、5.3 和 21.3 各自显示了强效力 (<20% 感染)。

实施例 B-4: 抵抗灰葡萄孢 / 西红柿的活性 (西红柿葡萄孢属感染)

在喷雾室中, 使用配制的测试化合物 (0.02% 活性化合物) 处理 4 周龄的西红柿植株 cv. Roter Gnom。施用两天后, 该西红柿植株通过对测试植物喷雾孢子悬浮液 (1×10^5 个分生孢子/ml) 接种。在生长室中于 20°C 和 95% r. h. 培养 4 天后评价发病率。

化合物 1.3、1.4、1.60a、1.61a 和 1.84 各自显示了良好的效力 (<50% 发病率)。

实施例 B-5: 抵抗马铃薯早疫链格孢 (Alternaria solani) / 西红柿的活性 (西红柿早疫病)

在喷雾室中, 使用配制的测试化合物 (0.02% 活性化合物) 处理 4 周龄西红柿植株 cv. Roter Gnom。施用两天后, 该西红柿植株通过对测试植株喷雾孢子悬浮液 (2×10^5 个分生孢子/ml) 接种。在生长室中于 20°C 和 95% r. h. 培养 3 天后评价发病率。

在该测试中, 化合物 1.3、1.4、1.60a 和 1.61a 各自显示了良好的效力 (<20% 发病率)。

实施例 B-6: 抵抗小麦壳针孢 / 小麦的活性(小麦斑枯病)

在喷雾室中, 使用配制的测试化合物 (0.02% 活性化合物) 处理 2 周龄小麦植株 cv. Riband。施用一天后, 小麦植株通过对测试植株喷雾孢子悬浮液 (10×10^5 个分生孢子/ml) 接种。于 23°C 和 95% r. h. 培养 1 天后, 将该植物置于 23°C 和 60% r. h. 的温室中 16 天。评价接种后

18 天的发病率。

在该测试中，化合物 1.3、1.4、1.60a 和 1.61a 各自显示了良好活性(<20%发病率)。

实施例 B-7: 抵抗葡萄钩丝壳 /葡萄的活性 (葡萄白粉病)

在喷雾室中，使用配制的测试化合物(0.02% 活性化合物)处理 5 周龄葡萄幼苗 cv. Gutedel。施用一天后，通过在测试植株上振摇感染白粉菌的植株而接种该葡萄植株。于 26°C 和 60%r.h、14/10 小时(光照/黑暗)的光照方案培养 7 天后，评价发病率。

在该测试中，化合物 1.3、1.4、1.60a 和 1.61a 各自显示了良好活性(<20%发病率)。

实施例 B-8: 抵抗苹果黑星菌/苹果的活性(苹果黑星病)

在喷雾室中，使用配制的测试化合物(0.02% 活性化合物)处理 4 周龄苹果幼苗 cv. McIntosh。施用一天后，苹果植株通过对测试植物喷雾孢子悬浮液(4x10⁵ 个分生孢子/ml)接种。于 21°C 和 95%r.h. 温育 4 天后，将该植株置于 21°C 和 60% r.h. 的温室中 4 天。再于 21°C 和 95% r.h 培养 4 天后，评价发病率。

化合物 1.3、1.4、1.60a 和 1.61a 各自显示了良好效力(<20%感染)。

实施例 B-9: 抵抗隐匿柄锈菌/小麦苹果(小麦叶锈病)

施用两天前，通过对测试植物喷雾孢子悬浮液(1x10⁵ 个夏孢子/ml)接种 1 周龄小麦植株 cv. Arina。在温室中于 20°C 和 95% r.h. 培养 1 天以及 20°C 和 60% r.h. 培养 1 天后，在喷雾室中施用配制的测试化合物处理所接种的植物。在温室中于 20°C/18°C 和 60%r.h. (白天/夜晚)再培养 8 天后，评价发病率。

化合物 1.3、1.4、1.60a、1.61a、1.84、5.3 和 21.3 各自均表现出强效力(<20%感染)。