[19]中华人民共和国专利局

[51]Int.Cl[6]
C07D239/56
A01N 43/54

[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 96103085.2

[43]公开日 1997 年 1 月 8 日

[11] 公开号 CN 1139671A

[22]申请日 96.3.8

[30]优先权

[32]95.3.10 [33]GB[31]9504920.1

[71]申请人 山道士有限公司

地址 瑞士巴塞尔

[72]发明人 G·W·克雷格 M·埃伯利 F·绍布

[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 谭明胜

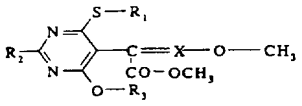
权利要求书 6 页 说明书 65 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 4-烷硫基嘧啶-5-基乙酸衍生物

[57]摘要

本发明公开了式 I 的 2-（4-烷硫基-嘧啶-5-基）-乙酸衍生物、这些化合物控制植物病原体的用途及所述用途的组合物和式 I 化合物的制备方法，

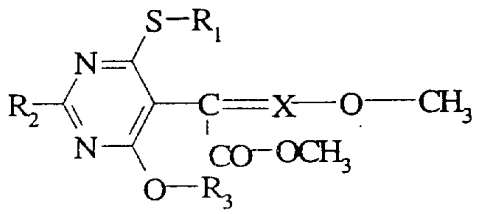
其中 R_1、R_2、R_3 和 X 的定义同说明书。



(I)

权 利 要 求 书

1.式 I 化合物



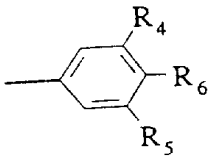
(I)

其中

R_1 是 C_{1-4} 烷基;

R_2 是氢、 C_{1-4} 烷基或 C_{3-7} 环烷基;

R_3 是下式基团



式中

R_4 是氢、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 卤代烷基、芳基、芳氧基、 C_{3-5} 链烯氧基、 C_{3-5} 炔氧基、卤素、氰基、芳基-C_{1-4} 烷氧基、芳氧基-C_{1-4} 烷基、杂芳基、杂芳氧基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 烷氧基-C_{1-4} 烷氧基、氰基-C_{1-4} 烷氧基、 C_{3-5} 链烯基、芳氧基-C_{1-4} 烷氧基、 C_{3-7} 环烷基、卤代-C_{3-7} 环烷基、 C_{3-5} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基羰基、-$CONR_9R_{10}$、-O-$CONR_9R_{10}$ 或-CR_8 = N-O-R_7, 上述基团的芳环上可任意带有取代基;

R_5 是氢、卤素、 C_{1-4} 烷氧基或 C_{1-4} 烷基;

R_6 是氢、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、氰基、硝基或卤素;

R_7 是 C_{1-4} 烷基、 C_{3-5} 链烯基、 C_{3-5} 炔基或芳基-C_{1-4} 烷基;

R_8 是氢、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、二-C_{1-4} 烷基氨基、 C_{1-4} 卤代烷基、卤素、氰基、 C_{1-4} 烷氧基羰基或 C_{3-7} 环烷基;

R_9和R_{10}独立地是氢或C_{1-4}烷基，或者一起是C_{3-6}亚烷基或被氧或硫原子隔断的C_{3-6}亚烷基；和

X是CH或N。

2.权利要求1的化合物，其中R_2和R_8各自独立地是氢或甲基。

3.权利要求1或2的化合物，其中R_1是甲基。

4. 权利要求1或2的化合物，其中R_2是甲基。

5.权利要求1或2的化合物，其中R_5是氢或甲基。

6.权利要求1或2的化合物，其中R_6是氢。

7.权利要求1或2的化合物，其中X是CH。

8.权利要求1或2的化合物，其中R_4是C_{1-4}烷基、C_{1-4}卤代烷基、苯基、苯氧基、氰基苯氧基、氯苯氧基、甲基苯氧基、二甲基苯氧基、三氟甲基苯氧基、卤素、氰基、苄氧基、异噁唑基、苯并噻唑氧基、C_{1-4}烷氧基或基团$-C(CH_3)=N-O-R_7$，其中R_7是C_{1-4}烷基、烯丙基、炔丙基或苄基。

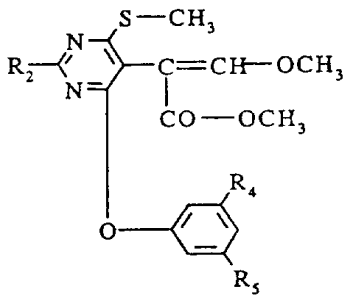
9.权利要求1或2的化合物，其中R_4是吡唑基。

10.权利要求1的化合物，其中R_1和R_2是甲基；R_5和R_6是氢；和R_4是C_{1-4}烷基、C_{1-4}卤代烷基、苯基、苯氧基、氰基苯氧基、氯苯氧基、甲基苯氧基、二甲基苯氧基、三氟甲基苯氧基、卤素、氰基、苄氧基、异噁唑基、苯异噻唑氧基、C_{1-4}烷氧基或基团$-C(CH_3)=N-O-R_7$，其中R_7是C_{1-4}烷基、烯丙基、炔丙基或苄基。

11.权利要求1的化合物，其中R_1和R_2是甲基，R_5和R_6是氢，和R_4是吡唑基。

12.权利要求10或11的化合物其中X是CH。

13.式Ia的权利要求1的化合物:



(Ia)

其中

R_2是氢或甲基;

R_4是氢、苯基、异噁唑基、C_{1-4}烷基、$-CH_2-O-$苯基、$-CH_2-O-CH_2-$苯基、$-C(CH_3)=N-O-C_{1-4}$烷基、$-C(CH_3)=N-O-C_{3-4}$链烯基、$-C(CH_3)=N-O-CH_2-$苯基,其中苯基可任意地被1或2个基团取代,所述基团独立地选自卤素、C_{1-4}烷基、C_{1-4}烷氧基或氰基;

或者R_4是任意被选自C_{1-4}烷基、氰基、硝基、卤素、C_{1-4}卤代烷基、C_{1-4}烷氧基或C_{1-4}卤代烷氧基的1至3个基团取代的苯氧基;

和

R_5是氢或甲基。

14.权利要求13的式Ia化合物,其R_2和R_5如权利要求13所定义,和R_4是吡唑基。

15.权利要求1的化合物,选自下列化合物:

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-甲氧基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(3-氯苄氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-异丙基-5-甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(1-甲基-2-乙氧基亚氨基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[-4-甲基-6-(3-(3-(1-甲基-2-乙氧基亚氨基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[-4-甲硫基-6-(3-(3-(1-甲基-2-乙氧基亚氨基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(4-氯苯基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(3-氰基苯基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-甲基苯基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

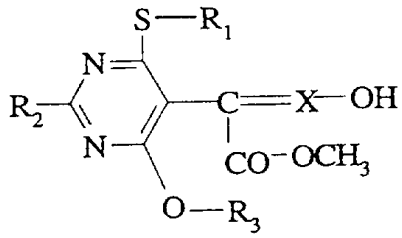
2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-叔丁基苯氧基)-嘧啶-5-基]乙酸甲酯; 和

2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3(-2-氰基苯氧基)苯氧基)-嘧啶-5-基]乙酸甲酯。

16.防治植物病原霉菌的方法, 它包括将杀霉菌有效量的权利要求1的式I化合物应用于所述霉菌或其生长栖息地。

17.杀霉菌组合物, 它包括权利要求1的式I化合物和农业上可接受的稀释剂。

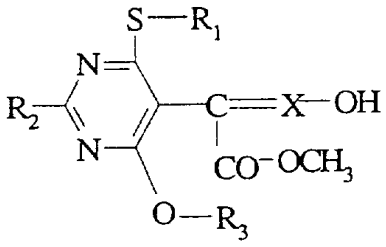
18.制备权利要求1的式I化合物的方法, 它包括使式II化合物O-甲基化,



(II)

其中 R_1、 R_2、 R_3和 X 的定义同权利要求 1 。

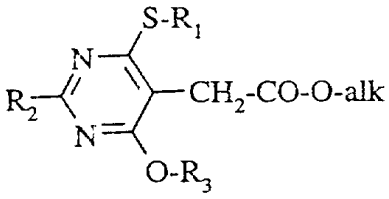
19.式 II 化合物



(II)

其中 R_1、 R_2、 R_3和 X 的定义同权利要求 1 。

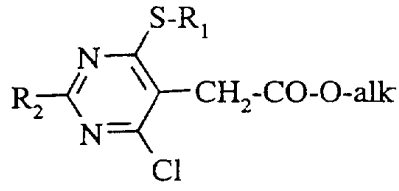
20.式 III 化合物



(III)

其中 R_1、 R_2和 R_3的定义同权利要求 1 ， 和 alk 是 C_{1-10}烷基。

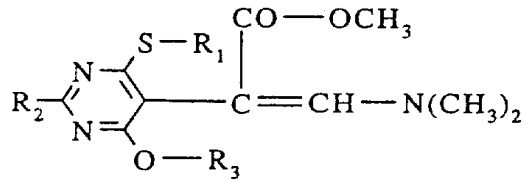
21.式 IV 化合物



(IV)

其中 R_1和 R_2的定义同权利要求 1 ， 和 alk 是 C_{1-10}烷基。

22.式 IIIa 化合物



(IIIa)

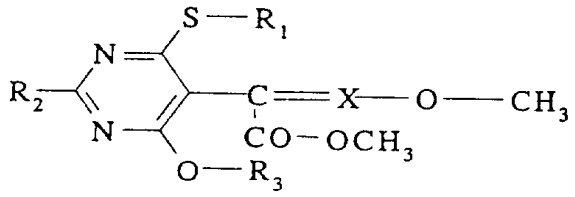
其中 R_1、 R_2和 R_3的定义同权利要求 1 。

说　明　书

4-烷硫基嘧啶-5-基乙酸衍生物

本发明涉及新的2-(4-烷硫基嘧啶-5-基)乙酸衍生物及其合成方法和控制植物病原体的用途。

现已发现式I化合物对于抗植物病原体是令人惊奇的有效:



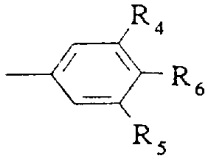
(I)

其中

R_1是C_{1-4}烷基;

R_2是氢、C_{1-4}烷基或C_{3-7}环烷基;

R_3是下式基团



式中

R_4是氢、C_{1-4}烷基、C_{1-4}卤代烷基、芳基、芳氧基、C_{3-5}链烯氧基、C_{3-5}炔氧基、卤素、氰基、芳基-C_{1-4}烷氧基、芳氧基-C_{1-4}烷基、杂芳基、杂芳氧基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}烷氧基-C_{1-4}烷氧基、氰基-C_{1-4}烷氧基、C_{3-5}链烯基、芳氧基-C_{1-4}烷氧基、C_{3-7}环烷基、卤代-C_{3-7}环烷基、C_{3-5}炔基、C_{1-4}烷氧基羰基、$-CONR_9R_{10}$、$-O-CONR_9R_{10}$或$-CR_8 = N-O-R_7$，上述基团的芳环上可任意带有取代基;

R_5是氢、卤素、C_{1-4}烷氧基或C_{1-4}烷基;

R_6是氢、C_{1-4}烷基、C_{1-4}烷氧基、氰基、硝基或卤素;

R_7是C_{1-4}烷基、C_{3-5}链烯基、C_{3-5}炔基或芳基-C_{1-4}烷基;

R_8是氢、C_{1-4}烷基、C_{1-4}烷氧基、二-C_{1-4}烷基氨基、C_{1-4}卤代烷基、卤素、氰基、C_{1-4}烷氧基羰基或C_{3-7}环烷基;

R_9和R_{10}独立地是氢或C_{1-4}烷基，或者一起是C_{3-6}亚烷基或被氧或硫原子隔断的C_{3-6}亚烷基；和

X是CH或N。

在式I基团的定义中，“烷基”应理解为直链和支链烷基，优选支链的和低级的烷基。例如烷基的实例是甲基、乙基、正丙基，异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基或仲丁基。“烷氧基”的实例包括甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基或仲丁氧基。“卤素”意指氟、氯、溴或 碘，优选氟和氯。“卤代烷基”意指一卤代至全卤代的直链或支链烷基，优选全氟代的直链低级烷基且氟和氯是优选的卤素。实例是三氟甲基、二氟甲基、 2,2,2-三氟乙基或2,2,3,3,3-五氟丙基。“芳基”代表芳烃基，例如苯基、萘基或蒽基，优选苯基。所述芳基可任意地再被取代。“芳氧基”意指通过氧原子键合的芳基，实例是苯氧基、萘氧基或蒽氧基。芳氧基的芳基部分可任意地再被取代。烷氧基烷氧基的实例包括甲氧基甲氧基、乙氧基甲氧基、甲氧基乙氧基或乙氧基乙氧基。氰基烷氧基包含例如氰基甲氧基、 1-氰基乙氧基或2-氰基乙氧基。链烯氧基代表例如烯丙氧基、 2-丁烯氧基、 3-丁烯氧基、 2-戊烯氧基、 2-甲基烯丙氧基、 3-戊烯基氧基、 4-戊烯基氧基、 2-甲基丁烯氧基、 3-甲基丁烯氧基或3-甲基-3-丁烯氧基。炔氧基的实例是炔丙氧基、 2-丁炔氧基、 2-戊炔氧基、 3-戊炔氧基、 4-戊炔氧基、 2-甲基-3-丁炔氧基或2-甲基炔丙氧基。芳烷氧基的实例是苄氧基、 2-苯基乙氧基或1-苯基乙氧基

或 3-苯基丙氧基。芳烷氧基的芳环上还有任意地被取代。芳氧基烷氧基的实例是苯氧甲氧基、 1-苯氧乙氧基、 2-苯氧乙氧基、 3-苯氧丙氧基或 2-苯氧丙氧基。芳氧烷氧基的芳基上还可任意被取代。芳氧烷基或杂芳氧烷基指的是芳基或杂芳基通过氧原子与烷基相连。典型的例子是苯氧甲基、苯氧乙基或苯氧丙基。芳氧基烷基或杂芳氧基烷基的芳环上还可任意被取代。链烯基指的是例如乙烯基、烯丙基、 2-丁烯基、 3-丁烯基、 2-戊烯基、 2-甲基烯丙基、 3-戊烯基、 4-戊烯基、 2-甲基丁烯基、 3-甲基-2-丁烯基或 3-甲基-3-丁烯基。炔基的实例是乙炔基、炔丙基、 2-丁炔基、 3-丁炔基、 2-戊炔基、 3-戊炔基、 4-戊炔基、 2-甲基-3-丁炔基或 1-甲基炔丙基。杂芳基代表含有选自氮、氧和硫的 1 、 2 或 3 个环原子的芳香族 5-或 6-元环状基团，该环状基团可以与其它杂芳基或芳基稠合。杂芳基可以任意地被取代。杂芳基实例有吡啶基、嘧啶基、噻吩基、噁唑基、噁二唑基、三唑基、噻二唑基、呋喃基、异噁唑基、噻唑基、咪唑基、哒嗪基、喹啉基、喹唑啉基、苯并咪唑基、吡唑基、苯并噻唑基、苯并噁唑基等。杂芳氧基代表通过氧桥连接的杂芳基。 R^8 和 R^9 任意形成的亚烷基桥与它们相连的氮原子一起形成通过该氮原子键接的例如吡咯烷基或哌啶基。其中该亚烷基链中可插入氧或硫，基团 NR_9R_{10} 可以代表例如 N-吗啉基或 N-硫代吗啉基。烷氧羰基的实例是例如甲氧羰基、乙氧羰基或丙氧羰基。环烷基代表环丙基、环丁基、环戊基、环己基或环庚基，优选环己基和环戊基。卤代环烷基的优选实例是 2,2-二氟环丙基。

在由各种其它定义组合的基团中，每一种定义具有它单独时定义的各种定义。

上述芳基和杂芳基可进一步被取代。其中芳基和杂芳基被取代，优选被 1 或 2 个选自卤素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 卤代烷基、 C_{1-4} 卤代烷氧基、氰基、硝基、$-CR_8 = N-O-R_7$、苯基和苯氧基的基团

取代，其中苯基和苯氧基还可依次被 1 或 2 个选自卤素、C_{1-4}烷基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}卤代烷基、氰基和硝基的取代基取代。

在式 I 化合物中，特别有意义的化合物是其中 R_2 和 R_8 独立地为氢或甲基的那些化合物。

式 I 化合物的进一步优选的基团是:

其中

a) R_1 是甲基；或

b) R_2 是甲基；或

c) R_5 是氢或甲基；或

d) R_6 是氢；或

e) X 是 CH；或

f) R_4 是 C_{1-4}烷基、C_{1-4}卤代烷基、苯基、苯氧基、氰基苯氧基、氯苯氧基、甲基苯氧基、二甲基苯氧基、三氟甲基苯氧基、卤素、氰基、苄氧基、异噁唑基、苯并噻唑氧基、C_{1-4}烷氧基或基团 $-C(CH_3)=N-O-R_7$，其中 R_7 是 C_{1-4}烷基、烯丙基、炔丙基或苄基；或

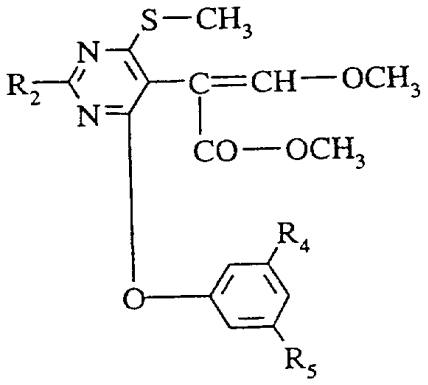
g) R_4 是吡唑基。

式 I 化合物的进一步优选的基团是：其中 R_1 和 R_2 是甲基；R_5 和 R_6 是氢；和 R_4 是 C_{1-4}烷基、C_{1-10}卤代烷基、苯基、苯氧基、氰基苯氧基、氯苯氧基、甲基苯氧基、二甲基苯氧基、三氟甲基苯氧基、卤素、氰基、苄氧基、异噁唑基、苯异噻唑氧基、C_{1-4}烷氧基或基团 $-C(CH_3)=N-O-R_7$，其中 R_7 是 C_{1-4}烷基、烯丙基、炔丙基或苄基。

式 I 化合物的另一些优选的基团是其中 R_1 和 R_2 是甲基，R_5 和 R_6 是氢，和 R_4 是吡唑基。

在上述的那些优选基团中，优选的化合物是其中 X 是 CH 的那些化合物。

另一些优选的化合物是相应于式 Ia 的化合物:



(Ia)

其中

R_2 是氢或甲基;

R_4 是氢、异噁唑基、苯基、 C_{1-4} 烷基、 $-CH_2-O-$ 苯基、 $-CH_2-O-CH_2-$ 苯基、 $-C(CH_3)=N-O-C_{1-4}$ 烷基、 $C(CH_3)=N-O-C_{3-4}$ 链烯基、 $-C(CH_3)=N-O-CH_2-$ 苯基, 其中苯基可任意地被 1 或 2 个基团取代, 所述基团独立地选自卤素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基或氰基; 或者 R_4 是任意被选自 C_{1-4} 烷基、氰基、硝基、卤素、 C_{1-4} 卤代烷基、 C_{1-4} 烷氧基或 C_{1-4} 卤代烷氧基的 1 至 3 个基团取代的苯氧基;

和

R_5 是氢或甲基。

此外, 在式 Ia 的化合物中, R_2 和 R_5 同上述定义, 而 R_4 是吡唑基。

式 I 的优选的具体化合物是:

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-甲氧基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(3-氯苄氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-异丙基-5-甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(1-甲基-2-乙氧基亚氨基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[-4-甲基-6-(3-(3-(1-甲基-2-乙氧基亚氨基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[-4-甲硫基-6-(3-(3-(1-甲基-2-乙氧基亚氨基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(4-氯苯基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(3-氰基苯基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

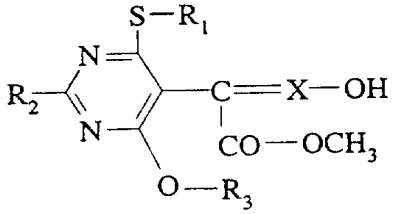
α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-甲基苯基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯;

2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-叔丁基苯氧基)-嘧啶-5-基]乙酸甲酯; 和

2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3(-2-氰基苯氧基)苯氧基)-嘧啶-5-基]乙酸甲酯。

式I化合物中的丙烯酸双键结构可以是E式或Z式。在本文中，当具体指明时则标出E式和Z式。在所有的其它情况下，是指两种异构体的混合物。在合成中得到E和Z式异构体时，可通过已知技术如结晶、色谱或蒸馏将其分离。在描述的制备方法中，优选得到E式。

通过式 II 化合物的 O-甲基化可得到式 I 化合物，



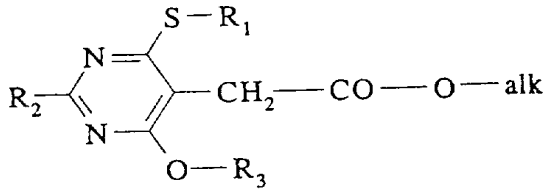
(II)

其中 R_1、 R_2、 R_3 和 X 同上述定义。

O-甲基化反应(II → I)可按本身已知的制备 3-甲氧基丙烯酸酯的方法进行，使用常规的甲基化试剂。适宜的甲基化试剂实例包括碘甲烷和硫酸二甲酯。 O-甲基化通常在碱存在下进行。反应湿度通常在 0 ℃至反应混合物的沸点温度，例如在室温。需要时可用惰性溶剂。适宜的碱的实例包括：碱金属氢化物，如氢化钠；碱金属醇盐，如甲醇钠；或碱金属碳酸盐。适宜的惰性溶剂包括：芳烃，如苯和甲基；醚类，如乙醚、四氢呋喃和 1,2-二甲氧基乙烷；极性溶剂，如二甲基甲酰胺、二甲基亚砜；醇类，如甲醇；丙酮；或上述两种或多种溶剂的混合物。按已知技术，例如蒸发溶剂、色谱和结晶，分离和纯化期望的终产物。

式 I 化合物本身是碱性的，它们可以与足够强的酸如 HCl 和 HBr 形成盐。

其中 X 是 CH 的式 II 化合物可以通过在碱存在下使式 III 化合物与甲酰化试剂如 N， N-二甲酰基甲胺或甲酸甲酯反应来制备：



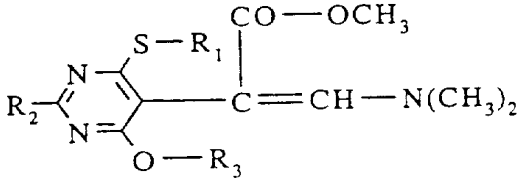
(III)

其中 R_1、 R_2 和 R_3 的定义同上，和 alk 是 $C_{1\text{-}10}$ 烷基。

该反应基本上是 Claisen 反应，可在该反应的已知条件下进行。该反应(III → II)可在惰性溶剂中进行。适宜的溶剂实例与 II 化合物 O-

甲基化的溶剂相同。适宜的碱的实例是通常用于 Claisen 反应的那些碱，例如：碱金属醇盐如甲醇钠；碱金属氢化物，如氢化钠；氨基锂或氨基钠，如二乙基氨基锂。反应温度可以在很宽范围内变化，例如 0 ℃至反应混合物沸点温度，优选室温或接近室温。

在另一方法中，还可以通过下法制备式 II 化合物：在强碱存在下将式 III 化合物与预先制备的二甲基甲酰胺和硫酸二甲酯的 1： 1 加成物反应，然后水解得到的式 IIIa 中间体，



(IIIa)

其中 R_1、 R_2和 R_3的定义同前。

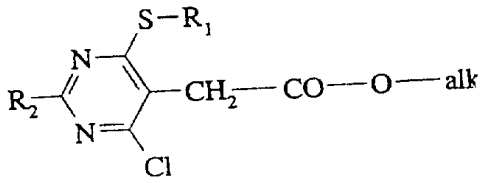
该反就优选在惰性溶剂中在-70 ℃至-30 ℃，优选-60 ℃至-40 ℃下进行。适宜的溶剂是醚类，如四氢呋喃、二噁烷、二乙基醚或甘醇二甲醚。适宜的碱是碱性醇盐如叔丁醇钾，或碱性氢化物，如 NaH 、KH 。水解步骤通常在两相系统中进行，通过加入水并在 0 ℃至 + 40 ℃，通常在室温下反应。

其中 X 是 N 的式 II 化合物，通过在碱存在下，任选在惰性溶剂存在，使式 III 化合物与亚硝酸烷基酯反应可制得。在此方法的一种变体中，其中 X 是 N 的式 II 化合物也可通过在盐酸存在下，任选在惰性溶剂中，使式 III 化合物与亚硝酸烷基酯反应而得到。反应温度通常为-40 ℃至 + 30 ℃，例如在-20 ℃至 0 ℃。必要时可用惰性溶剂。适宜的碱的实例包括芳烃如苯如甲苯；醚类，如乙醚、四氢呋喃和 1,2-二甲氧基乙烷；极性溶剂如二甲基甲酰胺、二甲基亚砜，醇类如叔丁醇；或所述两种或多种溶剂的混合物。

在两步方法的变体(III → II → I)中，式 I 化合物可以通过由式 III

化合物的“一锅烩”反应，不分离和纯化式 II 中间体而制得。

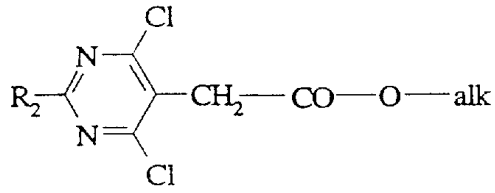
式 III 的乙酸酯可以在碱和惰性溶剂存在下，由式 IV 化合物与式 V 的 HOR_3(其中 R_3 的定义同前)反应而得到，



(IV)

其中 R_1 和 R_2 的定义同上， alk 是 C_{1-10} 烷基。适宜的碱和溶剂与(II → I)反应相同。

式 IV 化合物可在碱存在下使式 VI 化合物与式 VII 的 $H\text{-}S\text{-}R_1$ 化合物(其中 R_1 的定义同前)反应而得到，



(VI)

其中 R_2 的定义同前，且 alk 是 C_{1-10} 烷基。

该反应最好在惰性溶剂如醚类(例如二甲氧基乙烷)中进行。适宜的碱是氢化钠、甲醇钠等。在优选的变体中，所述碱先与该硫醇反应得到钠盐，该钠盐再与式 VI 化合物反应而没有碱的存在。

另一变体包括先用适宜的还原剂如碱性硼氢化物 (如 $NaBH_4$)或碱金属氢化物(如 NaH 、 CaH_2、 $LiAlH_4$)，还原烷基二硫化物 $R_1\text{-}SS\text{-}R_1$，其中 R_1 的定义同前，接着再与式 VI 化合物反应。此反应优选在惰性溶剂中进行，例如醚类如甘醇二甲醚、四氢呋喃、二甲基甲酰胺(DMF)、或有机烃类如苯或甲苯。

式 II 、 III 、 IIIa 和 IV 化合物已专门地开发用于式 I 化合物的合成。因此它们构成了本发明的部份。

式 V、 VI 和 VII 原料是已知的，或可按类似的已知方法制备。

式 I 化合物抗植物病原体是有效的。

它们的优良的杀霉菌活性通过用 0.1 ~ 500mg a.i./l 的浓度进行抗下列霉菌的体内试验而得到证明：架豆的疣顶单孢锈、小麦的小麦柄锈、黄瓜的单囊壳、小麦和大麦的禾本白粉菌、苹果的白叉丝单囊壳、葡萄的葡萄钩丝壳、小麦的小球腔菌、大麦的禾旋孢腔菌和麦类核腔菌、苹果的苹果黑星菌、西红柿的致病疫霉和葡萄的葡萄生单轴霉。

许多式 I 化合物具有优良的植物耐受性和内吸作用。因此表明本发明化合物适合于植物、种子和土壤的处理以防治植物病原霉菌，例如担子菌纲锈菌目，如锈柄菌 SPP、驼孢锈菌 SPP、和单孢锈菌 SPP；子囊菌纲白粉菌目(粉霉)，如 Erysiphe ssp、叉丝单囊壳 SPP、钩丝壳 SPP、单囊壳 SPP；以及旋孢腔菌；核腔菌 SPP；黑星菌 SPP；球腔菌 SPP；小球腔菌；半知菌纲，如 Pyricularia、薄膜苯菌(Corticium)、葡萄孢；和卵菌钢，如疫霉菌 SPP、单轴霉 SPP。

式 I 化合物抗粉霉属、锈菌属、核腔菌属和小球腔菌属霉菌，尤其是抗单子叶植物如谷类(包括小麦和大麦)的病原体特别有效。

本发明化合物的应用量取决于各种因素，如应用的具体化合物、处理的对象(植物、土壤、种子)、处理的类型(如喷洒、撒粉、拌种)、处理的目的(预防或治疗)，欲处理的霉菌类型和应用时间。

如果本发明化合物在植物或土壤处理的情况下以约 0.01-2.0kg/ha，优选 0.02~1kg/ha 的量应用，例如每公顷禾田(如谷类)施用 0.04 ~ 0.500kg 活性成分(a.i)，或以每百升 4 ~ 50g 的浓度(a.i)应用于禾苗如水果、葡萄园和蔬菜(应用体积 300 ~ 1000l/ha，取决于禾苗的大小或叶量，这相当于大约 30-500g/ha 的应用比率)，通常可获得满意的结果。如果必要，例如在隔 8 ~ 30 天期间可重复处理。

当本发明化合物用于种子处理时，如果以约 0.05 ~ 0.5g/kg 种子，优选约 0.1 ~ 0.3g/kg 种子应用本发明化合物，通常可得到满意的结果。

本文所用“土壤”一词意指包括天然的和人工的所有常规的生长介质。

本发明化合物可以用于各种禾苗，如大豆、咖啡、观赏植物(如天竺葵属植物、玫瑰)、蔬菜(如豌豆、黄瓜、芹菜、西红柿和豆类植物)、糖甜菜、甘蔗、棉花、亚麻、玉米、葡萄、梨果和核果(如苹果、梨、梅脯)和谷类(如小麦、燕麦、大麦、水稻)。

本发明还提供一种杀霉菌组合物，包括作为杀霉菌剂的式 I 化合物及农业上可接受的稀释剂(下文称稀释剂)。以常规方法，如将式 I 化合物与稀释剂和任选的其它成分(如表面活性剂)混合，可得到本发明组合物。

这里使用的稀释剂指的是农业上可接受的液体或固体物质，它可加入活性成分中使其成为更容易或更好的应用形式，特别是将活性成分稀释至可应用的或期望的活性强度。稀释剂的实例是滑石、高岭土、硅藻土、二甲苯或水。

特别是以喷洒形式使用的制剂，如水可分散的浓缩物或可湿粉，可以含有表面活性剂，如湿润剂和分散剂，例如甲醛与萘磺酸盐的缩合产物、烷基芳基磺酸盐、木素磺酸盐、脂肪烷基磺酸盐、乙氧基化的烷基酚和乙氧基化的脂肪醇。

通常，制剂包括 0.01-90%(重量)的活性成分、 0-20 % 农业上可接受的表面活性剂和 10-99.99 % 的稀释剂。组合物的浓缩形式如乳油，通常含有约 2-90 %，优选 5-70 %(重量)的活性成分。制剂的应用形式通常含有 0.0005-10%(重量)的本发明化合物作为活性成分，例如典型的喷洒悬浮液可含有 0.0005-0.05%，例如 0.0001 、 0.002 或 0.005 %(重

量)的活性成分。

除了常用的稀释剂和表面活性剂外，本发明组合物还可包括具有特殊目的的添加剂，如稳定剂、钝化剂(对于固体制剂或具有活性表面的载体)、改善对植物粘着性的试剂、腐蚀抑制剂、抗泡沫剂和着色剂。此外制剂中还可包括具有相同或补充的杀霉菌活性的杀霉菌剂，例如：硫、百菌清、抑菌灵；胍类杀霉菌剂如双辛胍胺；二硫代氨基甲酸酯类如代森锰锌、代森锰、代森锌、甲基代森锌；三氯甲硫基邻苯二甲酰亚胺类和类似物，如克菌丹、敌菌丹和灭菌丹；苯并咪唑类，如多菌灵、苯菌灵；吡咯类，如 cyproconazole、flusilazole、flutriafol、hexaconazole、propiconazole、tebuconazole、epoxiconazole、triticonzole、prochloraz；吗啉类，如 fenpropimorph、fenproidine；或其它有益的作用物质，如 cymoxanil、oxadixyl、metalaxyl；或杀虫剂。

植物的杀霉菌制剂的实例如下：

a. 可湿粉制剂

将 10 份式 I 化合物与 4 份合成的二氧化硅细粉、3 份月桂基硫酸钠、7 份木素磺酸钠、66 份高岭土细粉和 10 份硅藻土一起混合并碾磨至平均粒径为约 5 微米，得到的可湿粉在使用前稀释至喷洒液体，它可以通过叶喷洒及根浸透应用。

b.粒剂

在转筒混合器中，将 0.5 份(重量)结合剂(非离子表面活性剂)喷洒在 94.5 份(重量)的石英沙上并充分混合，然后加入 5 份(重量)式 I 化合物，充分混合，得到粒径为 0.3-0.7mm 的粒状制剂(必要时，通过加入 1-5 %(重量)的滑石粉干燥颗粒剂)。所得粒剂通过掺入待处理植物邻近的土壤中而施用。

c.乳化浓缩物

将10份(重量)式I化合物与10重量份的乳化剂和80重量份的二甲苯混合。得到的浓缩物的使用前用水稀释，得到期望浓度的乳化液。

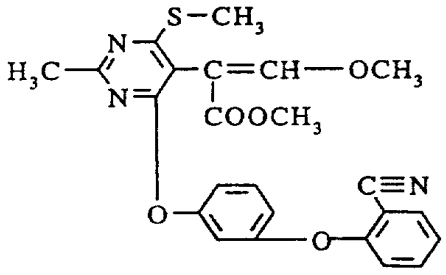
d.种子包衣

将45份式I化合物与1.5份二戊基苯酚癸二醇醚环氧丙烷加成物、2份锭子油、51份滑石细粉和0.5份着色剂绕丹宁B混合，混合物在contraplex磨中以10,000 rpm的速度研磨至粒径小于20微米，得到的干粉有很好的附着性，可用于种子，例如在一很慢旋转的容器中混合。

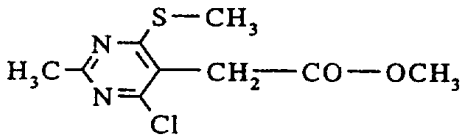
下述实施例进一步解释本发明，所有的温度均为摄氏度。

实施例1

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯



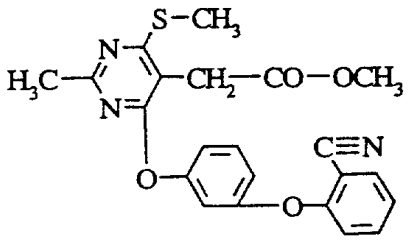
a). 2-(4-氯-2-甲基-6-甲硫基-嘧啶-5-基)-乙酸甲酯



将2-(4,6-二氯-2-甲基-嘧啶-5-基)-乙酸甲酯(40g)和甲硫醇钠(13g)混悬于甘醇二甲醚(200ml)中，室温下搅拌2.5小时。将混合物注入水中，用乙酸乙酯提取，用无水硫酸钠干燥有机相，蒸发后得2-(4-氯-

2-甲基-6-甲硫基-嘧啶-5-基)-乙酸甲酯， m.p. 74 ℃。 NMR($CDCl_3$): 3.89(S,2H); 3.70(S,3H); 2.63(S,3H); 2.55(S,3H)。

b). 2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯



室温下将 2-(4-氯-2-甲基-6-甲硫基嘧啶-5-基)-乙酸甲酯(5.5g)在DMF(80ml)中的溶液加入无水碳酸钾(5.6g)、 3-(2-氰基苯氧基)苯酚(5.1g)和碘化铜(1g)在 DMF 中的混悬液中。混合物加热至 120 ℃ 2 小时，然后冷却。混合物倒入水中用乙酸乙酯(2 × 50ml)提取。用无水硫酸钠干燥有机相，蒸发并在高真空下干燥，得 2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯粗产物，黄色油。NMR($CDCl_3$)： 6.18-6.84(m,3H)； 3.74(S,2H)； 3.69(S,3H)； 2.85(m,1H); 2.51(S,3H); 2.45(S,3H); 2.34(S,3H); 1.22(d,6H)。

c). 在氮气氛下于室温搅拌 18-冠-6(200mg)和叔丁基钾(3.5g)的混合物 20 分钟，然后冷却至-50 ℃，用 30 分钟滴入 2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯在甘醇二甲醚中的溶液。搅拌 15 分钟后滴加入预先制备的硫酸二甲酯-二甲基甲酰胺 1：1 加成物(11.5ml)。该加成物是通过合并等当量的硫酸二甲酯和二甲基甲酰胺，并加热至 + 60 ℃ 2 小时。含 1： 1 加成物的冷却的溶液按下面的方法中所描述的那样使用。移去冷却浴，并升温至室温。混合物再搅拌 2 小时，直到反应完成，然后倒入碳酸氢钠水溶液中，用乙酸乙酯提取(2 × 60ml)，有机相用无水硫酸钠干燥，蒸发溶剂和高真

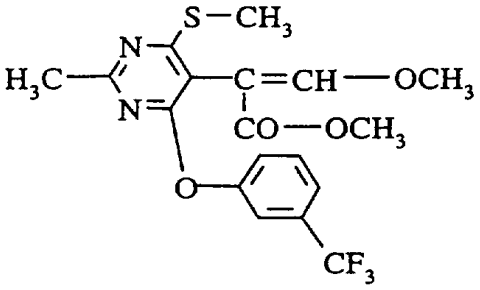
空下干燥，得粘油，其NMR与中间体α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氯基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-二甲氨基丙烯酸甲酯一致。

NMR($CDCl_3$)： 6.80-7.68(m,8H)； 3.60(S,3H)； 2.85(S,6H)； 2.5(S,3H)； 2.50(S,3H)。

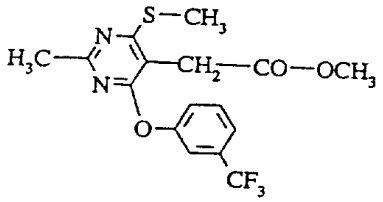
将中间体油(4.8g)溶于乙醚(80ml)中，在10℃与溶于水(80ml)中的对甲苯磺酸(2.9g)合并。室温下搅拌过夜完全水解，用碳酸氢钠水溶液中和后分离两相，水相用乙酸乙酯(2 × 60ml)提取，合并的有机相用硫酸钠干燥，蒸发除去溶剂。得到的粘油溶于含硫酸二甲酯(1.9ml)的二甲基甲酰胺(60ml)中，在10℃加入无水碳酸氢钠(4.0g)，室温搅拌3小时，完全甲基化成α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-异丙基-5-甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯。反应混合物注入水中，用乙酸乙酯(3 × 60ml)提取，有机相用无水硫酸钠干燥。蒸发溶剂，经二氧化硅柱色谱分离产物，得结晶产物， m.p. 144 ℃ NMR($CDCl_3$)： 6.78-7.69(m,8H)； 3.85(S,3H)； 3.68(S,3H)； 2.52(S,3H)； 2.48(S,3H)。

实施例2

α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯



a). 2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯



将2-(4-氯-2-甲基-6-甲硫基-嘧啶-5-基)-乙酸甲酯(4.9g)的DMF溶液室温下加入由无水碳酸钾(5.6g)、碘化铜(1.0g)、三氟甲基苯酚 (3.3g)和DMF(50ml)组成的混悬液中。将混合物加热至120 ℃ 90分，钟然后冷却。冷却的混合物注入水中，用乙酸乙酯(2 × 50ml)提取，有机相用无水硫酸钠干燥，蒸发，高真空干燥后得2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯，黑色油。 NMR($CDCl_3$): 7.25-7.55(m,4H); 3.78(S,3H); 3.70(S,3H); 2.62(S,3H); 2.46(S,3H)。

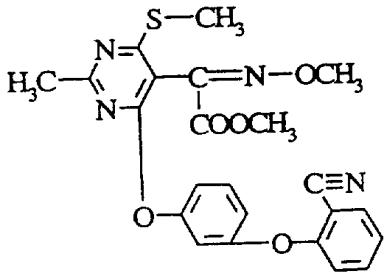
b)在氮气氛中于室温下将 18-冠-6(100mg)和丁基钾(5.0g)的混合物搅拌20分钟，溶液冷至-50 ℃，用30分钟滴加入2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯(5.6g)的甘醇二甲醚溶液，搅拌15分钟后，滴加入预先制备的硫酸二甲酯-二甲基甲酰胺的1： 1加成物(10.5ml)。移去冷却浴， 升温至室温。再搅拌2小时直到反应完全，倒入碳酸氢钠水溶液中，用乙酸乙酯(2 × 60ml)提取，用无水硫酸钠干燥有机相，蒸发溶剂，高真空下干燥，得粘稠油，其NMR 与中间体α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-二甲氨基丙烯酸甲酯一致。 NMR($CDCl_3$): 7.20-7.69(m,4H); 3.60(S,3H); 2.85(S,3H); 2.52(S， 3H); 2.48(S,3H)。

将中间体油(6.8g)，溶于乙醚(40ml)中，于+ 10 ℃与对甲苯磺酸(4.7g)的水(40ml)溶液合并，室温下搅拌过夜完全水解，用碳酸氢钠水溶液中和后分离两相，水相用乙酸乙酯(2 × 60ml)提取，合并的有机相用硫酸钠干燥，蒸发移去溶剂，得到的粘油溶于含硫酸二甲酯(4.0ml)的二甲基甲酰胺(60ml)中。在+ 10 ℃加入无碳酸钾(20g)，室温搅拌3小时，得到完全甲基化产物α-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基-苯氧基)-嘧啶-5-基]-β-甲氧基丙烯酸甲酯。将反应混合物注入水中，用乙

酸乙酯(3 × 60ml)提取，有机相用无水硫酸钠干燥，蒸发溶剂后，经二氧化硅色谱分离产物，得固体，3.99g，m.p.92 ℃;NMR($CDCl_3$): 7.20-7.61(m,5H); 3.50(S,3H); 3.70(S,3H); 2.55(S,3H); 2.50(S,3H)。

实施例 3

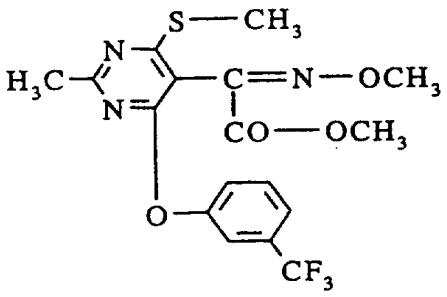
2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯



将 18-冠-6(50mg)和叔丁基钾(1.8g)的混合物于甘醇二甲醚中在氮气氛和室温下搅拌 15 分钟，然后将该溶液冷却至-30 ℃，用 30 分钟滴入 2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯(4.6g)的甘醇二甲醚溶液，并用 30 分钟滴加入亚硝酸叔丁酯(3.5ml)，搅拌持续 1.5 小时，同时温度升至室温。将混合物冷却至-20 ℃，接着加入氯化铵的饱和水溶液(26ml)，并搅拌 4 小时，同时升温至室温。混合物分配于水和乙酸乙酯(3 × 60ml)中，用无水硫酸钠干燥，溶剂蒸发后得油状物，将其溶于含有碘甲烷(3.4ml)的二甲基甲酰胺(60ml)中。于-20 ℃加入氢化钠(0.4g)，室温下搅拌混合物 3 小时完全甲基化，得 2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(2-氰基苯氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯。反应混合物倒入水中，用乙酸乙酯(3 × 60ml)提取，有机相用无水硫酸钠干燥，蒸发溶剂后，经二氧化硅柱色谱分离产物，得结晶固体，m.p.126 ℃。NMR($CDCl_3$): 6.78-7.69(m.8H); 4.12(S,3H); 3.86(S,3H); 2.57(S,3H); 2.5(S,3H)。

实施例 4

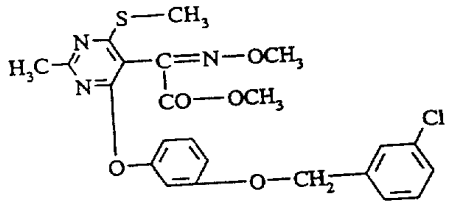
2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-((3-三氟甲基苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯



将 18-冠-6(50mg)和叔丁基钾(1.8g)的混合物于甘醇二甲醚中在氮气氛和室温下搅拌 15 分钟，然后将该溶液冷却至-30 ℃，用 30 分钟滴入 2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯(4.0g)的甘醇二甲醚溶液，并用 30 分钟滴加入亚硝酸叔丁酯(3.5ml)，搅拌持续 1.5 小时，同时温度升至室温。将混合物冷却至-20 ℃，接着加入氯化铵的饱和水溶液，并搅拌 3 小时。混合物分配于水和乙酸乙酯(3 × 60ml)中，用无水硫酸钠干燥，溶剂蒸发后得油状物，将其溶于含有硫酸二甲酯(1.6g)的二甲基甲酰胺(60ml)中。于+10 ℃加入无水碳酸钾(1.8g)，室温下搅拌混合物 3 小时完全甲基化，得 2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-三氟甲基苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯。反应混合物倒入水中，用乙酸乙酯(3 × 60ml)提取，有机相用无水硫酸钠干燥，蒸发溶剂后，经二氧化硅柱色谱分离主要产物，得黄色油(1.2g)。

实施例 5

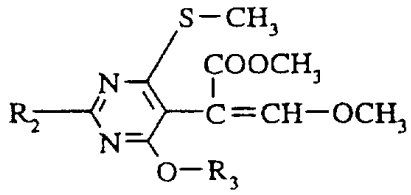
2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-((3-(3-氯苄基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯



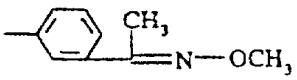
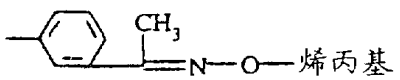
将18-冠-6(50mg)和叔丁基钾(1.68g)于甘醇二甲醚(50ml)中的混合物在氮气氛和室温下搅拌15分钟，然后将该溶液冷却至-30 ℃，用30分钟滴入2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(3-氯苄氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯(4.45g)的甘醇二甲醚溶液，并用30分钟滴加入亚硝酸叔丁酯(3.25ml)，搅拌持续1.5小时。将混合物冷却至-20 ℃，接着加入氯化铵水溶液，并搅拌3小时，同时升温至室温。混合物分配于水和乙酸乙酯(3 × 60ml)中，用无水硫酸钠干燥，溶剂蒸发后得油状物，将其溶于含有硫酸二甲酯(1.6g)的二甲基甲酰胺(60ml)中。于+10 ℃加入无水碳酸钾(1.8g)，室温下搅拌混合物3小时完全甲基化，得2-甲氧亚氨基-2-[2-甲基-4-甲硫基-6-(3-(3-氯苄氧基)-苯氧基)-嘧啶-5-基]-乙酸甲酯。反应混合物倒入水中，用乙酸乙酯(3 × 60ml)提取，有机相用无水硫酸钠干燥，蒸发溶剂后，经二氧化硅柱色谱分离主要产物，得黄色油(2.13g)。 NMR($CDCl_3$)： 6.40-7.42(m.8H)； 4.12(S,3H)； 3.85(S,3H)； 2.58(S,3H)； 2.45(S,3H)。

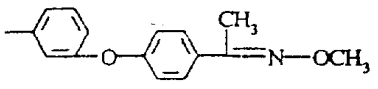
用类似方法制备了下列表1-7中的化合物:

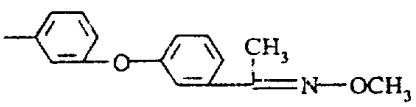
表 1

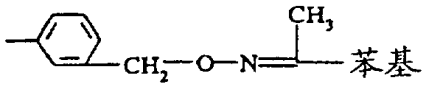
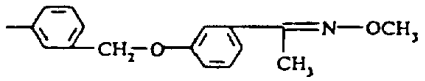
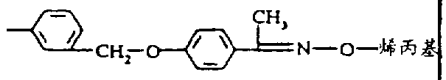
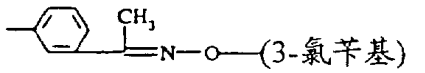
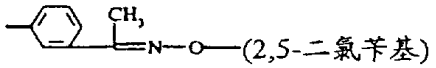
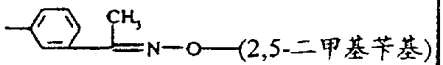
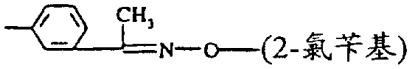
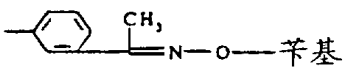
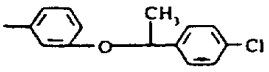


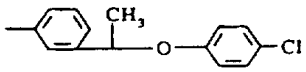
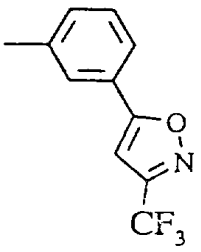
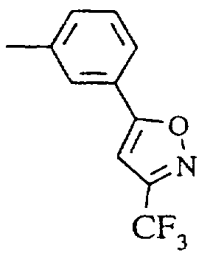
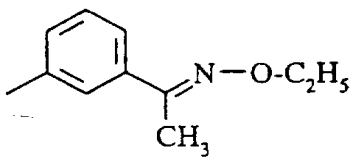
化合物 No.	R_2	R_3	物理数据 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$) 或/和m.p.
1.01	CH_3	3-联苯基	7.00-7.62 (m, 10H); 3.89 (s, 3H); 3.72 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.49 (s, 3H).
1.02	H	3-联苯基	8.55 (s, 1H), 7.10-7.61 (m, 10H); 3.95 (s, 3H); 3.75 (s, 3H); 2.55 (s, 3H).
1.03	H	3-三氟甲基苯基	8.50 (s, 1H); 8.65 (s, 1H); 7.20-7.60 (m, 4H); 3.90 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.60 (s, 3H).
1.04	CH_3	3-三氟甲基苯基	黄色油; 7.60(s,1H); 6.19-7.48 (m, 4H); 3.88 (s, 3H); 3.78(s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.45 (s, 3H).
1.05	CH_3	3-苯氧基苯基	
1.06	CH_3	3-氯苯基	
1.07	H	3-苯氧基苯基	

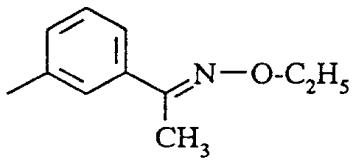
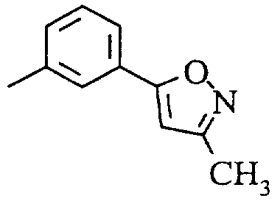
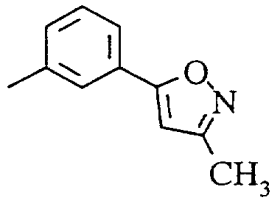
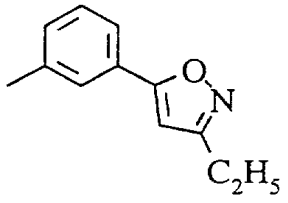
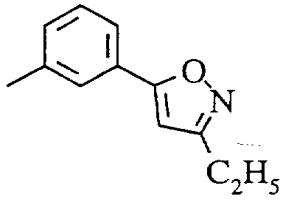
1.08	CH_3	3-叔丁基苯基	7.60 (s, 1H), 4.82-7.30 (m, 4H); 3.89 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.46 (s, 3H), 1.39 (s, 9H).
1.09	CH_3	3-甲基苯基	
1.10	CH_3		7.60 (s, 1H), 7.00-7.46 (m, 4H), 3.95 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 3.42 (5, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H); 2.20 (s, 3H).
1.11	CH_3	3-甲基-5-异丙基苯基	黄色油; 7.58 (s, 1H) 6.55-6.82 (m, 3H); 3.86 (s, 3H), 3.70 (s, 3H); 2,52 (s, 3H), 2.46 (s, 3H); 2.30 (s, 3H); 1.20 (d, 6H).
1.12	H	3-甲基-5-异丙基苯基	8.55 (s, 1H); 7.65 (s, 1H); 6.70-6.90 (m, 3H); 3.95 (s, 3H); 3.95 (s, 3H); 280-2.90 (m, 1H); 2.55 (s, 3H); 2.35 (s, 3H); 2.20 (s, 6H).
1.13	CH_3		oil; 7.01-7.61 (m, 5H); 5.99-6.18 (m,2H); 5.19-5.39 (2d, 2H); 4.71 (d, 1H); 3.90 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.58 (s, 3H); 2.48 (s, 3H); 2.24 (s, 3H).
1.14	CH_3	3-三氟甲基苄基	
1.15	CH_3	3-苯氧基苄基	

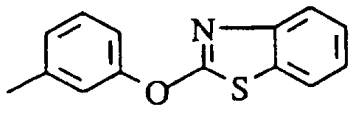
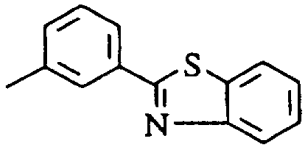
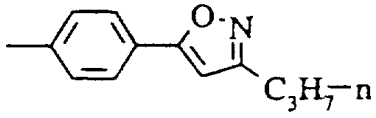
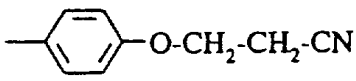
1.16	CH_3	3-(2-氰基苯氧基)-苯基	m.p. 144°C; 6.78-7.69 (m, 8H); 3.85 (s, 3H); 3.68 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H).
1.17	CH_3	3-异丙基苯基	7.60 (s, 1H); 6.85-7.30 (m, 4H); 3.90 (s, 3H); 3.79 (s, 3H); 2.85-2.95 (m, 1H); 2.55 (s, 3H); 2.45 (s, 3H); 2.20 (d, 6H).
1.18	CH_3	苯基	7.60 (s, 1H); 7.00-7.40 (m, 5H); 3.91 (5.3H); 3.72 (s, 3H); 2.55 (s, 3H); 2.50 (s, 3H).
1.19	CH_3	3-(3,5-二甲基苯氧基)-苯基	
1.20	CH_3	3-(2-氯-4-甲基苯氧基)-苯基	
1.21	CH_3	3-(2-氯-4-甲基苯氧基)-苯基	
1.22	CH_3	3-(3-氰基苯氧基)-苯基	
1.23	CH_3	3-(4-氰基苯氧基)-苯基	
1.24	CH_3	3-(2-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
1.25	CH_3	3-(2-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
1.26	CH_3	3-(2-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
1.27	CH_3		

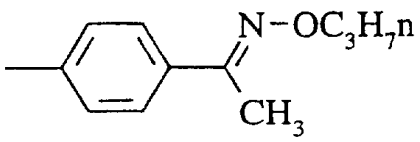
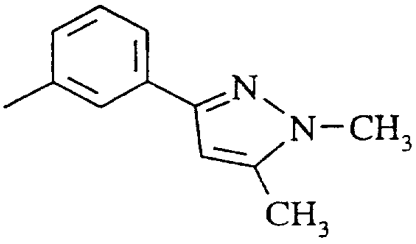
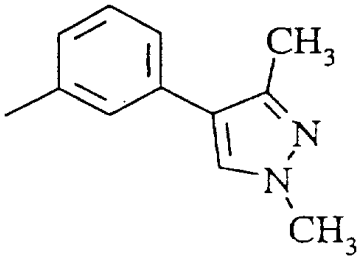
1.28	H		
1.29	CH_3	3-(3-氯苯氧基)-苯基	
1.30	CH_3	3-(3-甲氧基苯氧基)-苯基	
1.31	CH_3	3-(2-甲基苯氧基)-苯基	7.55 (s, 1H); 6.58-7.30 (m, 8H); 3.84 (s, 3H); 3.65 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.46 (s, 3H); 2.22 (s, 3H).
1.32	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基)-苯基	
1.33	CH_3	3-(2,3-二甲基苯氧基)-苯基	
1.34	CH_3	3-(3-甲基苯氧基)-苯基	
1.35	CH_3	3-苄氧基-苯基	
1.36	CH_3	3-(2-甲基苄氧基)-苯基	
1.37	CH_3	3-(2,5-二甲基苄氧基)-苯基	
1.38	CH_3	3-(3-氯苄氧基)-苯基	
1.39	CH_3	3-(3-甲基苄氧基)-苯基	7.56 (s, 1H); 6.40-7.46 (m, 8H); 5.00 (s, 2H); 3.86 (s,3H); 3.70 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H).
1.40	CH_3	3-(3-甲基苄氧基)-苯基	
1.41	CH_3	3-(4-氯苄氧基)-苯基	
1.42	CH_3	3-(3-甲氧基苄氧基)－苯基	
1.43	CH_3	3-(2-氰基苄氧基)-苯基	

1.44	CH_3	3-(苯基乙氧基)-苯基	
1.45	CH_3	3-(苯氧基甲基)-苯基	
1.46	CH_3		
1.47	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基-甲基)-苯基	
1.48	CH_3		
1.49	CH_3		
1.50	CH_3		油；7.01-7.61 (m, 9H); 5.20 (s, 2H); 3.86 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.55 (s, 3H); 2.45 (s, 3H); 2.25 (s,3H).
1.51	CH_3		
1.52	CH_3		
1.53	CH_3		
1.54	CH_3		
1.55	CH_3		

1.56	CH_3		
1.57	CH_3	3-(2-萘基)-苯基	7.20-7.85 (m, 8H); 3.95 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 3.55 (s, 3H); 3.45 (s, 3H); 2.55 (s, 3H); 2.45 (s, 3H).
1.58	CH_3	3-(4-甲基苯基)-苯基	
1.59	CH_3	3-(2-吡啶基)-苯基	
1.60	CH_3		7.18-7.66 (m, 5H); 6.98 (s, 1H); 3.92 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H).
1.61	H		7.18-7.66 (m, 5H); 6.98 (s, 1H); 3.92 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H)-
1.62	CH_3		油; 7.60 (s, 1H); 7.00-7.49 (m, 4H); 4.22 (8, 2H); 3.92 (s, 3H); 3.82 (s, 3H); 2.55 (s, 3H); 2.45 (s, 3H); 2.22 (s, 3H); 1.30 (t, 3H).

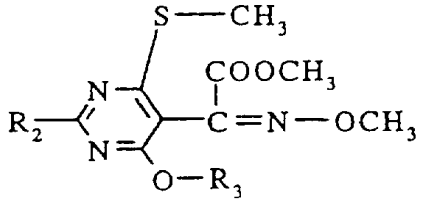
1.63	H		8.51 (s, 1H); 7.42 (s, 1H); 7.02-7.52 (m, 4H); 4.22 (8, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.86 (s, 3H); 2.56 (s, 3H); 2.20 (s, 3H); 1.28 (t, 3H).
1.64	CH_3		
1.65	H		
1.66	CH_3		7.25-7.62 (m, 3H); 7.70 (d, 1H); 6.35 (s, 1H); 3.90 (s, 3H); 3.72 (s, 3H); 2.70 (8, 2H); 2.55 (s, 3H); 2.48 (s, 3H); 2.48 (s, 3H); 1.30 (t, 3H).
1.67	H		

1.68	CH_3		
1.69	CH_3		
1.70	CH_3	3-甲氧基苯基	7.58 (s, 1H); 7.16-7.28 和 6.55-6.75 (m, 4H); 3.89 (s, 3H); 3.75 (s, 3H); 3.75 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H).
1.71	CH_3		
1.72	CH_3		
1.73	CH_3	3-(4-氯苯基)-苯基	7.61 (s, 1H); 7.00-7.52 (m, 8H); 3.90 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.55 (s, 3H); 2.45 (s, 3H).
1.74	CH_3	3-(4-氯基苯基)-苯基	
1.75	CH_3	3-(4-氯基苯基)-苯基	7.10-7.85 (m, 9H); 3.50 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.55 (s, 3H); 2.45 (s, 3H).

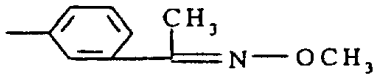
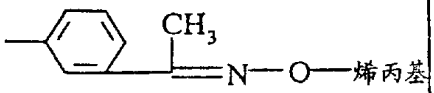
1.76	CH_3		7.60 (s, 1H), 7.00-7.42 (m, 8H); 4.15 (t, 2H), 3.90 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.55 (s, 3H); 2.48 (s, 3H); 2.20 (s, 3H); 1.79 (m, 2H); 1.00 (t, 3H).
1.77	CH_3		
1.78	CH_3		
1.79	CH_3	3-(2-氯基苯基)-苯基	7.10-7.80 (m, 9H); 3.50 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.18 (s, 3H).
1.80	CH_3	3-(2-甲基苯基)－苯基	7.00-7.60 (m, 9H); 3.91 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 3.55 (s, 3H); 3.50 (s, 3H); 2.30 (s, 3H).

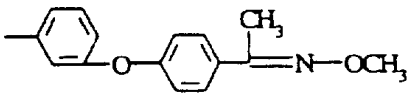
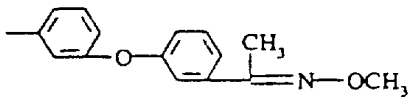
1.81	CH_3	3,5-二甲基苯基	7.60 (s, 1H); 6.62-6.80 (m, 3H); 3.95 (s, 3H); 3.75 (s, 3H), 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H); 2.30 (s, 6H)

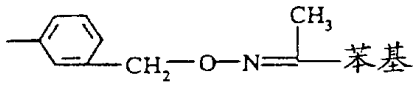
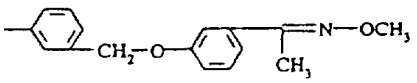
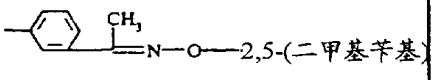
表 2:

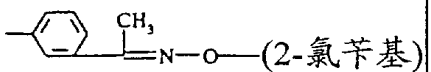
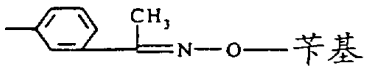
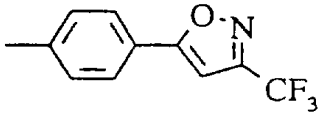
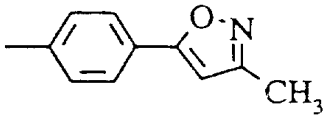
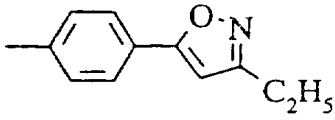
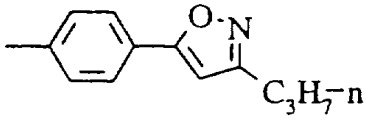
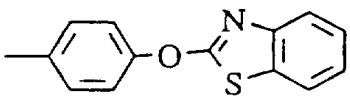


化合物 No.	R_2	R_3	物理数据 ^{1}H-NMR或/和 m.p
2.01	CH_3	3-联苯基	
2.02	H	3-联苯基	
2.03	H	3-三氟甲基苯基	
2.04	CH_3	3-三氟甲基苯基	
2.05	CH_3	3-苯氧基苯基	
2.06	CH_3	3-氯苯基	
2.07	H	3-三氟甲氧基苯基	
2.08	H	3-苯氧基苯基	
2.09	H	3-氯苯基	
2.10	CH_3	3-叔丁基苯基	

2.11	CH_3	3-甲基苯基	
2.12	CH_3		
2.13	CH_3	3-甲基-5-异丙基苯基	
2.14	H	3-甲基-5-异丙基苯基	
2.15	CH_3		
2.16	CH_3	3-三氟甲基苄基	
2.17	CH_3	3-苯氧基苄基	
2.18	CH_3	3-(2-氰基苯氧基)-苯基	m.p. 126°C; 6.78-7.69 (m, 8H); 4.12 (s, 3H); 3.86 (s, 3H); 2.57 (s, 3H); 2.50 (s, 3H)
2.19	CH_3	3-异丙基苯基	
2.20	CH_3	苯基	
2.21	CH_3	3-(3,5-二甲基苯氧基)-苯基	
2.22	CH_3	3-(2-氯-4-甲基苯氧基)-苯基	
2.23	CH_3	3-(4-氯-2-甲基苯氧基)-苯基	
2.24	CH_3	3-(3-氰基苯氧基)-苯基	
2.25	CH_3	3-(4-氰基苯氧基)-苯基	
2.26	CH_3	3-(2-三氟甲基-苯氧基)-苯基	

2.27	CH_3	3-(3-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
2.28	CH_3	3-(4-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
2.29	CH_3		
2.30	CH_3		7.00-7.55 (m, 4H); 4.22 (,2H); 3.78(s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H); 2.26 (s, 3H); 1.32 (t, 3H).
2.31	CH_3	3-(3-氯苯氧基)-苯基	
2.32	CH_3	3-(3-甲氧基苯氧基)-苯基	
2.33	CH_3	3-(2-甲基苯氧基)-苯基	
2.34	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基)-苯基	
2.35	CH_3	3-(3-甲基苯氧基)-苯基	
2.36	CH_3	3－苄氧基－苯基	
2.37	CH_3	3-(2-甲基苄氧基)-苯基	
2.38	CH_3	3-(2-氯苄氧基)-苯基	
2.39	CH_3	3-(2,5-二氯苄氧基)-苯基	
2.40	CH_3	3-(2,5-二甲基苄氧基)-苯基	

2.41	CH_3	3-(3-氯苄氧基)-苯基	6.40-7.42 (m, 8H); 5.02 (s, 2H); 4.12 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 2.58 (s, 3H); 2.45 (s, 3H)
2.42	CH_3	3-(3-甲基苄氧基)-苯基	
2.43	CH_3	3-(3-氯-4-甲基苄氧基)-苯基	
2.44	CH_3	3-(3-甲氧基苄氧基)-苯基	
2.45	CH_3	3-(2-氯基苄氧基)-苯基	
2.46	CH_3	3-(2-硝基苄氧基)-苯基	
2.47	CH_3	3-(苯乙氧基)-苯基	
2.48	CH_3	3-(苯氧基-甲基)-苯基	
2.49	CH_3	3-(3-氯苯氧基甲基)-苯基	
2.50	CH_3		
2.51	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基-甲基)-苯基	
2.52	CH_3		
2.53	CH_3		

2.54	CH_3		7.00-7.52 (m, 8H); 5.18 (s, 2H); 4.14(s, 3H); 3.75 (s, 3H); 2.56 (s, 3H); 2.45 (s, 3H); 2.25 (s, 3H)
2.55	CH_3		
2.56	CH_3	3-(2-萘基)-苯基	
2.57	CH_3	3-甲氧基苯基	
2.58	CH_3		
2.59	CH_3		
2.60	CH_3		
2.61	CH_3		
2.62	CH_3		

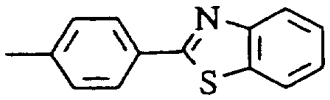
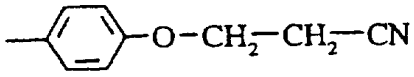
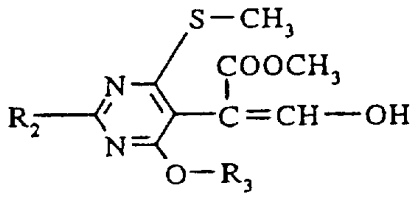
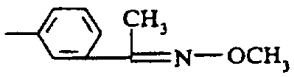
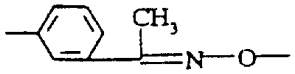
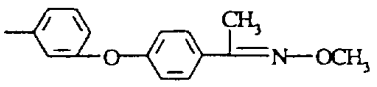
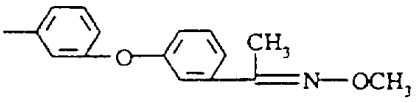
2.63	CH_3		
2.64	CH_3		

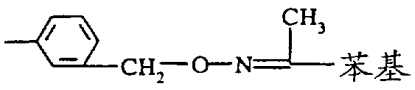
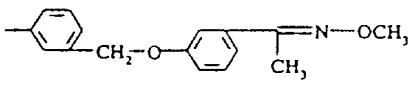
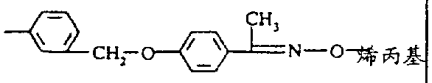
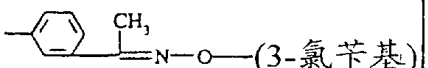
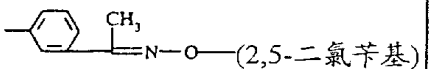
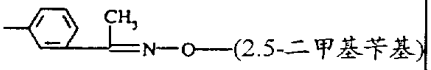
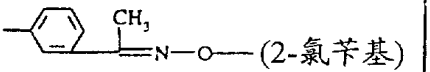
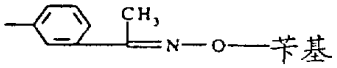
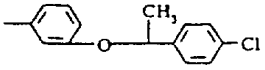
表 3:

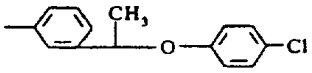
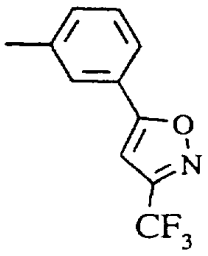
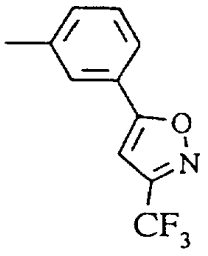
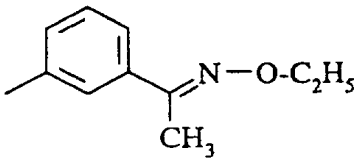


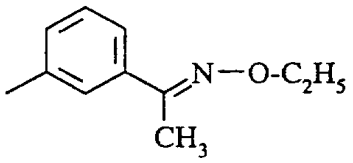
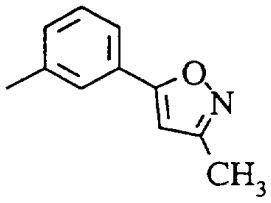
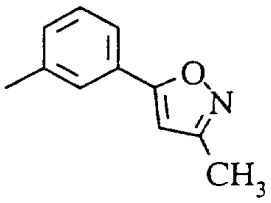
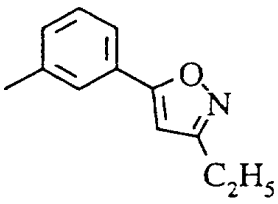
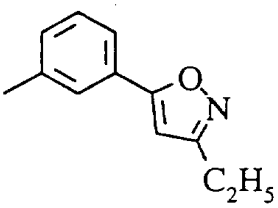
化合物 No.	R_2	R_3	物理数据
3.01	CH_3	3-联苯基	
3.02	H	3-联苯基	
3.03	H	3-三氟甲基苯基	
3.04	CH_3	3-三氟甲基苯基	Rf = 0.60 (30%乙酸乙酯/己烷)
3.05	CH_3	3-苯氧基苯基	
3.06	CH_3	3-氯苯基	
3.07	H	3-苯氧基苯基	
3.08	CH_3	3-叔丁基苯基	Rf = 0.78 (30%乙酸乙酯/己烷)

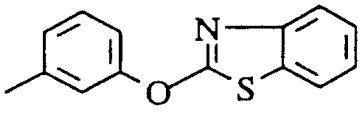
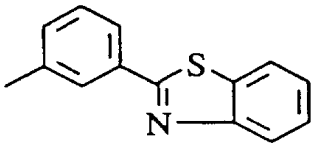
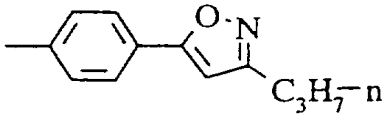
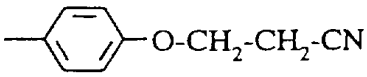
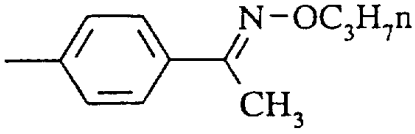
3.09	CH_3	3-甲基苯基	
3.10	CH_3		
3.11	CH_3	3-甲基-5-异丙基苯基	Rf = 0.75 (30%乙酸乙酯/己烷)
3.12	H	3-甲基-5-异丙基苯基	
3.13	CH_3		
3.14	CH_3	3-三氟甲基苄基	
3.15	CH_3	3-苯氧基苄基	
3.16	CH_3	3-(2-氰基苯氧基)-苯基	Rf = 0.55-0.60(30%乙酸乙酯/己烷)
3.17	CH_3	3－异丙基苯基	
3.18	CH_3	苯基	
3.19	CH_3	3-(3,5-二甲基苯氧基)-苯基	
3.20	CH_3	3-(2-氯-4-甲基苯氧基)-苯基	
3.21	CH_3	3-(4-氯-2-甲基苯氧基)-苯基	
3.22	CH_3	3-(3-氰基苯氧基)-苯基	
3.23	CH_3	3-(4-氰基苯氧基)-苯基	
3.24	CH_3	3-(2-三氟甲基-苯氧基)-苯基	

3.25	CH_3	3-(3-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
3.26	CH_3	3-(4-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
3.27	CH_3		
3.28	H		
3.29	CH_3	3-(3-氯苯氧基)-苯基	
3.30	CH_3	3-(3-甲氧基苯氧基)-苯基	
3.31	CH_3	3-(2-甲基苯氧基)-苯基	Rf = 0.56 (30%乙酸乙酯/己烷)
3.32	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基)-苯基	
3.33	CH_3	3-(2,3-二甲基苯氧基)-苯基	
3.34	CH_3	3-(3-甲基苯氧基)-苯基	
3.35	CH_3	3-苄氧基-苯基	
3.36	CH_3	3-(2-甲基苄氧基)-苯基	
3.37	CH_3	3-(2-氯苄氧基)-苯基	
3.38	CH_3	3-(2,5-二甲基苄氧基)-苯基	
3.39	CH_3	3-(3-氯苄氧基)-苯基	
3.40	CH_3	3-(3-甲基苄氧基)-苯基	
3.41	CH_3	3-(4-氟苄氧基)-苯基	

3.42	CH_3	3-(3-甲氧基苄氧基)-苯基	
3.43	CH_3	3-(2-氰基苄氧基)-苯基	
3.44	CH_3	3-(苯乙氧基)-苯基	
3.45	CH_3	3-(苯氧基-甲基)-苯基	
3.46	CH_3		
3.47	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基-甲基)-苯基	
3.48	CH_3		
3.49	CH_3		
3.50	CH_3		
3.51	CH_3		
3.52	CH_3		
3.53	CH_3		
3.54	CH_3		
3.55	CH_3		

3.56	CH_3		
3.57	CH_3	3-(2-萘基)-苯基	
3.58	CH_3	3-(4-甲基苯基)-苯基	
3.59	CH_3	3-(2-吡啶基)-苯基	
3.60	CH_3		
3.61	H		
3.62	CH_3		

3.63	H		
3.64	CH_3		
3.65	H		
3.66	CH_3		
3.67	H		

3.68	CH_3		
3.69	CH_3		
3.70	CH_3	3-甲氧基苯基	Rf = 0.55 (30%乙酸乙酯/己烷)
3.71	CH_3		
3.72	CH_3		
2.73	CH_3	3-(4-氯苯基)-苯基	
3.74	CH_3	3-(4-氰基苯基)-苯基	
3.75	CH_3	3-(3-氰基苯基)-苯基	
3.76	CH_3		

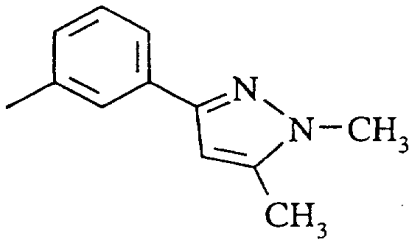
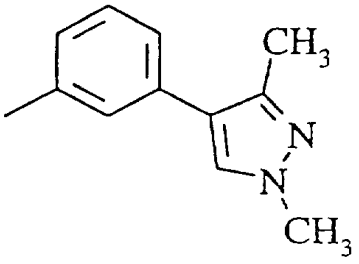
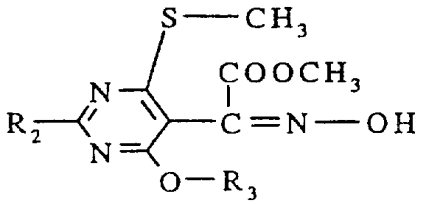
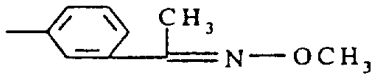
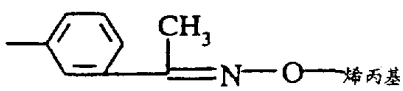
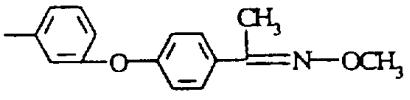
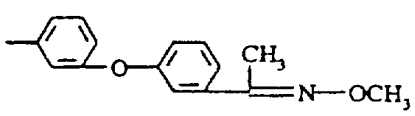
3.77	CH_3		
3.78	CH_3		
3.79	CH_3	3-(2-氰基苯基)苯基	
3.80	CH_3	3-(2-甲基苯基)苯基	
3.81	CH_3	3,5-二甲基苯基	

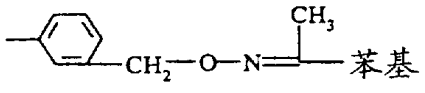
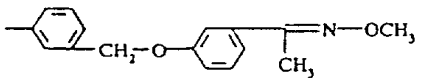
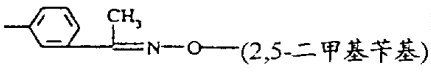
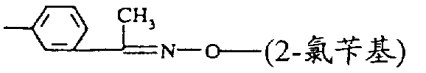
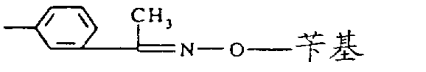
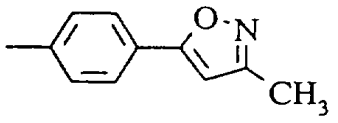
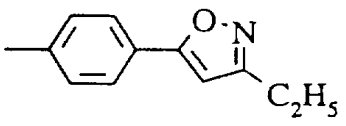
表 4:



化合物 No.	R_2	R_3	物理数据 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$)或/和m.p.
4.01	CH_3	3-联苯基	
4.02	H	3-联苯基	
4.03	H	3-三氟甲基苯基	
4.04	CH_3	3-三氟甲基苯基	
4.05	CH_3	3-苯氧基苯基	
4.06	CH_3	3－氯苯基	
4.07	H	3-三氟甲氧基苯基	
4.08	H	3-苯氧基苯基	
4.09	H	3-氯苯基	
4.10	CH_3	3-叔丁基苯基	
4.11	CH_3	3-甲基苯基	
4.12	CH_3		
4.13	CH_3	3-甲基-5-异丙基苯基	
4.14	H	3-甲基-5-异丙基苯基	

4.15	CH_3		
4.16	CH_3	3-三氟甲基苄基	
4.17	CH_3	3-苯氧基苄基	
4.18	CH_3	3-(2-氰基苯氧基)-苯基	
4.19	CH_3	3-异丙基苯基	
4.20	CH_3	苯基	
4.21	CH_3	3-(3,5-二甲基苯氧基)-苯基	
4.22	CH_3	3-(2-氯-4-甲基苯氧基)-苯基	
4.23	CH_3	3-(4-氯-2-甲基苯氧基)-苯基	
4.24	CH_3	3-(3-氰基苯氧基)-苯基	
4.25	CH_3	3-(4-氰基苯氧基)-苯基	
4.26	CH_3	3-(2-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
4.27	CH_3	3-(3-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
4.28	CH_3	3-(4-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
4.29	CH_3		

4.30	CH_3		
4.31	CH_3	3-(3-氯苯氧基)-苯基	
4.32	CH_3	3-(3-甲氧基苯氧基)-苯基	
4.33	CH_3	3-(2-甲基苯氧基)-苯基	
4.34	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基)-苯基	
435	CH_3	3-(3-甲基苯氧基)-苯基	
4.36	CH_3	3－苄氧基-苯基	
4.37	CH_3	3-(2-甲基苄氧基)-苯基	
4.38	CH_3	3-(2-氯苄氧基)-苯基	
4.39	CH_3	3-(2,5-二氯苄氧基)-苯基	
4.40	CH_3	3-(2,5-二甲基苄氧基)-苯基	
4.41	CH_3	3-(3-氯苄氧基)-苯基	
4.42	CH_3	3-(3-甲基苄氧基)-苯基	
4.43	CH_3	3-(3-氯-4-甲基苄氧基)-苯基	
4.44	CH_3	3-(3-甲氧基苄氧基)-苯基	
4.45	CH_3	3-(2-氯基苄氧基)-苯基	
4.46	CH_3	3-(2-硝基苄氧基)-苯基	
4.47	CH_3	3-(苯乙氧基)-苯基	

4.48	CH_3	3-(苯氧基-甲基)-苯基	
4.49	CH_3	3-(3-氯苯氧基甲基)-苯基	
4.50	CH_3		
4.51	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基-甲基)-苯基	
4.52	CH_3		
4.53	CH_3		
4.54	CH_3		
4.55	CH_3		
4.56	CH_3	3-(2-萘基)-苯基	
4.57	CH_3	3-甲氧基苯基	
4.58	CH_3		
4.59	CH_3		
4.60	CH_3		

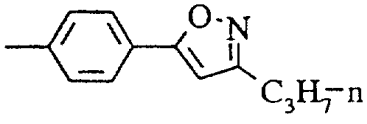
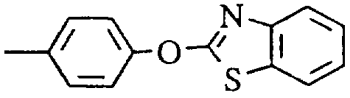
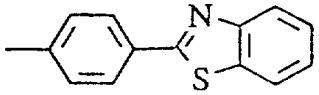
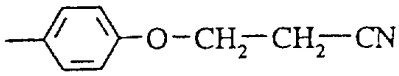
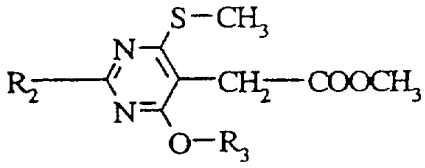
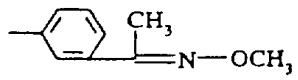
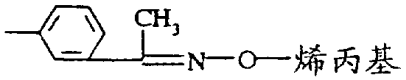
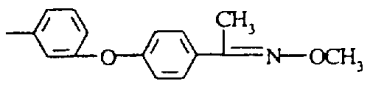
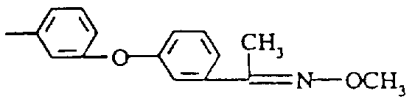
4.61	CH_3		
4.62	CH_3		
4.63	CH_3		
4.64	CH_3		4

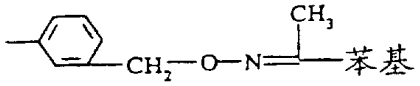
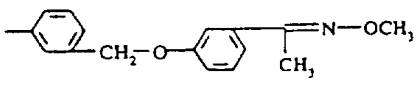
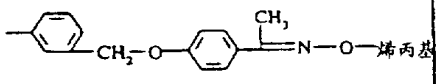
表 5:

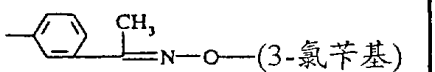
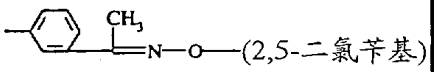
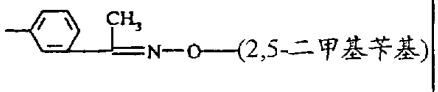
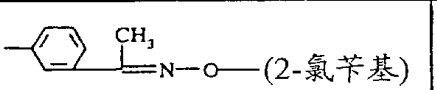
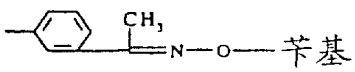
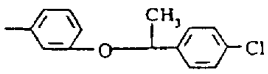
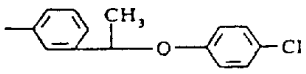
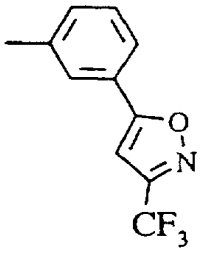


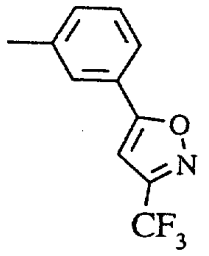
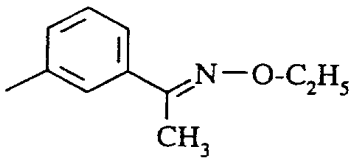
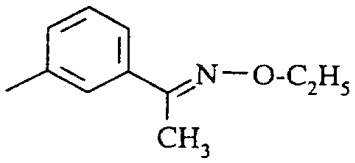
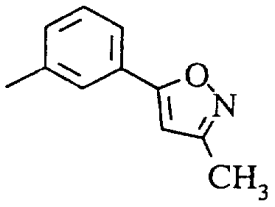
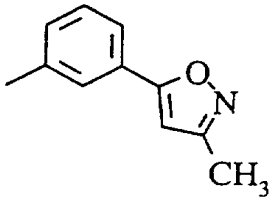
化合物 No.	R_2	R_3	物理数据 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$)或/和 m.p.
5.01	CH_3	3 - 联苯基	
5.02	H	3 - 联苯基	
5.03	H	3 - 三氟甲基苯基	

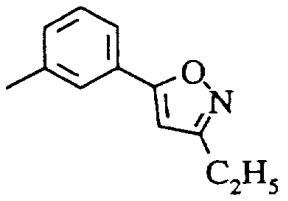
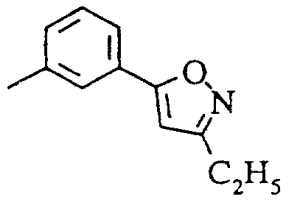
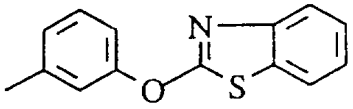
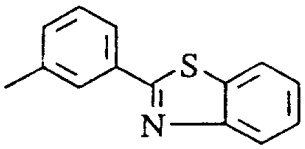
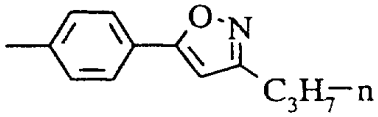
5.04	CH_3	3-三氟甲基苯基	7.25-7.55 (m, 4H); 3.78 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.62 (s, 3H); 2.46 (s, 3H).
5.05	CH_3	3－苯氧基苯基	
5.06	CH_3	3－氯苯基	
5.07	H	3－苯氧基苯基	
5.08	CH_3	3－叔丁基苯基	6.88-7.30 (m, 4H); 3.78 (s, 2H); 3.69 (s, 3H); 2.59 (s, 3H); 2.44 (s, 3H); 1.28 (s, 9H).
5.09	CH_3	3－甲基苯基	
5.10	CH_3		
5.11	CH_3	3－甲基-5-异丙基苯基	6.18-6.84 (m, 3H); 3.74 (s, 2H); 3.69 (s, 3H); 2.85 (m, 1H); 2.51 (s, 3H); 2.45 (s, 3H); 2.34 (s, 3H); 1.22 (d, 6H).
5.12	H	3－甲基-5-异丙基苯基	
5.13	CH_3		
5.14	CH_3	3－三氟甲基苄基	
5.15	CH_3	3－苯氧基苄基	
5.16	CH_3	3-(2-氰基苯氧基)-苯基	6.78-7.70 (m, 8H); 3.86 (s, 3H); 3.68 (s, 3H); 2.52 (s, 3H); 2.48 (s, 3H).
5.17	CH_3	3－异丙基苯基	

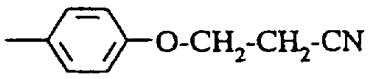
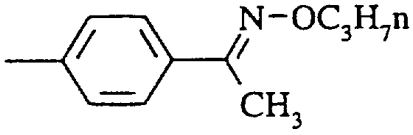
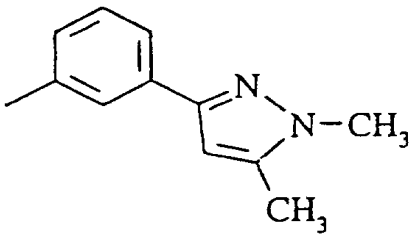
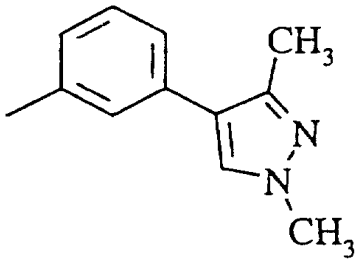
5.18	CH_3	苯基	
5.19	CH_3	3-(3,5-二甲基苯氧基)-苯基	
5.20	CH_3	3-(2-氯-4-甲基苯氧基)-苯基	
5.21	CH_3	3-(4-氯-2-甲基苯氧基)-苯基	
5.22	CH_3	3-(3-氰基苯氧基)-苯基	
5.23	CH_3	3-(4-氰基苯氧基)-苯基	
5.24	CH_3	3-(2-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
5.25	CH_3	3-(3-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
5.26	CH_3	3-(4-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
5.27	CH_3		
5.28	H		
5.29	CH_3	3-(3-氯苯氧基)-苯基	
5.30	CH_3	3-(3-甲氧基苯氧基)-苯基	
5.31	CH_3	3-(2-甲基苯氧基)-苯基	6.66-7.32 (m, 8H); 3.71 (s, 2H); 3.68 (s, 3H); 2.58 (s, 3H); 2.45 (s, 3H); 2.27 (s, 3H).

5.32	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基)-苯基	
5.33	CH_3	3-(2,3-二甲基苯氧基)-苯基	
5.34	CH_3	3-(3-甲基苯氧基)-苯基	
5.35	CH_3	3－苄氧基－苯基	
5.36	CH_3	3-(2-甲基苄氧基)-苯基	
5.37	CH_3	3-(2-氯苄氧基)-苯基	
5.38	CH_3	3-(2,5-二甲基苄氧基)-苯基	
5.39	CH_3	3-(3-氯苄氧基)-苯基	
5.40	CH_3	3-(3-甲基苄氧基)-苯基	
5.41	CH_3	3-(4-氯苄氧基)-苯基	
5.42	CH_3	3-(3-甲氧基苄氧基)-苯基	
5.43	CH_3	3-(2-氰基苄氧基)-苯基	
5.44	CH_3	3-(苯乙氧基)-苯基	
5.45	CH_3	3-(苯氧基-甲基)-苯基	
5.46	CH_3		
5.47	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基-甲基)-苯基	
5.48	CH_3		
5.49	CH_3		

5.50	CH_3		
5.51	CH_3		
5.52	CH_3		
5.53	CH_3		
5.54	CH_3		
5.55	CH_3		
5.56	CH_3		
5.57	CH_3	3-(2-萘基)-苯基	
5.58	CH_3	3-(4-甲基苯基)-苯基	
5.59	CH_3	3-(2-吡啶基)-苯基	
5.60	CH_3		

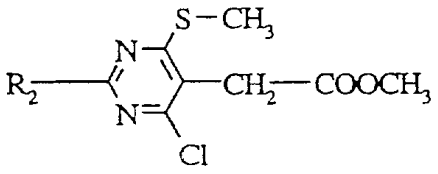
5.61	H		
5.62	CH_3		
5.63	H		
5.64	CH_3		
5.65	H		

5.66	CH_3		
5.67	H		
5.68	CH_3		
5.69	CH_3		
5.70	CH_3	3 - 甲氧基苯基	6.62-6.78 and 7.20-7.30 (m, 4H); 3.78 (s, 3H); 3.75 (s, 2H); 3.71 (s, 3H); 2.58 (s, 3H); 2.45 (s, 3H)
5.71	CH_3		

5.72	CH_3		
5.73	CH_3	3-(4-氯苯基)苯基	
5.74	CH_3	3-(4-氰基苯基)苯基	
5.75	CH_3	3-(3-氰基苯基)苯基	
5.76	CH_3		
5.77	CH_3		
5.78	CH_3		
5.79	CH_3	3-(2-氰基苯基)苯基	
5.80	CH_3	3-(2-甲基苯基)苯基	

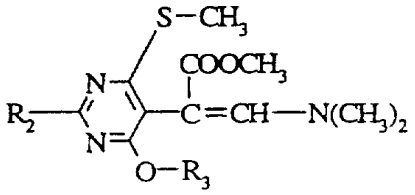
5.81	CH_3	3,5 - 二甲基苯基	

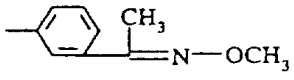
表 6:

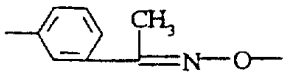


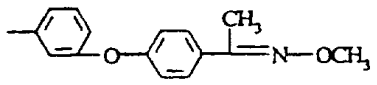
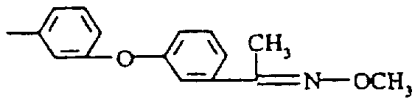
化合物 No.	R_2	物理数据
6.01	CH_3	3.80 (s, 2H); 3.75 (s, 3H); 2.62 (s, 6H)
6.02	H	8.50 (s, 1H); 3.81 (s, 2H); 3.76 (s, 3H); 2.60 (s, 3H)
6.03	C_2H_5	

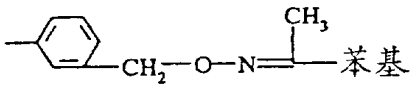
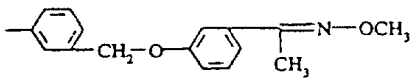
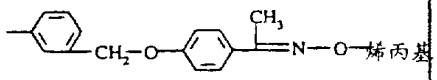
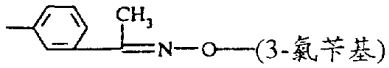
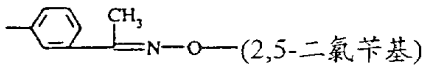
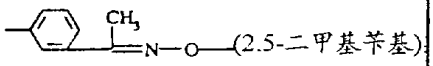
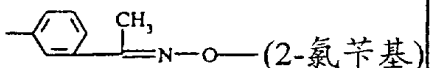
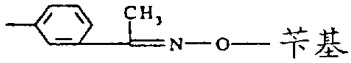
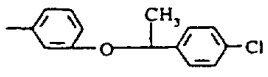
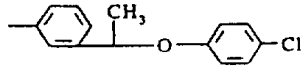
表 7:

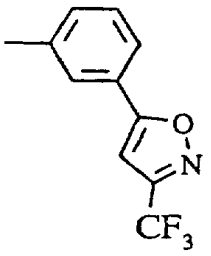
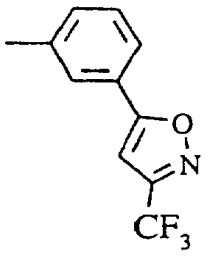
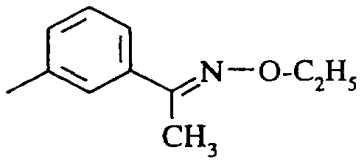
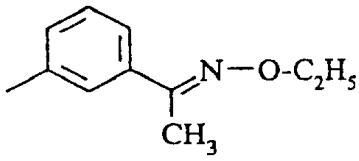


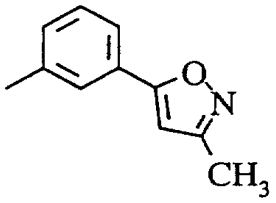
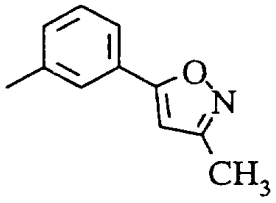
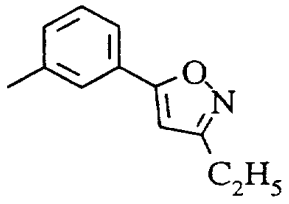
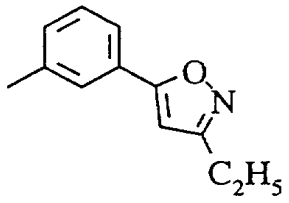
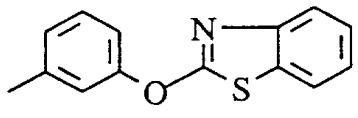
化合物 No.	R_2	R_3	物理数据 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$) 或/和 m.p.
7.01	CH_3	3 - 联苯基	
7.02	H	3 - 联苯基	
7.03	H	3 - 三氟甲基苯基	
7.04	CH_3	3 - 三氟甲基苯基	7.70 (s, 1H); 7.22-7.48 (m, 4H); 3.60 (s, 3H); 2.85 (s, 6H); 2.49 (d, 6H).
7.05	CH_3	3-苯氧基苯基	
7.06	CH_3	3 - 氯苯基	
7.07	H	3 - 苯氧基苯基	
7.08	CH_3	3 - 叔丁基苯基	7.69 (s, 1H); 7.08-7.30 (m, 4H); 3.60 (s, 3H); 2.85 (s, 6H); 2.50 (d, 6H); 1.30 (s, 9H).
7.09	CH_3	3 - 甲基苯基	
7.10	CH_3		

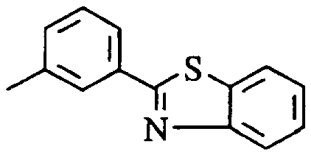
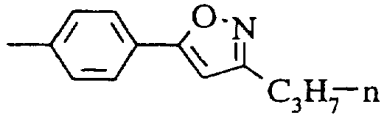
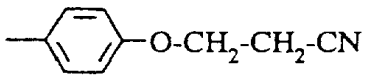
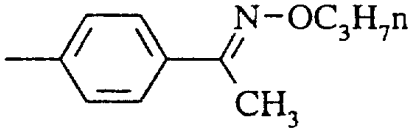
7.11	CH_3	3-甲基-5-异丙基苯基	7.68 (s, 1H); 6.68-6,82 (3s, 1H 各); 3.60 and 2.30 (2s, 3H 各); 2.85 (s, 7H); 2.50 (d, 6H); 1.20 (d, 6H).
7.12	H	3-甲基-5-异丙基苯基	
7.13	CH_3		
7.14	CH_3	3-三氟甲基苄基	
7.15	CH_3	3－苯氧基苄基	
7.16	CH_3	3-(2-氰基苯氧基)-苯基	6.80-7.67 (m, 9H); 3.60 (s, 3H); 2.80 (s, 6H); 2.48 (d, 6H).
7.17	CH_3	3-异丙基苯基	
7.18	CH_3	苯基	
7.19	CH_3	3-(3,5-二甲基苯氧基)-苯基	
7.20	CH_3	3-(2-氯-4-甲基苯氧基)-苯基	
7.21	CH_3	3-(4-氯-2-甲基苯氧基)-苯基	
7.22	CH_3	3-(3-氰基苯氧基)-苯基	
7.23	CH_3	3-(4-氰基苯氧基)-苯基	
7.24	CH_3	3-(2-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
7.25	CH_3	3(3-三氟甲基-苯氧基)-苯基	

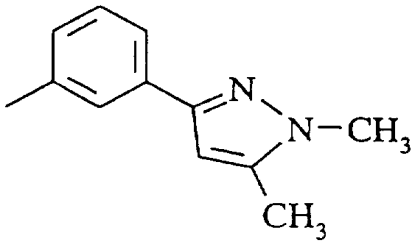
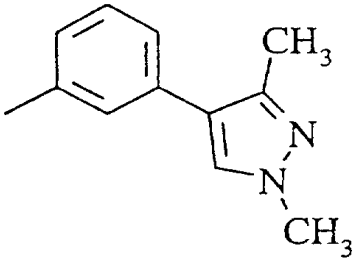
7.26	CH_3	3-(4-三氟甲基-苯氧基)-苯基	
7.27	CH_3		
7.28	H		
7.29	CH_3	3-(3-氯苯氧基)-苯基	
7.30	CH_3	3-(3-甲氧基苯氧基)-苯基	
7.31	CH_3	3-(2-甲基苯氧基)-苯基	7.65 (s, 1H); 6.60-7.61 (m, 8H); 3.55, 3.41, 2.75 and 2.24 (4s, 3H 各), 2.48 (d, 6H).
7.32	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基)-苯基	
7.33	CH_3	3-(2,3-二甲基苯氧基)-苯基	
7.34	CH_3	3-(3-甲基苯氧基)-苯基	
7.35	CH_3	3－苄氧基－苯基	
7.36	CH_3	3-(2-甲基苄氧基)-苯基	
7.37	CH_3	3-(2-氯苄氧基)-苯基	
7.38	CH_3	3-(2,5-二甲基苄氧基)-苯基	
7.39	CH_3	3-(3-氯苄氧基)-苯基	
7.40	CH_3	3-(3-甲基苄氧基)-苯基	
7.41	CH_3	3-(4-氯苄氧基)-苯基	
7.42	CH_3	3-(3-甲氧基苄氧基)-苯基	

7.43	CH_3	3-(2-氰基苄氧基)-苯基	
7.44	CH_3	3-(苯乙氧基)-苯基	
7.45	CH_3	3-(苯氧基-甲基)-苯基	
7.46	CH_3		
7.47	CH_3	3-(2,5-二甲基苯氧基-甲基)-苯基	
7.48	CH_3		
7.49	CH_3		
7.50	CH_3		
7.51	CH_3		
7.52	CH_3		
7.53	CH_3		
7.54	CH_3		
7.55	CH_3		
7.56	CH_3		

7.57	CH_3	3-(2-萘基)-苯基	
7.58	CH_3	3-(4-甲基苯基)-苯基	
7.59	CH_3	3-(2-吡啶基)-苯基	
7.60	CH_3		
7.61	H		
7.62	CH_3		
7.63	H		

7.64	CH_3		
7.65	H		
7.66	CH_3		
7.67	H		
7.68	CH_3		

7.69	CH_3		
7.70	CH_3	3－甲氧基苯基	7.68 (s, 1H); 7.20-7.30 (m, 1H); 6.60-6.72 (m, 3H); 3.78 and 3.60 (2s, 3H 各); 2.72 (s, 6H); 2.50 (d, 6H).
7.71	CH_3		
7.72	CH_3		
7.73	CH_3	3-(4-氯苯基)苯基	
7.74	CH_3	3-(4-氰基苯基)苯基	
7.75	CH_3	3-(3-氰基苯基)苯基	
7.76	CH_3		

7.77	CH_3		
7.78	CH_3		
7.79	CH_3	3-(2-氰基苯基)苯基	
7.80	CH_3	3-(2-甲基苯基)苯基	
7.81	CH_3	3,5-二甲基苯基	

实施例 A： 抗粉霉活性

单囊壳

用含 100mg/l 活性成分的混悬液喷洒 17 天(子叶阶段)的黄瓜属植物(黄瓜)至几乎滴液为止，并使其干燥，一天后用含有 1 × 10^5 个/ml 新收集的单囊壳分生孢子的孢子混悬液接种处理过的植物，然后于温室中培养 7 天，条件为 24 ℃和 60 % r.h. 。

通过与相同条件下未处理的植物比较霉菌发生的程度来评价试验化合物的效力。在此试验中，试验化合物 1.01 、 1.04 、 1.08 、 1.10、 1.13、 1.16、 1.17、 1.18、 1.24、 1.35、 1.39、 1.43、 1.50、 1.60、 1.62、 1.66、 1.73、 1.76、 1.79、 1.81、 2.18、 2.30、 2.41 和 2.54 显示出大于 90 % 的效力。

用同样方法试验了所述化合物抗下列病原体的效力:

苹果的白叉丝单囊壳和小麦和大麦的禾本白粉菌(干接种)，其中化合物 1.04 、 1.08 、 1.10 、 1.11 、 1.12 、 1.13 、 1.17 、 1.18 、 1.35、 1.36、 1.39、 1.44、 1.50、 1.60、 1.62、 1.76、 1.81、 2.30、 2.41 和 2.54 显示出大于 90 % 的效力； 和

葡萄的葡萄钩丝壳，其中化合物 1.16 、 1.31 、 1.70 和 2.18 显示出大于 90 % 的效力。

实施例 B： 抗锈菌、斑点病、核腔菌和小球腔菌的活性

疣顶单孢锈(Uyces appendiculatus):

用含 100mg/l 活性成分的混悬液喷洒 14 天(2 叶期)的菜豆属植物(架豆)至几乎滴液，使液体干燥。一天后用含有 1 × 10^5 个/ml 新收集的疣顶单孢锈孢子的孢子混悬液接种。在此试验中，化合物 1.04 、 1.08、 1.10、 1.11、 1.12、 1.13、 1.16、 1.17、 1.35、 1.36、 1.39、 1.41、 1.42、 1.50、 1.60、 1.62、 1.73、 1.76、 1.81、 2.18、 2.30、

2.41 和 2.54 显示出至少 90 % 的效力。

应用相同的方法试验了所述化合物抗下列病原体的效力:

小麦的小麦柄锈(植物 10 天龄), 其中 1.04、 1.08、 1.10、 1.11、 1.12、 1.17、 1.18、 1.35、 1.36、 1.39、 1.50、 1.60、 1.62、 1.76、 2.18、 2.30 和 2.41 显示出至少 90 % 的效力;

大麦的麦类核腔菌, 其中化合物 1.02、 1.10、 1.12、 1.17、 1.18、 1.60、 1.62、 1.81 和 2.18 显示出至少 90 % 的效力;

小麦的小球腔菌, 其中化合物 1.02、 1.04、 1.08、 1.17、 1.18、 1.60、 1.39、 1.50、 1.60、 1.62、 1.81、 2.18、 2.30 和 2.41 显示出至少 90 % 的效力; 和

苹果的黑星菌(植物 21 天龄, 含 1 % 麦芽的孢子混悬液), 其中化合物 1.04、 1.08、 1.11、 1.16、 1.31 和 1.70 显示出至少 90 % 的效力。

实施例 C: 抗霜霉的活性

用含 100mg/l 活性成分的混悬液喷洒具有 6 叶的番茄属植物(西红柿)至几乎滴液, 并使喷液干燥。一天后用含 1 × 10^5 个/ml 新收集的致病疫霉孢子的孢子混悬液接种处理过的植物, 然后在+18 ℃和大于 95 % r.h.的高湿环境培养 7 天。通过与相同条件下未经处理的植物比较霉菌发生的程度来评价试验化合物的效力。在此试验中, 化合物 1.01、 1.04、 1.08、 1.10、 1.11、 1.12、 1.13、 1.16、 1.17、 1.18、 1.31、 1.35、 1.36、 1.39、 1.43、 1.44、 1.60、 1.62、 1.66、 1.70、 1.76、 2.18、 2.30 和 2.54 显示出至少 90 % 的效力。

类似的方法用于化合物抗葡萄的葡萄生单轴霉试验, 其中化合物 1.04、 1.08、 1.11、 1.16、 1.31、 1.70 和 2.18 显示出至少 90 % 的效力。

实施例 D: 种子处理后的活性

本发明化合物也可用于种子处理，用下列病 原体通过体外试验评价它们的优良的杀霉菌活性:

麦类核腔菌，

裸黑粉菌，

Gerlachia nivalis，

小球腔菌。

消毒的小麦种子用所述病原体的孢子或菌丝体接种，并用不同浓度的试验化合物包衣，应用剂量为 50g a.i/100kg 种子。处理后的种子放于琼脂板上，在+24 ℃的黑暗处使病原体生长 3-8 天。

通过比较处理的和未处理的接种种子霉菌生长程度来确定试验化合物的效力。

为了评价本发明化合物的农作物耐受性，用上述剂量包衣小麦和大麦的健康种子。然后在石盘中的湿滤纸上于+18 ℃和高湿度下使种子发芽 10 天。记录植物的伤害，比较处理的和未处理的秧苗生长。

在此试验中，化合物 1.16 和 2.18 显示出至少 90 % 的抗裸黑粉菌的效力。