



[12] 发明专利说明书

[21] ZL 专利号 94194778.5

[45] 授权公告日 2004 年 6 月 2 日

[11] 授权公告号 CN 1152007C

[22] 申请日 1994. 12. 27 [21] 申请号 94194778.5

[30] 优先权

[32] 1994. 1. 5 [33] CH [31] 12/94 - 9

[32] 1994. 7. 1 [33] CH [31] 2117/94 - 0

[86] 国际申请 PCT/EP1994/004318 1994. 12. 27

[87] 国际公布 WO1995/018789 英 1995. 7. 13

[85] 进入国家阶段日期 1996. 7. 5

[71] 专利权人 诺瓦提斯公司

地址 瑞士巴塞尔

[72] 发明人 H. 齐格勒 S. 特拉赫 S. 法罗

R. 泽福洛

审查员 刘桂明

[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 全 菁

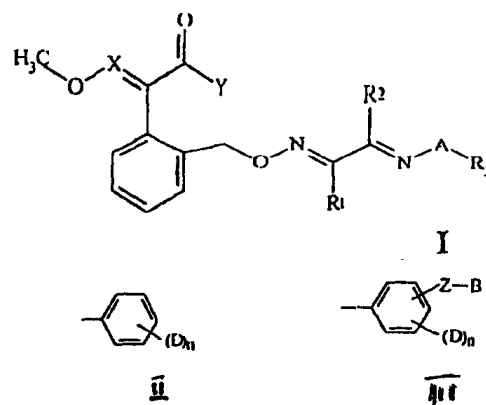
权利要求书 21 页 说明书 92 页

[54] 发明名称 杀虫剂

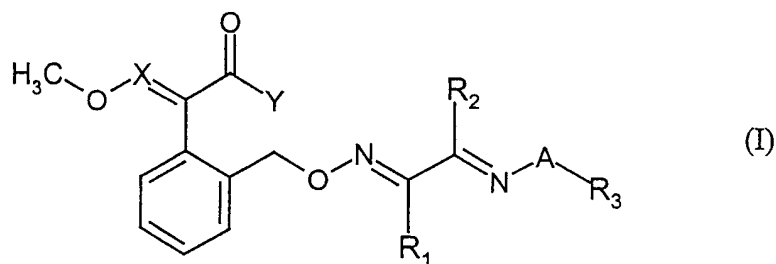
[57] 摘要

式 I 的化合物及它们的可能的异构体和异构体混合物是杀虫的活性成分, 其中或者 a) X 是 N 原子和 Y 是 OR₁₁ 或 N(R₁₂)R₁₃, 或者 b) X 是 CH 和 Y 是 OR₁₁, 而且其中: R₁₁ 是 C₁ - C₄ 烷基; R₁₂ 和 R₁₃ 独立地是氢或 C₁ - C₄ 烷基; A 是 O 原子或基团 NR₄; R₁ 是氢, C₁ - C₄ 烷基, 卤代 C₁ - C₄ 烷基, 环丙基, 氰基或甲硫基; R₂ 是氢, C₁ - C₆ 烷基, C₃ - C₆ 环烷基, 基团 II, 基团 III, 或噻吩基; R₃ 是氢, C₁ - C₆ 烷基, 具有 1 - 5 个卤素原子的 C₁ - C₆ 卤代烷基, C₁ - C₄ 烷氧基 - C₁ - C₂ 烷基, C₂ - C₄ 链烯基 - C₁ - C₂ 烷基, 它是未取代的或被 1 - 3 个卤素原子所取代, C₂ - C₄ 炔基 - C₁ - C₂ 烷基, C₃ - C₆ 环烷基, 它是未取代的或被 1 - 4 个卤素原子所取代, C₃ - C₆ 环烷基 C₁ - C₄ 烷基, 它是未取代的或被 1 - 4 个卤素原子所取代, 氰基 C₁ - C₄ 烷基; C₁ - C₄ 烷氧基羰基 C₁ - C₂ 烷基, C₁ - C₄ 烷氧基氨基甲酰基 C₁ - C₂ 烷基, 苯基 C₁ - C₃ 烷基、它是未取代的或被卤素, C₁ - C₃ 烷基, C₁ - C₄ 烷氧基, C₁ - C₄ 卤代烷基, 氰基, 硝基或 C₁ - C₄ 亚烷基二氧基所取代, 苯基被相同的或不同的取代基单取代至三取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被 C₁ - C₄ 烷基、C₁ - C₄ 烷氧基、卤素, 具有 1 - 3 个卤素原

子的 C₁ - C₂ 卤代烷基, 硝基或氰基单 - 至二 - 取代, 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被 C₁ - C₄ 烷基、C₁ - C₄ 烷氧基、卤素、具有 1 - 3 个卤素原子的 C₁ - C₂ 卤代烷基, 硝基或氰基单 - 至二 - 取代; R₄ 是 C₁ - C₄ 烷基, 苯基, 或 R₃ 和 R₄ 一起与它们所链接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5 - 7 元环, 它是未聚代的或被 C₁ - C₄ 烷基所取代并且能够具有 1 - 3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子, 和其中取代基 Z, B, D 和 n 是如本公开物中所定义。它们能够用于害虫控制, 尤其作为农业、园艺和卫生领域的杀微生物剂、杀虫剂和杀螨剂。



1. 一种式 I 的化合物



和它的可能的异构体和异构体混合物，其中或者

a) X 是 N 原子和

Y 是 OCH_3 或 NHCH_3 ，或者

b) X 是 CH 和

Y 是 OCH_3 ，

而且其中：

A 是 O 原子或基团 NR_4 ；

R_1 是 C_1 - C_4 烷基；环丙基；氰基或甲硫基；

R_2 是氢； C_1 - C_6 烷基； C_3 - C_6 环烷基；苯基，它是未被取代的或独立地被卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 C_3 - C_6 链烯氧基、 C_3 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_4 亚烷基二氧基、氰基或硝基单-至二-取代；噻吩基；

R_3 是氢； C_1 - C_6 烷基；具有 1-5 个卤素原子的 C_1 - C_6 卤代烷基； C_1 - C_4 烷氧基 C_1 - C_2 烷基； C_2 - C_4 链烯基 C_1 - C_2 烷基，它是未取代的或被 1-3 个卤素原子取代； C_2 - C_4 炔基 C_1 - C_2 烷基； C_3 - C_6 环烷基，它是未被取代的或被 1-4 个卤素原子取代； C_3 - C_6 环烷基 C_1 - C_4 烷基，它是未被取代的或被 1-4 个卤素原子取代；氰基- C_1 - C_4 烷基；

C_1 - C_4 烷氧基羰基 C_1 - C_2 烷基；苯基 C_1 - C_3 烷基，它是未被取代的或被卤

素、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷基、氰基、硝基、 C_1 - C_4 亚烷基二氧基取代，苯基被相同的或不同的取代基单-至三-取代是可能的；苯基，它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 卤代烷基，硝基或氰基单-至二-取代；吡啶基，它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 卤代烷基，硝基或氰基单-至二-取代；

R_4 是 C_1 - C_4 烷基，苯基，或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5-7 元环，它是未取代的或被 C_1 - C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子。

2. 根据权利要求 1 的式 I 化合物，其中

X 是 CH 或 N,

Y 是 OCH_3 ,

A 是 O 或 $N-R^4$,

R_1 是甲基，环丙基或甲硫基；

R_2 是甲基；环丙基；苯基，它是未被取代的或独立地被卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、被 1-5 个卤素原子取代的 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 C_3 - C_6 链烯氧基、 C_3 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_4 亚烷基二氧基、氰基或硝基单-至二-取代；或噻吩基；和其中

R_3 是如式 I 中所定义，和

R_4 是甲基或基，或

R_3 和 R_4 与它们所键接的氮原子一起是吡咯烷，哌啶，吗啉，硫代吗啉，六亚甲基亚胺，咪唑，吡唑，吡咯，1, 2, 4-三唑或 1, 2, 3-三唑。

3. 根据权利要求1的式I化合物, 其中

X 是 N,

Y 是 NHCH_3 ,

A 是 O 或 N-R^4 ,

R_1 是甲基, 环丙基或甲硫基;

R_2 是甲基; 环丙基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、被 1-5 个卤素原子取代的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链烯氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 炔氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 亚烷基二氧基、氰基或硝基单-至二-取代; 或噻吩基; 和其中

R_3 是如式 I 中所定义, 和

R_4 是甲基或苯基, 或

R_3 和 R_4 与它们所键接的氮原子一起是吡咯烷, 哌啶, 吗啉, 硫代吗啉, 六亚甲基亚胺, 咪唑, 吡唑, 吡咯, 1, 2, 4-三唑或 1, 2, 3-三唑。

4. 根据权利要求1的式I化合物, 其中:

A 是 O,

R_1 是甲基,

R_2 是甲基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、被 1-5 个卤素原子取代的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链烯氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 炔氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 亚烷基二氧基、氰基或硝基单-至二-取代; 或噻吩基; 和其中

R_3 是 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基。

5. 根据权利要求1的式I化合物, 其中

R_1 是甲基,

R_2 是甲基和

R_3 是如权利要求 1 所描述和

R_4 是甲基或苯基, 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5-7 元环, 它是未取代的或被 C_1 - C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子。

6. 根据权利要求 1 的式 I 化合物, 其中

R_3 是氢; C_1 - C_4 烷基; 具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_4 卤代烷基; C_1 - C_2 烷氧基 C_1 - C_2 烷基; 丙烯基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子取代; 炔丙基; C_3 - C_6 环烷基; C_3 - C_6 环烷基甲基, 它是未被取代的或被 1-2 个卤素原子取代; 氰基- C_1 - C_2 烷基; C_1 - C_2 烷氧基羰基 C_1 - C_2 烷基; 苯基 C_1 - C_2 烷基, 它是未被取代的或被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基; 氰基、硝基或 C_1 - C_2 亚烷基二氧基取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至二-取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基, 氰基或硝基单-至二-取代; 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基, 氰基或硝基单-至二-取代;

R_4 是甲基或苯基; 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5-7 元环, 它是未取代的或被 C_1 - C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子。

7. 根据权利要求 6 的式 I 化合物, 其中

R_3 和 R_4 与它们所键接的氮原子一起是三唑基, 吗啉基, 2, 6-二甲基吗啉基, 丫庚因基, 哌啶基或吡咯烷基。

8. 根据权利要求1的式I化合物, 其中

A 是 O 原子,

R₁ 是甲基,

R₂ 是甲基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基、被 1-5 个卤素原子取代的 C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 卤代烷氧基、C₃-C₆ 链烯氧基、C₃-C₆ 炔氧基、C₁-C₄ 亚烷基二氧基、氰基或硝基单-至二-取代; 或噻吩基; 和

R₃ 是氢; C₁-C₄ 烷基; 具有 1-3 个卤素原子的 C₁-C₄ 卤代烷基; C₁-C₂ 烷氧基 C₁-C₂ 烷基; 丙烯基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子取代; 炔丙基; C₃-C₆ 环烷基; C₃-C₆ 环烷基甲基, 它是未被取代的或被 1-2 个卤素原子取代; 氰基-C₁-C₆ 烷基; C₁-C₂ 烷氧基羰基 C₁-C₂ 烷基; 苯基 C₁-C₂ 烷基, 它是未被取代的或被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氰基、硝基或 C₁-C₂ 亚烷基二氧基取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至二-取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氰基或硝基单-至二-取代; 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氰基或硝基单-至二-取代。

9. 根据权利要求8的式I化合物, 其中

A 是氧原子,

R₁ 是甲基,

R₂ 是甲基, 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单-至二-取代; 和

R₃ 是甲基。

10. 根据权利要求1的式I化合物, 其中:

A 是 NCH_3 ,

R_1 是甲基,

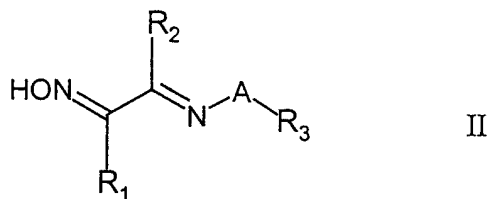
R_2 是甲基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单-至二-取代;

R_3 是甲基; 苯基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有1-3个卤素原子的卤代甲基、氰基或硝基单-或二-取代; 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有1-3个卤素原子的卤代甲基、氰基或硝基单-至二-取代。

11. 一种用来控制害虫的组合物, 它包含作为活性成分的一种根据权利要求1-10之一的化合物和合适的载体。

12. 控制和防止害虫的方法, 它包括对害虫或它们的环境施用根据权利要求1-10之一的化合物。

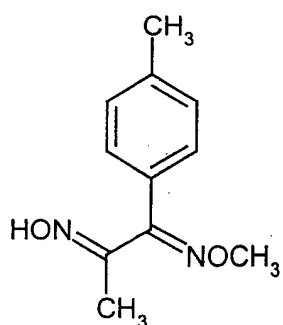
13. 式II的化合物



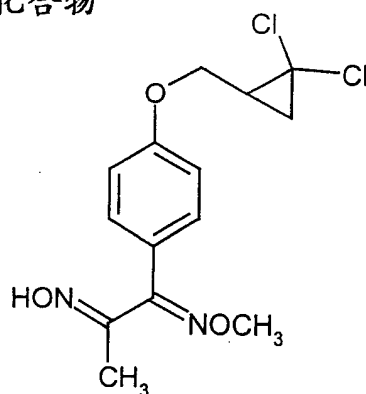
其中

A 和 R_1 - R_3 如权利要求1中式I的定义, 除了 R_1 是甲硫基的化合物。

14. 根据权利要求 13 的式 II.1 和 II.2 化合物

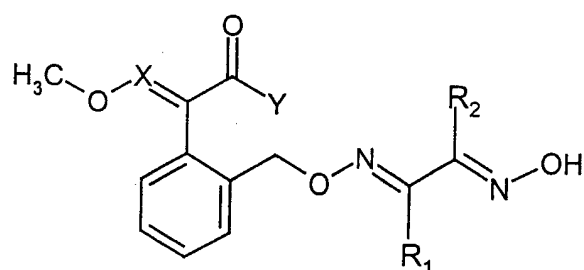


II.1



II.2

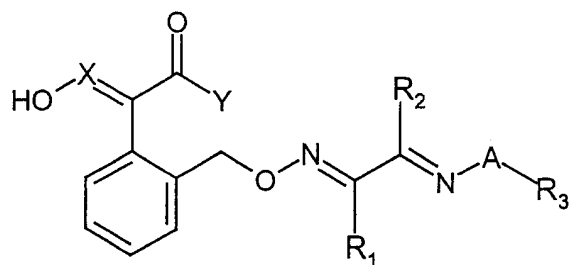
15. 式 IV 化合物, 其中



IV

其中 X, Y, A, R_1 和 R_2 如权利要求 1 中式 I 的定义。

16. 式 VII 的化合物



VII

其中

a) X 是 N 原子和

Y 是 OR_{11} 或 $N(R_{12})R_{13}$, 或者

b) X 是 CN 和

Y 是 OR_{11} ,

而且其中:

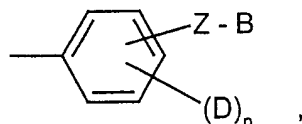
R_{11} 是 C_1 - C_4 烷基;

R_{12} 和 R_{13} 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;

A 是 O 原子或基团 NR_4 ;

R_1 是 C_1 - C_4 烷基, 卤代 C_1 - C_4 烷基, 环丙基, 氰基或甲硫基;

R_2 是氢, C_1 - C_6 烷基, C_3 - C_6 环烷基, 基团



或噻吩基;

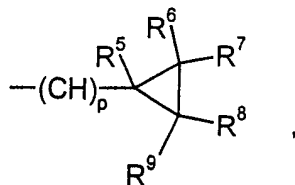
D 基团是相同的或不同的并且是氢, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_2 卤代烷基, C_1 - C_2 卤代烷氧基, C_3 - C_6 链烯氧基, C_3 - C_6 炔氧基, C_1 - C_4 亚烷基二氧基, 氰基或硝基;

n 是 0, 1, 2, 3 或 4;

Z 是 $-O-$, $-O-(C_1-C_4 \text{ 烷基})$, $-(C_1-C_4 \text{ 烷基})-O-$, $-S(O)_m-$, $-(C_1-C_4 \text{ 烷基})-S(O)_m-$, $-S(O)_m-(C_1-C_4 \text{ 烷基})-$,

m 是 0, 1 或 2,

B 是 C_1 - C_6 烷基, 卤代 C_1 - C_6 烷基, C_3 - C_6 环烷基, 或者是 C_2 - C_6 链烯基或 C_2 - C_4 炔基 C_1 - C_2 烷基, 它们中的每一个是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, 或者是芳基或杂环基, 这两个中的每一个相互独立地是未取代的或被 C_1 - C_6 烷基, 卤代 C_1 - C_6 烷基, 卤素, C_1 - C_6 烷氧基或卤代 C_1 - C_6 烷氧基单-至五-取代, 或基团



或三甲基甲硅烷基;

R_5 , R_6 , R_7 , R_8 和 R_9 相互独立地是氢, C_1 - C_4 烷基或卤素和
 p 是 0, 1, 2 或 3;

R_3 是氢, C_1 - C_6 烷基, 具有 1-5 个卤素原子的 C_1 - C_6 卤代烷基, C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_2 烷基, C_2 - C_4 链烯基- C_1 - C_2 烷基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, C_2 - C_4 炔基- C_1 - C_2 烷基, C_3 - C_6 环烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, C_3 - C_6 环烷基 C_1 - C_4 烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, 氰基 C_1 - C_4 烷基;

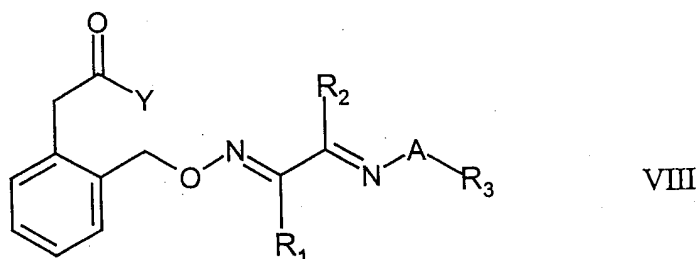
C_1 - C_4 烷氧基羰基 C_1 - C_2 烷基, C_1 - C_4 烷氧基氨基甲酰基 C_1 - C_2 烷氧基, 苯基 C_1 - C_3 烷基, 它们是未被取代的或被卤素、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷基、氰基、硝基、 C_1 - C_4 亚烷基二氧基取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至三-取代是可能的;

苯基, 它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 卤代烷基, 硝基或氰基单-至二-取代, 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 烷卤代烷基, 硝基或氰基单-至二-取代;

R_4 是 C_1 - C_4 烷基, 苯基, 或

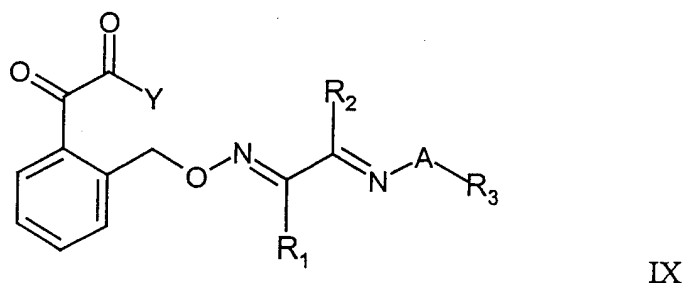
R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5-7 元环, 它是未取代的或被 C_1 - C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子.

17. 式 VIII 的化合物



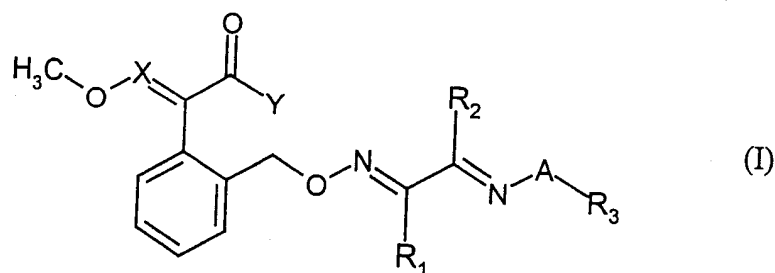
式中 A, Y 和 R_1 - R_3 如权利要求 16 中的式 VII 所定义。

18. 式 IX 的化合物



式中 A, Y 和 R_1 - R_3 如权利要求 16 中的式 VII 所定义。

19. 式 I 化合物



和它的可能的异构体和异构体混合物, 其中或者

a) X 是 N 原子和

Y 是 OCH_3 或 $NHCH_3$, 或者

b) X 是 CH 和

Y 是 OCH_3 ,

而且其中:

A 是 O 原子或基团 NR_4 ;

R_1 是卤代- C_1 - C_4 烷基;

R_2 是 C_1 - C_4 烷基或环烷基;

R_3 是氢; C_1 - C_6 烷基; 具有 1-5 个卤素原子的 C_1 - C_6 卤代烷基; C_1 - C_4 烷氧基 C_1 - C_2 烷基; C_2 - C_4 链烯基 C_1 - C_2 烷基, 它是未取代的或被 1-3 个卤

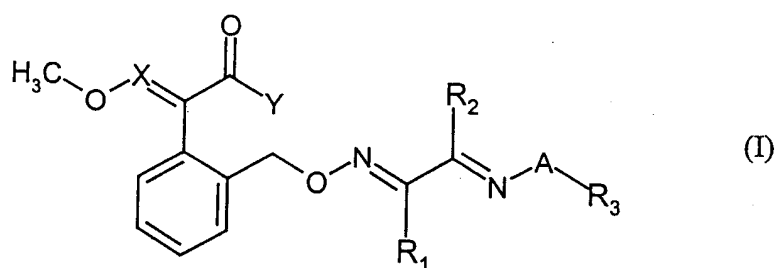
素原子取代; C_2-C_4 炔基 C_1-C_2 烷基; C_3-C_6 环烷基, 它是未被取代的或被 1-4 个卤素原子取代; C_3-C_6 环烷基 C_1-C_4 烷基, 它是未被取代的或被 1-4 个卤素原子取代; 氰基- C_1-C_4 烷基;

C_1-C_4 烷氧基羰基 C_1-C_2 烷基; 苯基 C_1-C_3 烷基, 它是未被取代的或被卤素、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基、氰基、硝基、 C_1-C_4 亚烷基二氧基取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至三-取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_2 卤代烷基, 硝基或氰基单-至二-取代; 吡啶基, 它是未取代的或独立地被 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_2 卤代烷基, 硝基或氰基单-至二-取代;

R_4 是 C_1-C_4 烷基, 苯基, 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5-7 元环, 它是未取代的或被 C_1-C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子。

20. 式 I 化合物



和它的可能的异构体和异构体混合物, 其中或者

X 是 CH;

Y 是 OCH_3 ;

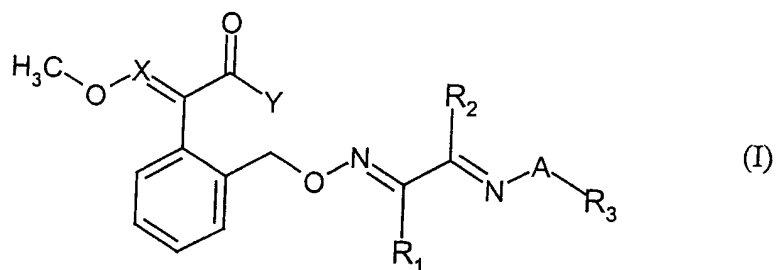
R_1 是 CH_3 ;

A 是氧;

R_2 是 4-甲基苯基或 4-烯丙氧基苯基或 4-(3-三氟甲基苄氧基)苯基或 4-(2,2-二氯环丙基甲氧基)苯基和

R_3 是 CH_3 。

21. 式 I 化合物



和它的可能的异构体和异构体混合物, 其中或者

a) X 是 N 原子和

Y 是 OR_{11} 或 $N(R_{12})R_{13}$, 或者

b) X 是 CH 和

Y 是 OR_{11} ,

而且其中:

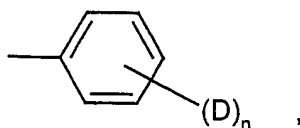
R_{11} 是 C_1 - C_4 烷基;

R_{12} 和 R_{13} 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;

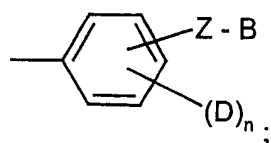
A 是 O 原子或基团 NR_4 ;

R_1 是 C_1 - C_4 烷基, 卤代 C_1 - C_4 烷基, 环丙基, 氰基或甲硫基;

R_2 是基团



基团

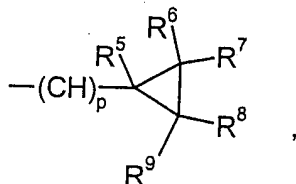


D 基团是相同的或不同的并且是 C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_2 卤代烷氧基, C_3 - C_6 炔氧基, C_1 - C_4 亚烷基二氧基;

n 是 0, 1, 2, 3 或 4;

Z 是 $-(C_1-C_4 \text{ 烷基})-O-$, $-S(O)_m-$, $-(C_1-C_4 \text{ 烷基})-S(O)_m-$, $-S(O)_m-(C_1-C_4 \text{ 烷基})-$, m 是 0, 1 或 2,

B 是卤代 C_1 - C_6 烷基, C_3 - C_6 环烷基, 或者是 C_2 - C_6 链烯基或 C_2 - C_4 炔基 C_1 - C_2 烷基, 它们中的每一个是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, 或者是芳基或杂环基, 这两个中的每一个相互独立地是未取代的或被 C_1 - C_6 烷基, 卤代 C_1 - C_6 烷基, 卤素, C_1 - C_6 烷氧基或卤代 C_1 - C_6 烷氧基单-至五-取代, 或基团



或三甲基甲硅烷基;

R_5 , R_6 , R_7 , R_8 和 R_9 相互独立地是氢, C_1 - C_4 烷基或卤素和

p 是 0, 1, 2 或 3;

R_3 是氢, C_1 - C_6 烷基, 具有 1-5 个卤素原子的 C_1 - C_6 卤代烷基, C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_2 烷基, C_2 - C_4 链烯基- C_1 - C_2 烷基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, C_2 - C_4 炔基- C_1 - C_2 烷基, C_3 - C_6 环烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, C_3 - C_6 环烷基 C_1 - C_4 烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, 氰基 C_1 - C_4 烷基;

C_1 - C_4 烷氧基羰基 C_1 - C_2 烷基, C_1 - C_4 烷氧基氨基甲酰基 C_1 - C_2 烷氧基, 苯基 C_1 - C_3 烷基, 它们是未被取代的或被卤素、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷基、氰基、硝基、 C_1 - C_4 亚烷基二氧基取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至三-取代是可能的;

苯基, 它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有

1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 卤代烷基, 硝基或氰基单-至二-取代, 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 烷卤代烷基, 硝基或氰基单-至二-取代;

R_4 是 C_1 - C_4 烷基, 苯基, 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5-7 元环, 它是未取代的或被 C_1 - C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子。

22. 根据权利要求 21 的式 I 化合物, 其中:

X 是 N 原子;

Y 是 OR_{11} ;

R_{11} 是 C_1 - C_4 烷基; 和其中

A, R_1 , R_2 和 R_3 如权利要求 21 中所定义。

23. 根据权利要求 21 的式 I 化合物, 其中

X 是 N 原子;

Y 是 $N(R_{12})R_{13}$;

R_{12} 和 R_{13} 独立地是氢原子或 C_1 - C_4 烷基; 和其中

A, R_1 , R_2 和 R_3 如权利要求 21 中所定义。

24. 根据权利要求 21 的式 I 化合物, 其中 X = C 双键是 E 形式。

25. 根据权利要求 21 的式 I 化合物, 其中或者

a) X 是 N 原子和

Y 是 OCH_3 或 $NHCH_3$, 或者

b) X 是 CH 和

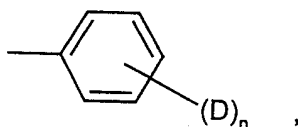
Y 是 OCH_3 ,

而且其中:

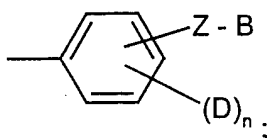
A 是 O 原子或基团 NR_4 ;

R_1 是 C_1 - C_4 烷基, 卤代 C_1 - C_4 烷基, 环丙基, 氰基或甲硫基;

R_2 是基团



或基团



D 基团是相同的或不同的并且是 C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_2 卤代烷基, C_3 - C_6 链烯氧基, C_1 - C_4 亚烷基二氧基;

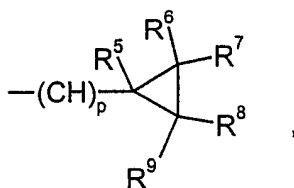
n 是 0, 1, 2, 3 或 4;

Z 是 $-(\text{C}_1\text{-C}_4 \text{ 烷基})\text{-O-}$, $-\text{S}(\text{O})_m-$, $-(\text{C}_1\text{-C}_4 \text{ 烷基})\text{-S}(\text{O})_m-$, $-\text{S}(\text{O})_m\text{-(C}_1\text{-C}_4 \text{ 烷基})\text{-}$,

m 是 0, 1 或 2,

B 是卤代 C_1 - C_6 烷基, C_3 - C_6 环烷基,

或者是 C_2 - C_6 链烯基或 C_2 - C_4 炔基 C_1 - C_2 烷基, 它们中的每一个是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, 或者是芳基或杂环基, 或芳基或杂环基, 这些基团中的每一个相互独立地被 C_1 - C_6 烷基, 卤代 C_1 - C_6 烷基, 卤素, C_1 - C_6 烷氧基或卤代 C_1 - C_6 烷氧基单取代至五取代, 或基团



R_5 , R_6 , R_7 , R_8 和 R_9 相互独立地是氢, C_1 - C_4 烷基或卤素和

p 是 0, 1, 2 或 3;

R_3 是氢, C_1 - C_6 烷基, 具有 1-5 个卤素原子的 C_1 - C_6 卤代烷基, C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_2 烷基, C_2 - C_4 链烯基- C_1 - C_2 烷基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, C_2 - C_4 炔基- C_1 - C_2 烷基, C_3 - C_6 环烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, C_3 - C_6 环烷基 C_1 - C_4 烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, 氰基 C_1 - C_4 烷基;

C_1 - C_4 烷氧基羰基 C_1 - C_2 烷基, 苯基 C_1 - C_3 烷基, 它是未取代的或被卤素, C_1 - C_3 烷基, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 卤代烷基, 氰基, 硝基, C_1 - C_4 亚烷基二氧基所取代, 苯基被相同的或不同的取代基单取代至三取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 卤代烷基, 硝基或氰基单-至二-取代, 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 卤代烷基, 硝基或氰基单-至二-取代;

R_4 是 C_1 - C_4 烷基或苯基, 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和 5-7 元环, 它是未取代的或被 C_1 - C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子。

26. 根据权利要求 25 的式 I 化合物, 其中

X 是 N, 和

Y 是 OCH_3 .

27. 根据权利要求 25 的式 I 化合物, 其中

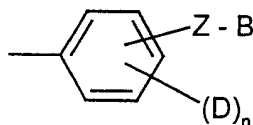
X 是 CH.

28. 根据权利要求 25 的式 I 化合物, 其中
 X 是 N,
 Y 是 NHCH_3 和
 R_1 是 CH_3 , 环丙基或 CN .

29. 根据权利要求 25 的式 I 化合物, 其中
 A 是 O, NCH_3 或 $\text{n-C}_6\text{H}_5$.

30. 根据权利要求 25 的式 I 化合物, 其中
 R^1 是甲基, 环丙基或氰基.

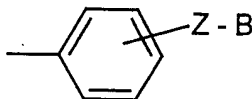
31. 根据权利要求 25 的式 I 化合物, 其中
 R_2 是基团



和

Z 是 $-(\text{C}_1\text{-C}_4 \text{ 烷基})\text{-O-}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{-}$, $-(\text{C}_1\text{-C}_4 \text{ 烷基})\text{-S}(\text{O})_2\text{-}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{-(C}_1\text{-C}_4 \text{ 烷基})\text{-}$.

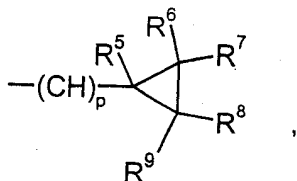
32. 根据权利要求 25 的式 I 化合物, 其中
 R^2 是基团



和

B 是卤代 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基, 或者是 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 链烯基或 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基, 它们中的每一个是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, 或者是芳基, 或被 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基, 卤代 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基, 卤素, $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷氧基或卤代 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷氧基单

独立地单-或二-取代的芳基, 或者是基团



R_5 , R_6 , R_7 , R_8 和 R_9 相互独立地是氢, C_1 - C_4 烷基或卤素和 p 是 0, 1, 2 或 3.

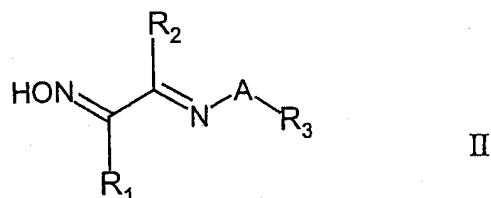
33. 根据权利要求 25 的式 I 化合物, 其中 R_2 是苯基, 它在 4-位被 -Z-B 取代.

34. 根据权利要求 21 的式 I 化合物的制备方法, 它包括:

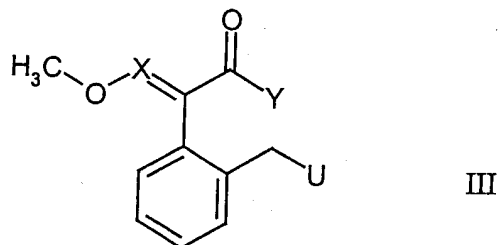
A) 为了制备其中 Y 是 $N(R_{12})R_{13}$ 的式 I 化合物, 其中 Y 是 OR_{11} 的式 I 化合物与 $HN(R_{12})R_{13}$ 在 $0-40^\circ\text{C}$ 下在溶剂中反应;

B) 为了制备其中 X, Y, A 和 R_1 - R_3 如权利要求 21 中所定义(和其中 R_3 不是氢)的式 I 化合物:

让通式 II 的肟



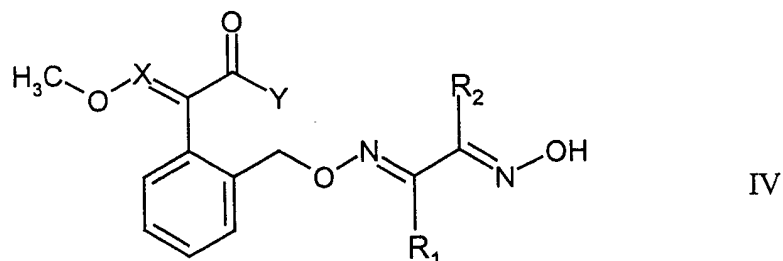
式中 A 和 R_1 - R_3 如上所定义, 与通式 III 的苄基衍生物反应



式中 X 和 Y 如上所定义的 U 是离去基团, 反应在惰性有机稀释剂中, 在碱存在下和在有或没有相转移催化剂存在下, 在 $0-50^\circ\text{C}$ 下进行;

C)为了制备其中 A 是氧和 X, Y 和 R_1 - R_3 如权利要求 21 中所定义的式 I 化合物:

让通式 IV 的肟



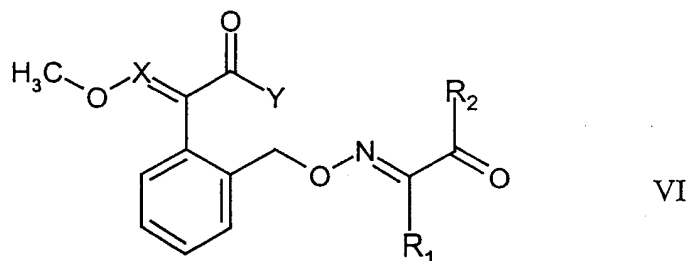
式中 X, Y, R_1 和 R_2 如上所定义, 与通式 V 的化合物反应



式中 R_3 如式 I 下所定义和 U 如式 III 下所定义(R_3 既不是氢, 也不是苯基或吡啶基);

D)为了制备其中 X, Y, R_1 和 R_2 如权利要求 21 中所定义的式 IV 化合物:

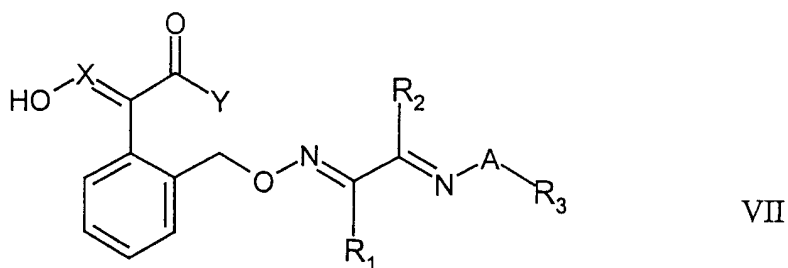
让通式 VI 的酮



式中 X, Y, R_1 和 R_2 如上所定义, 与羟基胺或其盐如卤在溶剂中于 0-50 °C 下反应;

E)为了制备其中 A, X, Y 和 R_1 - R_3 如权利要求 21 中所定义(且 R_3 不是氢)的式 I 化合物:

让通式 VII 的烯醇或肟



式中 A, X, Y 和 R_1 - R_3 如上所定义, 与甲基化试剂如甲基碘, 硫酸二甲酯或重氮甲, 在碱存在下在合适的溶剂中反应。

35. 一种用来控制害虫的组合物, 它包含作为活性成分的一种根据权利要求 21-33 之一的化合物和合适的载体。

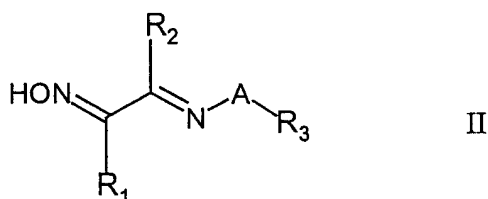
36. 根据权利要求 21 的式 I 化合物的用途, 其用于控制害虫。

37. 一种控制和防止害虫的方法, 它包括对害虫或它们的环境施用根据权利要求 21-33 之一的化合物。

38. 根据权利要求 37 的方法, 其中种子被处理。

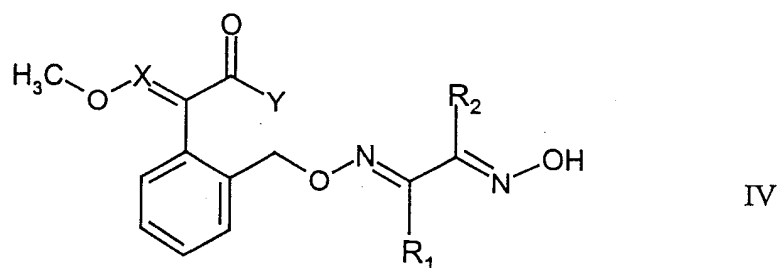
39. 已根据权利要求 38 处理过的种子。

40. 式 II 的化合物



其中 A 和 R_1 - R_3 如权利要求 21 的式 I 中的定义, 除了 R_1 为甲硫基的化合物。

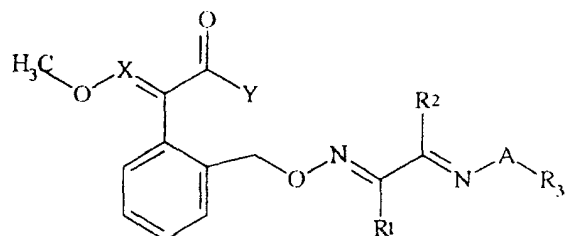
41. 式 IV 的化合物



其中 X, Y, R₁ 和 R₂ 如权利要求 21 的式 I 中的定义, 除了 R₁ 为甲硫基的化合物。

杀虫剂

本发明涉及式 I 的新型杀虫活性化合物



I

和涉及它们的可能的异构体和异构体混合物，其中或者

a) X 是 N 原子和 Y 是 OR_{11} 或 $N(R_{12})R_{13}$ ，或者

b) X 是 CH 和 Y 是 OR_{11} ，

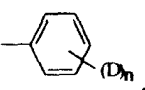
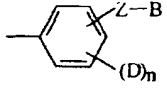
而且其中：

R_{11} 是 C_1 - C_4 烷基；

R_{12} 和 R_{13} 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基；

A 是 O 原子或基团 NR_4 ；

R_1 是氢， C_1 - C_4 烷基，卤代 C_1 - C_4 烷基，环丙基，氰基或甲硫基；

R_2 是氢， C_1 - C_6 烷基， C_3 - C_6 环烷基，基团 , 基团 , 或噻吩基；

D 基团是相同的或不同的并且是氢， C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 烷氧基， C_1 - C_2 卤代烷基， C_1 - C_2 卤代烷氧基， C_3 - C_6 链烯氧基， C_3 - C_6 炔氧基， C_1 - C_4 亚烷基二氧基，氰基或硝基；

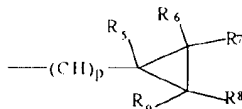
n 是 0, 1, 2, 3 或 4；

Z 是 -O-, -O- $(C_1$ - C_4 烷基)-, - $(C_1$ - C_4 烷基)-O-, -S(O) $_m$ -, - $(C_1$ - C_4 烷基)-S(O) $_m$ -, -S(O) $_m$ - $(C_1$ - C_4 烷基)-,

m 是 0, 1 或 2，

B 是 C_1 - C_6 烷基，卤代 C_1 - C_6 烷基， C_3 - C_6 环烷基，或者是 C_2 - C_6 链烯基或

C_2-C_4 炔基 C_1-C_2 烷基, 它们中的每一个是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, 或者是芳基或杂环基, 这两个中的每一个相互独立地是未取代的或被 C_1-C_6 烷基, 卤代 C_1-C_6 烷基, 卤素, C_1-C_6 烷氧基或卤代 C_1-C_6 烷氧基



单-至五-取代的, 或基团, 或三甲基甲硅烷基;

R_5 , R_6 , R_7 , R_8 和 R_9 相互独立地是氢, C_1-C_4 烷基或卤素和 p 是 0, 1, 2 或 3;

R_3 是氢, C_1-C_6 烷基, 具有 1-5 个卤素原子的 C_1-C_6 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_2 烷基, C_2-C_4 链烯基- C_1-C_2 烷基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, C_2-C_4 炔基- C_1-C_2 烷基, C_3-C_6 环烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, C_3-C_6 环烷基 C_1-C_4 烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, 氧基 C_1-C_4 烷基; C_1-C_4 烷氧基羰基 C_1-C_2 烷基, C_1-C_4 烷氧基氨基甲酰基 C_1-C_2 烷基, 苯基 C_1-C_3 烷基, 它是未取代的或被卤素, C_1-C_3 烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 卤代烷基, 氧基, 硝基或 C_1-C_4 亚烷基二氧基所取代, 苯基被相同的或不同的取代基单取代至三取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_2 卤代烷基, 硝基或氧基单-至二-取代, 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_2 卤代烷基, 硝基或氧基单-至二-取代;

R_4 是 C_1-C_4 烷基, 苯基, 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5 - 7 元环, 它是未取代的或被 C_1-C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子;

满足如下条件的式 I 化合物除外: 其中, 如果

X 是 CH,

Y 是 OCH_3 ,

A 是 O 原子,

R_1 是氢和

R_3 是甲基; 那么

R_2 不是仅由一个或多个氯原子取代的苯基。

根据本发明的化合物具有杀霉菌、杀螨和杀虫特性，并适合作为活性成分用于农业、园艺和卫生领域。

本发明还涉及制备本发明化合物的方法，和涉及包含此类化合物作为活性成分的杀霉菌、杀螨和杀虫组合物，和涉及此类化合物和组合物在控制植物病原菌、蜱螨目和昆虫方面的用途和在防止此类病害的侵袭方面的用途。

如果在式 I 的化合物中存在不对称碳原子, 该化合物以光学活性形式存在。该化合物在任何情况下以[E]和/或[Z]形式存在, 仅仅因为存在脂族, 肟基和亚肟基双键。而且, 可存在旋转对映异构现象(atropisomerism)。式 I 是想包括所有这些可能的异构形式和它们的混合物, 例如外消旋混合物, 和任何[E/Z]混合物。

WO90/07493 公开了作为杀霉菌剂的醛亚胺基和酮亚胺基-氧基-邻甲基丙烯酸酯的甲基酯, 其结构与本发明化合物不同。

除非另有定义, 前面和后面使用的一般术语是指以下意义:

卤素是氟, 氯, 溴或碘, 特别是氟, 氯或溴, 尤其是氟或氯。

烷基或者是直链的, 例如甲基, 乙基, 正丙基, 正丁基, 正己基, 正辛基, 正癸基, 正十二烷基, 正十六烷基或正十八烷基, 或者是支化的, 例如异丙基, 异丁基, 仲丁基, 叔丁基, 异戊基, 新戊基或异己基。

链烯基是直链的或支化的链烯基, 例如乙烯基, 1-甲基乙烯基, 烯丙基, 1-丁烯基, 异丙烯基, 尤其是烯丙基。

炔基例如是乙炔基, 1-丙炔基或1-丁炔基, 尤其是炔丙基。

环烷基应理解为环丙基, 环丁基, 环戊基或环己基。

卤素取代的基团如卤代烷基和卤代烷氧基能够被相同的或不同的取代基部分地或全部地卤化。卤代烷基的例子是被氟、氯和/或溴单-至三-取代的甲基, 如 CHF_2 , CF_3 或 CH_2Cl ; 被氟、氯和/或溴单-至五-取代的乙基, 如 CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF 或 CClFCHClF ; 三氟甲基是非常优选的。

直链 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 亚烷基二氧基是 $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$, $-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-$, $-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-$ 或 $-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-$ 。

芳基例如是苯基或萘基, 尤其是苯基。

杂环基是具有 1-3 个选自 N, O 和 S 的杂原子的 5 - 7 元芳族或非芳族环。优选的是有氮原子作为杂原子的和, 如果合适, 有其它杂原子(优选氮或硫, 尤其是氮)的芳族 5-和 6-元环。

术语“由 R_3 和 R_4 一起与它们所链接的氮原子形成的 5 - 7 元环”尤其

包括吡咯烷，哌啶，吗啉，硫代吗啉，六亚甲基亚胺，咪唑，吡唑，吡咯，1,2,4-三唑，1,2,3-三唑，四唑，异恶唑，恶唑，异恶唑烷，恶唑烷，噻唑，异噻唑，噻唑啉和异噻唑烷。

在本发明的范围内优选的是

(1) 式 I 的化合物, 其中或者

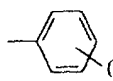
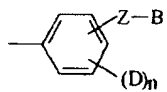
a) X 是 N 原子和 Y 是 OCH_3 或 NHCH_3 , 或者

b) X 是 CH 和 Y 是 OCH_3 ,

而且其中:

A 是 O 原子或基团 NR_4 ;

R_1 是氢, $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基, 卤代 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基, 环丙基, 氰基或甲硫基;

R_2 是氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ 环烷基, 基团 , 基团 , 或噻吩基;

D 基团是相同的或不同的并且是氢, $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基, $\text{C}_1\text{-C}_2$ 卤代烷基, $\text{C}_1\text{-C}_2$ 卤代烷氧基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链烯氧基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ 炔氧基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ 亚烷基二氧基, 氰基或硝基;

n 是 0, 1, 2, 3 或 4;

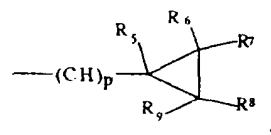
Z 是 $-\text{O}-$, $-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})-$, $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})-\text{O}-$, $-\text{S}(\text{O})_m-$, $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})-\text{S}(\text{O})_m-$, $-\text{S}(\text{O})_m-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})-$,

m 是 0, 1 或 2,

B 是 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, 卤代 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ 环烷基,

或者是 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 链烯基或 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基, 它们中的每一个是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, 或者是芳基或杂环基, 或芳基或杂环基, 这些基团中的每一个相互独立地被 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, 卤代 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, 卤素, $\text{C}_1\text{-C}_6$

烷氧基或卤代 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基单取代至五取代, 或基团



R_5 , R_6 , R_7 , R_8 和 R_9 相互独立地是氢, $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基或卤素和 p 是 0, 1, 2 或 3;

R_3 是氢, $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, 具有 1-5 个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 卤代烷基, $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基, $\text{C}_2\text{-C}_4$ 链烯基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基, $\text{C}_3\text{-C}_6$ 环烷基, 它是未取代的或被 1-4

个卤素原子所取代, C_3-C_6 环烷基 C_1-C_4 烷基, 它是未取代的或被 1-4 个卤素原子所取代, 氨基 C_1-C_4 烷基; C_1-C_4 烷氧基羰基 C_1-C_2 烷基, 苯基 C_1-C_3 烷基, 它是未取代的或被卤素, C_1-C_3 烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 卤代烷基, 氨基, 硝基, C_1-C_4 亚烷基二氧基所取代, 苯基被相同的或不同的取代基单取代至三取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_2 卤代烷基, 硝基或氨基单-至二-取代, 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_2 卤代烷基, 硝基或氨基单-至二-取代;

R_4 是 C_1-C_4 烷基或苯基, 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5 - 7 元环, 它是未取代的或被 C_1-C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子;

(2) 式 I 的化合物, 其中 X 是 N 和 Y 是 OCH_3 ;

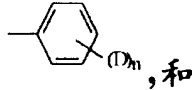
(3) 式 I 的化合物, 其中 X 是 CH;

(4) 式 I 的化合物, 其中 X 是 N, Y 是 $NHCH_3$ 和 R_1 是 H, CH_3 , 环丙基或 CN;

(5) 式 I 的化合物, 其中 A 是 O, NCH_3 或 $n-C_6H_5$, 尤其是 O 或 NCH_3 , 特别是 O;

(6) 式 I 的化合物, 其中 R_1 是氢, 甲基, 环丙基或氨基, 尤其是甲基;

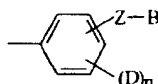
(7) 式 I 的化合物, 其中 R_2 是 C_1-C_4 烷基或环丙基, 尤其是甲基或环丙基;

(8) 式 I 的化合物, 其中 R_2 是基团 , 和

D 是氢, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 烷氧基, 被 1-5 个卤素原子取代的 C_1 - C_2 烷基, C_1 - C_2 卤代烷氧基, C_3 - C_6 链烯氧基, C_3 - C_6 炔氧基, C_1 - C_4 亚烷基二氧基, 氧基或硝基, 或噻吩基,

D 尤其是氟, 氯, 溴, C_1 - C_4 烷基或 CF_3 ;

(9) 式 I 的化合物, 其中 R_2 是基团



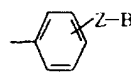
和

Z 是 -O-, -O- $(C_1$ - C_4 烷基)-, - $(C_1$ - C_4 烷基)-O-, -S(O)₂-, - $(C_1$ - C_4 烷基)-S(O)₂-, -S(O)₂- $(C_1$ - C_4 烷基)-,

尤其是 -O-, -CH₂-O- 或 -O-CH₂-,

特别是 -O-CH₂-;

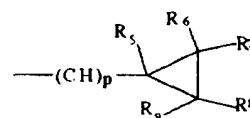
(10) 式 I 的化合物, 其中 R_2 是基团



和

B 是 C_1 - C_4 烷基, 卤代 C_1 - C_4 烷基, 或者是 C_2 - C_6 链烯基或 C_2 - C_4 炔基 C_1 - C_2 烷基, 它们中的每一个是未取代的或被 1-3 个卤素原子所取代, 或者是芳基, 或者是被 C_1 - C_2 烷基, 卤代 C_1 - C_2 烷基, 卤素, C_1 - C_2 烷氧基或卤代

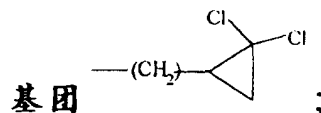
C_1 - C_2 烷氧基独立地单-或二-取代的芳基, 或者是基团



R_5 , R_6 , R_7 , R_8 和 R_9 相互独立地是氢, C_1 - C_2 烷基或卤素和

p 是 0, 1, 2 或 3;

B 尤其是 C_1 - C_2 烷基, 卤代 C_1 - C_3 烷基, 或者是烯丙基或炔丙基, 它们中的每一个是未被取代的或在每一种情况下被 1 个或 2 个卤素原子或 1 个或 2 个甲基取代, 或苯基, 被选自氟、氯、溴和 CF_3 的取代基取代的苯基, 或



(11) 式 I 的化合物, 其中 R_2 是苯基, 它在 4-位上被 -Z-B 取代;

(12) 式 I 的化合物, 其中

R_3 是氢, C_1-C_6 烷基或具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_4 卤代烷基, C_1-C_2 烷氧基 C_1-C_2 烷基, C_1-C_4 烷氧基羰基- C_1-C_2 烷基, 丙烯基, 它是未被取代的或被 1-3 个卤素原子取代, 炔丙基, C_3-C_6 环烷基, 环丙基甲基, 它是未被取代的或被 1-2 个卤素原子取代, 氨基- C_1-C_2 烷基, 苯基 C_1-C_2 烷基, 它是未被取代的或被卤素、甲基、甲氧基或具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基所取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至二-取代是可能的; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基或硝基单-至二-取代; 或吡啶基, 它是未被取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基或硝基单-至二-取代; 或 R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5-7 元环, 它是未被取代的或被 C_1-C_4 烷基取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子;

R_3 优选氢, C_1-C_6 烷基, 具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_4 卤代烷基, C_1-C_2 烷氧基甲基, 丙-2-烯-1-基, 它是未被取代的或被 1-3 个卤素原子取代, 炔丙基, C_3-C_6 环烷基, 环丙基甲基, 它是未被取代的或被 1-2 个氟或氯原子取代, 氨基- C_1-C_2 烷基, 苯基- C_1-C_2 烷基, 它是未被取代的或被卤素、甲基、甲氧基或具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基所取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至二-取代是可能的; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基或硝基单-至二-取代; 或吡啶基, 它是未被取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基或硝基单-至二-取代; 或 R_3 和 R_4 与它们所键接的氮原子一起是 1,2,4-三唑基, 4-吗啉基, 1-吡咯烷基 (azepinyl), 1-哌啶基或 1-吡咯烷基,

R_3 尤其优选是甲基;

(13) 式 I 的化合物, 其中 R_4 是甲基或苯基, 尤其是甲基;

(14) 式 I 的化合物, 其中

X 是 CH; Y 是 OCH_3 ; R_1 是 CH_3 ; A 是 O;

R_2 是 4-甲基苯基或 4-烯丙氧基苯基或 4-(3-三氟甲基苄氧基)苯基或 4-(2,2-二氧环丙基甲氧基)苯基和

R_3 是 CH_3 ;

(15) 式 I 的化合物, 其中或者

a) X 是 N 原子和

Y 是 OCH_3 或 $NHCH_3$, 或者

b) X 是 CH 和

Y 是 OCH_3 ,

而且其中:

A 是 O 原子或基团 NR_4 ;

R_1 是氢; C_1 - C_4 烷基; 环丙基; 氟基或甲硫基;

R_2 是氢; C_1 - C_6 烷基; C_3 - C_6 环烷基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 C_3 - C_6 链烯氧基、 C_3 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_4 亚烷基二氧基、氟基或硝基单-至二-取代; 噻吩基;

R_3 是氢; C_1 - C_6 烷基; 具有 1-5 个卤素原子的 C_1 - C_6 卤代烷基; C_1 - C_4 烷氧基 C_1 - C_2 烷基; C_2 - C_4 链烯基 C_1 - C_2 烷基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子取代; C_2 - C_4 炔基 C_1 - C_2 烷基; C_3 - C_6 环烷基, 它是未被取代的或被 1-4 个卤素原子取代; C_3 - C_6 环烷基 C_1 - C_4 烷基, 它是未被取代的或被 1-4 个卤素原子取代; 氟基- C_1 - C_4 烷基; C_1 - C_4 烷氧基羰基 C_1 - C_2 烷基; 苯基 C_1 - C_3 烷基, 它是未被取代的或被卤素、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷基、氟基、硝基、 C_1 - C_4 亚烷基二氧基取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至三-取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 卤代烷基, 硝基或氟基单-至二-取代; 吡啶基, 它是未取代的或独立地被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、卤素、具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_2 卤代烷基, 硝基或氟基单-至二-取代;

R_4 是 C_1 - C_4 烷基, 苯基, 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5 - 7 元环, 它是未取代的或被 C_1 - C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子;

(16) 式 I 的化合物, 其中

X 是 CH 或 N

Y 是 OCH_3

A 是 O 或 N-R_4

R_1 是甲基, 环丙基或甲硫基;

R_2 是甲基; 环丙基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、被 1-5 个卤素原子取代的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链烯氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 炔氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 亚烷基二氧基、氧基或硝基单-至二-取代; 或噻吩基; 和其中

R_3 是如式 I 中所定义 和

R_4 是甲基或苯基, 或

R_3 和 R_4 与它们所链接的氮原子一起是吡咯烷, 哌啶, 吗啉, 硫代吗啉, 六亚甲基亚胺, 咪唑, 吡唑, 吡咯, 1,2,4-三唑或 1,2,3-三唑。

(17) 式 I 的化合物, 其中:

X 是 N,

Y 是 NHCH_3 ,

A 是 O 或 N-R_4 ,

R_1 是甲基, 环丙基或甲硫基;

R_2 是甲基; 环丙基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、被 1-5 个卤素原子取代的 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 卤代烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链烯氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 炔氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 亚烷基二氧基、氧基或硝基单-至二-取代; 或噻吩基; 和其中

R_3 是如式 I 中所定义 和

R_4 是甲基或苯基, 或

R_3 和 R_4 与它们所链接的氮原子一起是吡咯烷, 哌啶, 吗啉, 硫代吗啉, 六亚甲基亚胺, 咪唑, 吡唑, 吡咯, 1,2,4-三唑或 1,2,3-三唑。

(18) 式 I 的化合物, 其中:

A 是 O,

R_1 是甲基,

R_2 是甲基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、被 1-5 个卤素原子取代的 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷氧基、 C_3-C_6 链烯氧基、 C_3-C_6 炔氧基、 C_1-C_4 亚烷基二氧基、氨基或硝基单-至二-取代; 或噻吩基; 和

R_3 是 C_1-C_6 烷基;

而 X 和 Y 如式 I 中所定义。

(19) 式 I 的化合物, 其中

R_1 是甲基,

R_2 是甲基和

R_3 是如上所描述和

R_4 是甲基或苯基, 或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5 - 7 元环, 它是未取代的或被 C_1-C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子;

而 A, X 和 Y 是如式 I 中所定义。

(20) 式 I 的化合物, 其中:

R_3 是氢; C_1-C_4 烷基; 具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_4 卤代烷基; C_1-C_2 烷氧基 C_1-C_2 烷基; 丙烯基, 它是未取代的或被 1-3 个卤素原子取代; 炔丙基; C_3-C_6 环烷基; C_3-C_6 环烷基甲基, 它是未被取代的或被 1-2 个卤素原子取代; 氨基- C_1-C_2 烷基; C_1-C_2 烷氧基羰基 C_1-C_2 烷基; 苯基 C_1-C_2 烷基, 它是未被取代的或被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基、硝基或 C_1-C_2 亚烷基二氧基取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至二-取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基, 甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基, 氨基或硝基单-至二-取代; 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基, 甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基, 氨基或硝基单-至二-取代;

R_4 是甲基或苯基；或

R_3 和 R_4 一起与它们所键接的氮原子形成饱和的或不饱和的 5 - 7 元环，它是未取代的或被 C_1 - C_4 烷基所取代并且能够具有 1-3 个另外的选自 N, O 和 S 的杂原子；

而 A, X, Y, R_1 和 R_2 是如式 I 中所定义。

(21) 在 (20) 下述及的式 I 的化合物当中，满足以下条件的那些化合物：其中

R_3 和 R_4 与它们所键接的氮原子一起是三唑基，吗啉基，2,6-二甲基吗啉基， γ 庚因基，嘧啶基或吡咯烷基。

(22) 式 I 的化合物，其中：

A 是 O,

R_1 是甲基,

R_2 是甲基；苯基，它是未被取代的或独立地被卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、被 1-5 个卤素原子取代的 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 C_3 - C_6 链烯氧基、 C_3 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_4 亚烷基二氧基、氧基或硝基单-至二-取代；或噻吩基；和

R_3 是氢； C_1 - C_4 烷基；具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_4 卤代烷基； C_1 - C_2 烷氧基 C_1 - C_2 烷基；丙烯基，它是未取代的或被 1-3 个卤素原子取代；炔丙基； C_3 - C_6 环烷基； C_3 - C_6 环烷基甲基，它是未被取代的或被 1-2 个卤素原子取代；氧基- C_1 - C_2 烷基； C_1 - C_2 烷氧基羰基 C_1 - C_2 烷基；苯基 C_1 - C_2 烷基，它是未被取代的或被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氧基、硝基或 C_1 - C_2 亚烷基二氧基取代，苯基被相同的或不同的取代基单-至二-取代是可能的；苯基，它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氧基或硝基单-至二-取代；或吡啶基，它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氧基或硝基单-至二-取代；

而 X 和 Y 如式 I 中所定义。

(23) 在(22)下述及的式I化合物当中, 满足以下条件的那些化合物: 其中

A 是氧,

R₁ 是甲基,

R₂ 是甲基, 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单-至二-取代; 和

R₃ 是甲基。

(24) 式I的化合物, 其中:

A 是 NCH₃,

R₁ 是甲基,

R₂ 是甲基; 苯基, 它是未被取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单-至二-取代;

R₃ 是甲基; 苯基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氟基或硝基单-至二-取代; 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氟基或硝基单-至二-取代;

而 X 和 Y 如式 I 中所定义。

(25) 式I的化合物, 其中:

X 是 N 原子;

Y 是 OR₁₁;

R₁₁ 是 C₁-C₄ 烷基; 和其中

A, R₁, R₂ 和 R₃ 如式 I 中所定义。

(26) 在(25)下述及的式I化合物当中, 满足以下条件的那些化合物: 其中

A 是 O 原子;

R₁ 和 R₂ 是甲基,

R₃ 是氢; C₁-C₄ 烷基; 具有 1-3 个卤素原子的 C₁-C₄ 卤代烷基; C₁-C₂ 烷氧

基 C_1-C_2 烷基；丙烯基，它是未取代的或被 1-3 个卤素原子取代；炔丙基； C_3-C_6 环烷基； C_3-C_6 环烷基甲基，它是未被取代的或被 1-2 个卤素原子取代；氨基- C_1-C_2 烷基； C_1-C_2 烷氧基羰基 C_1-C_2 烷基；苯基 C_1-C_2 烷基，它是未被取代的或被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基、硝基或 C_1-C_2 亚烷基二氧基取代，苯基被相同的或不同的取代基单-至二-取代是可能的；苯基，它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基或硝基单-至二-取代；或吡啶基，它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基或硝基单-至二-取代。

(27) 在 (26) 下述及的式 I 化合物当中，满足以下条件的那些化合物：其中

R_3 是氢； C_1-C_4 烷基或具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_4 卤代烷基。

(28) 式 I 的化合物，其中：

X 是 N 原子；

Y 是 N (R_{12}) R_{13} ；

R_{12} 和 R_{13} 独立地是氢或 C_1-C_4 烷基；和其中

A, R_1 , R_2 和 R_3 如式 I 中所定义。

(29) 在 (28) 下述及的化合物当中，满足以下条件的那些化合物：其中

Y 是 NH_2 , $N(CH_3)_2$ 或 NHC_2H_5 ；

A 是 O 原子；

R_1 和 R_2 是甲基，

R_3 是氢； C_1-C_4 烷基；具有 1-3 个卤素原子的 C_1-C_4 卤代烷基； C_1-C_2 烷氧基 C_1-C_2 烷基；丙烯基，它是未取代的或被 1-3 个卤素原子取代；炔丙基； C_3-C_6 环烷基； C_3-C_6 环烷基甲基，它是未被取代的或被 1-2 个卤素原子取代；氨基- C_1-C_2 烷基； C_1-C_2 烷氧基羰基 C_1-C_2 烷基；苯基 C_1-C_2 烷基，它是未被取代的或被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、

氨基、硝基或 C_1 - C_2 亚烷基二氧基取代, 苯基被相同的或不同的取代基单-至二-取代是可能的; 苯基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基或硝基单-至二-取代; 或吡啶基, 它是未取代的或独立地被卤素、甲基、甲氧基、具有 1-3 个卤素原子的卤代甲基、氨基或硝基单-至二-取代。

(30) 在 (29) 下述及的化合物当中, 满足以下条件的那些化合物:
其中
R 是氢; C_1 - C_4 烷基或具有 1-3 个卤素原子的 C_1 - C_4 卤代烷基。

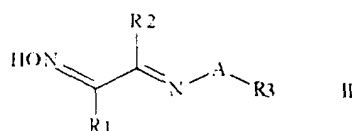
(31) 式 I 的化合物, 其中 $X=C$ 双键是 E 形式。

式 I 的化合物能够通过以下方法制备:

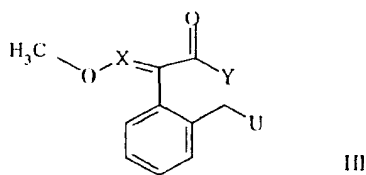
A) 为了获得其中 Y 是 $N(R_{12})R_{13}$ 的式 I 的化合物, 其中 Y 是 OR_{11} 的式 I 化合物与 $HN(R_{12})R_{13}$ 反应。反应最好在惰性有机稀释剂中进行, 例如在醇类如乙醇中, 在醚类如四氢呋喃或二噁烷中, 在酯类如乙酸乙酯中, 亚砷如二甲基亚砷, 酰胺如二甲基甲酰胺或酮类如甲基异丁基酮中。甲胺能够以气体形式使用或以溶解形式使用, 例如以在乙醇中的溶液形式使用。工艺温度一般在 0-40 °C 之间, 优选在室温下。

B) 为了制备其中 X, Y, A 和 R_1 - R_3 如式 I 中所定义 (和其中 R_3 不是氢) 的式 I 化合物:

让通式 II 的化合物



式中 A 和 R_1 - R_3 如上所定义, 与以下通式的化合物反应



式中 X 和 Y 如上所定义和 U 是离去基团。

这一反应是亲核取代反应，它能够在此类情况下通常使用的反应条件下进行。离去基团 U 优选是氯、溴、碘、甲磺酰氧基或甲苯磺酰氧基。有利的是反应在惰性有机稀释剂中，例如环醚如四氢呋喃或二噁烷，酮类如丙酮，酰胺如二甲基甲酰胺，亚砷如二甲基亚砷，在碱如氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、氯化钠、叔胺（例如三烷基胺，尤其二氮杂双环壬烷或二氮杂双环十一烷）或氧化银存在下，在 -20 - 80 °C 之间的温度下，优选在 0 - 50 °C 之间的温度下进行。

另外，该反应能够在有机溶剂例如二氯甲烷中，在碱性水溶液例如氢氧化钠溶液和相转移催化剂例如四丁基硫酸氢铵存在下，在室温下用相转移催化来进行。

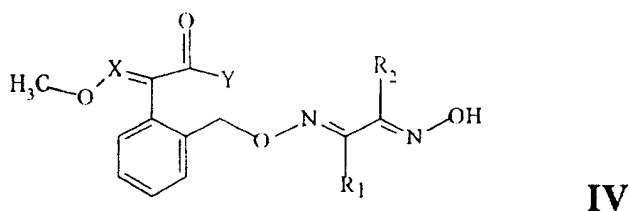
所得到的式 I 的化合物能够通过本身已知的方法分离和提纯。同样，所获得的异构体混合物，例如 E/Z 异构体混合物，能够通过本身已知的方法分离得到纯异构体，例如通过色谱分离或分级结晶。

用作起始原料的通式 II 的肟是已知的或能够通过已知方法制备 (J.Chem.Soc. , Perkin Trans II 537(1990) ; Ber.Deutsch.Chem.Ges.62 , 866(1929); Gazz.Chim.Ital. 37 II , 147(1907); Liebigs Ann. Chem.262 , 305(1891))

同样，式 III 的起始原料能够按本身已知的方法制备，例如按欧洲专利公开 EP-A-203 606(BASF) 和它所引用的文献中描述的那样，或按 Angew.Chem.71 , 349 - 365(1959) 中描述的那样。

C) 为了制备其中 A 是氧和 X，Y 和 R₁-R₃ 如式 I 中所定义的式 I 化合物：

让如下通式的化合物



式中 X, Y, R₁ 和 R₂ 如上所定义, 与以下通式的化合物反应

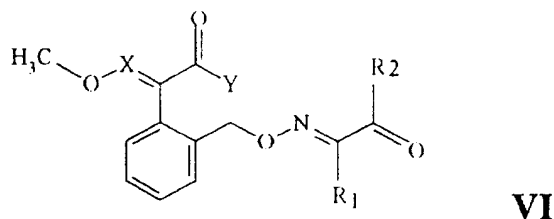


R₃ 如式 I 下所定义和 U 如式 III 下所定义 (R₃ 既不是氢, 也不是苯基或吡啶基)。

这一反应是亲核取代反应, 如 B) 下所述。

D) 为了制备其中 X, Y, R₁ 和 R₂ 如式 I 中所定义的式 IV 化合物, 进行一操作过程, 其中:

使以下通式的化合物

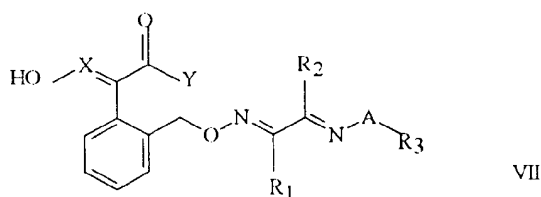


式中 X, Y, R₁ 和 R₂ 如上所定义, 与羟基胺或其盐如盐酸盐反应。有利的是该反应在作为溶剂的吡啶或甲醇中, 在 -20 - 80 °C 或甲醇的沸点之间的温度下, 优选在 0 - 50 °C 温度范围内进行, 如果使用甲醇则需要碱, 例如碱金属碳酸盐, 如碳酸钾, 叔胺如三乙胺或二氮杂双环壬烷, 吡啶或氧化银。

通式 VI 的酮类可以按类似于 B) 下描述的方法来制备。通式 VI 的酮类和它们的制备例如在 EP-370 629, EP - 506 149, EP - 403 618, EP - 414 153, EP - 463 488, EP - 472 300, EP - 460 575, WO - 92/18494 中和在其它公开物中有叙述。

E) 为了制备其中 A, X, Y 和 R₁-R₃ 如式 I 中所定义但 R₃ 不是氢的式 I 化合物, 进行一操作过程, 其中, 例如:

使以下通式的化合物

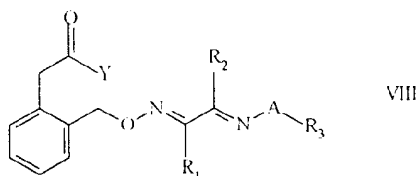


VII

式中 A, X, Y 和 R_1 - R_3 如上所定义, 与甲基化试剂如甲基碘, 硫酸二甲酯或重氮甲烷反应。该反应最好在碱例如碳酸钾或氢氧化钠存在下, 在合适的溶剂中和在合适的反应温度下进行 (例如参见, H.S. Anker und H.T. Clarke; Organic Synthesis, Coll.Vol. 3, 172)。

F) 为了制备其中 A, X, Y 和 R_1 - R_3 如式 I 中所定义的式 VII 化合物, 有利的是进行一操作过程, 其中:

使下式的化合物

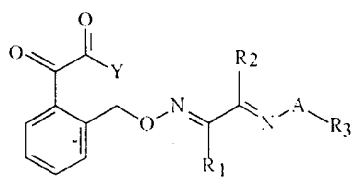


VIII

式中 A, Y 和 R_1 - R_3 如上所定义, 按类似于 EP - A - 178 826 中描述的方法在碱存在下与甲酸盐反应, 或按类似于 EP - A - 254 426 中描述的方法在碱存在下用亚硝酸或亚硝酸盐进行亚硝化。

合成式 VII 的化合物的另一可能性是如下反应:

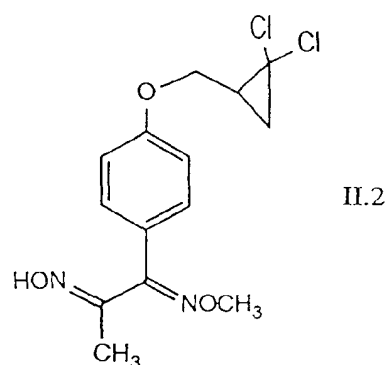
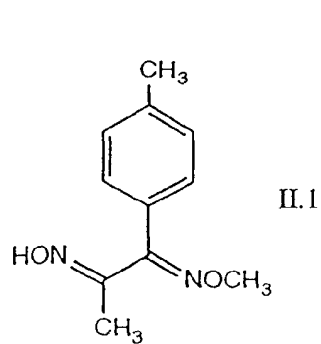
下式的化合物



IX

式中 A, Y 和 R_1 - R_3 如上所定义, 按类似于 EP - A - 178 826 中描述的方法与甲氧基亚甲基三苯基正膦反应或按类似于 EP - A - 254 426 中描述的方法与 O-甲基羟基胺 (或其盐) 反应。

由本发明还能够获得新型的式 II、VII、VIII 和 IX 的化合物, 特别是式 II.1 和 II.2 的化合物



现已发现式 I 的化合物具有控制植物病原菌（尤其霉菌）的杀微生物谱，它对于实际需要来说是非常有益的。它们具有非常理想的治愈性、防止性和尤其内吸性质，并能够用来保护大量的作物植物。通过使用式 I 的活

性成分，在各种有用植物的植株或植株的部分（果实、花、叶子、茎、块茎、根）上发现的害虫能够被控制或杀灭，且甚至在以后的时间形成的植株的部分保持没有植物病原微生物。

式I的化合物另外还能够用作种子涂饰（dressing）剂，用来处理种子（果实、块茎、谷粒）和植物苗以抵抗霉菌感染和抵抗土壤传染的植物病原菌。

式I的化合物例如对于植物病原菌具有活性，这些植物病原菌属于以下各类：半知菌类（尤其葡萄孢属，此外还有梨孢霉属，长蠕孢属，镰孢霉属，壳针孢属，尾孢菌属，小尾孢属和交链孢霉属）；担子菌纲（例如丝核菌属，驼孢锈菌属，柄锈菌属）；子囊菌纲（例如黑星菌属和白粉菌属，叉丝单囊壳属，念核盘菌属，钩丝壳属）；卵菌纲（例如疫霉属，霜霉属，盘梗霉属，腐霉属，单轴霉属）。

式I的化合物还是抵抗在农业和园艺的有用植物和观赏植物上（尤其在水稻、棉花、蔬菜和水果等作物中）和在林业上发现的昆虫和蜂螨目的有价值的活性成分，并且对于温血动物、鱼类和植物无害。化合物I特别适合于控制水稻、水果和蔬菜中的昆虫，尤其是植物伤害性昆虫。本发明的活性成分的其它应用领域是保护仓储物品和原料，和在卫生方面，尤其保护家养动物和生产性畜牲。式I化合物不仅对正常敏感性害虫的所有或单个发育阶段具有抵抗活性，而且对耐药性害虫的所有或单个发育阶段也具有抵抗活性。它们的活性能够从，例如害虫的死亡，或者立即或者一些时间过后，例如在脱皮过程中，或者从减少的产卵和孵化率体现。

上述动物害虫例如包括：

鳞翅目，例如，

长翅卷蛾属数种，褐带卷蛾属数种，透翅蛾属数种，地老虎属数种，棉叶夜蛾，*Amylois* 属数种，梨豆夜蛾，黄卷蛾属数种，带卷蛾属数种，丫纹夜蛾属数种，玉米茎蛀褐夜蛾，干果斑螟，桃蛀果蛾，禾草螟属数种，色卷蛾属数种，葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)，野螟属数种，云卷蛾属数种，细卷蛾属数种(*Cochylis*)，鞘蛾属数种，*Crocidolomia binotalis*，苹果异形小卷蛾，蠹蛾属数种(*Cydia* spp.)，杆草螟属数种，苏丹棉铃虫，金剛钻属数种，粉斑螟属数种，花小卷蛾属数种，*Eupoecilia ambiguella*，黄

毒蛾属数种，切根虫属数种，小食心虫属数种，广翅小卷蛾(*Hedya nubiferana*)，实夜蛾属数种，菜心野螟，美国白蛾，番茎麦蛾，旋纹潜蛾，潜叶细蛾属数种，花翅小卷蛾，毒蛾属数种，潜蛾属数种，天幕毛虫属数种，甘蓝夜蛾，烟草天蛾(*Manduca sexta*)，尺蛾属数种，玉米螟，超小卷蛾属数种，褐卷蛾属数种，小眼夜蛾，棉红铃虫，马铃薯麦蛾，小菜粉蝶，菜粉蝶属数种，菜蛾，小白巢蛾属数种，白禾螟属数种，蛀茎夜蛾属数种，长须卷蛾属数种，灰翅夜蛾属数种，透翅蛾属数种，异舟蛾属数种，卷蛾属数种，粉纹夜蛾和巢蛾属数种；

鞘翅目，例如，

叩头虫属数种，花象属数种，甜菜隐食甲，甜菜胫跳甲，根颈象属数种，象虫属数种，皮蠹属数种，条叶甲属(*Diabrotica*)数种，食植瓢虫属数种，*Eremnus* 属数种，马铃薯叶甲，稻象属数种，鳃角金龟属数种，*Orycaephilus* 属数种，耳象属数种，*Phlyctinus* 属数种，弧丽蛾属数种，十节跳甲属数种，谷蠹属数种，*Scarabeidae*，谷象属数种，麦蛾属数种，粉虫属数种，拟谷盗属数种，和 *Trogormia* 属数种；

直翅目，例如，

非螻属数种，姬螻属数种，蝼蛄属数种，马德拉 非螻，飞蝗属数种，大螻属数种和沙漠蝗属数种；

等翅目，例如，

散白蚁属数种；

啮虫目，例如，

粉啮虫属数种；

虱目，例如，血虱属数种，毛虱属数种，虱属数种，瘰绵蚜属数种和根瘤蚜属数种；

食毛目，例如，

畜虱 (*Damalinea*) 属数种和啮虱属数种；

缨翅目，例如，

花蓟马属数种，蒿蓟马属数种，带蓟马属数种，棕榈蓟马，烟蓟马和桔梗蓟马(*Scirtothrips aurantii*)；

异翅亚目，例如，

臭虫属数种, 可可狄盲蝽, 棉红蝽属数种, *Euchistus* 属数种, 扁盾蝽属数种, 稻缘蝽属数种, 绿蝽属数种, 皮蝽属数种, 红猎蝽属数种, 可可褐盲蝽(*Sahlbergella singularis*), 黑蝽属数种和锥猎蝽属数种;

同翅亚目, 例如,

软毛粉虱, 甘蓝粉虱, 肾圆蝽属数种, 蚜科, 蚜属数种, 圆盾蚜属数种, 木薯粉虱, 蜡蚜属(*Ceroplaster*)数种, 黑褐圆盾蚜, 橙褐圆盾蚜, 褐软蚜, 小绿叶蝉属数种, 苹果棉蚜, 斑叶蝉属数种, *Gascardia* 属数种, 稻虱属数种, 水木坚蚜, 蛎盾蚜属数种, *Macrosiphus* 数种, 瘤蚜属数种, 黑尾叶蝉属数种, 褐飞虱属数种, *Paratoria* 属数种, 瘿绵蚜属数种, 臀粉蚜属数种, 桑白盾蚜属数种, 粉蚜属数种, 木虱属数种, *Pulvinaria aethiopica*, 齿盾蚜属数种, 缢管蚜属数种, 蝽属数种, 叶蝉属数种, 二叉蚜属数种, 长管芽属数种, 温室粉虱, *Trioza erytrae* 和桔矢尖盾蚜;

膜翅目, 例如,

Acromyrmex, 叶蚁属数种, 茎蜂属数种, 锯角叶蜂属数种, 锯节叶蜂科, 云杉叶蜂(*Gilpinia polytoma*), 实叶蜂属数种, 蚁属数种, 法老蚁, (杉、松)叶蜂属(*Neodiprion*)数种, 火蚁属数种和胡蜂属数种;

双翅目, 例如, 伊蚊属数种, *Antherigona soccata*, 毛蚊(*Bibio hortulanus*), 红头丽蝇, 蜡实蝇属数种, 金蝇属数种, 库蚊属数种, 疽蝇属数种, 寡毛实蝇属数种, 黑尾果蝇, 厕蝇属数种, 胃蝇属数种, 舌蝇属数种, 皮蝇属数种, 虱蝇属(*Hyppabosca*)数种, 斑潜蝇属数种, 绿蝇属数种, 黑潜蝇属数种, 家蝇属数种, 狂蝇属数种, *Orseolia* 属数种, 瑞典麦秆蝇, 甜菜象蝇, *Phorbia* spp., 革绕实蝇, 革蝇属(*Sciara*)数种, 厩螫蝇属数种, 虻属数种, *Tannia* 属数种和大蚊属数种;

蚤目, 例如,

角叶蚤属数种和印鼠客蚤;

缨尾目, 例如,

衣鱼; 和

蜉蝣目, 例如,

粗脚粉螨, 桔芽瘿螨, 苹果刺绣螨, 花蜱属数种, 锐缘蜱属数种, 牛蜱属数种, 短须螨属数种, 苜蓿苔螨, 上三节缨螨属(*Calipitrimerus*)数种,

痒螨属数种，鸡皮刺螨，鹤耳枹始叶螨(*Eotetranychus carpini*)，缨螨属数种，璃眼蜱属数种，硬蜱属数种，草地小爪螨，钝缘螨属数种，全爪螨属数种，桔芸锈螨，侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*)，痒螨属数种，扇头蜱属数种，根螨属数种，疥螨属数种，跗线螨属数种和叶螨属数种。

在本发明范围内，作物保护的目标作物例如是以下类型的作物：谷类作物（小麦、大麦、黑麦、燕麦、水稻、玉米、高粱和相关植物）；甜菜（制糖甜菜和饲用甜菜）；梨果、核果和软果（苹果，梨，李，桃，杏，櫻桃，草莓、木莓和黑刺莓）；豆类（豆、小扁豆、豌豆和大豆）；油类作物（油菜、芥子、罂粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻油植物、可可豆和花生）；瓜类（西葫芦、黄瓜和甜瓜）；纤维植物（棉花、亚麻、大麻和黄麻）；柑桔类水果（橙子、柠檬、葡萄柚和桔子）；蔬菜类（菠菜、莴苣、芦笋、甘蓝、胡萝卜、洋葱、番茄、马铃薯和辣椒）；樟科（桤梨、肉桂和樟脑）；和植物如烟草，坚果，咖啡，紫茄，甘蔗，茶叶，胡椒，葡萄树，啤酒花，香蕉和天然橡胶树，以及观赏植物。

根据本发明的式I化合物和包含它们的组合物的作用可通过添加其它的杀微生物剂、杀虫剂和/或杀螨剂而显著地增大和适用于普遍情况。以下活性成分的代表是合适添加剂的例子：有机磷化合物类，硝基苯酚类和衍生物类，甲脒类，脲类，氨基甲酸酯类，拟除虫菊酯类，氯代烃类，和苏云金芽孢杆菌制剂。

一般，式I的活性成分是以组合物的形式使用并能够与其它活性成分同时或连续施用于所要处理的区域或植物。这些其它的活性成分可以是肥料，微量元素调节剂或对植物生长有作用的其它制剂。还能够使用选择性除草剂，以及杀虫剂，杀霉剂，杀菌剂，杀线虫剂，杀贝剂或这些制剂中的几种的混合物，有或没有在现有技术的配制剂中使用的其它载体，表面活性剂或其它施用效果增强剂。

合适的载体和添加剂可以是固态或液态，且是在配制技术领域合适的那些物质，例如天然或再生矿物质，溶剂、分散剂、润湿剂、增粘剂、增稠剂、粘合剂或肥料。

下面是合适的溶剂：芳族烃类，优选 $C_8 - C_{12}$ 馏分，如二甲苯混合物或取代萘类，邻苯二甲酸酯类如邻苯二甲酸二丁酯或邻苯二甲酸二辛酯，

脂族烃类如环己烷或链烷烃类，醇类和二元醇及其醚类和酯类，如乙醇，乙二醇，乙二醇单甲醚或乙醚，酮类，如环己酮，强极性溶剂，如N-甲基吡咯烷-2-酮，二甲基亚砷或二甲基甲酰胺，和未环氧化或环氧化植物油，如环氧化椰子油或大豆油；或水。

一般用于例如粉剂和可分散粉剂的固体载体是磨碎的天然岩石，如方解石、滑石、高岭土、蒙脱土或硅镁土。

可导致大大减少施用率的特别理想的施用效果增强剂是，天然（动物或植物）磷脂或来自一系列脑磷脂和卵磷脂的合成磷脂，它们例如能够从大豆获得。

取决于欲配制的式I活性成分的性质，合适的表面活性化合物是具有良好的乳化、分散和润湿性能的非离子、阳离子和/或阴离子表面活性剂。表面活性剂还应理解为表面活性剂混合物。

合适的阴离子表面活性剂可以是所谓的水溶性盐和水溶性合成表面活性化合物。

皂是高级脂肪酸（ $C_{10} - C_{22}$ ）的碱金属盐，碱土金属盐或者未取代的或取代的铵盐，例如油酸或硬脂酸的或天然脂肪酸混合物（它们例如能够从椰子油或浮油获得）的钠盐和钾盐；还可以提到脂肪酸甲基牛磺酸盐。

合适的非离子表面活性剂是脂族或脂环族醇类，饱和或不饱和脂肪酸和烷基酚类的聚乙二醇醚衍生物，该衍生物含有3 - 30个乙二醇醚基和8 - 20个在（脂族）烃部分中的碳原子和6 - 18个在烷基酚类的烷基部分中的碳原子。

非离子表面活性剂的代表性例子是壬基苯酚聚乙氧基乙醇，蓖麻油聚乙二醇醚，聚环氧丙烷/环氧乙烷加合物，三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇，聚乙二醇和辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。

其它合适的物质是聚氧乙烯脱水山梨糖醇的脂肪酸酯，例如聚氧乙烯脱水山梨糖醇三油酸酯。

阳离子表面活性剂主要是季铵盐，它含有，作为N-取代基，至少一个 $C_8 - C_{22}$ 烷基和，作为另外的取代基，卤代的或未卤代的低级烷基，苄基或低级羟基烷基。

一般，农业化学制剂包含0.1-99%，优选0.1-95%的式I活性成分，

99.9-1%，优选 99.9-5%的固体或液体添加剂，和 0-25%，尤其 0.1-25%的表面活性剂。

尽管浓缩组合物作为商品是更优选的，但最终用户一般使用稀释组合物。

组合物还可包含其它添加剂，如稳定剂，消泡剂，粘度调节剂，粘结剂，增粘剂，肥料或为获得特殊效果的其它活性成分。

配制剂，即包含式 I 活性成分和有或没有固体或液体添加剂的组合物，制剂或结合物，能够按已知方法制备，例如通过将活性成分与增量剂如溶剂（混合物）、固体载体和，如果合适，表面活性化合物（表面活性剂）紧密混合和/或研磨。

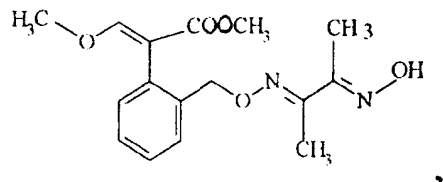
式 I 活性成分或包含至少一种活性成分的农业化学组合物的优选施用方法是施用于叶子上（叶面施用）。施用的频率和比率取决于被所述病原体侵袭的危害程度。然而，式 I 活性成分还能够通过用液体制剂浸透植物生长处，经土壤通过根系统（内吸作用），或通过将物质以固体形式引入土壤，例如以粒料形式（土壤施用），而最终达到植物。在水稻的情况下，此类粒料能够计量投入灌溉的水稻田。另外，式 I 化合物能够施用于种子（涂覆），或者将种子浸入活性成分的液体制剂中或者用固体制剂涂覆它们。一般来说，通过使用式 I 化合物能够保护任何类型的植物繁殖材料，例如种子、根或茎。

式 I 化合物能够以纯化合物形式使用，或优选与在配制技术中常用的辅助剂一起使用。为此，它们最好按已知方法加工，例如得到乳液浓缩物，可散布的糊剂，可直接喷射的或稀释的溶液剂，稀释乳液，可湿性粉剂，可溶性粉剂，粉剂，粒剂和胶囊剂（例如在聚合物中）。施用方法如喷射、喷雾、撒粉、散播、涂覆或倾入，以及组合物的性质都得加以选择，以适应预定目的或普遍情况。一般有益的施用率是 1g 至 2kg 活性成分（a.i.）/1 公顷（ha），优选 25g 至 800g a.i./ha，尤其 50g 至 400g a.i./ha。当用作种子涂饰（dressing）剂时，每 kg 种子优选使用 0.001g 至 1.0g 活性成分的剂量比率。

下面的实施例是为了更详细地说明本发明，而对它没有任何限制。

制备实施例实施例 H - 1:

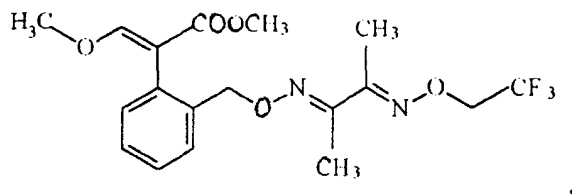
以下化合物的制备



将 1.32g 羟基胺盐酸盐加入到 5.2g 3-甲氧基-2-([(3-氧代-2-丁基)亚氨基]氧基)邻甲苯基]丙烯酸甲酯 (EP-A-370 629, No.156) 在 20ml 吡啶中的溶液中。在混合物于 30 °C 下搅拌 6 小时后, 添加冰水, 过滤出在几小时后形成的晶体饼, 晶体用水洗涤。从乙醇/水重结晶得到 4.8g 熔点为 104 - 107 °C 的、黄色晶体形式的 3-甲氧基-2-([(3-羟基-2-丁基)亚氨基]氧基)邻甲苯基]丙烯酸甲酯 (Comp.No.1.73)。

实施例 H - 2:

以下化合物的制备

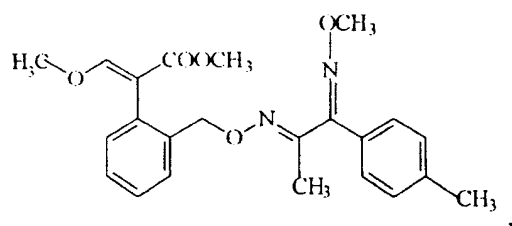


在一耐压管中, 将 5ml 二甲基甲酰胺加入到 0.2g 已用己烷洗涤过的约 65% 氢氧化钠悬浮液中。然后, 添加 1.6g 3-甲氧基-2-([(3-羟基-2-丁基)亚氨基]氧基)邻甲苯基]丙烯酸甲酯和然后添加 1.1g 2,2,2-三氟乙基碘。在氢气的释放平息之后, 密封耐压管, 混合物在 50 °C 下搅拌 5 小时。然后将反应溶液倾到冰水中, 用乙酸乙酯萃取, 产物用乙酸乙酯/己烷 (1:3) 在硅胶上进行色谱分离。得到 1.2g 无色油形式的 3-甲氧基-2-([(3-(2,2,2-三氟乙氧基)亚氨基)-2-丁基)亚氨基]氧基)邻甲苯基]丙烯酸甲酯 (Comp.No.1.74)。

在 CDCl_3 中的 ^1H NMR: 两个亚氨基取代的甲基的化学位移: 1.99 和 2.04ppm。

实施例 H - 3:

以下化合物的制备



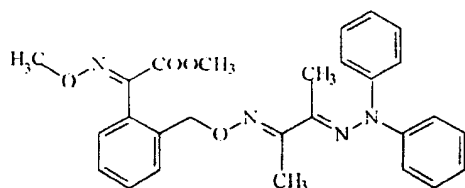
将 15.0g 对甲基苯基·乙基(甲)酮和 20ml 亚硝酸异戊酯在 30ml 甲醇中的溶液慢慢滴加到 20ml 甲醇钠(30%, 在甲醇中)中。在混合物被搅拌 5 小时后, 滴加 30ml 水, 混合物随后用乙酸酸化。混合物用乙酸乙酯萃取, 然后用水洗涤萃取物, 干燥(硫酸钠)和真空浓缩。残余物从乙醚/正己烷重结晶。得到熔点为 122 - 124 °C 的无色晶体形式的 α -肟基-4-甲基苯基·乙基(甲)酮。

8.1g 前面获得的化合物和 4.6g o-甲基羟基胺盐酸盐在 40ml 吡啶中回流 1 小时。在添加甲苯之后, 混合物被真空浓缩, 用水处理和用乙酸乙酯萃取。有机相用水洗涤, 经硫酸镁干燥和真空浓缩。从乙醚/正己烷重结晶, 得到熔点为 156-157 °C 的无色晶体形式的 α -肟基-4-甲基苯基·乙基(甲)酮 O-甲基肟。

将 1.87g 前面获得的肟和 2.58g 2-(α -溴-邻甲苯基)-3-甲氧基丙烯酸甲酯加入到 0.41g 氢氧化钠在 25ml N,N-二甲基甲酰胺中的悬浮液中, 然后反应混合物被搅拌 3 小时。然后用乙酸酸化, 用水处理和用乙酸乙酯萃取。有机相用饱和碳酸氢钠溶液洗涤两次和再用饱和氯化钠溶液洗涤一次。在经无水硫酸钠干燥后, 真空蒸除溶剂。H-3 以熔点为 98-101 °C 的无色晶体形式从乙醚/正己烷中重结晶 (Comp.No.1.117)。

实施例 H - 4:

以下化合物的制备



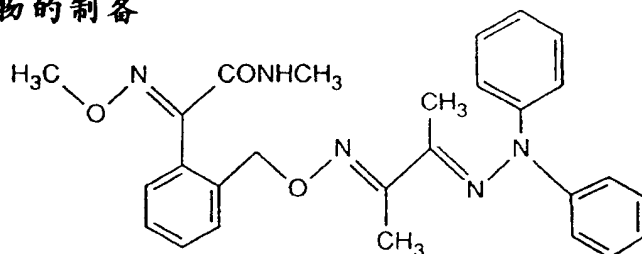
0.37g 的约 65% 氢氧化钠悬浮液用己烷洗涤, 然后添加 10ml 二甲基甲酰胺

胺。将 2.59g 2-(2-溴甲基苯基)二羟乙酸甲酯 O-甲基肼和 2.42g 2-(二苯基亚肼基)-3-肼基丁烷的混合物加入到这一悬浮液中,混合物然后使用热空气鼓风机升温至 40-50 °C,一直到氢气快速放出为止。然后,混合物搅拌 1 小时排出水汽,并倾到冰水中。用乙酸乙酯萃取和用乙酸乙酯/己烷 (1:2) 在硅胶上进行色谱分离,得到 3.7g 黄色油形式的 2-[[[(3-二苯基亚肼基-2-丁基)亚肼基]肼基]邻甲苯基]二羟乙酸甲酯 O-甲基肼 (Comp.No. 2.19)。

在 CDCl_3 中的 $^1\text{H NMR}$: 两个亚肼基取代的甲基的化学位移: 1.64 和 2.12ppm。

实施例 H - 5:

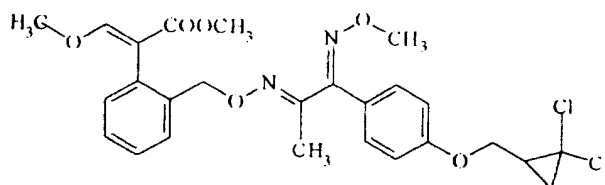
以下化合物的制备



1.9g 2-[[[(3-二苯基亚肼基-2-丁基)亚肼基]肼基]邻甲苯基]二羟乙酸甲酯 O-甲基肼在 10ml 的 33% 甲基胺的乙醇溶液中于室温下搅拌 2 小时。蒸除乙醇和多余的甲基胺。残余物与乙醚拌和在一起,过滤溶液,滤液蒸发至干燥,产物保留为晶体固体。用己烷洗涤,得到 1.8g 熔点为 135-136 °C 的浅米色晶体形式的 N-单甲基 2-[[[(3-二苯基亚肼基-2-丁基)亚肼基]肼基]邻甲苯基]二羟乙酰胺 O-甲基肼 (Comp. No. 3.19)。

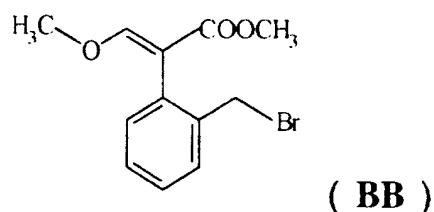
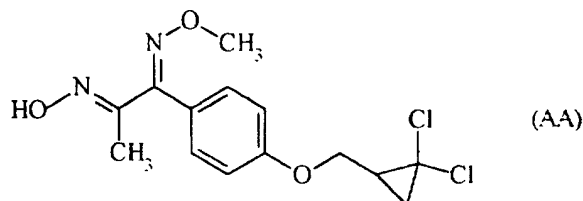
实施例 H - 6:

以下化合物的制备



将 1.74g 式 (AA) 的 1-[4-(2,2-二氯环丙基甲氧基)苯基]丙烷-1,2-二酮 1-(O-甲基肼)-2-肼基加入到 0.13g 氢氧化钠在 25ml N,N-二甲基甲酰胺中的溶液中。随后添加 1.5g 式 (BB) 的 2-(2-溴甲基苯基)-3-甲氧基丙烯酸

甲酯，混合物在室温下搅拌3小时。混合物用乙酸酸化，添加水和乙酸乙酯。分离出水相，有机相用饱和碳酸氢钠溶液洗涤一次，并用无水硫酸钠干燥。真空蒸发溶剂，所得残余物用己烷/乙酸乙酯（3:1）在硅胶上进行提纯。获得油形式的标题化合物。通过在硅胶上进行柱色谱分离（己烷:乙酸乙酯（3:1）溶液）得到三种异构体：异构体A，m.p.86-88℃，异构体B，油，异构体C，油（化合物5.9）

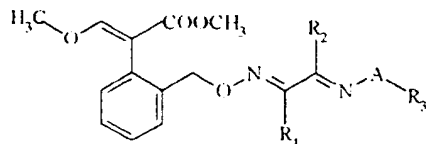


下面的化合物能够按这种方法制备或按类似于上述方法中任何一种的方法制备：

（缩写：Me=甲基，Et=乙基， Δ =环丙基，Ph=苯基，m.p.=熔点）。

NMR：以在 CDCl_3 中的 δ (ppm) 给出化学位移。

表 1



Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据 * *
1.1	NMe	Me	Me	6-CF ₃ -2-吡啶基	2.17/2.19
1.2	NMe	H	Me	6-CF ₃ -2-吡啶基	
1.3	NMe	Me	Δ	6-CF ₃ -2-吡啶基	
1.4	NMe	Me	H	苯基	
1.5	NMe	Me	Me	苯基	2.09/2.18
1.6	NMe	Δ	Me	苯基	
1.7	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -2-吡啶基	m.p.100 ℃
1.8	NMe	H	Me	4-CF ₃ -2-吡啶基	
1.9	NMe	Δ	Δ	苯基	
1.10	NMe	Me	Me	5-CF ₃ -2-吡啶基	2.17/2.18
1.11	NMe	H	Me	5-CF ₃ -2-吡啶基	
1.12	-	H	Me	4-(1,2,4-三唑基)	
1.13	-	Me	Me	4-(1,2,4-三唑基)	161 -163 ℃
1.14	-	Me	Δ	4-(1,2,4-三唑基)	
1.15	-	Me	Δ	4-吗啉基	
1.16	-	Me	Me	4-吗啉基	113 ℃
1.17	-	H	Me	4-吗啉基	
1.18	NPh*	H	Me	苯基	
1.19	NPh*	Me	Me	苯基	1.74/2.22
1.20	NPh*	Me	Δ	苯基	
1.21	NPh*	Δ	Me	苯基	
1.22	NMe	Me	Me	2-硝基苯基	1.93/2.06
1.23	NMe	H	Me	2-硝基苯基	
1.24	O	Me	Me	Me	76-78 ℃
1.25	O	H	Me	Me	1.97/7.68

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据 * *
1.26	O	Δ	Me	Me	1.96/2.00
1.27	O	Me	Δ	Me	62-62 ℃
1.28	O	Me	H	Me	
1.29	NMe	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
1.30	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	2.06/2.18
1.31	NMe	Δ	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
1.32	NMe	Δ	Me	3-硝基-2-吡啶基	
1.33	NMe	H	Me	3-硝基-2-吡啶基	
1.34	NMe	Me	Me	3-硝基-2-吡啶基	1.94/2.26
1.35	NMe	Me	Me	2-CF ₃ -苯基	1.85/2.10
1.36	NMe	Me	Δ	2-CF ₃ -苯基	
1.37	NMe	H	Me	2-CF ₃ -苯基	
1.38	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -苯基	
1.39	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -苯基	
1.40	NMe	H	Me	4-CF ₃ -苯基	
1.41	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -苯基	
1.42	NMe	Me	Me	2-氯苯基	1.73/2.13
1.43	NMe	Me	Me	3-氯苯基	2.12/2.17
1.44	NMe	H	Me	4-氯苯基	
1.45	NMe	Me	Me	4-氯苯基	2.10/2.15
1.46	O	Me	Me	苯基	2.14/2.22
1.47	O	Me	Δ	苯基	
1.48	O	Me	Me	苄基	106-108 ℃
1.49	O	Me	Me	Et	1.92/1.95
1.50	O	H	Me	Et	
1.51	O	Δ	Me	Et	
1.52	O	Me	Δ	Et	

1.53	O	Me	H	Et	
1.54	O	H	Me	甲氧基甲基	
1.55	O	Me	Me	甲氧基甲基	. 83-84 ℃
1.56	O	Me	Δ	甲氧基甲基	

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据
* *					
1.57	O	Δ	Me	甲氧基甲基	
1.58	O	Me	Me	乙氧基甲基	2.04/2.04
1.59	O	H	Me	氟基甲基	
1.60	O	Me	Me	氟基甲基	2.04/2.04
1.61	O	Δ	Me	氟基甲基	
1.62	-	Me	Me	苧庚因基	2.02/2.04
1.63	-	Me	Me	吡啶子基	
1.64	-	Me	Me	吡咯烷基	
1.65	O	H	Me	叔丁基	
1.66	O	Me	Me	叔丁基	1.96/2.04
1.67	O	Me	Me	炔丙基	114-115 ℃
1.68	O	Δ	Me	炔丙基	
1.69	O	Me	Δ	炔丙基	
1.70	O	Me	Me	2,2-二氯环丙基甲基	2.02/2.02
1.71	O	Δ	Me	2,2-二氯环丙基甲基	
1.72	O	H	Me	H	
1.73	O	Me	Me	H	104-107 ℃
1.74	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	1.99/2.04
1.75	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
1.76	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
1.77	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
1.78	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
1.79	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	2.10/2.13
1.80	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
1.81	NMe	Me	Me	Me	94-98 ℃
1.82	NMe	Me	Δ	Me	
1.83	O	Me	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	80 ℃

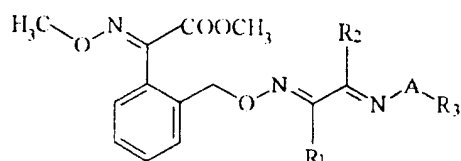
1.84	O	Δ	Me	$\text{CH}_2\text{-CCl=CH}_2$	
1.85	O	Me	Me	丙基	
1.86	O	Me	Me	丁基	36-38 °C

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据**
1.87	O	Me	Me	己基	1.99/2.01
1.88	O	Me	Me	甲氧基羰基甲基	90-93 ℃
1.89	O	H	Me	甲氧基羰基甲基	
1.90	O	Me	Me	3-氟苄基	2.00/2.04
1.91	O	Me	Me	4-氟苄基	
1.92	O	Me	Me	2-氟苄基	
1.93	O	Me	Me	2-CF ₃ -苄基	
1.94	O	Me	Me	3-CF ₃ -苄基	56-58 ℃
1.95	O	Me	Me	4-CF ₃ -苄基	
1.96	O	Me	Me	3,4-二氟苄基	
1.97	O	Me	Me	2,4,6-三甲基苄基	
1.98	O	Me	Me	4-氟-2-硝基苄基	
1.99	O	Me	Me	3-甲氧基苄基	
1.100	O	Me	Me	2-苄基乙基	1.97/2.02
1.101	O	Me	Me	3-苄基丙基	
1.102	O	Me	Me	2-(4-硝基苄基)乙基	
1.103	O	Me	Me	2-(2-CF ₃ -苄基)乙基	
1.104	O	Me	Me	2-(4-甲氧基苄基)乙基	
1.105	O	Me	Me	2-氟-6-氟苄基	
1.106	O	Me	Me	3,4-亚甲基二氧基苄基	
1.107	O	Me	Me	2-氟基苄基	
1.108	O	Me	Me	2-(4-氟苄基)乙基	
1.109	O	Me	Me	环丙基甲基	2.01/2.01
1.110	O	Me	Me	2-(1,3-二氧戊环基)甲基	
1.111	O	Me	Me	2,2,3,3-四氟环丁基甲基	
1.112	O	Me	Me	α-氟乙氧基羰基甲基	
1.113	O	Me	2-噻吩基	Me	2.06/2.10/

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据* *
					2.20(E/Z)
1.114	O	Me	4-甲基苯基	Et	2.12
1.115	NMe	Me	4-甲基苯基	Me	2.10(异构体 1)
					2.08(异构体 2)
1.116	O	Me	Me	CH ₂ FCH ₂	50-51 ℃
1.117	O	Me	Me	2-(4-吗啉代)乙基	1.99/2.01
1.118	-	Me	Me	1-吡咯基	89-91 ℃
1.119	O	Me	Me	2-(1-哌啶子基)乙基	
1.120	O	Me	Me	2-氟苄基	93-96 ℃
1.121	O	Me	Me	4-氟苄基	104-106 ℃

**m.p. 或 R₁/R₂ 或 R₃ 的 ¹H NMR

表 2



Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据**
2.1	NMe	Me	Me	6-CF ₃ -2-吡啶基	87-88 ℃
2.2	NMe	H	Me	6-CF ₃ -2-吡啶基	
2.3	NMe	Me	Δ	6-CF ₃ -2-吡啶基	
2.4	NMe	Me	H	苯基	
2.5	NMe	Me	Me	苯基	
2.6	NMe	Δ	Me	苯基	
2.7	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -2-吡啶基	
2.8	NMe	H	Me	4-CF ₃ -2-吡啶基	
2.9	NMe	Δ	Δ	苯基	
2.10	NMe	Me	Me	5-CF ₃ -2-吡啶基	
2.11	NMe	H	Me	5-CF ₃ -2-吡啶基	1.64/2.12
2.12	-	H	Me	4-(1,2,4-三唑基)	
2.13	-	Me	Me	4-(1,2,4-三唑基)	
2.14	-	Me	Δ	4-(1,2,4-三唑基)	
2.15	-	Me	Δ	4-吗啉基	
2.16	-	Me	Me	4-吗啉基	
2.17	-	H	Me	4-吗啉基	
2.18	NPh	H	Me	苯基	
2.19	NPh	Me	Me	苯基	
2.20	NPh	Me	Δ	苯基	
2.21	NPh	Δ	Me	苯基	
2.22	NMe	Me	Me	2-硝基苯基	
2.23	NMe	H	Me	2-硝基苯基	

2.24	O	Me	Me	Me	104-106 ℃
2.25	O	H	Me	Me	

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据**
2.26	O	Δ	Me	Me	1.92/1.97
2.27	O	Me	Δ	Me	67-70 ℃
2.28	O	Me	H	Me	
2.29	NMe	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
2.30	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
2.31	NMe	Δ	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
2.32	NMe	Δ	Me	3-硝基-2-吡啶基	
2.33	NMe	H	Me	3-硝基-2-吡啶基	
2.34	NMe	Me	Me	3-硝基-2-吡啶基	
2.35	NMe	Me	Me	2-CF ₃ -苯基	
2.36	NMe	Me	Δ	2-CF ₃ -苯基	
2.37	NMe	H	Me	2-CF ₃ -苯基	
2.38	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -苯基	
2.39	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -苯基	
2.40	NMe	H	Me	4-CF ₃ -苯基	
2.41	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -苯基	
2.42	NMe	Me	Me	2-氯苯基	81 ℃
2.43	NMe	Me	Me	3-氯苯基	2.10/2.13
2.44	NMe	H	Me	4-氯苯基	
2.45	NMe	Me	Me	4-氯苯基	2.08/2.13
2.46	O	Me	Me	苯基	89-90 ℃
2.47	O	Me	Δ	苯基	
2.48	O	Me	Me	苄基	
2.49	O	Me	Me	Et	
2.50	O	H	Me	Et	
2.51	O	Δ	Me	Et	
2.52	O	Me	Δ	Et	
2.53	O	Me	H	Et	

2.54	O	H	Me	甲氧基甲基	
2.55	O	Me	Me	甲氧基甲基	87-88 ℃
2.56	O	Me	Δ	甲氧基甲基	
2.57	O	Δ	Me	甲氧基甲基	

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据 * *
2.58	O	Me	Me	乙氧基甲基	
2.59	O	H	Me	氟基甲基	
2.60	O	Me	Me	氟基甲基	94-95 ℃
2.61	O	Δ	Me	氟基甲基	
2.62	-	Me	Me	γ庚因基	
2.63	-	Me	Me	吡啶子基	
2.64	-	Me	Me	吡咯烷基	
2.65	O	H	Me	叔丁基	
2.66	O	Me	Me	叔丁基	1.93/2.02
2.67	O	Me	Me	炔丙基	120-122 ℃
2.68	O	Δ	Me	炔丙基	
2.69	O	Me	Δ	炔丙基	
2.70	O	Me	Me	2,2-二氯环丙基甲基	1.99/1.99
2.71	O	Δ	Me	2,2-二氯环丙基甲基	
2.72	O	H	Me	H	
2.73	O	Me	Me	H	114-116 ℃
2.74	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	52-53 ℃
2.75	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
2.76	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
2.77	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
2.78	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
2.79	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	86 ℃
2.80	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
2.81	NMe	Me	Me	Me	80-81 ℃
2.82	NMe	Me	Δ	Me	
2.83	O	Me	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	66 ℃
2.84	O	Δ	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	

2.85	O	Me	Me	丙基	
2.86	O	Me	Me	丁基	58-62 ℃

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 N R ₃ R ₄	物理数据 **
2.87	O	Me	Me	己基	50-53 ℃
2.88	O	Me	Me	甲氧基羰基甲基	1.96/2.04
2.89	O	H	Me	甲氧基羰基甲基	
2.90	O	Me	Me	3-氟苄基	
2.91	O	Me	Me	4-氟苄基	
2.92	O	Me	Me	2-氟苄基	
2.93	O	Me	Me	2-CF ₃ -苄基	
2.94	O	Me	Me	3-CF ₃ -苄基	87-88 ℃
2.95	O	Me	Me	4-CF ₃ -苄基	
2.96	O	Me	Me	3,4-二氟苄基	
2.97	O	Me	Me	2,4,6-三甲基苄基	
2.98	O	Me	Me	4-氟-2-硝基苄基	
2.99	O	Me	Me	3-甲氧基苄基	
2100	O	Me	Me	2-苯基乙基	
2.101	O	Me	Me	3-苯基丙基	
2.102	O	Me	Me	2-(4-硝基苯基)乙基	
2.103	O	Me	Me	2-(2-CF ₃ -苯基)乙基	
2.104	O	Me	Me	2-(4-甲氧基苯基)乙基	
2.105	O	Me	Me	2-氟-6-氟苄基	
2.106	O	Me	Me	3,4-亚甲基二氧基苄基	
2.107	O	Me	Me	2-氟基苄基	
2.108	O	Me	Me	2-(4-氟苯基)乙基	
2.109	O	Me	Me	环丙基甲基	1.98/1.98
2.110	O	Me	Me	2-(1,3-二氧戊环基)甲基	
2.111	O	Me	Me	2,2,3,3-四氟环丁基甲基	
2.112	O	Me	Me	α-氟乙氧基羰基甲基	
2.113	O	Me	2-噻吩基	Me	83-86 ℃

2.114 **O** **Me** **4-甲基苯基**

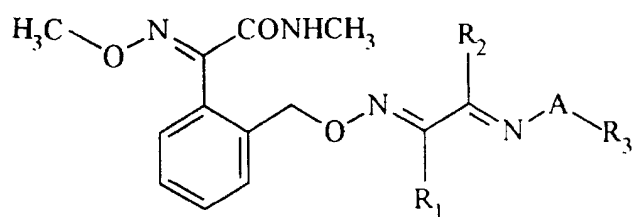
Et

94-96 °C

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据**
2.115	NMe	Me	4-甲基苯基	Me	
2.116	O	Me	Me	CH ₂ FCH ₂	62-63 ℃
2.117	O	Me	Me	2-(4-吗啉基)乙基	1.97/1.99
2.118	-	Me	Me	1-吡咯基	
2.119	O	Me	Me	2-(1-吡啶子基)乙基	
2.120	O	Me	Me	2-氟苄基	81-83 ℃
2.121	O	Me	Me	4-氟苄基	116-118 ℃

**m.p. 或 R₁/R₂ 或 R₃ 的 ¹H NMR

表 3



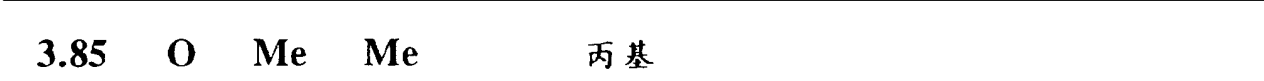
Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据
					**
3.1	NMe	Me	Me	6-CF ₃ -2-吡啶基	
3.2	NMe	H	Me	6-CF ₃ -2-吡啶基	
3.3	NMe	Me	Δ	6-CF ₃ -2-吡啶基	
3.4	NMe	Me	H	苯基	
3.5	NMe	Me	Me	苯基	2.07/2.15
3.6	NMe	Δ	Me	苯基	
3.7	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -2-吡啶基	
3.8	NMe	H	Me	4-CF ₃ -2-吡啶基	
3.9	NMe	Δ	Δ	苯基	
3.10	NMe	Me	Me	5-CF ₃ -2-吡啶基	
3.11	NMe	H	Me	5-CF ₃ -2-吡啶基	
3.12	-	H	Me	4-(1,2,4-三唑基)	
3.13	-	Me	Me	4-(1,2,4-三唑基)	
3.14	-	Me	Δ	4-(1,2,4-三唑基)	
3.15	-	Me	Δ	4-吗啉基	
3.16	-	Me	Me	4-吗啉基	
3.17	-	H	Me	4-吗啉基	
3.18	NPh	H	Me	苯基	
3.19	NPh	Me	Me	苯基	135-136 °C
3.20	NPh	Me	Δ	苯基	
3.21	NPh	Δ	Me	苯基	
3.22	NMe	Me	Me	2-硝基苯基	
3.23	NMe	H	Me	2-硝基苯基	

3.24	O	Me	Me	Me	90-92 ℃
3.25	O	H	Me	Me	1.97/7.68

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据 * *
3.26	O	Δ	Me	Me	1.94/1.95
3.27	O	Me	Δ	Me	88-90 °C
3.28	O	Me	H	Me	
3.29	NMe	H	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
3.30	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
3.31	NMe	Δ	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
3.32	NMe	Δ	Me	3-硝基-2-吡啶基	
3.33	NMe	H	Me	3-硝基-2-吡啶基	
3.34	NMe	Me	Me	3-硝基-2-吡啶基	
3.35	NMe	Me	Me	2-CF ₃ -苯基	
3.36	NMe	Me	Δ	2-CF ₃ -苯基	
3.37	NMe	H	Me	2-CF ₃ -苯基	
3.38	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -苯基	
3.39	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -苯基	
3.40	NMe	H	Me	4-CF ₃ -苯基	
3.41	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -苯基	
3.42	NMe	Me	Me	2-氯苯基	1.72/2.11
3.43	NMe	Me	Me	3-氯苯基	2.09/2.14
3.44	NMe	H	Me	4-氯苯基	
3.45	NMe	Me	Me	4-氯苯基	2.08/2.13
3.46	O	Me	Me	苯基	
3.47	O	Me	Δ	苯基	
3.48	O	Me	Me	苄基	
3.49	O	Me	Me	Et	
3.50	O	H	Me	Et	
3.51	O	Δ	Me	Et	
3.52	O	Me	Δ	Et	

3.53	O	Me	H	Et	
3.54	O	H	Me	甲氧基甲基	
3.55	O	Me	Me	甲氧基甲基	2.00/2.03
3.56	O	Me	Δ	甲氧基甲基	
3.57	O	Δ	Me	甲氧基甲基	

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据
* *					
3.58	O	Me	Me	乙氧基甲基	
3.59	O	H	Me	氟基甲基	
3.60	O	Me	Me	氟基甲基	2.00/2.01
3.61	O	Δ	Me	氟基甲基	
3.62	-	Me	Me	苄庚因基	
3.63	-	Me	Me	吡啶子基	
3.64	-	Me	Me	吡咯烷基	
3.65	O	H	Me	叔丁基	
3.66	O	Me	Me	叔丁基	1.95/2.01
3.67	O	Me	Me	炔丙基	114-115 ℃
3.68	O	Δ	Me	炔丙基	
3.69	O	Me	Δ	炔丙基	
3.70	O	Me	Me	2,2-二氯环丙基甲基	
3.71	O	Δ	Me	2,2-二氯环丙基甲基	
3.72	O	H	Me	H	
3.73	O	Me	Me	H	
3.74	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	94-96 ℃
3.75	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
3.76	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
3.77	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
3.78	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
3.79	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
3.80	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
3.81	NMe	Me	Me	Me	90-91 ℃
3.82	NMe	Me	Δ	Me	
3.83	O	Me	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	1.97/2.02
3.84	O	Δ	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	



Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据 * *
3.86	O	Me	Me	丁基	91-92 ℃
3.87	O	Me	Me	己基	84-86 ℃
3.88	O	Me	Me	甲氧基羰基甲基	127-129 ℃
3.89	O	H	Me	甲氧基羰基甲基	
3.90	O	Me	Me	3-氟苄基	
3.91	O	Me	Me	4-氟苄基	
3.92	O	Me	Me	2-氟苄基	
3.93	O	Me	Me	2-CF ₃ -苄基	
3.94	O	Me	Me	3-CF ₃ -苄基	1.96/2.00
3.95	O	Me	Me	4-CF ₃ -苄基	
3.96	O	Me	Me	3,4-二氟苄基	
3.97	O	Me	Me	2,4,6-三甲基苄基	
3.98	O	Me	Me	4-氟-2-硝基苄基	
3.99	O	Me	Me	3-甲氧基苄基	
3.100	O	Me	Me	2-苯基乙基	
3.101	O	Me	Me	3-苯基丙基	
3.102	O	Me	Me	2-(4-硝基苯基)乙基	
3.103	O	Me	Me	2-(2-CF ₃ -苯基)乙基	
3.104	O	Me	Me	2-(4-甲氧基苯基)乙基	
3.105	O	Me	Me	2-氟-6-氟苄基	
3.106	O	Me	Me	3,4-亚甲基二氧基苄基	
3.107	O	Me	Me	2-氟基苄基	
3.108	O	Me	Me	2-(4-氟苯基)乙基	
3.109	O	Me	Me	环丙基甲基	2.00/2.00
3.110	O	Me	Me	2-(1,3-二氧戊环基)甲基	
3.111	O	Me	Me	2,2,3,3-四氟环丁基甲基	

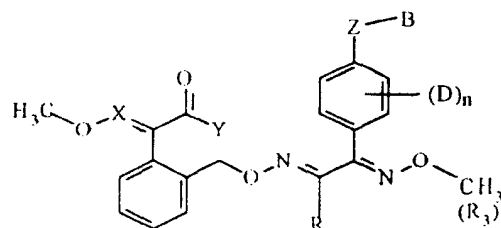
3.112 O Me Me α -氟乙氧基羰基甲基

3.113 O Me 2-噻吩基 Me

Ex.No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据**
3.114	O	Me	4-甲基苯基	Et	103-104 ℃
3.115	NMe	Me	4-甲基苯基	Me	
3.116	O	Me	Me	CH ₂ FCH ₂	95-97 ℃
3.117	O	Me	Me	2-(4-吗啉代)乙基	1.98/2.06
3.118	-	Me	Me	1-吡咯基	
3.119	O	Me	Me	2-(1-吡啶子基)乙基	1.96/1.98
3.120	O	Me	Me	2-氟苄基	90-91 ℃
3.121	O	Me	Me	4-氟苄基	130-131 ℃

**m.p. 或 R₁/R₂ 或 R₃ 的 ¹H NMR

表 4



Ex.	X	Y	R ₁	Z*	n	B 或 D	物理数据* *
4.1	CH	OMe	Me	-	1	3-CF ₃	133-135 ℃
4.2	CH	OMe	Me	-	1	4-氯	140-142 ℃
4.3	CH	OMe	Me	-	1	3-氯	175-177 ℃
4.4	CH	OMe	Me	-	1	2-氯	136-137 ℃
4.5	CH	OMe	Me	-	1	4-甲基	异构体 1: 98-101 ℃ 异构体 2: 油 异构体 3: 油
4.6	CH	OMe	Me	O	0	甲基-	104-106 ℃
4.7	CH	OMe	Me	-	1	4-溴	126-128 ℃
4.8	CH	OMe	Me	-	1	4-氟	141-144 ℃
4.9	CH	OMe	Me	-	2	3-F-5-CF ₃	164-166 ℃
4.10	CH	OMe	Me	-	0	-	141-143 ℃
4.11	CH	OMe	Me	-	1	2-甲基	113-115 ℃
4.12	CH	OMe	Me	-	1	3-溴	176-178 ℃
4.13	CH	OMe	Me	-	2	3,4-亚甲基二 氧基	143-145 ℃
4.14	CH	OMe	Me	O	0	烯丙基	77-80 ℃(异构体 1) 2.08(异构体 2)
4.15	CH	OMe	SMe	-	1	4-甲基	2.08(异构体 1) 2.11(异构体 2)
4.16	CH	OMe	Et	-	1	4-甲基	3.90(异构体 1) 3.97(异构体 2)

4.17	CH OMe Me	-	1	4-异丁基-	2.11(异构体 1)
					2.08(异构体 2)
4.18	CH OMe Me O		0	炔丙基	2.06/2.11(E/Z)

Ex.	X	Y	R _i	Z*	n	B 或 D	物理数据**
4.19	CH	OMe	Me	O	0	2,2,2-三氯乙基	2.11(异构体 1) 2.07(异构体 2)
4.20	CH	OMe	Me	O	0	乙基	93-95 ℃(异构体 1) 2.06(异构体 2)
4.21	CH	OMe	CN	-	1	4-甲基	98-133 ℃(E/Z)
4.22	CH	OMe	CN	-	1	4-氯	106-108 ℃
4.23	CH	OMe	CN	-	2	3,4-二氯	128-130 ℃ 109-111 ℃(E/Z)
4.24	CH	OMe	CN	O	0	-CF ₃	油(E/Z)
4.25	CH	OMe	CN	-	1	3-CF ₃	
4.26	CH	OMe	CN	-	1	2-氯	
4.27	CH	OMe	CN	-	1	4-氯	
4.28	CH	OMe	Me	O	0	苯基	112-124 ℃(异构体 1) 油(异构体 2)
4.29	CH	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CCl ₂	
4.30	CH	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CF ₂	
4.31	CH	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CBr ₂	
4.32	CH	OMe	Me	O	0	4-Cl-苯基	
4.33	CH	OMe	Me	O	0	4-F-苯基	
4.34	CH	OMe	Me	S	0	苯基	
4.35	CH	OMe	Me	-CH ₂ O-	0	苯基***	异构体 1: 树脂 异构体 2: 树脂
4.36	CH	OMe	Me	-OCH ₂ -	0	苯基***	油
4.37	N	OMe	Me	-	1	3-CF ₃	
4.38	N	OMe	Me	-	1	4-氯	
4.39	N	OMe	Me	-	1	3-氯	
4.40	N	OMe	Me	-	1	2-氯	111-112 ℃

4.41	N	OMe	Me	-	1	4-甲基	101-103 ℃
4.42	N	OMe	Me	O	0	4-甲基	104-106 ℃
4.43	N	OMe	Me	-	1	4-溴	134-136 ℃
4.44	N	OMe	Me	-	1	4-氟	
4.45	N	OMe	Me	-	2	3-F-5-CF ₃	
4.46	N	OMe	Me	-	0	-	
4.47	N	OMe	Me	-	1	2-甲基	105-107 ℃

Ex.	X	Y	R ₁	Z*	n	B 或 D	物理数据**
4.48	N	OMe	Me	-	1	3-溴	
4.49	N	OMe	Me	-	2	3,4-亚甲基二氧 基	
4.50	N	OMe	Me	O	0	烯丙基	74-76 °C
4.51	N	OMe	SMe	-	1	4-甲基	88-91 °C
4.52	N	OMe	Et	-	1	4-甲基	
4.53	N	OMe	Me	-	1	4-异丁基	
4.54	N	OMe	Me	O	0	炔丙基	油
4.55	N	OMe	Me	O	0	2,2,2-三氟乙基	
4.56	N	OMe	Me	O	0	乙基	油
4.57	N	OMe	CN	-	1	4-甲基	
4.58	N	OMe	CN	-	1	4-氯	
4.59	N	OMe	CN	-	2	3,4-二氯	
4.60	N	OMe	CN	O	0	-CF ₃	
4.61	N	OMe	CN	-	1	3-CF ₃	
4.62	N	OMe	CN	-	1	2-氯	
4.63	N	OMe	CN	-	1	4-氟	
4.64	N	OMe	Me	O	0	苯基	
4.65	N	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CCl ₂	
4.66	N	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CF ₂	
4.67	N	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CBr ₂	
4.68	N	OMe	Me	O	0	4-Cl-苯基	
4.69	N	OMe	Me	O	0	4-F-苯基	
4.70	N	OMe	Me	S	0	苯基	
4.71	N	OMe	Me	-CH ₂ O-	0	苯基***	
4.72	N	OMe	Me	-OCH ₂ -	0	苯基***	
4.73	N	NHCH ₃	Me	-	1	3-CF ₃	

4.74	NNHCH₃ Me	-	1	4-氯	
4.75	N NHCH₃ Me	-	1	3-氯	
4.76	NNHCH₃ Me	-	1	2-氯	2.11
4.77	N NHCH₃ Me	-	1	4-甲基	2.10
4.78	NNHCH₃ Me	O	0	甲基-	
4.79	NNHCH₃ Me	-	1	4-溴	2.09
4.80	N NHCH₃ Me	-	1	4-氯	
4.81	N NHCH₃ Me	-	2	3-F-5-CF₃	

Ex.	X	Y	R ₁	Z*	n	B 或 D	物理数据**
4.82	N	NHCH ₃	Me	-	0	-	
4.83	N	NHCH ₃	Me	-	1	2-甲基	2.05
4.84	N	NHCH ₃	Me	-	1	3-溴	
4.85	N	NHCH ₃	Me	-	2	3,4-亚甲基二氧基	
4.86	N	NHCH ₃	Me	O	0	烯丙基	118-120 °C
4.87	N	NHCH ₃	SMe	-	1	4-甲基	2.06
4.88	N	NHCH ₃	Et	-	1	4-甲基	
4.89	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-异丁基	
4.90	N	NHCH ₃	Me	O	0	炔丙基	油
4.91	N	NHCH ₃	Me	O	0	2,2,2-三氟乙基	
4.92	N	NHCH ₃	Me	O	0	乙基	油
4.93	N	NHCH ₃	CN	-	1	4-甲基	
4.94	N	NHCH ₃	CN	-	1	4-氯	
4.95	N	NHCH ₃	CN	-	2	3,4-二氯	
4.96	N	NHCH ₃	CN	O	0	-CF ₃	
4.97	N	NHCH ₃	CN	-	1	3-CF ₃	
4.98	N	NHCH ₃	CN	-	1	2-氯	
4.99	N	NHCH ₃	CN	-	1	4-氯	
4.100	N	NHCH ₃	Me	O	0	苯基	
4.101	N	NHCH ₃	Me	O	0	-CH ₂ CH=CCl ₂	
4.102	N	NHCH ₃	Me	O	0	-CH ₂ CH=CF ₂	
4.103	N	NHCH ₃	Me	O	0	-CH ₂ CH=CBr ₂	
4.104	N	NHCH ₃	Me	O	0	4-Cl-苯基	
4.105	N	NHCH ₃	Me	O	0	4-F-苯基	
4.106	N	NHCH ₃	Me	S	0	苯基	
4.107	N	NHCH ₃	Me	-CH ₂ O-	0	苯基	***
4.108	N	NHCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	苯基	***
4.109	CH	OCH ₃	Me	O	0	正丙基	异构体 1: 油

						异构体 2：油
4.110	CH	OCH ₃	Me	O	0	3,3-二甲基烯丙基 107-110 ℃(异构体 1)
						油(异构体 2)
4.111	CH	OCH ₃	Me	O	0	2-甲基-烯丙基 异构体 1： 97-99 ℃
						异构体 2：油

Ex.	X	Y	R ₁	Z*	n	B 或 D	物理数据**
4.11 2	CH	OCH ₃	Me	O	0	3-甲基烯丙基	异构体 1: 油 异构体 2: 油
4.11 3	CH	OCH ₃	Me	O	0	烯丙基	异构体 1: 74-76 °C
4.11 4	CH	OCH ₃	Me	O	0	炔丙基	油
4.11 5	CH	NHCH ₃	Me	O	0	烯丙基	
4.11 6	CH	NHCH ₃	Me	O	0	炔丙基	
4.11 7	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-CF ₃ -苯基***	异构体 1: 83-85 °C 异构体 2: 树脂
4.11 8	CH	OCH ₃	Me	O	0	3-CF ₃ -苯基	异构体 1: 127-128 °C 异构体 2: 油
4.11 9	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	C ₆ H ₁₁ ***	异构体 1: 油 异构体 2: 油
4.12 0	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	苯基***	异构体 1: 油 异构体 2: 油
4.12 1	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	4-F-苯基***	异构体 1: 油 异构体 2: 油
4.12 2	CH	OCH ₃	Me	S	0	CH ₃	异构体 1: 119-121 °C 异构体 2: 树脂
4.12 3	CH	OCH ₃	Me	-SO ₂ -	0	CH ₃	异构体 1: 泡沫 异构体 2: 树脂
4.12 4	CH	OCH ₃	Me	-CH ₂ O-	0	苯基***	异构体 1: 油 异构体 2: 树脂
4.12 5	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	4-CF ₃ -苯基***	

4.12 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 4-Br-苯基***

6

4.12 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 4-CH₃-苯基***

7

4.12 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 4-OCH₃-苯基

8

4.12 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 2-CF₃-苯基***

9

4.13 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 2-F-苯基***

0

异构体 1：油

异构体 2：油

4.13 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 2-Cl-苯基***

1

4.13 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 2-Br-苯基***

2

4.13 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 3-F-苯基***

3

异构体 1：111-112 °C

异构体 2：油

4.13 CH OCH₃ Me -OCH₂- 0 3-CCl-苯基***

4

异构体 1：油

异构体 2：油

Ex.	X	Y	R ₁	Z*	n	B 或 D	物理数据**
4.135	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-Br-苯基***	异构体 1: 树脂 异构体 2: 树脂
4.136	N	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	烯丙基***	
4.137	N	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-CF ₃ -苯基***	
4.138	N	NHCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-CF ₃ -苯基***	
4.139	N	OCH ₃	Me	-	1	2-CF ₃	油
4.140	N	OCH ₃	Me	-	1	2-CH ₃	异构体 1: 105-107 °C 异构体 2: 树脂
4.141	N	NHCH ₃	Me	-	1	2-CF ₃	树脂
4.142	N	NHCH ₃	Me	-	1	2-CH ₃	异构体 1: 油 异构体 2: 油
4.143	CH	OCH ₃	CN	-	-	H	油
4.144	CH	OCH ₃	CN	O	0	CH ₃	异构体 1: 136-138 °C 异构体 2: 树脂
4.145	CH	OCH ₃	CN	-	1	4-叔丁基	油
4.146	CH	OCH ₃	CN	O	0	苯基	油
4.147	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	异构体 1: 80-82 °C
4.148	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHCl ₂	
4.149	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHBr ₂	
4.150	N	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.151	N	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.152	N	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.153	N	NHCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.154	N	NHCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.155	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-乙基	异构体 1: 油 异构体 2: 油
4.156	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-叔丁基	异构体 1: 树脂 异构体 2: 油

4.157	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-CF ₃	异构体 1：树脂
							异构体 2：101-102 ℃
4.158	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	1	4-Cl-苯基***	
4.159	CH	OMe	CN	O	0	苯基	
4.160	N	OCH ₃	Me	-SO ₂ -	0	Et	泡沫

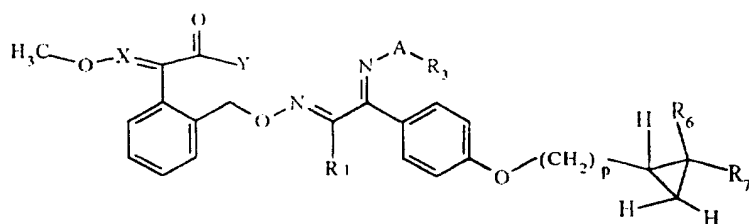
Ex.	X	Y	R ₁	Z*	n	B 或 D	物理数据**
4.161	N	NHCH ₃	Me	-SO ₂ -	0	Et	141-143 °C
4.162	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	SiMe ₃	异构体 1: 树脂 异构体 2: 油
4.163	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHFCI	异构体 1: 75-76 °C
4.164	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHFBr	异构体 1: 树脂
4.165	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHFCF	异构体 1: 82-84 °C
4.166	CH	OCH ₃	Me	S	0	³ Et	异构体 1: 油 异构体 2: 油
4.167	CH	OCH ₃	Me	S	0	n-C ₃ H ₇	异构体 1: 油 异构体 2: 油
4.168	CH	OCH ₃	Me	-SCH ₂ -	0	3-CF ₃ -苯基	
4.169	CH	OCH ₃	Me	-SO ₂ CH ₂ -	0	3-CF ₃ -苯基	
4.170	CH	OCH ₃	Me	-SO ₂ CH ₂ -	1	<u>B</u> 3-CF ₃ -苯基	<u>D</u> 3-F [#] # 异构体 1: 112-114 °C # 异构体 2: 树脂

*在 Z 栏中的字符“-”指化合物没有取代基-Z-B。

**物理数据: m.p. 或 R₁ 或 R₃ 的 ¹H NMR, 根据本表标题的结构式, R₃ 总是 CH₃。

***基团 Z 应以这样一种方式读取: 该结构骨架处在所述结构基元的左边, 而取代基 B 处在右边。例如, 在化合物 4.107 中取代基 Z-B 是 -CH₂O-苯基。

表 5



Ex.No.	X	Y	A	R ₁	R ₃	R ₆	R ₇	p	物理数据
5.1	CH	OCH ₃	NMe	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.2	CH	OCH ₃	NMe	H	Me	Cl	Cl	1	
5.3	CH	OCH ₃	NMe	Me	Me	F	F	1	
5.4	CH	OCH ₃	NMe	Me	Et	F	F	1	
5.5	CH	OCH ₃	NMe	Me	Me	Br	Br	1	
5.6	CH	OCH ₃	NPh	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.7	CH	OCH ₃	NPh	H	Me	Cl	Cl	1	
5.8	CH	OCH ₃	NPh	Me	Et	Cl	Cl	1	
5.9	CH	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	1	异构体 1: 86-88 ℃ 异构体 2: 树脂 异构体 3: 树脂
5.10	CH	OCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	1	
5.11	CH	OCH ₃	O	Me	Me	F	F	1	
5.12	CH	OCH ₃	O	H	Me	F	F	1	
5.13	CH	OCH ₃	O	Me	H	F	F	1	
5.14	CH	OCH ₃	O	Me	C ₃	Cl	Cl	1	
				H ₇					
5.15	CH	OCH ₃	O	Me	Δ	Cl	Cl	1	
5.16	CH	OCH ₃	O	Δ	Me	Cl	Cl	1	
5.17	CH	OCH ₃	O	Me	Δ	Cl	Cl	1	
5.18	CH	OCH ₃	O	Me	Me	Br	Br	1	泡沫
5.19	CH	OCH ₃	O	H	Me	Br	Br	1	
5.20	CH	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	2	

5.21 CH_3OCH_3 O H Me Cl Cl 2

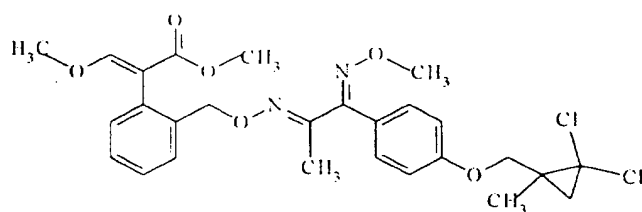
Ex.No.	X	Y	A	R ₁	R ₃	R ₆	R ₇	p	物理数据
5.22	CH	OCH ₃	O	Me	Me	F	F	2	
5.23	N	OCH ₃	NMe	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.24	N	OCH ₃	NMe	H	Me	Cl	Cl	1	
5.25	N	OCH ₃	NMe	Me	Me	F	F	1	
5.26	N	OCH ₃	NMe	Me	Et	F	F	1	
5.27	N	OCH ₃	NMe	Me		Br	Br	1	
5.28	N	OCH ₃	NPh	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.29	N	OCH ₃	NPh	H	Me	Cl	Cl	1	
5.30	N	OCH ₃	NPh	Me	Et	Cl	Cl	1	
5.31	N	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.32	N	OCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	1	
5.33	N	OCH ₃	O	Me	Me	F	F	1	
5.34	N	OCH ₃	O	H	Me	F	F	1	
5.35	N	OCH ₃	O	Me	H	F	F	1	
5.36	N	OCH ₃	O	Me	C ₃	Cl	Cl	1	
					H ₇				
5.37	N	OCH ₃	O	Me	Δ	Cl	Cl	1	
5.38	N	OCH ₃	O	Δ	Me	Cl	Cl	1	
5.39	N	OCH ₃	O	Me	Δ	Cl	Cl	1	
5.40	N	OCH ₃	O	Me	Me	Br	Br	1	
5.41	N	OCH ₃	O	H	Me	Br	Br	1	
5.42	N	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	2	
5.43	N	OCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	2	
5.44	N	OCH ₃	O	Me	Me	F	F	2	
5.45	N	NHCH ₃	NMe	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.46	N	NHCH ₃	NMe	H	Me	Cl	Cl	1	
5.47	N	NHCH ₃	NMe	Me	Me	F	F	1	
5.48	N	NHCH ₃	NMe	Me	Et	F	F	1	

5.49	N	NHCH₃	NMe Me	Br	Br	1	
5.50	CH	OCH₃	O	Me Me	H	H	1
							异构体 1: 油
							异构体 2: 油
5.51	N	OCH₃	O	Me Me	Cl	Cl	1
							异构体 1: 油
5.52	N	NHCH₃	O	Me Me	Cl	Cl	1
							137-139 °C
5.53	N	NHCH₃	O	Me Me	Cl	Cl	1

Ex.No.	X	Y	A	R ₁	R ₃	R ₁	R ₁	p	物理数据
5.54	N	NHCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	1	
5.55	N	NHCH ₃	O	Me	Me	F	F	1	
5.56	N	NHCH ₃	O	H	Me	F	F	1	
5.57	N	NHCH ₃	O	Me	H	F	F	1	
5.58	N	NHCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	2	
5.59	N	NHCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	2	
5.60	N	NHCH ₃	O	Me	Me	F	F	2	

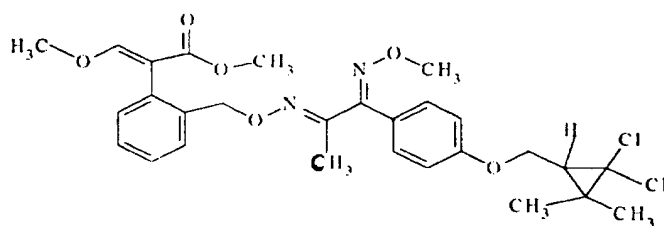
和化合物

5.61



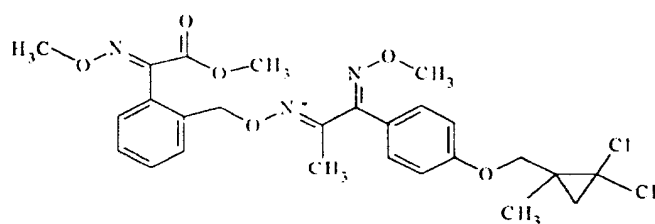
异构体 1: 113-115 °C/异构体 2: 油

5.62



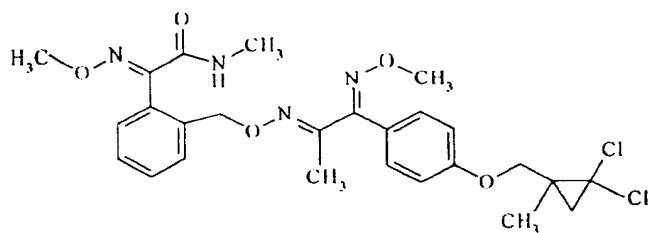
异构体 1: 油/异构体 2: 油

5.63

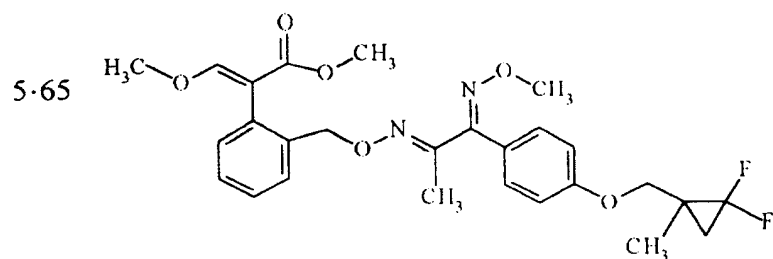


树脂

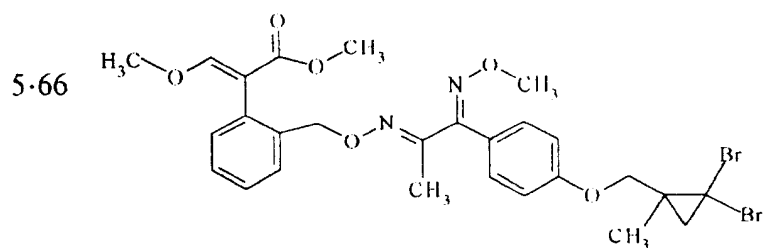
5.64



155-160 °C

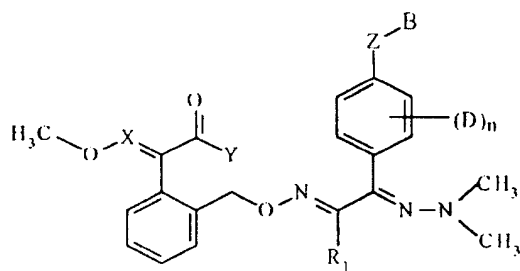


异构体 1: 109-110 °C / 异构体 2: 树脂



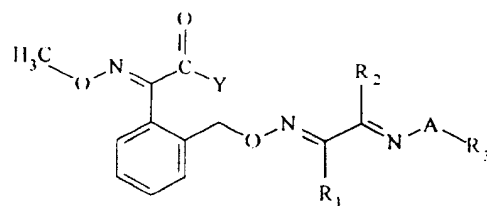
异构体 1: 131-133 °C / 异构体 2: 树脂

**物理数据: m.p. 或 R₁/R₂ 或 R₃ 的 ¹H NMR

表 6

Ex.	X	Y	R ₁	Z*	n	B 或 D	物理数据**
6.1	CH	OCH ₃	Me	O	0	烯丙基	油
6.2	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-Br	异构体 1: 油 异构体 2: 油
6.3	N	OCH ₃	Me	O	0	烯丙基	油
6.4	N	OCH ₃	Me	-	1	4-Br	131-132 °C
6.5	N	NHCH ₃	Me	O	-	烯丙基	油
6.6	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-Br	异构体 1: 117-119 °C 异构体 2: 油
6.7	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-甲基-	异构体 1: 2.10 异构体 2: 2.08
6.8	N	OCH ₃	Me	-	1	4-甲基-	
6.9	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-甲基-	

表 7:



Ex.No.	Y	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据**
7.1	OEt	NMe	Me	Me	Me	
7.2	OEt	NMe	H	Me	6-CF ₃ -2-吡啶基	
7.3	OEt	NMe	Me	Δ	6-CF ₃ -2-吡啶基	
7.4	OEt	NMe	Me	H	苯基	
7.5	OEt	NMe	Me	Me	苯基	
7.6	OEt	NMe	Δ	Me	苯基	
7.7	OEt	NMe	H	Me	4-吗啉基	
7.8	OEt	NPh	H	Me	苯基	
7.9	OEt	NPh	Me	Me	苯基	
7.10	OEt	NPh	Me	Δ	苯基	
7.11	OEt	NPh	Δ	Me	苯基	
7.12	OEt	O	Me	Me	Me	75 ℃
7.13	OEt	O	H	Me	Me	
7.14	OEt	O	Δ	Me	Me	
7.15	OEt	O	Me	Δ	Me	
7.16	OEt	O	Me	H	Me	
7.17	OEt	O	Me	Me	苯基	
7.18	OEt	O	Me	Me	苄基	
7.19	OEt	O	Me	Me	3-CF ₃ -2-吡啶基	
7.20	OEt	O	Me	Me	3-CF ₃ -苯基	
7.21	NH ₂	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -苯基	
7.22	NH ₂	NMe	H	Me	4-CF ₃ -苯基	

Ex.No.	Y	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据
						**

7.23	NH ₂	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -苯基
7.24	NH ₂	NMe	Me	Me	2-氯苯
7.25	NH ₂	NMe	Me	Me	3-氯苯
7.26	NH ₂	NMe	Me	Me	4-氯苯
7.27	NH ₂	O	Me	Me	苯基
7.28	NH ₂	O	Me	Me	Me
7.29	NH ₂	O	Me	Me	苄基
7.30	NH ₂	O	Me	Me	Et
7.31	NH ₂	O	H	Me	Et
7.32	NH ₂	O	Δ	Me	Et
7.33	NH ₂	O	Me	Δ	Et
7.34	NH ₂	O	Me	H	Et
7.35	NH ₂	O	Me	Me	甲氧基甲基
7.36	NH ₂	O	Me	Δ	甲氧基甲基
7.37	NH ₂	O	Δ	Me	甲氧基甲基
7.38	NH ₂	O	Me	Me	乙氧基甲基
7.39	NH ₂	O	H	Me	炔丙基
7.40	NH ₂	O	Me	Me	氰基甲基
7.41	NH ₂	O	Me	Me	H
7.42	NH ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂
7.43	NH ₂	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂
7.44	NH ₂	O	Me	H	CF ₃ CH ₂
7.45	NH ₂	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂
7.46	NH ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂
7.47	NH ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂
					CH ₂
7.48	NH ₂	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂

CH ₂					
7.49	NHEt	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -苯基
7.50	NHEt	NMe	H	Me	4-CF ₃ -苯基
7.51	NHEt	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -苯基
7.52	NHEt	NMe	Me	Me	2-氯苯基
7.53	NHEt	NMe	Me	Me	3-氯苯基
7.54	NHEt	NMe	Me	Me	4-氯苯基

Ex.No.	Y	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据**
7.55	NHEt	O	Me	Me	苯基	77 ℃
7.56	NHEt	O	Me	Me	Me	
7.57	NHEt	O	Me	Me	苄基	
7.58	NHEt	O	Me	Me	Et	
7.59	NHEt	O	H	Me	Et	
7.60	NHEt	O	Δ	Me	Et	
7.61	NHEt	O	Me	Δ	Et	
7.62	NHEt	O	Me	H	Et	
7.63	NHEt	O	Me	Me	甲氧基甲基	
7.64	NHEt	O	Me	Δ	甲氧基甲基	
7.65	NHEt	O	Δ	Me	甲氧基甲基	
7.66	NHEt	O	Me	Me	乙氧基甲基	
7.67	NHEt	O	H	Me	炔丙基	
7.68	NHEt	O	Me	Me	氯基甲基	
7.69	NHEt	O	Me	Me	H	
7.70	NHEt	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	
7.71	NHEt	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
7.72	NHEt	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
7.73	NHEt	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.74	NHEt	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.75	NHEt	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ C H ₂	
7.76	NHEt	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ C H ₂	
7.77	N(Me) ₂	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -苯基	
7.78	N(Me) ₂	NMe	H	Me	4-CF ₃ -苯基	
7.79	N(Me) ₂	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -苯基	
7.80	N(Me) ₂	NMe	Me	Me	2-氯苯基	

7.81	N(Me)₂	NMe	Me	Me	3-氯苯基
7.82	N(Me)₂	NMe	Me	Me	4-氯苯基
7.83	N(Me)₂	O	Me	Me	苯基
7.84	N(Me)₂	O	Me	Me	Me
7.85	N(Me)₂	O	Me	Me	苄基
7.86	N(Me)₂	O	Me	Me	Et

Ex.No.	Y	A	R ₁	R ₂	R ₃ 或 NR ₃ R ₄	物理数据**
7.87	N(Me) ₂	O	H	Me	Et	
7.88	N(Me) ₂	O	Δ	Me	Et	
7.89	N(Me) ₂	O	Me	Δ	Et	
7.90	N(Me) ₂	O	Me	H	Et	
7.91	N(Me) ₂	O	Me	Me	甲氧基甲基	
7.92	N(Me) ₂	O	Me	Δ	甲氧基甲基	
7.93	N(Me) ₂	O	Δ	Me	甲氧基甲基	
7.94	N(Me) ₂	O	Me	Me	乙氧基甲基	
7.95	N(Me) ₂	O	H	Me	炔丙基	
7.96	N(Me) ₂	O	Me	Me	氰基甲基	
7.97	N(Me) ₂	O	Me	Me	H	
7.98	N(Me) ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	
7.99	N(Me) ₂	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
7.100	N(Me) ₂	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
7.101	N(Me) ₂	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.102	N(Me) ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.103	N(Me) ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ C H ₂	
7.104	N(Me) ₂	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ C H ₂	

2. 式 I 的活性成分的配制剂实施例 (%=重量百分数)

2.1. 可湿性粉剂

	a)	b)	c)
表 1-7 中的活性成分	25%	50%	75%
木素磺酸钠	5%	5%	-
月桂基硫酸钠	3%	-	5%
二异丁基萘磺酸钠	-	6%	10%
辛基苯酚聚乙二醇醚 (7-8mol 环氧乙烷)	-	2%	-
高度分散的硅石	5%	10%	10%
高岭土	62%	27%	-

活性成分与各种添加剂混合均匀，然后混合物在合适的研磨机中充分研磨。得到可湿性粉剂，它能够用水稀释得到任何所需浓度的悬浮液。

2.2. 乳化浓缩物

表 1-7 中的活性成分	10%
辛基苯酚聚乙二醇醚 (4-5mol 环氧乙烷)	3%
十二烷基苯磺酸钙	3%
环己酮	34%
二甲苯混合物	50%

通过用水稀释能够从这一浓缩物制备任何期望稀释程度的乳液。

2.3. 粉剂

	a)	b)
表 1-7 中的活性成分	5%	8%
滑石	95%	-
高岭土	-	92%

通过将活性成分与载体混合并在合适的研磨机中研磨而获得随时可用的粉剂。

2.4.挤出粒料

表 1-7 中的活性成分	10%
木素磺酸钠	2%
羧甲基纤维素	1%
高岭土	87%

活性成分与添加剂混合，混合物然后进行研磨并用水润湿。混合物被挤出，随后在空气流中干燥。

2.5.涂覆粒剂

表 1-7 中的活性成分	3%
聚乙二醇(MW200)	3%
高岭土	94%

(MW=分子量)

在一混合机中，将磨细的活性成分均匀施加到已用聚乙二醇润湿的高岭土中。得到无粉尘的涂覆粒剂。

2.6.悬浮浓缩物

表 1-7 中的活性成分	40%
乙二醇	10%
壬基苯酚聚乙二醇醚 (15mol 环氧乙烷)	6%
木素磺酸钠	10%
羧甲基纤维素	1%
37%甲醛水溶液	0.2%
75%水乳液形式的硅油	0.8%
水	32%

磨细的活性成分与添加剂紧密地混合。得到悬浮浓缩物，通过用水稀释能够从它制备任何所需稀释程度的悬浮液。

3.生物学实施例

A)杀微生物作用

实施例 B - 1: 抵抗番茄上的致病疫霉的作用

a)治愈作用

番茄植株 cv. “Roter Gnom” 生长 3 星期，然后喷洒霉菌的游动孢子悬浮液，并在温室中于 18-20 °C 下和在饱和大气湿度下培养。24 小时后中断加湿。在植株干燥后用一种混合物喷洒植株，该混合物包含 200ppm 浓度的已配制成可湿性粉剂的活性成分。在喷洒层干燥后，植株返回湿润的温室中培养 4 天。在这段时间之后产生的典型叶斑的数目和尺寸可用来评价试验物质的活性。

b)预防性内吸作用

已被配制成可湿性粉剂的活性成分以 60ppm(相对于土壤体积)的浓度施用于盆中生长 3 星期的番茄植株 cv. “Roter Gnom” 的土壤表面上。在植株放置 3 天后，叶片的下侧用致病疫霉的游动孢子悬浮液喷洒。植株然后在 18-20 °C 和饱和大气湿度下在喷洒室中放置 5 天。在这段时间过后，产生典型的叶斑，它的数目和尺寸用来评价试验物质的活性。

而未处理过的但已感染的对照植株却显示出 100% 的感染率，根据任何一个表中的式 I 的活性成分，尤其是化合物 No.1.5, 1.24, 1.117, 2.24, 2.74 和 3.24, 使得在两个试验中的感染率降低至 20% 或 20% 以下。

实施例 B - 2: 对葡萄藤上的葡萄生单轴霉 (Bert.et Curt.) (Berl.et De Toni) 的抵抗作用。

a) 残留防治作用

葡萄藤插条 cv. “Chasselas” 在温室中生长。当它们到达 10 叶阶段时，3 棵植株用混合物 (200ppm 活性成分) 喷洒。在植株上的喷洒涂层干燥后，叶子的下侧均匀地接种霉菌的孢子悬浮液。植株随后在潮湿的室内放置 8 天。在这段时间过后，对照植株的病害症状明显发展。在处理过的植株上的病斑的数目和尺寸用来评价试验物质的活性。

b)治愈作用

葡萄藤插条 cv. “Chasselas” 在温室中生长, 当它们到达 10 叶阶段时, 在叶子的下侧用葡萄生单轴霉的孢子悬浮液接种。在植株在潮湿的室内保持 24 小时后, 用活性成分的混合物 (200ppm 活性成分) 喷洒它们。植株随后在潮湿的室内再放置 7 天。在这段时间过后, 在对照植株上发展了病害症状。在处理过的植株上的病斑的数目和尺寸用来评价试验物质的活性。

与对照植株相比较, 用式 I 的活性成分处理过的植株的感染率是 20% 或 20% 以下。

实施例 B - 3: 对制糖甜菜上德巴利腐霉的抵抗作用 (Beta vulgaris)

a)在土壤施用后的作用

霉菌在无菌燕麦谷粒上生长, 然后加入到土和砂的混合物中。这一接种土壤被装填到花盆中, 播种制糖甜菜的种子。在播种之后立即将试验制剂 (已配制成可湿性粉剂) 以水悬浮液 (20ppm 活性成分, 相对于土壤体积) 的形式倾注在土壤上。之后将盆放在温室中在 20-24 °C 下放置 2-3 星期。在所有的时间, 通过用水轻微地喷雾使土壤保持均匀的潮湿。当进行评价时, 确定制糖甜菜植株的出苗率以及健康植株和患病植株的比例。

b)种子涂饰后的作用

霉菌在无菌燕麦谷粒上生长, 然后加入到土和砂的混合物中。这一接种土壤被装填到花盆中, 播种已用配制成种子涂饰粉剂的试验制剂 (1000ppm 活性成分, 相对于种子重量) 涂饰过的制糖甜菜种子。将盆与种子一起在 20-24 °C 的温室中放置 2-3 星期。通过用水轻微地喷雾使土壤保持均匀的潮湿。当进行评价时, 确定制糖甜菜植株的出苗率以及健康植株和患病植株的比例。

在用式 I 的活性成分, 尤其是用化合物 No.1.5, 1.24, 1.117, 2.24, 2.74 和 3.24 处理之后, 超过 80% 的植株出苗并具有健康的外观。在对照盆中, 只有几株具有不健康外观的植株出苗。

实施例 B - 4：抵抗花生上的落花生尾孢的残留保护作用

10-15cm 高的花生植株用含水喷射混合物（0.02%的活性成分）喷射至滴点(drip point)，和 48 小时后，用霉菌的分生孢子悬浮液接种。植株在 21℃和高大气湿度下培养 72 小时，随后放置在温室中一直到典型的叶斑发展为止。在接种 12 天后根据叶斑的数目和尺寸分析活性成分的作用。式 I 的活性成分引起叶斑减少至低于约 10%的叶子表面积。在一些情况下，病害被完全减少（0-5%感染）。

实施例 B - 5：抵抗小麦上禾柄锈菌的作用

a) 残留保护作用

在播种 6 天后，小麦植株用含水喷射混合物（0.02%的活性成分）喷射至滴点，和 24 小时后，用霉菌的夏孢子悬浮液接种。在 48 小时的培养时间（条件：在 20℃，相对湿度 95-100%）之后，将植株放入 22℃的温室中。在接种 12 天后，分析锈疤的发展情况。

b) 内吸作用

播种 5 天后，将含水喷射混合物（0.006%的活性成分，相对于土壤体积）倾倒在小麦植株附近。小心避免喷射混合物与植株的地上部分的任何接触。48 小时后，植株用霉菌的夏孢子悬浮液接种。在 48 小时的培养时间（条件：在 20℃，相对湿度 95-100%）之后，将植株放入 22℃的温室中。在接种 12 天后，分析锈疤的发展情况。

式 I 的化合物，尤其是表 1 中那些化合物，特别是 No.1.5，1.24，1.117 和 2.74，引起霉菌感染率显著减少，在一些情况下降至 10-0%。

实施例 B - 6：抵抗水稻上的稻梨孢的作用

a) 残留保护作用

水稻植株生长 2 星期，然后用含水喷射混合物（0.02%的活性成分）喷射至滴点，和 48 小时后，用霉菌的分生孢子悬浮液接种。在接种 5 天后分析霉菌感染率，在这段时间相对大气湿度保持在 95-100%和温度保持在

22 ℃。

b)内吸作用

将含水喷射混合物（0.006%的活性成分，相对于土壤体积）倾倒在已生长2星期的植株附近。小心避免喷射混合物与植株的地上部分的任何接触。然后，盆内装上一定量的水以使水稻植株的茎的最低部分被浸没。96小时后，植株用霉菌的分生孢子悬浮液接种，并在相对大气湿度95-100%和温度24 ℃下保持5天。在许多情况下，式I的化合物防止了感染植株上病害的发展。

实施例 B - 7：抵抗苹果树上的苹果黑星菌的残留保护作用

长有10-20cm长的新枝的苹果插条用喷射混合物（0.02%的活性成分）喷射至滴点，和24小时后，用霉菌的分生孢子悬浮液接种。植株在95-100%的相对大气湿度下培养5天，并在温室中于20-24 ℃下再保持10天。在接种15天后分析黑星病感染。

表1，2或3中的任何一个表中的大多数式I的化合物具有持续的抵抗黑星病病害的作用。

实施例 B - 8：抵抗大麦上的禾白粉菌的作用

a)残留保护作用

约8cm高的大麦植株用喷射混合物（0.02%的活性成分）喷射至滴点，和3-4小时后，用霉菌的分生孢子撒粉。将接种植株放入22 ℃的温室中。在接种10天后分析霉菌感染率。

b)内吸作用

将含水喷射混合物（0.002%的活性成分，相对于土壤体积）倾倒在约8cm高的植株附近。小心避免喷射混合物与植株的地上部分的任何接触。48小时后，植株用霉菌的分生孢子撒粉。将接种植株放入22 ℃的温室中。在接种10天后分析霉菌感染率。

式I的化合物，尤其是化合物No.1.117，2.24和3.24，一般能够将

病害减少至 20% 以下，在一些情况下完全减少。

实施例 B - 9：对苹果树枝上的白叉丝单囊壳细菌的抵抗作用

残留保护作用

长有约 15cm 长的新枝的苹果树插条用喷射混合物（0.06% 活性成分）喷射。24 小时后，处理过的植株用霉菌的分生孢子悬浮液接种，并放入 70% 的相对大气湿度和 20 °C 下的环境控制室内。接种 12 天后分析霉菌感染率。

式 I 的活性成分使病害减少至 20% 以下。对照植株显示出病害水平 100%。

实施例 B - 10：对苹果果实上的灰葡萄孢的抵抗作用

残留保护作用

人工伤害的苹果通过对伤口滴施一种喷射混合物（0.02% 活性成分）进行处理。处理过的果实随后用霉菌的孢子悬浮液接种，并在高大气湿度和约 20 °C 下培养 1 星期。试验物质的杀菌作用从显示腐烂印记的伤口的数目推断。

式 I 的活性成分能够减少腐烂的蔓延，在一些情况下完全减少。

实施例 B - 11：对禾长蠕孢的抵抗作用

小麦粒用霉菌的孢子悬浮液污染，并干燥。污染过的麦粒用试验物质的悬浮液（600ppm 活性成分，相对于种子重量）涂饰。两天后，麦粒放在含有琼脂的合适碟上，再过四天后，检查麦粒周围霉菌菌落的发展。根据菌落的数目和尺寸来分析试验物质。

在一些情况下由式 I 的化合物显示出良好的作用，即抑制霉菌菌落的作用。

实施例 B - 12：对黄瓜上的葫芦科刺盘孢的抵抗作用

黄瓜植株生长 2 星期，然后用喷射混合物（浓度 0.002%）喷射。2 天后，植株用霉菌的孢子悬浮液（ 1.5×10^5 孢子/ml）接种，并在 23 °C 和高

大气湿度下培养 36 小时。然后在正常大气湿度和约 22-23 °C 下继续培养。接种 8 天后分析已发展的霉菌感染。未处理的,但感染的对照植株显示 100% 的霉菌感染率。

在一些情况下,由式 I 的化合物,尤其是 No.1.5 和 3.24,显示实际上完全抑制病害感染。

实施例 B - 13: 对黑麦上的雪腐镰孢的抵抗作用

被雪腐镰孢自然感染的黑麦 cv.Tetrahell 通过使用混合鞣用试验杀霉菌剂涂饰,使用以下浓度: 20 或 6ppm 的 a.i. (相对于种子重量)。

使用种子条播机,已感染和处理的黑麦在十月条播在田野中,在 6 条播沟的 3m 地段。每种浓度重复三次。

一直到评价感染时为止,试验植株在正常田间条件(优选在冬季完全覆盖雪的区域)下生长。

为了分析药害,记下在秋季的发芽率和在春季的每单位面积的植株数/每植株的分蘖数。

为了确定活性成分的活性,在雪融化后立即记下镰孢霉菌感染的植株百分数。在这一情况下,感染植株的数目低于 5%。出芽的植株具有健康的外观。

实施例 B - 14: 对小麦上的颖枯壳针孢的抵抗作用

处在 3 叶阶段的小麦植株用喷射混合物 (60ppm 的 a.i.) 喷射,该混合物是用活性成分的可湿性粉剂 (2.8:1) 制备的。

24 小时后,处理过的植株用霉菌的分生孢子悬浮液接种。植株随后在 90-100% 的相对大气湿度下培养 2 天,并在 20-24 °C 的温室中再放置 10 天。接种 13 天后,分析霉菌感染率。低于 1% 的小麦植株被感染。

实施例 B - 15: 对水稻上的立枯丝核菌的抵抗作用

局部保护性土壤施用

在生长 10 天的水稻植株周围的土壤用悬浮液 (喷射混合物) 泼浇,要

求使植株的地上部分不与悬浮液接触，该悬浮液是用配制的试验物质制备的。三天后，通过在各盆的水稻植株之间放置已用立枯丝核菌感染的大麦秆的主茎而使植株接种。在 29℃ 白天温度和 26℃ 夜晚温度和 95% 的相对大气湿度下，在环境控制室内培养 6 天后，分析霉菌感染率。少于 5% 的水稻植株被感染。植株具有健康的外观。

局部保护性叶面施用

生长 12 天的水稻植株用悬浮液喷射，该悬浮液是用配制的试验物质制备的。1 天后，通过在各盆的水稻植株之间放置已用立枯丝核菌感染的大麦秆的主茎，进行接种。在 29℃ 白天温度和 26℃ 夜晚温度和 95% 的相对大气湿度下，在环境控制室内培养 6 天后，记录有关植株的情况。未处理但感染的对照植株显示 100% 的霉菌感染率。式 I 的化合物在一些情况下完全抑制病害感染。

B. 杀虫作用

实施例 B - 16：抵抗豆蚜的作用

在豌豆幼苗上繁殖豆蚜，随后用包含 400ppm 活性成分的喷射混合物喷射，然后在 20℃ 下培养。3 天和 6 天后，通过比较处理和未处理植株上的死豆蚜数目，确定总数目的减少百分率（%作用）。在这一试验中，表 1-7 中的化合物显示良好的作用。化合物 No.4.5，尤其是异构体 1，具有 80% 以上的作用。

实施例 B - 17：抵抗带斑黄瓜叶甲的作用

玉米幼苗用包含 400ppm 活性成分的含水乳液喷射混合物喷射，然后，在喷雾涂层干燥后，繁殖 10 个带斑黄瓜叶甲的第二龄幼虫，随后放入塑料容器中。6 天后，通过比较处理和未处理植株上的死幼虫数目，确定总数目的减少百分率（%作用）。

在这一试验中，表 1-7 中的化合物显示良好的作用。尤其是化合物 No.1.5，1.24，2.24，3.24，4.5，异构体 1，4.14，异构体 1，4.14，

异构体 1, 4.117, 两个异构体, 4.121, 4.170, 5.9, 异构体 1 和 5.51, 异构体 1, 具有 80% 以上的作用。

实施例 B - 18: 抵抗烟芽夜蛾的作用

大豆植株苗用包含 400ppm 活性成分的含水乳液喷射混合物喷射, 然后, 在喷雾涂层干燥后, 繁殖 10 个烟芽夜蛾的第一龄期毛虫, 随后放入塑料容器中。6 天后, 通过比较处理和未处理植株上的死毛虫数目和投饵伤害率, 确定总数目的减少百分率和投饵伤害率 (% 作用)。

在这一试验中, 表 1-7 中的化合物显示良好的作用。尤其是化合物 No.4.5, 异构体 1, 4.14, 异构体 1, 4.18, 4.117, 两个异构体, 4.121, 5.9, 异构体 1 和 5.52, 异构体 1, 具有 80% 以上的作用。

实施例 B - 19: 抵抗海灰翅夜蛾的作用

大豆植株苗用包含 400ppm 活性成分的含水乳液喷射混合物喷射, 然后, 在喷雾涂层干燥后, 繁殖 10 个海灰翅夜蛾的第三龄期毛虫, 随后放入塑料容器中。3 天后, 通过比较处理和未处理植株上的死毛虫数目和投饵伤害率, 确定总数目的减少百分率和投饵伤害率的减少百分率 (% 作用)。

在这一试验中, 表 1-7 中的化合物显示良好的作用。尤其是化合物 No.1.5, 1.24, 2.24, 3.24, 4.18, 4.5, 异构体 1, 5.9, 异构体 1 和 5.52, 异构体 1, 具有 80% 以上的作用。

C. 杀螨活性

实施例 B - 20: 抵抗棉叶螨的作用

豆植株苗上繁殖棉叶螨的混合种群, 1 天后, 用包含 400ppm 活性成分的含水乳液喷射混合物喷射, 然后, 在 25 °C 下培养 6 天, 随后进行评价。通过比较处理和未处理植株上的死卵、幼虫和成虫的数目, 确定总数目的减少百分率 (% 作用)。

在这一试验中, 表 1-6 中的化合物显示良好的作用。尤其是化合物 No.1.5, 1.24, 2.24 和 3.24, 4.5, 异构体 1, 4.14, 异构体 1, 4.117, 两个异构体, 5.9, 异构体 1 和 5.52, 异构体 1, 具有 80% 以上的作用。

实施例 B - 21：抵抗微小牛蜱的作用

将成年雌性扁虱（已将它们本身已吸满）固定在 PVC 板上并用棉线球覆盖，将 10ml 的包含 125ppm 活性成分的试验水溶液倾倒在扁虱上。取下棉线球，扁虱培养 4 星期，使它产卵。在雌性的情况下，以死亡或不育的形式，或者在卵的情况下，以杀卵作用的形式，都能够明显地显示作用。