[19]中华人民共和国专利局

[51]Int.Cl[6]
A01N 43/40
C07D211/88
C07D211/76

[12]发明专利说明书

[21] ZL 专利号 90107393.8

[45]授权公告日 1997 年 12 月 3 日

[11] 授权公告号 CN 1036564C

[22]申请日 90.8.31 [24]颁证日 96.9.13

[21]申请号 90107393.8

[30]优先权

[32]89.8.31 [33]US[31]401,329

[32]90.8.9 [33]US[31]563,780

[73]专利权人 罗姆和哈斯公司

地址 美国宾夕法尼亚

[72]发明人 巴里·克利福德·兰格

简·威辛格-科尼尔

约翰·威廉姆·阿什莫尔

科林·迈克尔·泰斯

[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 周中琦

[56]参考文献

US4595408

US4798620

US4880929

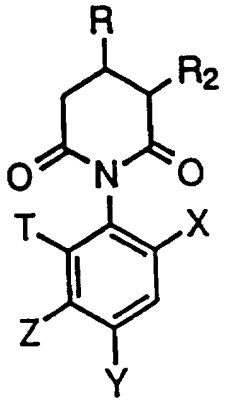
审查员 E4 12

权利要求书 11 页 说明书 120 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 具有除草活性的戊二酰亚胺的除草组合物

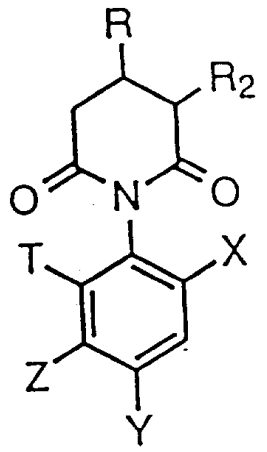
[57]摘要

本发明涉及具有除草活性的具有下述结构的戊二酰亚胺（其中 R、R^2、T、X、Y 和 Z 的定义见说明书）、含这些化合物的除草组合物以及这类化合物作为除草剂和杀藻剂的使用方法。



权 利 要 求 书

1. 一种含有农药化学可接受的载体及除草有效量的具有下式的化合物及其农药化学可接受的盐的除草组合物：



其中活性化合物中的

R 为(C_1—C_4)烷基、(C_1—C_4)卤代烷基或苯基；

R^2 为 H，或与 R 一起形成稠合苯环；

X 为 H、Cl、Br、CN 或 F；

Y 为 H、卤素、CH_3、SCH_3、硝基或 OCH_3；

但当 Y 为氢时，R 为三氟甲基，R^2 为氢且 Z 不是氢；

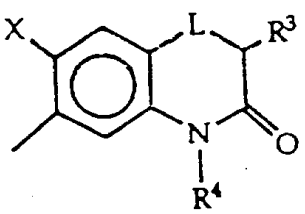
T 为 H 或 F；

Z 为 H、OH、卤原子、CN、SH、(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)卤代烷基、

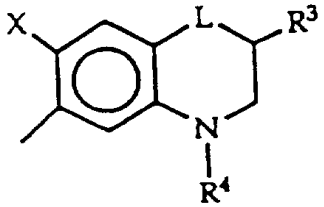
—OSO_2(C_1—C_6)烷基、—OSO_2 苯基、羧基、甲酰基、苯氧羰基、(C_1—C_6)烷氧基、(C_3—C_6)链烯氧基、(C_3—C_6)链炔氧基、氰基(C_1—C_6)烷氧基、苯基(C_1—C_6)烷氧基、(C_1—C_6)烷硫基、(C_1—C_6)烷酰氧基、(C_1—C_6)烷酰硫基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_4)烷硫基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_4)烷氧基、(C_1—C_6)烷氧羰基〔(C_1—C_6)烷氧基〕(C_1—C_6)烷氧基、(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷氧基、(苯硫基)(C_1—C_6)烷氧基、羧基(C_1—C_6)烷氧基、四氢呋喃氧基、吡啶(C_1—C_6)烷氧基、四氢呋喃(C_1—C_6)烷氧基、(C_1—C_6)烷基羰基、(C_1—C_6)烷氧羰基、〔(C_1—C_6)烷硫基〕羰基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_6)烷氧羰基、(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷氧羰基、氰基(C_1—C_6)烷氧羰基、(C_3—C_6)链烯氧基羰基、(C_3—C_6)链炔氧基羰基、卤代(C_3—C_6)链炔氧羰基、(C_3—C_6)环烷氧羰基、四氢异噁唑基羰基、呋喃基(C_1—C_6)烷氧羰基、吡啶基(C_1—C_6)烷氧羰基、四氢呋喃氧羰基、三(C_1—C_6)烷基甲硅烷基(C_1—C_6)烷氧基羰基、二(C_1—C_6)烷氧膦酰(C_1—C_6)烷氧羰基、二(C_1—C_6)烷基亚氨基氧羰基、一(C_1—C_6)烷基氨基羰基、一(C_3—C_6)链炔氨基羰基、苯基氨基羰基、一(C_1—C_6)烷氧基氨基羰基、(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷基、(C_3—C_6)链烯氧基(C_1—C_6)烷基、(C_3—C_6)链炔氧基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷酰氧基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷硫基(C_1—C_6)烷基、苯氧基(C_1—C_6)烷基、苯硫基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷基醛肟基、(C_3—C_6)链烯醛肟基、(C_3—C_6)链炔醛肟基、苯基(C_1—C_6)烷基醛肟基、二氧环戊基、环氧(C_1—C_6)烷氧基、二(C_1—C_6)烷基—2—噁唑啉基、一(C_1—C_6)烷酰氨基(C_3—C_6)环烷氧基；或者

Z 与 Y 一起形成 5—或 6—员杂环，该杂环与苯环结构稠合，形

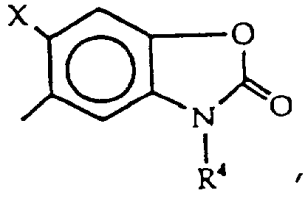
成具有下述结构的双环基团：



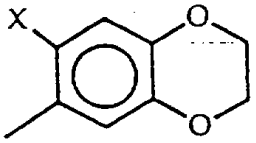
(1)，



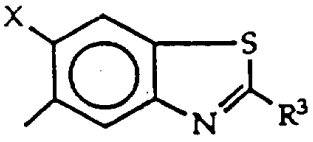
(2)，



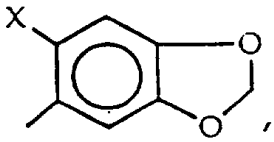
(3)，



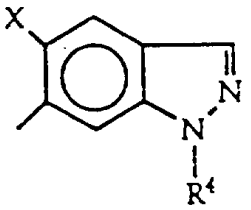
(4)，



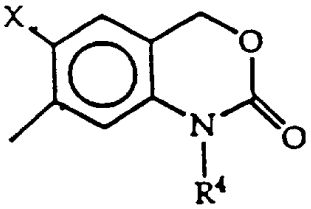
(5)，



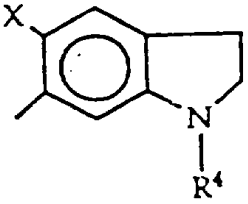
(6)，



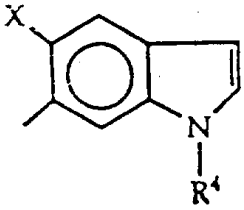
(7)，



(8)，



(9)或



(10)

其中

L 为氧或硫；

R^3 为氢或(C_1—C_3)烷基；且

式(1)中，R^4 为氢、(C_1—C_8)烷基、(C_3—C_6)链烯基、(C_3—C_6)链炔基、(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷基、(C_3—C_6)环烷基、(C_3—C_6)环烷基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷硫基(C_1—C_6)烷基、苯基(C_1—C_6)烷基、氰基

(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷氧羰基、四氢化糠基、四氢呋喃基、四氢呋喃基(C_1—C_6)烷基、二(C_1—C_6)烷氨基(C_1—C_6)烷基、二(C_1—C_6)烷氨基羰基(C_1—C_6)烷基或(C_1—C_6)烷酰基；

式(2)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基；

式(3)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基或(C_3—C_6)链炔基；

式(7)中，R^4 为(C_1—C_6)烷酰基或(C_3—C_6)链炔基；

式(8)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基；

式(9)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基羰基；

式(10)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基或(C_3—C_6)链炔基。

2. 权利要求1的组合物，其中活性化合物中的

R 为(C_1—C_4)烷基、(C_1—C_4)卤代烷基或苯基；

R^2 为H，或与R一起形成稠合苯环；

X 为H、Cl、Br 或F；

Y 为H、Cl、Br 或 CH_3；

T 为H 或F；且

Z 为(C_1—C_6)烷氧基、(C_3—C_6)链烯氧基、(C_3—C_6)链炔氧基、苯基(C_1—C_6)烷氧基、(C_1—C_6)烷硫基、(C_1—C_6)烷酰氧基、(C_1—C_6)烷酰硫基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_4)烷硫基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_4)烷氧基、氰基(C_1—C_6)烷氧基、(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷氧基、(苯硫基)(C_1—C_6)烷氧基、羧基(C_1—C_6)烷氧基、四氢呋喃氧基、吡啶(C_1—C_6)烷氧基、四氢呋喃(C_1—C_6)烷氧基、(C_3—C_6)环烷氧基、(C_3—C_6)环烷基、(C_1—C_6)烷氧基或(C_1—C_6)烷氧羰基〔(C_1—C_6)烷氧基〕(C_1—C_6)烷氧基。

3. 权利要求 2 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CH_3、CHF_2 或 CF_3，R^2 为 H，X 为 Cl 或 F，Y 为 Br、F 或 Cl，T 为 H，Z 为(C_1—C_6)烷氧基、(C_3—C_6)链烯氧基、(C_3—C_6)链炔氧基、四氢呋喃氧基、(C_3—C_6)环烷基(C_1—C_6)烷氧基或(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷氧基。

4. 权利要求 3 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CF_3，R^2 为氢，X 为氟，Y 为氯，Z 为烯丙氧基、异丙氧基、仲丁氧基、炔丙氧基、1—甲基炔丙氧基、环戊氧基、环丙甲氧基、3—四氢呋喃氧基或甲氧基甲氧基。

5. 权利要求 3 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CHF_2，R^2 为氢，X 为氟，Y 为氯，Z 为炔丙氧基。

6. 权利要求 3 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CF_3，R^2 为氢，X 为氟，Y 为溴，Z 为炔丙氧基。

7. 权利要求 1 的组合物，其中活性化合物中的

R 为(C_1—C_4)烷基、(C_1—C_4)卤代烷基或苯基；

R^2 为 H，或与 R 一起形成稠合苯环；

X 为 H、Cl、Br 或 F；

Y 为 H、Cl、Br、F 或 CH_3；

T 为 H 或 F；

Z 为羧基、甲酰基、(C_1—C_6)烷氧羰基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_6)烷氧羰基、氰基(C_1—C_6)烷氧羰基、(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷氧羰基、〔(C_1—C_6)烷硫基〕羰基、(C_1—C_6)烷羰基、(C_3—C_6)链烯氧羰基、卤代(C_3—C_6)链炔氧羰基、(C_3—C_6)链炔氧羰基、(C_3—C_6)环烷氧羰基、四氢呋喃氧羰基、三(C_1—C_6)烷基甲硅烷基(C_1—C_6)烷氧羰基、二(C_1—C_6)烷氧基膦酰基(C_1—C_6)烷氧羰基、二(C_1—C_6)烷基亚氨基氧羰基、一烷基氨基羰基、一(C_1—C_6)烷氧氨基羰基、一(C_1—C_6)链炔氨基羰基或苯基氨基羰基。

8. 权利要求 7 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CH_3、CHF_2 或 CF_3，R^2 为 H，X 为 Cl 或 F，Y 为 Br、F 或 Cl，T 为 H，Z 为 CO_2H、(C_1-C_6) 烷氧羰基、(C_3-C_6)环烷氧羰基、(C_3-C_6)链烯氧羰基或(C_3-C_6)链炔氧羰基。

9. 权利要求 8 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CF_3，R^2 为氢，X 为氟，Y 为氯，Z 为羧基、甲氧羰基、正丙氧羰基、异丙氧羰基、仲丁氧羰基、环丁氧羰基或乙氧羰基。

10. 权利要求 8 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CF_3，R^2 为氢，X 为氟，Y 为溴，Z 为异丙氧羰基。

11. 权利要求 8 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CHF_2，R^2 为氢，X 为氟，Y 为氯，Z 为异丙氧羰基。

12. 权利要求 8 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CH_3，R^2 为氢，X 为氟，Y 为氯，Z 为异丙氧羰基。

13. 权利要求 1 的组合物，其中活性化合物中的

R 为(C_1-C_4)烷基、(C_1-C_4)卤代烷基或苯基；

X 为 H、Cl、Br 或 F；

Y 为 H、Cl、Br、F 或 CH_3；

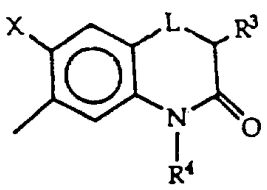
T 为 H 或 F；

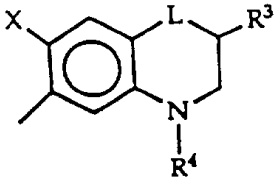
Z 为(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷氧基(C_1-C_6)烷基、(C_3-C_6)链烯氧基(C_1-C_6)烷基、(C_3-C_6)链炔氧基(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷酰氧基(C_1-C_6)烷基、〔(C_1-C_6)烷硫基〕(C_1-C_6)烷基、苯氧基(C_1-C_6)烷基、苯硫基(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷氧羰基(C_1-C_6)烷氧基(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷基醛肟基、(C_3-C_6)链烯醛肟基、(C_3-C_6)链炔醛肟基或苯基(C_1-C_6)烷基醛肟基。

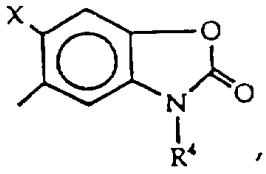
14. 权利要求13的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CH_3、CHF_2 或 CF_3，R^2 为 H，X 为 Cl 或 F，Y 为 Br、F 或 Cl，T 为 H，Z 为(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷氧甲基、(C_3—C_6)链烯氧甲基、(C_3—C_6)链炔氧甲基、(C_1—C_6)烷基醛肟基或(C_1—C_6)链炔醛肟基。

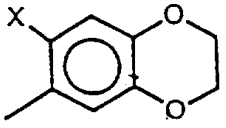
15. 权利要求14的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CH_3，R^2 为氢，X 为氟，Y 为氯，Z 为异丙氧甲基、1—(甲基)炔丙氧甲基、甲基醛肟基、异丙基醛肟基、炔丙基醛肟基或叔丁基醛肟基。

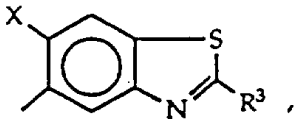
16. 权利要求1的组合物，其中活性化合物中的 R 为(C_1—C_4)烷基、(C_1—C_4)卤代烷基或苯基，R^2 为 H 或与 R 一起形成稠合苯环，Z 和 Y 形成5—或6—员杂环，该杂环与苯环结构稠合，形成具有下述结构的双环基团：

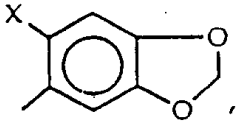

(1)

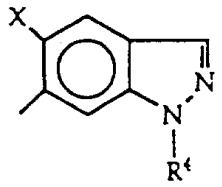

(2)

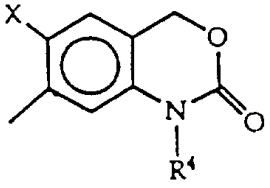

(3)

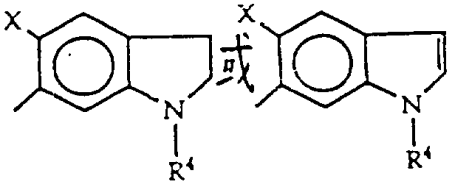

(4)


(5)


(6)


(7)


(8)


(9)　(10)

其中

L 为 O 或 S；

X 为 H 或 F；

R^3 为 H 或(C_1—C_3)烷基；且

式(1)中，R^4 为氢、(C_1—C_8)烷基、(C_3—C_6)链烯基、(C_3—C_6)链炔基、(C_1—C_6)烷氧基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷硫基(C_1—C_6)烷基、(C_3—C_6)环烷基、(C_3—C_6)环烷基(C_1—C_6)烷基、苯基(C_1—C_6)烷基、氰基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷氧羰基(C_1—C_6)烷基、四氢化糠基、四氢呋喃基、四氢呋喃(C_1—C_6)烷基、二(C_1—C_6)烷氨基(C_1—C_6)烷基、二(C_1—C_6)烷氨基羰基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷氧羰基或(C_1—C_6)烷酰基；

式(2)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基；

式(3)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基或(C_3—C_6)链炔基；

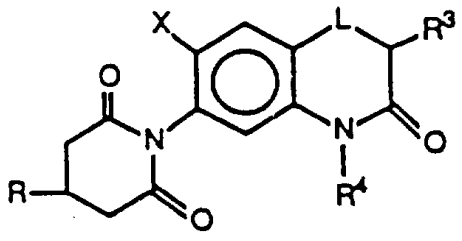
式(7)中，R^4 为(C_1—C_6)烷酰基或(C_3—C_6)链炔基；

式(8)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基；

式(9)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基羰基；

式(10)中，R^4 为(C_1—C_6)烷基或(C_3—C_6)链炔基。

17. 权利要求 16 的组合物，其中活性化合物具有下述结构：



其中

L 为 O 或 S；

X 为 H 或 F；

R 为 CH_3、CHF_2 或 CF_3；

R^3 为 H 或(C_1—C_3)烷基；且

R^4 为氢、(C_1—C_6 烷基、(C_3—C_6)链烯基、卤代(C_3—C_6)链烯基、(C_3—C_6)链炔基、(C_3—C_6)环烷基、(C_3—C_6)环烷基(C_1—C_6)烷基、(C_1—C_6)烷氧甲基、(C_1—C_6)烷硫甲基、氰基(C_1—C_6)烷基、四氢化糠基、四氢呋喃基、四氢呋喃(C_1—C_6)烷基、二(C_1—C_6)烷氨基(C_1—C_6)烷基或二(C_1—C_6)烷基氨基羰基(C_1—C_6)烷基。

18. 权利要求 17 的组合物，其中活性化合物中的 *X* 为 *H* 或 *F*，*R* 为 CH_3、CHF_2 或 CF_3，R^3 为 *H*、CH_3 或 CH_2CH_3，R^4 为炔丙基、烯丙基、乙氧甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、1—乙基丙基、2—甲氧乙基、甲氧甲基、甲硫甲基、1—氰基乙基、1—甲基炔丙基、2—甲基烯丙基、氰基甲基、环丙甲基、环戊基、二甲氨基羰甲基、2—四氢呋喃甲基、3—四氢呋喃基、2—氯烯丙基或 3,3—二氯烯丙基。

19. 权利要求 18 的组合物，其中活性化合物中的 *L* 为氧，*R* 为 CH_3，R^3 为 *H*，R^4 为炔丙基，*X* 为 *F*。

20. 权利要求 18 的组合物，其中活性化合物中的 *R* 为 CF_3，R^3 为 CH_3，R^4 为炔丙基，*L* 为氧，*X* 为 *H* 或 *F*。

21. 权利要求 18 的组合物，其中活性化合物中的 *R* 为 CF_3，R^3 和 *X* 为 *H*，*L* 为氧，R^4 为炔丙基、正丙基、1—甲基炔丙基、烯丙基、仲丁基、甲氧甲基或 2—甲氧乙基。

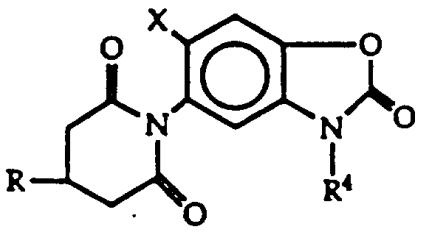
22. 权利要求 18 的组合物，其中活性化合物中的 *R* 为 CF_3，R^3 为 *H*，*X* 为 *F*，*L* 为氧，R^4 为炔丙基、氰基甲基、烯丙基、甲氧甲基、乙氧甲基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、1—氰基乙基、2—甲基烯丙基、甲基硫甲基、2—乙基丙基、环丙甲基、环戊基、二甲氨基羰甲基、2—四氢呋喃甲基、3—四氢呋喃基、2—氯烯丙基、3,3—二氯烯丙基或乙基。

23. 权利要求 18 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CHF_2，R^3 为 H，L 为氧，X 为 F，R^4 为烯丙基。

24. 权利要求 18 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CF_3，R^3 为 CH_2CH_3，L 为氧，X 为 F，R^4 为炔丙基。

25. 权利要求 18 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CF_3，R^3 为 H，L 为 S，X 为 F，R^4 为炔丙基。

26. 权利要求 16 的组合物，其中的活性化合物具有下列结构：



其中 R 为 CH_3 或 CF_3，X 为 H 或 F，R^4 为(C_1—C_6)烷基。

27. 权利要求 26 的组合物，其中活性化合物中的 R 为 CF_3，X 为 F，R^4 为正丙基。

28. 权利要求 1—27 中任何一项的组合物，其中还含有表面活性剂。

29. 权利要求 1—27 中任何一项的组合物，其中的化合物占整个组合物重量的 1%—98%。

30. 一种控制不需要的植物生长的方法，该方法包括向植物或其生长介质上施用权利要求 1—27 中任一项所述的化合物。

31. 权利要求 30 的方法，其中化合物施用率为 0.0001—12 磅/

英亩(1.12×10^{-5} 克/米^2—1.344 克/米^2)。

32. 权利要求 31 的方法，其中化合物施用率为 0.001—5 磅/英亩(11.2×10^{-5} 克/米^2—0.56 克/米^2)。

33. 权利要求 32 的方法，其中化合物施用率为 0.002—2 磅/英亩(22.4×10^{-5} 克/米^2—0.224 克/米^2)。

34. 权利要求 30 的方法，其中化合物是芽前施用的。

35. 权利要求 30 的方法，其中化合物是芽后施用的。

36. 一种在被藻污染的区域阻止藻生长的方法，该方法包括在该区域施用足以阻止藻生长的量的权利要求 1—27 中任一项所定义的组合物。

37. 权利要求 36 的方法，其中的化合物为 N—(4'—氯—2'氟—5'—炔丙氧苯基)—3—(三氟甲基)戊二酰亚胺、N—〔5'—(异丙氧)羰基—4'—氯—2'—氟苯基〕—3—(三氟甲基)戊二酰亚胺、4—炔丙基—6—(N—(3—三氟甲基)戊二酰亚胺基)—2 H—1,4—苯并恶嗪—3(4H)—酮、N—(4'—氯—2'—氟—5'—炔丙氧苯基)—3—五氟乙基)戊二酰亚胺、N—(4'—氯—2'—氟—5'—异丙氧苯基)—3—(五氟乙基)戊二酰亚胺或 N—〔4'—氯—2'—氟—5'—(甲氧氨基羰基)苯基〕—3—(三氟甲基)戊二酰亚胺。

说　　明　　书

含具有除草活性的戊二酰亚胺的除草组合物

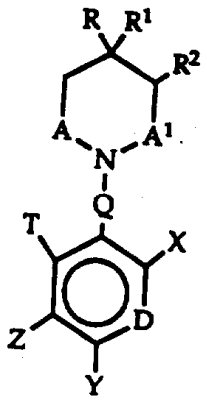
本发明涉及具有除草和杀藻活性的新的戊二酰亚胺、含有该化合物的组合物及该化合物的使用方法。

在过去的数年中，人们加强了抑制不需要的植物生长的除草剂的研究。美国专利4,400,202 公开了N-(间- 苯基戊二酰亚氨基)脲和N-(间- 苯基琥珀酰亚氨基)脲，以及这些化合物作为除草剂的用途。该专利没有披露任何在苯环上有其它取代基的化合物。

美国专利4,595,408 公开了N-(间- 酰氨基苯基)琥珀酰亚胺和N-(间- 酰氨基苯基)戊二酰亚胺，以及这些化合物作为除草剂的用途。该专利没有披露任何在苯环上有其它取代基的化合物。

人们还需要与现存化合物同样有效或更有效的除草剂。

本发明涉及一类新的具有下式的取代环状酰亚胺：



I

其中

A为羰基（C= O）、硫代羰基（C= S）或亚甲基（CH_2）；

A^1为羰基（C= O）或亚甲基（CH_2）；

但当Z为氢（H）时，A和A^1不都是CH_2；

D为CH，但当X为氢时，D为氮（N）；

Q为亚甲基[$(CH_2)_n$]（其中n为0或1），或为氧（O）；

R为（C_1-C_4）烷基、含1-9个卤原子的（C_1-C_4）卤代烷基或苯基；

R^1为氢或（C_1-C_2）烷基；但当X和Z分别独立地为氢或卤原子且Y为卤原子时，R^1为氢；

R^2为氢；或者

R、R^1和R^2一起形成稠合的苯环；

X为氢、氰基（CN）或卤原子；

Y为氢、卤原子、氰基（CN）、（C_1-C_3）烷硫基、卤代（C_1-C_3）烷硫基、（C_1-C_3）烷基、卤代（C_1-C_3）烷基、硝基、卤代（C_1-C_3）烷氧基或（C_1-C_3）烷氧基；

当Y为氢时，R为三氟甲基（CF_3），R^1和R^2为氢且Z不是氢；

T为氢或氟；且

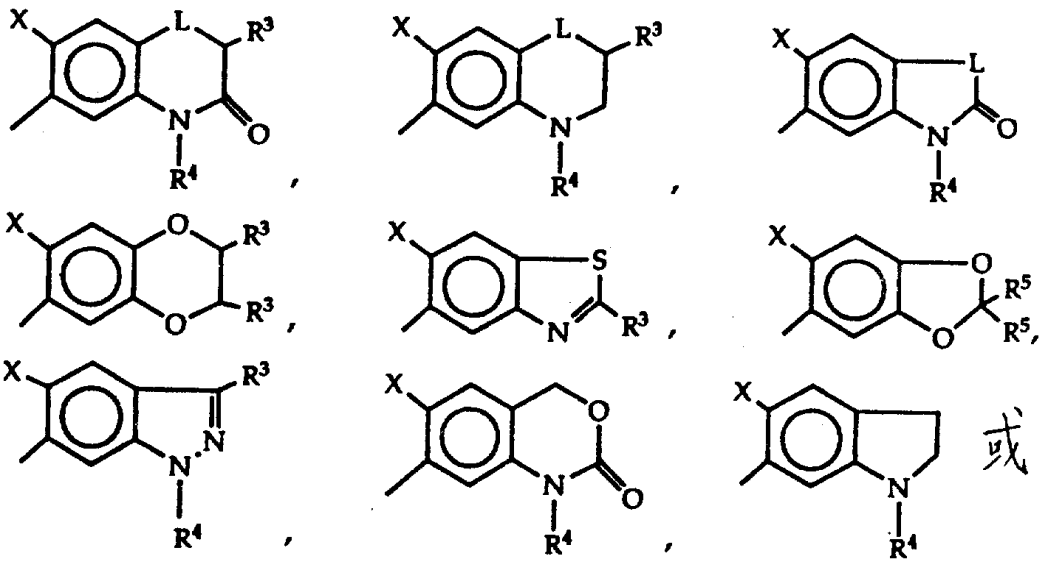
Z为氢、羟基（OH）、卤原子、氰基、硫羟基（SH）、烷基磺酰氧基（-OSO_2烷基）、苯基磺酰氧基（-OSO_2苯基）、烷基、烷氧基、链烯氧基、链炔氧基、环烷氧基、环烷基烷氧基、苯基烷氧基、烷硫基、链烯硫基、链炔硫基、环烷硫基、环

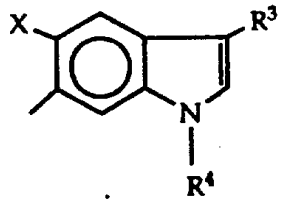
烷基烷硫基、苯基烷硫基、链烷酰氧基、链烷酰硫基、烷氧羰基烷硫基、烷氧羰基烷氧基、烷氧羰基（烷氧基）烷氧基、烷氧基烷氧基、（烷硫基）烷氧基、烷氧基烷硫基、烷硫基烷硫基、（苯硫基）烷氧基、苯氧基烷氧基、苯硫基烷硫基、苯氧基烷硫基、羧基烷硫基、羧基烷氧基、杂环氧基、杂环烷氧基、羧基、甲酰基、烷羰基、烷氧羰基、（烷硫基）羰基、烷氧羰基烷氧羰基、苯氧羰基、烷氧基烷氧羰基、链烯氧基羰基、链炔氧基羰基、环烷氧羰基、环烷基烷氧羰基、（链烯硫基）羰基、（链炔硫基）羰基、（环烷硫基）羰基、（环烷基烷硫基）羰基、杂环羰基、杂环烷氧羰基、杂环氧羰基、三烷基甲硅烷基烷氧羰基、二烷氧基膦酰基羰基〔- C(=O) O烷基P(=O) 烷氧基)$_2$〕、二烷基亚胺基氧羰基〔-C(=O) ON= C(烷基)$_2$〕、烷基亚胺基氧羰基、烷基（烷氧基）亚胺基氧羰基、烷基（烷硫基）亚胺基氧羰基、苯氨基羰基、氨基羰基、烷氨基羰基、链烯氨基羰基、链炔氨基羰基、烷氧氨基羰基、烷氧基烷基、链烯氧基烷基、链炔氧基烷基、环烷氧基烷基、环烷基烷氧基烷基、烷酰氧基烷基、烷硫基烷基、链烯硫基烷基、链炔硫基烷基、环烷氧基烷基、环烷基烷硫基烷基、（烷酰硫基）烷基、苯氧基烷基、苯硫基烷基、烷氧羰基烷氧基烷基、醛肟基〔-CH= NOH〕、烷基醛肟基〔-CH= NO烷基〕、链烯基醛肟基〔-CH= NO链烯基〕、链炔基醛肟基〔-CH= NO链炔基〕、烷氧羰基烷基醛肟基〔-CH= NO(烷氧羰基)烷基〕、烷基(烷氧基）醛肟基〔-C （烷氧基)=NO烷基〕、链烯基（烷氧基）醛肟基〔-C(烷氧基)=NO链烯基〕；链炔基（烷氧基）醛肟基〔-

C（烷基）=NO链炔基]、烷氧羰基烷基（烷氧基）醛肟基[-C（烷氧基)=NO（烷氧羰基）烷基]、烷基（烷基）醛肟基[-C（烷基)=NO烷基]、链烯基（烷基）醛肟基[-C（烷基)=NO链烯基]、链炔基（烷基）醛肟基[-C（烷基)=NO链炔基]、烷氧羰基烷基（烷基）醛肟基[-C（烷基)=NO（烷氧羰基）烷基]、烷基（烷硫基）醛肟基[-C（烷硫基)=NO烷基]、链烯基（烷硫基）醛肟基[-C（烷硫基)=NO链烯基]、链炔基（烷硫基）醛肟基[-（烷硫基)=NO链炔基]、烷氧羰基烷基（烷硫基）醛肟基[-C（烷硫基)=NO（烷氧羰基）烷基]、杂环基、烷氨基、链烯氨基、链炔氨基或烷酰基氨基；

但当X和Y均为溴（Br)或氯（Cl)且D为CH时，Z不是氢；或者

Z与Y一起形成5-或6-员杂环，该杂环与苯环结构形成具有下列结构的双环基：





其中

L为氧（O）或硫（S）；

R^3 为氢或烷基；

R^4 为氢、烷基、链烯基、链炔基、烷氧基烷基、链烯氧基烷基、链炔氧基烷基、氰基烷基、烷氧羰基烷基、环烷基、环烷基烷基、苯基烷基、烷硫基烷基、链烯硫基烷基、链炔硫基烷基、杂环基、杂环基烷基、烷氨基烷基、烷氨基羰基烷基、烷氧羰基或烷酰基；且

R^5 为氢、（C_1-C_3）烷基或氟原子。

本发明还包括上述化合物的农药化学可接受的盐。

烷基是指直链或支链烷基，例如（C_1-C_8）烷基（如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、1-乙基丙基或正

辛基）。上述Z取代基中所列的任何一个取代基的烷基部分还可被1-5 个卤原子取代，形成如三氟甲基、1,1,1,2,2-五氟乙基或（三氟甲基）甲基等基团；可被苯基取代，形成如苄基或苯乙基等基团；或可被氰基取代，形成如氰基甲基、2-氰基乙基或1-氰基乙基等基团。环烷基为，例如，环丙基、环丁基、环戊基、环己基，并包括可被（C_1-C_4）烷基取代的环烷基，如2-甲基环丙基，及可被卤原子取代的环烷基，如2,2-二氯环丙基。苯基可被1 个或2 个取代基如（C_1-C_3）烷基、卤原子、（C_1-C_3）烷氧基或三氟甲基所取代。R代表的卤代烷基为，例如，氟甲基、二氟甲基、三氟甲基或五氟乙基。

杂环基指3 至6 员杂环，其中含1 个、2 个或3 个杂原子如氧、氮或硫，还包括饱和或不饱和环，如四氢呋喃基、呋喃基、环氧基、吡啶基、哌啶基、二氧环戊基、异 噁唑烷基、三唑基、噻吩基、噻唑基或哌嗪基，这些基团可被1-3 个（C_1-C_6） 烷基取代，如5,5-二甲基 噁唑啉基。

卤原子指氟、氯、溴或碘原子。

在取代基Y和Z中，“硫代”指 -S- 。当不与羰基相连时，“硫代”还包括亚硫酰基(-SO-)和硫酰基。

取代的氨基如烷氨基包括一和二- 取代基团，如一烷基氨基和二烷基氨基。

肟可为顺式或反式构型，或两者的混合物。

农药化学可接受的盐包括那些本领域已知形式的盐，如钠、钾、钙和镁等金属盐，铵盐如异丙基铵盐以及三烷基锍盐如三甲基

锍盐。

烷氧基为，例如（C_1-C_6）烷氧基（如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基或仲丁氧基）。链烯氧基为，例如，（C_3-C_6）链烯氧基（如烯丙氧基、2-氯烯丙氧基或3,3-二氯烯丙氧基）。链炔氧基为，例如，（C_3-C_6）链炔氧基（如炔丙氧基、1-甲基炔丙氧基、1-（3- 丁炔基）氧基或1-（2- 丁炔基）氧基。苯基烷氧基为，例如，苯基（C_1-C_6）烷氧基（如苯基甲氧基）。烷硫基为，例如，（C_1-C_6）烷硫基（如甲硫基、乙硫基、丙硫基、丁硫基）。链烯硫基为，例如，（C_3-C_6）链烯硫基。链炔硫基为，例如，（C_3-C_6）链炔硫基。苯基烷硫基为，例如，苯基（C_1-C_6）烷硫基。烷酰氧基为，例如，（C_1-C_6）烷酰氧基。烷酰硫基为，例如，（C_1-C_6）烷酰硫基（如乙酰硫基）。烷氧羰基烷硫基为，例如，（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_4）烷硫基（如甲氧羰基甲硫基或异丙氧羰基甲硫基）。烷氧羰基烷氧基为，例如，（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_4）烷氧基（如甲氧羰基甲氧基）。烷氧羰基（烷氧基）烷氧基为，例如，（C_1-C_6）烷氧羰基[（C_1-C_6） 烷氧基]（C_1-C_6）烷氧基[如甲氧羰基（甲氧基）甲氧基]。烷氧基烷氧基为，例如，（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷氧基（如甲氧基甲氧基或2-甲氧基乙氧基）。（烷硫基）烷氧基为，例如，[（C_1-C_6） 烷硫基]（C_1-C_6）烷氧基。烷氧基烷硫基为，例如，（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷硫基。烷硫基烷硫基为，例如，（C_1-C_6）烷硫基（C_1-C_6）烷硫基。（苯硫基）烷氧基为，例如，（苯硫基）（C_1-C_6）烷氧基[如（苯硫基）甲氧

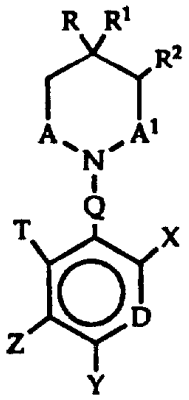
基]。苯氧基烷氧基为，例如，苯氧基（C_1-C_6）烷氧基。苯硫基烷硫基为，例如，苯硫基（C_1-C_6）烷硫基。苯氧基烷硫基为，例如，苯氧基（C_1-C_6）烷硫基。羧基烷硫基为，例如，羧基（C_1-C_6）烷硫基。羧基烷氧基为，例如，羧基（C_1-C_6）烷氧基（如羧基甲氧基）。烷羰基为，例如，（C_1-C ）烷羰基（如甲羰基，即乙酰基）。烷氧羰基为，例如，（C_1-C_6）烷氧羰基（如甲氧羰基、乙氧羰基、正丙氧羰基、异丙氧羰基、1-氰基乙氧羰基、异丁氧羰基或仲丁氧羰基）。（烷硫基）羰基为，例如，[（C_1-C_6）烷硫基] 羰基 [如（ 乙硫基 ）羰基或（异丙硫基）羰基]。烷氧羰基烷氧羰基为，例如，（C_1-C_6）烷氧基羰基（C_1-C_6）烷氧羰基 [如甲氧羰基（甲基）甲氧羰基或乙氧羰基甲氧羰基]。烷氧基烷氧羰基为，例如（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷氧羰基 [如（2- 甲氧基）乙氧羰基或（2-甲氧基-1- 甲基）乙氧羰基]。链烯氧羰基为，例如，（C_3-C_6）链烯氧羰基。链炔氧羰基为，例如，（C_3-C_6）链炔氧羰基（如炔丙氧羰基、3-碘代炔丙氧羰基、1-甲基炔丙氧羰基或3-丁炔氧羰基）。环烷氧羰基为，例如，（C_3-C_6）环烷氧羰基（如环丁氧羰基、环戊氧羰基或环己氧羰基）。环烷基烷氧羰基为，例如，（C_3-C_6）环烷基（C_1-C_6）烷氧羰基。（链烯硫基）羰基为，例如，[（C_3-C_6）链烯硫基] 羰基。（链炔硫基）羰基为，例如，[（C_3-C_6）链炔硫基] 羰基。（环烷硫基）羰基为，例如，[（C_3-C_6）环烷硫基）羰基。（环烷基烷硫基）羰基为，例如，[（C_3-C_6] 环烷基（C_1-C_6）烷硫基]羰基。杂环烷氧羰基为杂环（C_1-C_6）烷氧羰基。杂环氧羰基为，例如，3-四氢呋喃氧羰基。三烷基甲基

硅烷氧基羰基为，例如，三（C_1-C_6）烷基甲硅烷基（C_1-C_6）烷氧羰基（如三甲基甲硅烷基甲氧羰基）。二烷氧基膦酰基烷氧羰基为，例如，二（C_1-C_6）烷氧基膦酰基（C_1-C_6）烷氧羰基（如二乙氧基膦酰基甲氧羰基）。二烷基亚氨基氧羰基为，例如，二（C_1-C_6）烷基亚氨基氧羰基（如二甲基亚氨基氧羰基）。烷基亚氨基氧羰基为，例如，（C_1-C_6）烷基亚氨基氧羰基。烷基（烷氧基）亚氨基氧羰基为，例如，（C_1-C_6）烷基[（C_1-C_6）烷氧基]亚氨基氧羰基。烷基（烷硫基）亚氨基氧羰基为，例如，（C_1-C_6）烷基[（C_1-C_6）烷硫基]亚氨基氧羰基。烷基氨基羰基为，例如，一（C_1-C_6）烷基氨基羰基（如异丙基氨基羰基）或二（C_1-C_6）烷基氨基羰基。链烯氨基羰基为，例如，一（C_3-C_6）链烯氨基羰基。链炔氨基羰基为，例如，一（C_3-C_6）链炔氨基羰基（如炔丙氨基羰基）。烷氧基氨基羰基为，例如，一（C_1-C_6）烷氧基氨基羰基（如甲氧基氨基羰基）。烷氧基烷基为，例如，（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷基（如甲氧甲基、乙氧甲基或异丙基氧甲基）。链烯氧烷基为，例如，（C_3-C_6）链烯氧（C_1-C_6）烷基。链炔氧烷基为，例如，（C_3-C_6）链炔氧（C_1-C_6）烷基（如炔丙氧甲基或1-甲基炔丙氧甲基）。环烷氧烷基为，例如，（C_3-C_6）环烷氧（C_1-C_6）烷基。环烷基烷氧基烷基为，例如，（C_3-C_6）环烷基（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷基。烷酰氧烷基为，例如，（C_1-C_6）烷酰氧（C_1-C_6）烷基（如乙酰氧甲基）。烷硫基烷基为，例如，（C_1-C_6）烷硫基（C_1-C_6）烷基（如甲基硫基甲基、异丙硫基甲基或乙硫基甲基）。链烯硫烷基为，例如，（C_3-C_6）链烯硫（

C_1-C_6)烷基。链炔硫烷基为，例如，(C_3-C_6)链炔硫(C_1-C_6)烷基。环烷基硫烷基为，例如，(C_3-C_6)环烷基硫(C_1-C_6)烷基。环烷基烷基硫烷基为，例如，(C_3-C_6)环烷基(C_1-C_6)烷硫(C_1-C_6)烷基。(烷酰硫)烷基为，例如，[(C_1-C_6)烷酰硫](C_1-C_6)烷基。苯氧烷基为，例如，苯氧(C_1-C_6)烷基(如苯氧甲基)。苯基硫烷基为，例如，苯基硫(C_1-C_6)烷基(如苯基硫甲基)。烷氧羰基烷氧烷基为，例如，(C_1-C_6)烷氧羰基(C_1-C_6)烷氧基(C_1-C_6)烷基[如乙氧羰基(甲基)甲氧甲基]。烷氨基烷基为，例如，二(C_1-C_6)烷基氨基(C_1-C_6)烷基(如二甲基氨基乙基)。链烯基为，例如，(C_3-C_6)链烯基(如烯丙基)。链炔基为，例如(C_3-C_6)链炔基(如炔丙基或1-甲基炔丙基)。烷基醛肟基为，例如，(C_1-C_6)烷基醛肟基(如甲基醛肟基、异丙基醛肟基或叔丁基醛肟基)。链烯基醛肟基为，例如，(C_3-C_6)链烯基醛肟基(如烯丙基醛肟基)。链炔基醛肟基为，例如，(C_3-C_6)链炔基醛肟基(如炔丙基醛肟基)。烷氧羰基烷基醛肟基为，例如，(C_1-C_6)烷氧羰基(C_1-C_6)烷基醛肟基。苯基烷基醛肟基为，例如，苯基(C_1-C_6)烷基醛肟基(如苯甲基醛肟基)。烷基(烷基)醛肟基为，例如，(C_1-C_6)烷基[(C_1-C_6)烷基]醛肟基。链烯基(烷基)醛肟基为，例如，(C_3-C_6)链烯基[(C_1-C_6)烷基]醛肟基。链炔基(烷基)醛肟基为，例如，(C_3-C_6)链炔基[(C_1-C_6)烷基]醛肟基。烷氧羰基烷基(烷基)醛肟基为，例如(C_1-C_6)烷氧羰基(C_1-C_6)烷基[(C_1-C_6)烷基]醛肟基。烷基(烷氧基)醛肟基为，例如，(C_1-C_6)烷基

[（C_1-C_6）烷基］醛肟基。链烯基（烷氧基）醛肟基为，例如，（C_3-C_6）链烯基[（C_1-C_6）烷氧基］醛肟基。链炔基（烷氧基）醛肟基为，例如，（C_3-C_6）链炔基[（C_1-C_6）烷氧基］醛肟基。烷氧基羰基烷基（烷氧基）醛肟基为，例如，（C_1-C_6）烷氧基羰基（C_1—C_6）烷基[（C_1-C_6）烷氧基］醛肟基。烷基（烷硫基）醛肟基为，例如，（C_1-C_6）烷基[（C_1-C_6）烷硫基］醛肟基。链烯基（烷硫基）醛肟基为，例如，（C_3-C_6）链烯基[（C_1-C_6）烷硫基］醛肟基。链炔基（烷硫基）醛肟基为，例如，（C_3-C_6）链炔基[（C_1-C_6）烷硫基］醛肟基。烷氧羰基烷基（烷硫基）醛肟基为，例如，（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷基[（C_1-C_6）烷硫基］醛肟基。烷基氨基为，例如，—（C_1-C_6）烷基氨基或二（C_1-C_6）烷基氨基。链烯氨基为，例如，—（C_3-C_6）链烯氨基或二（C_3-C_6）链烯氨基。链炔氨基为，例如，—（C_3-C_6）链炔氨基。烷酰氨基为，例如，—（C_1-C_6）烷酰氨基（如乙酰氨基）。烷氧羰基烷基为，例如，（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷基（如异丙氧羰基甲基）。氰基烷基为，例如，氰基（C_1-C_6）烷基（如氰基甲基或1-氰基乙基）。苯基烷基为，例如，苯基（C_1-C_6）烷基（如苄基）。杂环烷基为，例如，杂环（C_1-C_6）烷基（如环氧甲基或2-四氢呋喃甲基）。杂环羰基为，例如，异丁噁唑烷羰基。杂环烷氧基为，例如，杂环（C_1-C_6）烷氧基（如环氧甲氧基、2-吡啶甲氧基或2-四氢呋喃甲氧基）。杂环氧基为，例如，3- 四氢呋喃氧基。

本发明的优选化合物为具有下式的化合物：



I

其中

A为C= O、C= S或CH_2；

A^1 为C= O、或CH_2；

但当Z为氢时，A和A 不都是CH；

D为CH，当X为H时，D为N；

Q为（CH_2）n（其中n 为0 或1 ）或为氧；

R为（C_1-C_4）烷基、（C_1-C_4）卤代烷基或苯基；

R^1 为H或（C_1-C_2）烷基，但当X和Z相互独立地为氢或卤原子且Y为卤原子时，R^1 为H；

R^2 为H，或与R和R^1 一起形成稠合苯环；

X为H、Cl、Br、CN或F；

Y为H、Cl、Br、F、I、CH_3、SCH_3、硝基或

OCH_3；

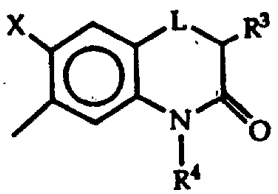
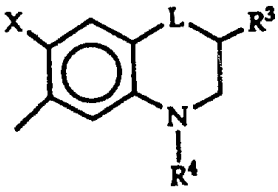
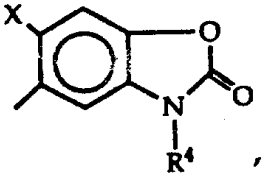
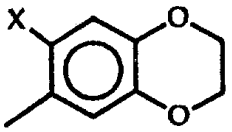
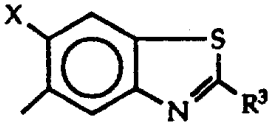
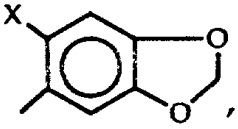
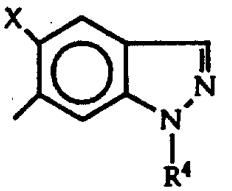
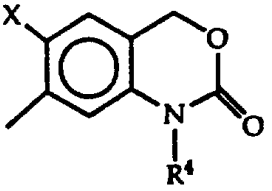
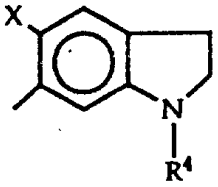
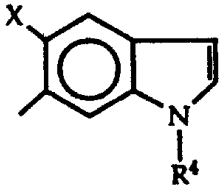
但当Y为氢时，R为三氟甲基，R^1 和R^2 为氢且Z不是氢；

T为H或F；

Z为H、OH、卤原子、CN、SH、（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）卤代烷基、-OSO_2（C_1-C_6）烷基、-OSO_2苯基、羧基、甲酰基、苯氧羰基、（C_1-C_6）烷氧基、（C_3-C_6）链烯氧基、（C_3-C_6）链炔氧基、氰基（C_1-C_6）烷氧基、苯基（C_1-C_6）烷氧基、（C_1-C_6）烷硫基、（C_1-C_6）烷酰氧基、（C_1-C_6）烷酰硫基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_4）烷硫基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_4）烷氧基、（C_1-C_6）烷氧羰基[（C_1-C_6）烷氧基]（C_1-C_6）烷氧基、（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷氧基、（苯硫基）（C_1-C_6）烷氧基、羧基（C_1-C_6）烷氧基、杂环氧基、杂环（C_1-C_6）烷氧基、（C_1-C_6）烷基羰基、（C_1-C_6）烷氧羰基、[（C_1-C_6）烷硫基]羰基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷氧羰基、（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷氧羰基、氰基（C_1-C_6）烷氧羰基、（C_3-C_6）链烯氧基羰基、（C_3-C_6）链炔氧基羰基、卤代（C_3-C_6）链炔氧羰基、（C_3-C_6）环烷氧羰基、杂环羰基、杂环氧羰基、三（C_1-C_6）烷基甲硅烷基（C_1-C_6）烷氧基羰基、二（C_1-C_6）烷氧膦酰（C_1-C_6）烷氧羰基、二（C_1-C_6）烷基亚氨基氧羰基、一（C_1-C_6）烷基氨基羰基、一（C_3-C_6）链炔氨基羰基、苯基氨基羰基、一（C_1-C_6）烷氧基氨基羰基、（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷基、（C_3-C_6）链烯氧基（C_1-C_6）烷基、（C_3-C_6）链炔氧基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷酰氧基（C_1-C_6）

烷基、（C_1-C_6）烷硫基（C_1-C_6）烷基、苯氧基（C_1-C_6）烷基、苯硫基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷基醛肟基、（C_3-C_6）链烯醛肟基、（C_3-C_6）链炔醛肟基、苯基（C_1-C_6）烷基醛肟基、杂环基，一（C_1-C_6）烷酰氨基；或者

Z与Y一起形成5-或6-员杂环，该杂环与苯环结构稠合，形成具有下述结构的双环基团：


，

，

，

，

，

，

，

，

或


其中

L为氧或硫；

R^3 为氢或（C_1-C_3）烷基；且

R^4 为氢、（C_1-C_8）烷基、（C_3-C_6）链烯基、（C_3-C_6）链炔基、（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷基、（C_3-C_6）环烷基、（C_3-C_6）环烷基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷硫基（C_1-C_6）烷基、苯基（C_1-C_6）烷基、氰基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧羰基、杂环基、杂环基（C_1-C_6）烷基、二（C_1-C_6）烷氨基（C_1-C_6）烷基、二（C_1-C_6）烷氨基羰基（C_1-C_6）烷基或（C_1-C_6）烷酰基。

本发明的一类优选化合物是具有式（I）的醚戊二酰亚胺和硫醚戊二酰亚胺，式（I）中：

A为C=O或CH_2；

A^1 为C=O或CH_2；

D为CH，当X为H时，D为N；

Q为（CH_2）n（其中n为0或1）；

R为（C_1-C_4）烷基、（C_1-C_4）卤代烷基或苯基；

R^1 为H或（C_1-C_2）烷基；

R^2 为H，或与R和R^1 一起形成稠合苯环；

X为H、Cl、Br或F；

Y为H、Cl、Br、或CH_3；

T为H或F；且

Z为（C_1-C_6）烷氧基、（C_3-C_6）链烯氧基、（C_3-C_6）链炔氧基、苯基（C_1-C_6）烷氧基、（C_1-C_6）烷硫基、（C_1-C_6）烷酰氧基、（C_1-C_6）烷酰硫基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷硫基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_4）烷氧基、氰基（C_1-C_6）烷氧基、（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷氧基、（苯硫基）（C_1-C_6）烷氧基、羧基（C_1-C_6）烷氧基、杂环氧基、杂环（C_1-C_6）烷氧基、（C_3-C_6）环烷氧基、（C_3-C_6）环烷基（C_1-C_6）烷氧基或（C_1-C_6）烷氧羰基[（C_1-C_6）烷氧基]（C_1-C_6）烷氧基。

这些醚戊二酰亚胺和硫醚戊二酰亚胺中，优选的是具有式（I）且其中A和A^1为C=O、D为CH、Q为（CH_2）n（n为0）、R为CH_3、CHF_2或CF_3、R^1为H、R^2为H、X为Cl或F、Y为Br、F或Cl、T为H且Z为（C_1-C_6）烷氧基、（C_3-C_6）链烯氧基、（C_3-C_6）链炔氧基、（C_3-C_6）环烷氧基、（C_3-C_6）环烷基（C_1-C_6）烷氧基或（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷氧基的那些化合物。

更优选的是，当R为CF_3、R^1和R^2为氢、X为氟且Y为氯时，Z为烯丙氧基、异丙氧基、仲丁氧基、炔丙氧基、1-甲基炔丙氧基、环戊氧基、环丙甲氧基、3-四氢呋喃氧基或甲氧基甲氧基。

更优选的是，当R为CHF_2、R^1和R^2为氢、X为氟且Y为氯时，Z为炔丙氧基。

更优选的是，当R为CF_3、R^1和R^2为氢、X为氟且Y为溴时，Z为炔丙氧基。

本发明的第二类优选化合物是具有式（I）的酯戊二酰亚胺，式（I）中：

A为C= O或CH_2；

A^1 为C= O或CH_2；

D为CH，当X为H时，D为N；

Q为（CH_2）n（其中n 为0 或1）；

R为（C_1-C_4）烷基、（C_1-C_4）卤代烷基或苯基；

R^1 为H或（C_1-C_2）烷基；

R^2 为H，或与R和R^1 一起形成稠合苯环；

X为H、Cl、Br 或F；

Y为H、Cl、Br、F或CH_3；

T为H或F；

Z为羧基、甲酰基、（C_1-C_6）烷氧羰基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷氧羰基、氰基（C_1-C_6）烷氧羰基、（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷氧羰基、[（C_1-C_6）烷硫基]羰基、（C_1-C_6）烷羰基、（C_3-C_6）链烯氧羰基、卤代（C_3-C_6）链炔氧羰基、（C_3-C_6）链炔氧羰基、（C_3-C_6）环烷氧羰基、杂环氧羰基、三（C_1-C_6）烷基甲硅烷基（C_1-C_6）烷氧羰基、二（C_1-C_6）烷氧基膦酰基（C_1-C_6）烷氧羰基、二（C_1-C_6）烷基亚氨基氧羰基、一烷基氨基羰基、一（C_1-C_6）烷氧氨基羰基、一（C_3-C_6）链炔氨基羰基或苯基氨基羰基。

这些酯戊二酰亚胺中，优选的是具有式（I）且其中A和A^1为C= O、D为CH、Q为（CH_2）n（n 为0）、R为CH_3、CHF_2

或CF_3、R^1为H、R^2为H、X为Cl或F、Y为Br、F或Cl、T为H且Z为CO_2H、(C_1-C_6)烷氧羰基、(C_3-C_6)环烷氧羰基、(C_3-C_6)链烯氧羰基或(C_3-C_6)链炔氧羰基的那些化合物。

更优选的是，当R为CF_3、R^1和R^2为氢、X为氟且Y为氯时，Z为羰基、甲氧羰基、正丙氧羰基、异丙氧羰基、仲丁氧羰基、环丁氧羰基或乙氧羰基。

更优选的是，当R为CF_3、R^1和R^2为氢、X为氟且Y为溴时，Z为异丙氧羰基。

更优选的是，当R为CHF_2、R^1和R^2为氢、X为氟且Y为氯时，Z为异丙氧羰基。

更优选的是，当R为CH_3、R^1和R^2为氢、X为氟且Y为为氯时，Z为异丙氧羰基。

本发明的第三类优选化合物是具有式（I）的烷基戊二酰亚胺和醛肟基戊二酰亚胺，式（I）中：

A为C= O或CH_2；

A^1为C= O或CH_2；

D为CH，当X为H时，D为N；

Q为$(CH_2)_n$（其中n为0或1）；

R为(C_1-C_4)烷基、(C_1-C_4)卤代烷基或苯基；

R^1为H或(C_1-C_2)烷基；

R^2为H，或与R和R^1一起形成稠合苯环；

X为H、Cl、Br或F；

Y为H、Cl、Br、F或CH_3；

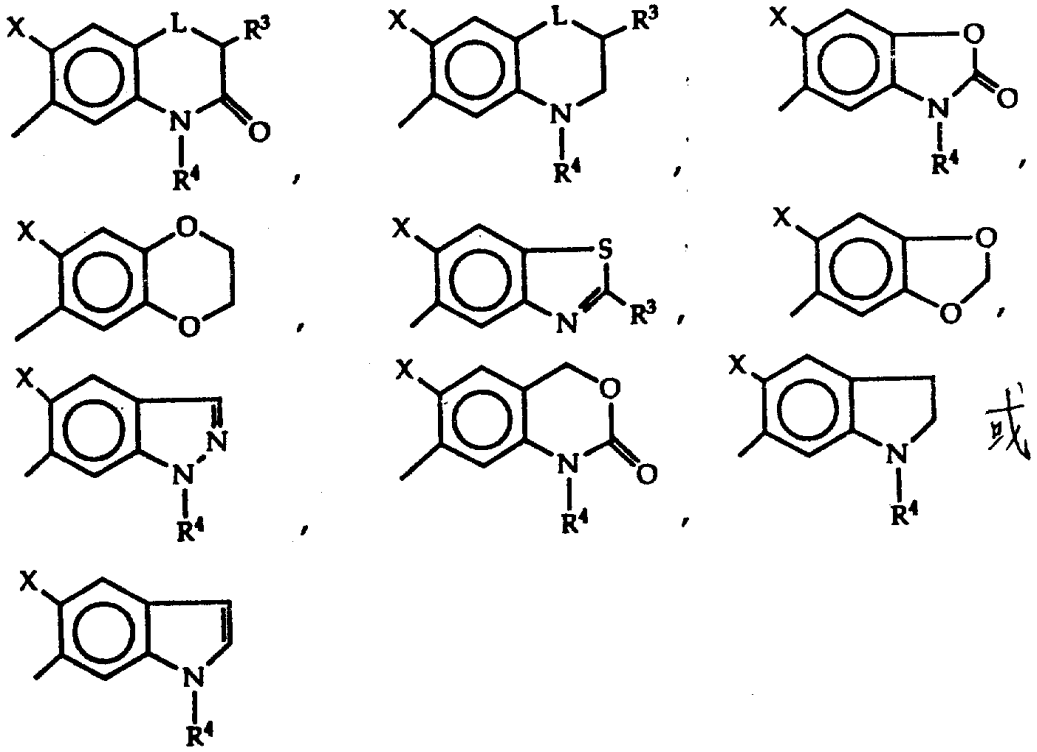
T为H或F；

Z为（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷基、（C_3-C_6）链烯氧基（C_1-C_6）烷基、（C_3-C_6）链炔氧基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷酰氧基（C_1-C_6）烷基、[（C_1-C_6）烷硫基]（C_1-C_6）烷基、苯氧基（C_1-C_6）烷基、苯硫基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷基醛肟基、（C_3-C_6）链烯醛肟基、（C_3-C_6）链炔醛肟基或苯基（C_1-C_6）烷基醛肟基。

这些烷基戊二酰亚胺和醛肟基戊二酰亚胺中，优选的是具有式（I）且其中A和A^1为C=O、D为CH、Q为$(CH_2)_n$（n为0）、R为CH_3、CHF_2或CF_3、R^1为H、R^2为H、X为Cl或F、Y为Br、F或Cl、T为H且Z为（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧甲基、（C_3-C_6）链烯氧甲基、（C_3-C_6）链炔氧甲基、（C_1-C_6）烷基醛肟基或（C_3-C_6）链炔醛肟基的那些化合物。

更优选的是，R为CF_3，R^1和R^2为氢，X为氟，Y为氯且Z为异丙氧甲基、1-甲基炔丙氧甲基、甲基醛肟基、异丙基醛肟基、炔丙基醛肟基或叔丁基醛肟基。

本发明的第四类优选化合物是具有式（I）的杂环戊二酰亚胺，式（I）中Z和Y形成具有下述结构的杂环：



其中

A和A′为C= O；

D为CH；

Q为（CH_2）n（其中n为0）；

L为O或S；

X为H或F；

R为（C_1-C_4）烷基、（C_1-C_4）卤代烷基或苯基；

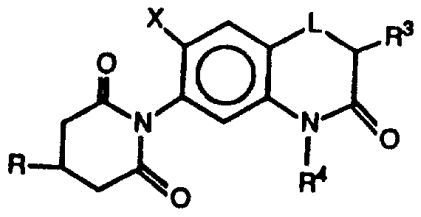
R′为H或（C_1-C_2）烷基；

R^2 为H，或与R和R^1 一起形成稠合苯环；

R^3 为H或（C_1-C_3）烷基；且

R^4 为氢、（C_1-C_8）烷基、（C_3-C_6） 链烯基、（C_3-C_6）链炔基、（C_1-C_6）烷氧基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷硫基（C_1-C_6）烷基、（C_3-C_6）环烷基、（C_3-C_6）环烷基（C_1-C_6）烷基、苯基（C_1-C_6）烷基、氰基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧羰基（C_1-C_6）烷基、杂环基、杂环（C_1-C_6）烷基、二（C_1-C_6）烷氨基（C_1-C_6）烷基、二（C_1-C_6）烷氨基羰基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧羰基或（C_1-C_6）烷酰基。

这类化合物中，优选的化合物是具有下式的化合物：



其中

L为O或S；

X为H或F；

R 为CH_3、CHF_2或CF_3；

R^3 为H或（C_1-C_3）烷基；且

R^4为氢、（C_1-C_6）烷基、（C_3-C_6）链烯基、卤代（C_3-C_6）链烯基、（C_3-C_6）链炔基、（C_3-C_6）环烷基、（C_3-C_6）环烷基（C_1-C_6）烷基、（C_1-C_6）烷氧甲基、（C_1-C_6）烷硫甲基、氰基（C_1-C_6）烷基、杂环基、杂环（C_1-C_6）烷基、二（C_1-C_6）烷氨基（C_1-C_6）烷基或二（C_1-C_6）烷基氨基羰基（C_1-C_6）烷基。

更优选的是，X为H或F，R为CH_3、CHF_2或CF_3，R^3为H、CH_3或CH_2CH_3，R^4为炔丙基、烯丙基、乙氧甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、1-乙基丙基、2-甲氧乙基、甲氧甲基、甲硫甲基、1-氰基乙基、1-甲基炔丙基、2-甲基烯丙基、氰基甲基、环丙甲基、环戊基、二甲氨基羰甲基、2-四氢呋喃甲基、3-四氢呋喃基、2-氯烯丙基或3,3-二氯烯丙基。

最优选的是，当R为CH_3、R^3为H、L为氧且R^4为炔丙基时，X为F。

最优选的是，当R为CF_3、R^3为CH_3、L为氧且R^4为炔丙基时，X为H或F。

最优选的是，当R为CF_3、R^3和X为H且L为氧时，R^4为炔丙基、正丙基、1-甲基炔丙基、烯丙基、仲丁基、甲氧甲基或2-甲氧乙基。

最优选的是，当R为CF_3、R^3为H、L为氧且X为F时，R^4为炔丙基、氰基甲基、烯丙基、甲氧甲基、乙氧甲基、正丙

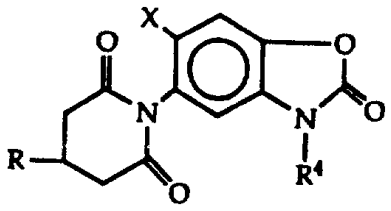
基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、1-氰乙基、2-甲基烯丙基、甲基硫甲基、2-乙基丙基、环丙甲基、环戊基、二甲氨基羰甲基、2-四氢呋喃甲基、3-四氢呋喃基、2-氯烯丙基、3,3-二氯烯丙基或乙基。

最优选的是，当R为CHF_2、R^3为H、L为氧且X为F时，R^4为烯丙基。

最优选的是，当R为CF_3、R^3为CH_2CH_3、L为氧且X为F时，R^4为炔丙基。

最优选的是，当R为CF_3、R^3为H、L为硫且X为F时，R^4为炔丙基。

这类化合物中，其它优选的化合物是具有下式的化合物：

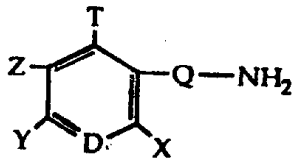


其中

R为CF_3或CH_3，X为H或F；R^4为（C_1-C_6）烷基。

最优选的是，R为CF_3，X为F，R^4为正丙基。

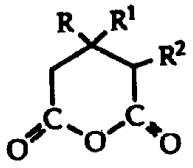
本发明的戊二酰亚胺可通过两步法制备，原料为具有下式的苯胺基或氨基化合物：



II

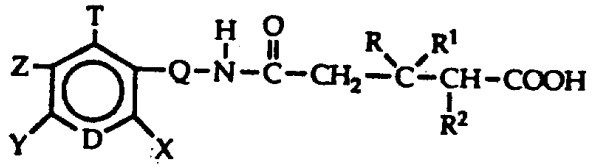
其中，D、T、X、Y、Z和Q的定义与式（I）中的相同。

式（II）化合物与大约等量的具有下式的适宜取代的戊二酐：



III

（其中，R、R^1和R^2的定义与式（I）中的相同）反应，得到具有下式的化合物：

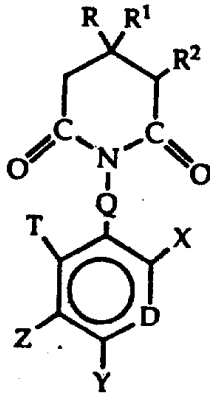


IV

该反应的适宜溶剂包括醚，如乙醚、四氢呋喃（ＴＨＦ）和甘醇二甲醚；烃，如甲苯；乙腈；Ｎ，Ｎ- 二烷基酰胺，如二甲基酰胺；以及卤代烃，如二氯甲烷和氯仿。为取得均化效果，还可使用溶剂混合物。该反应一般在大气压左右的压力下，于约-10 ℃至约100 ℃的温度下进行。优选的温度范围为约0 ℃至约70℃。

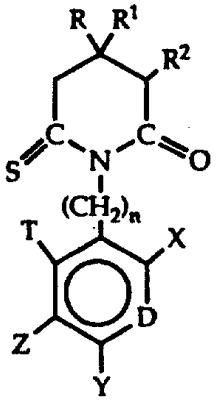
然后，在乙酐和乙酸钠或乙酰氯或乙酸乙酯的存在下，用亚硫酰氯和Ｎ，Ｎ- 二甲基甲酰胺将式（Ⅳ）化合物环化，得到所需的本发明的Ｎ- 取代戊二酰亚胺（式Ⅴ）。该反应一般在约-10 ℃至约250 ℃温度下进行。更优选的是，该反应在约30℃至约150 ℃的温度下进行。

举例来说，可通过采用硫羰基转化剂如Ｌawesson 试剂[2,4-双(4- 甲氧苯基)-1,3-二硫-2,4- 二磷丁环-2,4- 二硫化物] 或五硫化二磷，在六甲基磷酰胺或二甲苯的存在下，将具有式（Ⅴ）的Ｎ- 取代戊二酰亚胺：



V

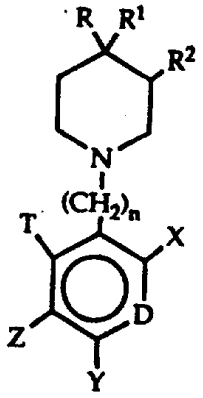
（其中Q不是氧）转化为本发明的硫代戊二酰亚胺（式Ⅵ）：



VI

该反应一般在约-10 ℃至约250 ℃的温度下进行，优选温度是约50℃至约150 ℃。

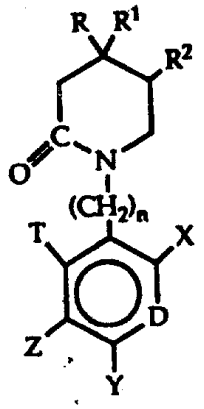
举例来说，可通过采用还原剂如氢化锂铝，将式（Ⅴ）的N-取代戊二酰亚胺（其中Q不是氧）还原为相应的本发明N- 取代哌啶（式Ⅶ）：



VII

该反应一般在非质子传递溶剂如乙醚或四氢呋喃中进行。该反应一般在约-20 ℃至约100 ℃的温度下进行。优选的温度为约0 ℃至约65℃。

可用式（Ⅳ）化合物（其中Q不是氧）经三步法制备本发明的哌啶酮（式Ⅷ）：



VIII

先将式（Ⅳ）戊酰胺酸还原为相似的5-羟基戊酰胺。例如，使用于溶剂（如四氢呋喃或乙醚）中的还原剂（如甲硼烷- 二甲硫配合物）。温度范围为约-20 ℃至约150 ℃，优选约0 ℃至约100 ℃。

例如，通过与亚硫酰氯于非质子传递溶剂如二氯甲烷中，在约－２０℃～约１５０℃（最好在约0℃～约１００℃）温度范围内反应，使５－羟基戊酰胺转化成相应的５－氯戊酰胺。

然后，例如，通过用碱如氢氧化钠，在非质子传递溶剂如四氢呋喃中，在约－２０℃～约１５０℃（最好在约0℃～１００℃）温度范围处理，使５－氯戊酰胺环化成式（ＶⅢ）哌啶酮。

在Z是取代的羰基的情况下，式（Ⅴ）羧酸（Z＝CO_2H，其中Q不是氧）可通过与氯化试剂如亚硫酰氯，在惰性溶剂（最好是烃如甲苯或氯仿）中，在－２０℃～２００℃（最好在约５０℃～约１００℃）温度范围内反应，转化成相应的酰氯（Z＝C（O）Cl）。然后将酰卤与适当的亲核试剂（例如醇、硫醇和胺）在适当的碱（最好是三乙胺或吡啶）存在下反应，生成相应的式（Ⅰ）化合物。反应在惰性有机溶剂（最好是在ＴＨＦ或二氯甲烷）中进行。

在Y和Z共同形成杂环的情况下，用本领域已知方法制备氨基取代的杂环，然后与上述戊二酸酐（Ⅲ）反应。此外，若杂环含有可被烷基化的部位，则可以在与戊二酸酐反应之后，进行烷基化反应，随后进行环化反应。

在Z是取代的烷氧基情况下，式（Ⅴ）酚（Z＝OH，其中Q不是氧）用非亲核碱如氢化钠处理，并与适当的烷基化试剂反应，生成相应的戊二酰亚胺。反应在惰性有机溶剂（如四氢呋喃或乙醚）中，在约－２０℃～约１５０℃（最好约0℃～约１００℃）温度范围内进行。

在Z是醛肟基的情况下，式（Ⅴ）苯甲醛（Z＝CHO，Q不是氧）与适当的烷氧基胺或烷氧基胺盐在极性有机溶剂如乙醇中，在约

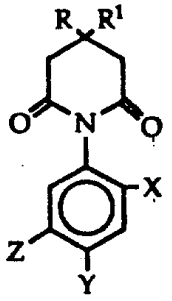
－２０℃～约１５０℃（最好在约0℃～约１００℃）温度范围内反应。若采用盐，则可向反应混合物中加入碱，如吡啶。

原料戊二酸酐按照本领域已知方法制备，例如见J．GOOtjes和W．Th．Nanto，Rec．Trav.Chem.,80, 1183（１９６５）。此外，将4，4，4—三氯巴豆酸乙酯和钠代丙二酸二乙酯在催化量的催化剂如溴化四丁铵存在下反应，生成2－（三氯甲基）丙三酸乙酯，后者与强碱如氢氧化钾，最好在约５０℃～约１５０℃温度范围内反应，然后酸化并脱去羧基，生成3－（三氯甲基）戊二酸。

原料苯胺基和氨基化合物可按已知方法制备，例如见 US４，４３９，２２９；４，４８４，９４０；４，４８４，９４１；４，５９４，０９９；和４，６４０，７０７以及PCT／EP８７／００２７９和PCT／us８７／００５６，上述文献在此列作参考。

以下实施例将进一步说明本发明，但绝非用以限制本发明。表I至Ⅳ列举了制得的N—取代的戊二酰亚胺的例子及其熔点。表Ⅴ给出了未提供熔点的化合物的H－NMR数据。在表Ⅴ之后叙述了化合物的具体制备例。

表　I



No.	R,R¹	X	Y	Z	m.p. (℃)
1.	CF_3,H	F	Cl	OCH_3	55-70
2.	CF_3,H	F	Cl	OCH_2CH_3	72-75
3.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2CH_2CH_3$	106-110
4.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2CH_2CH_2CH_3$	112-114
5.	CF_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	88-90
6.	CF_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)CH_2CH_3$	油
7.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2CH(CH_3)_2$	124-127
8.	CF_3,H	F	Cl	$OCOCH_3$	71-76
9.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2CH=CH_2$	80-83
10.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2C\equiv CH$	88-91
11.	CF_3,H	F	Cl	OCH_2CN	123.5-127
12.	CF_3,H	F	Cl	OCH_2OCH_3	油
13.	CF_3,H	F	Cl	$OSO_2C_6H_5$	214-215
17.	CF_3,H	F	Br	H	140-143

表 I（续）

No.	R,R¹	X	Y	Z	m.p. (°C)
18.	CF_3,H	F	F	H	108-113
19.	CF_3,H	F	Cl	OH	112-114
20.	CF_3,H	H	Cl	Cl	44-46
21.	CF_3,H	H	Br	CF_3	99-102
22.	CF_3,H	H	Br	H	163-164
23.	CF_3,H	H	CH_3	H	179-182
24.	CF_3,H	H	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	155-156
25.	CF_3,H	Cl	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	油
29.	CH_3,H	F	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	130-133
30.	CH_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	104-107
31.	CH_3,H	Cl	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	170-175
32.	CH_3,H	H	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	171-174
33.	CF_3,H	F	H	$CO_2CH(CH_3)_2$	146-148
34.	CH_3,H	F	Br	H	99-101
38.	CH_3,CH_3	F	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	101-102.5
39.	CF_3,H	CN	Cl	H	135-138
40.	CF_3,H	H	SCH_3	H	144-145.5
41.	CF_3,H	F	Cl	$SCH(CH_3)_2$	油
42.	CH_3,H	F	Cl	$OCOCH_3$	135-141
43.	CH_2CH_3,H	F	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	102-107
44.	CH_2CH_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	81-84
45.	CF_2CF_3,H	F	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	131-132
46.	CF_2CF_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	66-67.5
47.	$CH(CH_3)_2$,H	F	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	103-106
48.	$CH(CH_3)_2$,H	F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	油
49.	C_6H_5,H	F	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	188-190
50.	CF_3,H	F	Cl	$SCH_2CO_2CH(CH_3)_2$	油
51.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)_2$	96-98
52.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2SC_6H_5$	108-109.5

表 I（续）

No.	R,R¹	X	Y	Z	m.p. (°C)
53.	CF_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)CN$	175-177(分解)
54.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2CO_2CH_3$	90-91
55.	CF_3,H	F	Cl	$OCH(OCH_3)CO_2CH_3$	40.5-43
56.	CF_3,H	F	Cl	$SCH_2CO_2CH_3$	油
57.	CF_3,H	F	Cl	SCH_2CO_2H	137-139
58.	CF_3,H	F	Cl	SH	68-72
59.	CF_3,H	F	Cl	$SCOCH_3$	油
60.	CF_3,H	F	Cl	SCH_3	114-116
61.	CF_3,H	F	Cl	CO_2CH_3	172-174
62.	CF_3,H	F	Cl	CO_2H	220-225
63.	CH_2CH_3,H	H	Br	H	140-145
66.	CH_3,H	H	F	H	125-127
67.	CH_3,H	H	Cl	H	163-164
68.	CH_3,H	H	I	H	174-177
69.	CH_3,H	H	OCH_3	H	112-113
70.	CH_3,H	H	Cl	Cl	156-159
71.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2CH_3$	104-105
72.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2(CH_2)_2CH_3$	79-80
73.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2C_6H_5$	121-122.5
74.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)CO_2CH_3$	94-96
75.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2CH(CH_3)_2$	82-85
76.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2C{\equiv}CCH_3$	95-97
77.	CF_3,H	F	Cl	$CONHC_6H_5$	55-60
78.	CF_3,H	F	Cl	$CONHCH(CH_3)_2$	95-112
79.	CF_3,H	F	Cl	CH_2OCOCH_3	115-116.5
80.	CF_3,H	Cl	Cl	$CO_2CH(CH_3)_2$	油
81.	CF_3,H	F	Cl	CH_2OCH_3	86-88
82.	CF_3,H	F	Cl	$CH_2OCH(CH_3)_2$	77-79
83.	CF_3,H	F	Cl	$CH_2OCH_2C{\equiv}CH$	油

表 I（续）

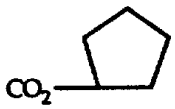
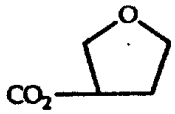
No.	R,R¹	X	Y	Z	m.p.(°C)
92.	CF_3,H	F	Cl	CH_3	119-120
93.	CF_3,H	F	Cl	$CH{=}NOCH_3$	150.5-152.5
94.	CF_3,H	F	Cl	CHO	146-148.5
95.	CF_3,H	F	Cl	$COCH_3$	127-129
99.	CF_3,H	H	H	$OCH_2C{\equiv}CH$	70.5-72
100.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2N{=}C(CH_3)_2$	144-145
101.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2PO(OC_2H_5)_2$	油
102	CF_3,H	F	Cl	$COSC_2H_5$	102-104
103.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2CO_2C_2H_5$	139-140
104.	CF_3,H	F	Cl	$COSCH(CH_3)_2$	102-105
106.	CF_3,H	F	Cl	$CH_2SCH(CH_3)_2$	107-109
107.	CF_3,H	F	Cl	$CH_2SC_2H_5$	oil
108.	CF_3,H	F	Cl	$CH_2OC_6H_5$	120-122
109.	CF_3,H	F	Cl	$CH_2SC_6H_5$	oil
110.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2C{\equiv}CH$	120-123
111.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)C{\equiv}CH$	45-50
112.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2CH_2C{\equiv}CH$	油
113.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)CN$	油
114.	CF_3,H	F	Cl	$CONHOCH_3$	158-162
115.	CF_3,H	F	Cl	$CH_2OCH(CH_3)CO_2C_2H_5$	油
116.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2CH_2OCH_3$	油
117.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)CH_2OCH_3$	油
118.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)CH_2CH_3$	油
127.	CF_3,H	F	Cl		77-78
130.	CF_3,H	F	Cl		52-55
133.	CF_3,H	F	Cl	$CONHC(CH_3)_2C{\equiv}CH$	166-170

表 I（续）

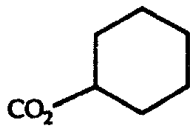
No.	R,R¹	X	Y	Z	m.p. (°C)
135.	CF_3,H	F	Cl		油
140.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2CH_2C{\equiv}CH$	89-91
141.	CF_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)C{\equiv}CH$	102-104
144.	CF_3,H	F	Cl	$CH_2OCH(CH_3)C{\equiv}CH$	油
148.	CF_3,H	F	OCH_3	$NHCOCH_3$	155-157
150.	CF_3,H	F	Cl	$CH{=}NOCH_2CH{=}CH_2$	油
152.	CF_3,H	F	CN	H	154-155
156.	CF_3,H	F	Cl	$CH{=}NOCH_2C_6H_5$	187-188
158.	CF_3,H	F	Cl	$CH{=}NOC_2H_5$	111.5-113.5
159.	CF_3,H	F	Cl	CH=NOH	75-80(升华)
160.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2CH_2OCH_3$	95-97
161.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2C_6H_5$	206-208
162.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2Si(CH_3)_3$	95-98
163.	CF_3,H	F	Cl		53-55
164.	CF_3,H	F	Cl	$CONHCH_2C{\equiv}CH$	63-65
168.	CF_3,H	F	Cl	$CH{=}NOC(CH_3)_3$	140-141.5
169.	CF_3,H	F	Cl	CN	210-212
172.	CF_3,H	F	Cl	$C(CH_3){=}NOCH_3$	130-135
173.	CF_3,H	F	Cl	$C(CH_3){=}NOH$	178-179.5
174.	CF_3,H	F	Cl	$C(CH_3){=}NOCH_2CH_3$	106-109
175.	CF_3,H	F	Cl	$C(CH_3){=}NOC(CH_3)_3$	132-134
176.	CF_3,H	F	Cl	$C(CH_3){=}NOCH_2CH{=}CH_2$	95.5-98
177.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2^- NH_3CH(CH_3)_2^+$	168-173（分解）
178.	CF_3,H	F	Cl	$C(CH_3){=}NOCH_2C_6H_5$	92-97
180.	CF_3,H	H	OCF_3	H	113-116
183.	CF_3,H	H	Cl	$N(CH_3)C(=O)CH_3$	203-204

表 I（续）

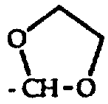
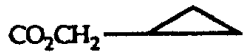
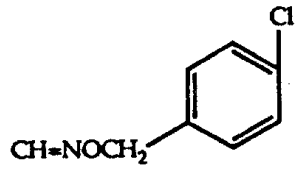
No.	R,Rl	X	Y	Z	m.p.(°C)
185.	CF_3,H	H	NO_2	H	133-134
186.	CF_3,H	F	Cl	$CH{=}NOCH(CH_3)_2$	140-141.5
187.	CF_3,H	F	Cl	$CH{=}NOCH_2C{\equiv}CH$	57-61
190.	CF_3,H	F	Cl	$OSO_2CH_2CH_3$	41-44
191.	CF_3,H	H	CF_3	H	143-144
192.	CF_3,H	F	Cl		63-65.5
193.	CF_3,H	F	Cl		157-159
194.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2C_6H_5$	50-55
195.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2CH{=}CH_2$	107-108
196.	CF_3,H	F	Cl		91-92
197.	CF_3,H	F	Cl		188-90
199.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH_2C{=}Cl$	55-60
201.	CH_3,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)_2$	101-103
202.	CF_3,H	F	Cl	$SO_2CH_2CH(CH_3)_2$	48-51
203.	CF_3,H	F	Cl	$SCH_2CH(CH_3)_2$	71-74
205.	CF_3,H	F	Cl		137.5-140
206.	CF_3,H	F	Br	$CO_2CH(CH_3)_2$	98-99
207.	CF_3,H	H	Cl	$CO_2CH(CH_3)_2$	113-115
209.	CF_3,H	F	F	F	97-99
212.	CF_3,H	F	F	$OCH_2C{\equiv}CH$	67-68
213.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2^-K^+$	133-143
214.	CF_3,H	H	CH_3	Cl	148-149.5

表 I（续）

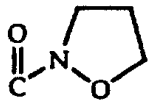
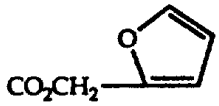
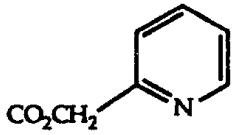
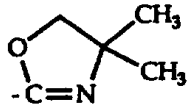
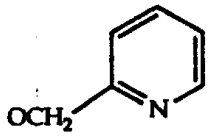
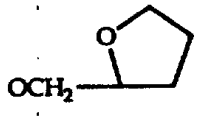
No.	R,R¹	X	Y	Z	m.p. (°C)
215.	CF_3,H	F	Cl		175-178
216.	CF_3,H	F	Cl		125-128
218.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2N{=}CHCH(CH_3)_2$	110-117
219.	CF_3,H	F	Cl		105-107
220.	CF_3,H	F	Cl		油
221.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2N{=}C(CH_3)OCH_2CH_3$	油
222.	CF_3,H	F	Cl	NO_2	164-167
223.	CF_3,H	F	F	$CO_2CH(CH_3)_2$	127-129
224.	CF_3,H	F	Br	$OCH_2C{\equiv}CH$	105-107.5
225.	CF_3,H	F	Cl	$N(COCH_3)_2$	164-169
227.	CF_3,H	F	Cl		165-173
228.	CF_3,H	F	CF_3	$CO_2CH(CH_3)_2$	89-92
229.	CF_3,H	F	OCH_3	OCH_3	55-60
231.	CF_3,H	F	Cl		152-153
232.	CF_3,H	F	Cl		84-86

表 I（续）

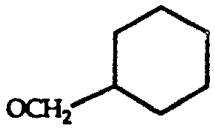
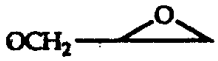
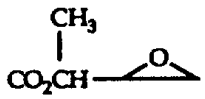
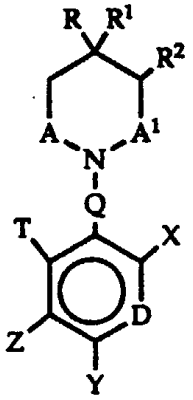
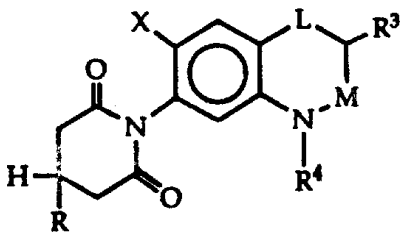
No.	R,R¹	X	Y	Z	m.p. (°C)
234.	CF_3,H	F	Cl		144-147
236.	CF_3,H	F	Cl	OSO_2CH_3	96-99
237.	CHF_2,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)_2$	油
240.	CF_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)CH=CH_2$	油
241.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2C(Cl)=CH_2$	103-106
242.	CF_3,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)CH=CH_2$	79-81
243.	CF_2H,H	F	Cl	$OCH_2C\equiv CH$	110-111.5
244.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2CH=C(Cl)_2$	106-108
245.	CF_3,H	F	Cl		121-123.3
246.	CF_3,H	F	Cl	$S(O)CH_2CH(CH_3)_2$	133-134
247.	CH_2F,H	F	Cl	$CO_2CH(CH_3)_2$	
248.	CH_2F,H	F	Cl	$OCH_2C\equiv CH$	
264.	CF_3,H	F	Cl	$NCH_2CH_2CH_3$	
265.	CF_3,H	F	OCH_3	$NCH_2CH_2CH_3$	
266.	CF_3,H	F	Cl	$NCH_2C\equiv CH$	
267.	CF_3,H	F	Cl	$NCH_2CH=CH_2$	
268.	CF_3,H	F	Cl		
269.	CF_3,H	F	Cl	$C(OCH_3)=NOCH_3$	
271.	CF_3,H	F	OCH_3	$CO_2CH(CH_3)_2$	
272.	CF_3,H	F	$OCHF_2$	$CO_2CH(CH_3)_2$	
273.	CF_3,H	F	OCF_3	$CO_2CH(CH_3)_2$	

表 II



No.	R,R¹	X	Y	Z	A	A¹	Q	T	D	m.p. (°C)
14.	CF_3,H	F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	CH_2	C=O	-	H	CH	98-102
15.	CF_3,H	F	Cl	$OCH_2C{\equiv}CH$	CH_2	CH_2	-	H	CH	油
16.	CF_3,H	F	F	H	C=O	C=O	-	F	CH	94-97
26.	CF_3,H	H	Cl	H	C=O	C=O	-	H	N	119-121
27.	CF_3,H	F	Cl	H	C=O	C=O	CH_2	H	CH	113-115
28.	CF_3,H	H	Cl	H	C=O	C=O	CH_2	H	CH	114-119
35.	CH_3,H	H	Cl	H	C=O	C=O	-	H	N	154
36.	CH_3,H	H	F	H	C=S	C=O	-	H	CH	84.5-87.5
37.	CH_3,H	H	F	CN	C=O	C=O	-	F	CH	92-94
64.	CF_3,H	H	Cl	H	C=O	C=O	O	H	CH	148-152
65.	CF_3,H	H	NO_2	CO_2CH_3	C=O	C=O	O	H	CH	152-155
132.	CF_3,H	F	Cl	H	C=O	C=O	-	F	CH	134-135

表 III



No.	X	L	M	R	R^3	R^4	m.p.(℃)
84.	H	O	C=O	CF_3	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	100-102
85.	H	O	C=O	CF_3	H	$CH_2C{\equiv}CH$	203-204.5
88.	F	O	C=O	CF_3	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	147-148
89.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2C{\equiv}CH$	182-183
96.	F	O	C=O	CF_3	H	CH_2CN	126-128
97.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH{=}CH_2$	126-128
98.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2OCH_2CH_3$	151-152
105.	H	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH_2CH_3$	170-171
121.	F	O	C=O	CF_3	H	CH_2SCH_3	油
122.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH_2CH_3$	油
124.	H	S	C=O	CF_3	H	$CH_2C{\equiv}CH$	165-168
126.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2C_6H_5$	212-216
128.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	180-181
129.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	108-109
131.	F	O	C=O	CF_3	H	CH_3	170-173
134.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2(CH_2)_6CH_3$	91-94
136.	H	O	CH2	CF_3	H	$CH_2CH_2CH_3$	68-71
137.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CO_2CH(CH_3)_2$	164-166
138.	F	O	C=O	CF_3	H	H	油
139.	F	O	C=O	CF_3	H	$COCH_3$	油
142.	F	O	C=O	CF_3	H	CO_2CH_3	油

表 Ⅲ（续）

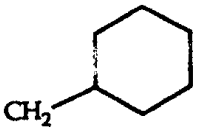
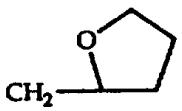
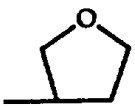
No.	X	L	M	R	R^3	R^4	m.p.(°C)
143.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH(CH_3)_2$	油
145.	F	O	C=O	CH_3	H	$CH_2C{\equiv}CH$	192-194
146.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH(CH_2CH_3)_2$	油
147.	H	O	C=O	CF_3	H	$CH(CH_3)C{\equiv}CH$	68-70
149.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH(CH_3)CN$	油
151.	H	O	C=O	CF_3	H	CH_2OCH_3	138-140
154.	H	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH{=}CH_2$	144-146
155.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2C(CH_3){=}CH_2$	200-202
157.	H	O	C=O	CF_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	115-118
165.	F	O	C=O	CF_3	H	CH_2CH_3	148-150
166.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	165-167
167.	H	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH_2OCH_3$	143-146
171.	H	O	C=O	CH_3	H	$CH_2C{\equiv}CH$	200-204
179.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH_2CH_2Cl$	138-140
182.	F	O	C=O	CF_3	H		146-148
184.	F	S	C=O	CF_3	H	$CH_2CH{=}CH_2$	148-150
188.	F	O	C=O	CF_3	H	CH_2OCH_3	175-176
189.	F	O	C=O	CF_3	H		油
200.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CON(CH_3)_2$	>200
204.	F	O	C=O	CF_3	H		180-181
208.	F	O	C=O	CF_3	H		发泡
210.	F	O	C=O	CF_3	H		〃
211.	H	O	C=O	CF_3	H	$CH(CH_3)_2$	153-155

表 Ⅲ（续）

No.	X	L	M	R	R^3	R^4	m.p.(°C)
217.	H	O	C=O	CF_3	H	CH_2CH_2Cl	109-110
226.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH_2N(CH_3)_2$	122-124
230.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2C(Cl)=CH_2$	178-180
233.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH=CCl_2$	173-175
235.	F	O	C=O	CF_3	CH_2CH_3	$CH_2C\equiv CH$	发泡
238.	F	O	C=O	CF_2H	H	$CH_2C\equiv CH$	>200
239.	F	O	C=O	CF_3	H		发泡
249.	F	O	C=O	CFH_2	H	$CH_2C\equiv CH$	
250.	H	O	C=O	CFH_2	H	$CH_2C\equiv CH$	
251.	H	O	C=O	CF_2H	H	$CH_2C\equiv CH$	
252.	F	O	C=O	CF_2H	H	$CH_2CH=CH_2$	
253.	F	O	C=O	CF_2H	H	$CH(CH_3)_2$	
254.	F	O	C=O	CF_2H	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	
255.	F	O	C=O	CF_2H	H	CH_2OCH_3	
256.	F	O	C=O	CFH_2	H	CH_2OCH_3	
257.	F	O	C=O	CFH_2	H	$CH(CH_3)_2$	
258.	F	O	C=O	CFH_2	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	
259.	F	O	C=O	CFH_2	H	$CH_2CH=CH_2$	
260.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2C(=O)CH_3$	
261.	F	O	C=O	CF_3	H	$CH_2CH(OH)CH_3$	

表 IV

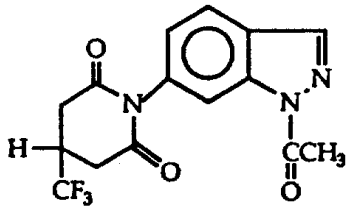
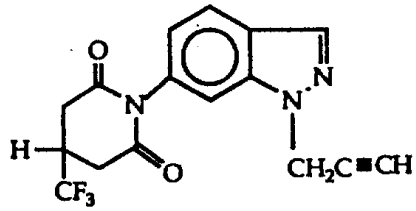
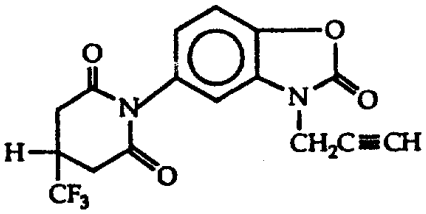
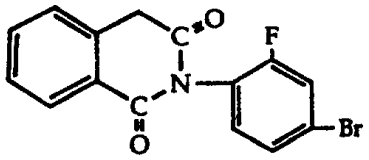
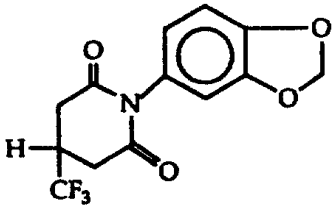
No.		m.p.(°C)
86.		178-179
87.		197.5-199
90.		152-155
91.		132-137
119.		165

表 Ⅳ（续）

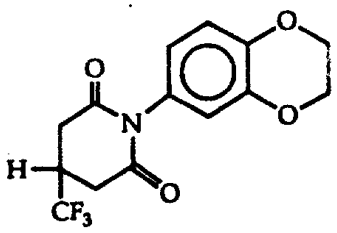
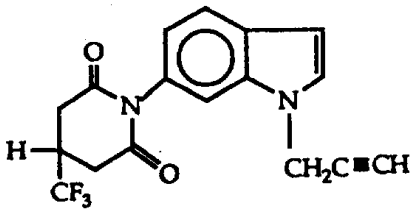
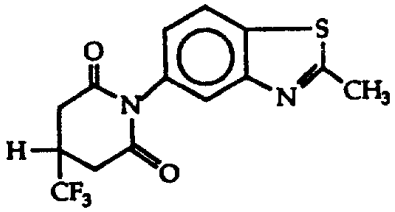
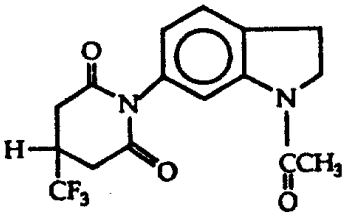
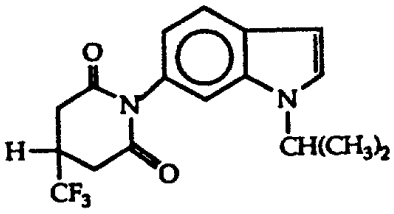
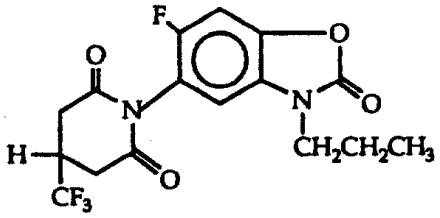
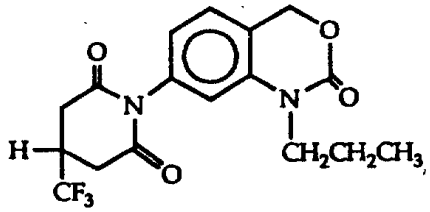
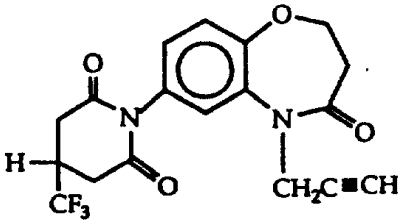
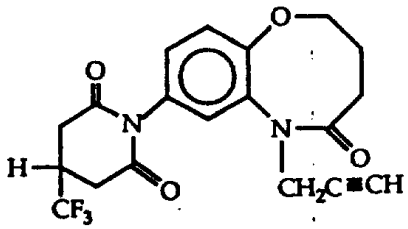
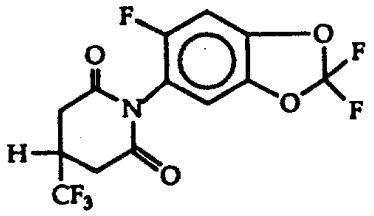
No.		m.p.(°C)
120.		177-178
123.		195
125.		185-186
153.		222-223
170.		95.5-98

表 Ⅳ（续）

No.		m.p.(°C)
181.		148-152
198.		158-160
262.		
263.		
270.		

275.

285-287

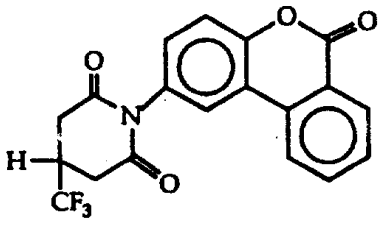


表 V NMR数据

实施例号	溶剂	（200MHz，δ位移以ppm表示，以四甲基一甲硅烷（TMS）作内标）
6.	$CDCl_3$	1.0(t,3H), 1.3(d,3H), 1.6-1.9(m,2H), 2.8-3.2(m,5H), 4.1-4.3(m,1H), 6.7(dd,1H), 7.3(dd,1H)
12.	$CDCl_3$	3.0(m,4H), 3.5(s,3H), 3.5(m,1H), 5.2(s,2H), 7.0(d,1H), 7.3(d,1H)
15.	$CDCl_3$	1.8(m,4H), 2.2(m,1H), 2.6(m,1H), 2.7(t,2H), 3.5(d,2H), 4.7(s,2H), 6.7(d,1H), 7.1(d,1H)
25.	$CDCl_3$	2.6(t,1H), 2.9-3.3(m,5H), 4.9(d,2H), 6.9(m,1H), 7.6(m,1H)
41.	d_6 —丙酮	1.3(d,6H), 3.1(m,4H), 3.4(m,1H), 4.0(m,1H), 7.4(t,1H), 7.5(d,1H)
48.	"	1.0(d,6H), 1.4(d,6H), 1.7(m,1H), 2.5-3.0(m,4H), 4.1(m,1H), 4.6(m,1H), 7.1(m,1H), 7.4(m,1H)

表 V（续）

实施例号	溶剂	（200MHz，δ位移以ppm表示，以四甲基甲硅烷（TMS）作内标）
50.	d_6 —丙酮	1.2(d,6H), 3.1(m,4H), 3.5(m,1H), 3.8(d,2H), 4.9(m,1H), 7.4(dd,1H), 7.5(d,1H)
56.	〃	3.2(m,4H), 3.7(s,3H), 3.6(m,1H), 3.8(d,2H), 7.5(dd,1H), 7.6(d,1H)
59.	〃	2.5(s,3H), 3.2(m,4H), 3.6(m,1H), 7.5(t,1H), 7.6(d,1H)
80.	$CDCl_3$	1.33(d,6H), 2.80-3.23(m,5H), 5.25(heptet, lH), 7.65(m,2H)
83.	$CDCl_3$	2.5(s,1H), 2.8-3.2(m,5H), 4.25(d,2H), 4.65(s,2H), 7.2-7.4(m,2H)
101.	d_6-DMSO	1.3(t,6H), 2.9-3.2(m,4H), 3.6(m,1H), 4.1 (quintet,4H), 4.7(d,2H), 7.8-8.0(m,2H)
107.	$CDCl_3$	1.2-1.3(t,3H), 2.5(q,2H), 2.9-3.3(m,5H), 3.8(s,2H), 7.25(d,1H), 7.30(d,1H)
109.	$CDCl_3$	2.8-3.2(m,5H), 4.1(s,2H), 6.9-7.1(q,1H), 7.2-7.4(m,6H)
112.	$CDCl_3$	2.02(s,1H), 2.64(td,2H), 2.82-3.28(m,5H), 4.39(t,2H), 7.36(d,1H), 7.80(dd,1H)
113.	d_6-DMSO	1.70(d,3H), 2.96-3.19(m,5H), 5.78(m,1H), 7.86-8.08(m,2H)
115.	$CDCl_3$	1.3(t,3H), 1.4-1.5(d,3H), 2.8-3.2(m,5H), 4.1-4.2(q,1H), 4.2-4.3(q,2H), 4.55(d,1H), 4.75(d,1H), 7.2-7.3(d,1H), 7.3-7.4(d,1H)

表 V（续）

实施例号	溶剂	（200MHz，δ位移以ppm表示，以四甲基甲硅烷（TMS）作内标）
116.	$CDCl_3$	2.8-3.2(m,5H), 3.37(s,3H), 3.72(m,2H), 4.45(t,2H), 7.35(d,1H), 7.78(d,1H)
117.	$CDCl_3$	1.35(d,3H), 2.86-3.22(m,5H), 3.38(s,3H), 3.55(m,2H), 5.35(m,1H), 7.35(d,1H), 7.73(d,1H)
118.	$CDCl_3$	0.92(t,3H), 1.35(d,3H), 1.70(heptet,2H), 2.85-3.25(m,5H), 5.10(sextet,1H), 7.35(d,1H), 7.7(dd,1H)
121.	d_6 —丙酮	2.2(s,3H), 3.1(m,4H), 3.5(m,1H), 4.8(s,2H), 5.1(d,2H), 6.9(d,1H), 7.1(t,1H)
122.	"	0.9(t,3H), 1.7(m,2H), 3.1(m,4H), 3.5(m,1H) 3.9(m,2H), 4.7(s,2H), 7.0(d,1H), 7.1(d,1H)
135.	$CDCl_3$	1.65-2.00(m,2H), 2.20(m,2H), 2.45(m,2H), 2.85-3.25(m,5H), 5.20(quintet,1H), 7.30(d,1H), 7.75(d,1H)
138.	d_6 —丙酮	3.1(m,4H), 3.5(m,1H), 4.7(s,2H), 6.8(d,1H), 6.9(d,1H), 9.8(bs*,1H)
139.	"	2.6(s,3H), 3.2(bm**,4H), 3.6(m,1H), 4.9(s,2H), 7.1(d,1H), 7.7(d,1H)
142.	"	3.1(bm,4H), 3.6(m,1H), 4.0(s,3H), 4.8(s,2H), 7.0(d,1H), 7.4(d,1H)
143.	"	1.5(d,6H), 3.1(m,4H), 3.5(m,1H), 4 .6(s,2H), 4.7(m,1H), 6.9(d,1H), 7.2(d,1H)

表 V（续）

实施例号	溶剂	（200MHz，δ位移以ppm表示，以四甲基甲硅烷（TMS）作内标）
144.	$CDCl_3$	1.55(d,3H), 2.5(d,1H), 2.8-3.3(m,5H), 4.3(m,1H), 4.55(d,1H), 4.80(d,1H), 7.2(d,1H), 7.35(d,1H)
146.	d_6 —丙酮	0.9(d,6H), 1.8(m,4H), 3.0(m,4H), 3.5(m,1H), 4.5(bm,1H), 4.7(s,2H), 6.9(d,1H), 7.2(d,1H)
149.	d_6-DMSO	0.9(d,3H), 3.2(m,4H), 3.6(m,1H), 4.8(s,2H), 6.0(quintet,1H), 7.1(d,1H), 7.3(d,1H)
150.	$CDCl_3$	2.75-3.25(m,5H), 4.6(d,2H), 5.3(t,2H), 6.0-6.1(m,1H), 7.2(t,1H), 7.7(dd,1H), 8.4(s,1H)
189.	d_6 —丙酮	2.1(m,4H), 2.3(m,4H), 3.2(m,4H), 3.5(m,1H), 4.6(s,2H), 4.7(m,1H), 7.0(d,1H), 7.4(d,1H)
208.	〃	1.8(m,1H), 1.9(m,3H), 3.1(m,4H), 3.5(m,1H), 3.8(m,2H), 4.2(m,3H), 4.7(s,2H), 6.9(d,1H), 7.2(d,1H)
210.	〃	2.2(m,2H), 3.1(m,4H), 3.5(m,1H), 3.8(m,2H), 3.9(m,2H), 4.6(s,2H), 5.5(m,1H), 7.0(d,1H), 7.3(dd,1H)
220.	〃	3.0-3.4(m,4H), 3.55(m,1H), 5.45(s,2H), 7.35(dd,1H), 7.53(d,1H), 7.62(d,1H), 7.85(td,1H), 7.98(dd,1H), 8.59(d,1H)
221.	〃	1.34(t,3H), 2.13(s,3H), 3.0-3.3(m,4H), 3.55(m,1H), 4.22(q,2H), 7.65(d,1H), 7.90(dd,1H)

表 V（续）

实施例号	溶剂	（200MHz，δ位移以ppm表示，以四甲基甲硅烷（TMS）作内标）
235.	d_6 —丙酮	1.1(t,3H), 1.9(m,2H), 2.8(d,1H), 3.1(m,4H), 3.5(m,1H), 4.7(m,3H), 7.0(m,2H)
237.	"	1.5(d,6H), 2.9-3.2(m,5H), 5.2(heptet,1H), 6.2(tdd,1H), 7.5(dd,1H), 7.8(dd,1H)
239.	"	2.6(m,1H), 2.7(m,1H), 3.1(m,4H), 3.5(m,b,2H), 3.8(dt,1H), 4.3(dt,1H), 4.8(s,2H), 6.9(d,1H), 7.2(t,1H)
240.	$CDCl_3$	1.5(d,3H), 3.0(m,5H), 4.65 (t, 1H), 5.15(d,1H), 5.25(d,1H), 5.85(m,1H), 6.65(dd,1H), 7.25(d,1H)

*bs = 宽的单峰
**bm = 宽的多重峰

实例A：1－氯－2－氟－5－炔丙氧基苯胺的制备

向一漏斗、半器、度计夜漏00ml三颈圆底烧瓶中圆底烧瓶中加入氧基－2－氯－2－氯氟苯氟苯酚（1.0g，0.103ol）和二甲基亚砜（DMSO）（100Ml）。混合物在室温下搅拌并用10分钟滴加氢氧化钾（KOH）水溶液（7.0gKOH，88%w／w，1.01当量，溶于10ml水中）。加料过程中，观察到反应放热（25℃至40℃）。溶液搅拌1小时，然后滴加炔丙基溴溶液（80%，在甲苯中，12.7ml，1.10当量）。加料过程中，观察到反应放热（自25℃至40℃）。混合物在室温下搅拌过夜。

早晨，由薄层色谱法（TLC）（硅胶，1：1V／V已烷／乙酸乙酯（EtoAc））证明反应已完全。将混合物倾入冰水（600ml）中，过滤，水洗并于50℃通宵真空干燥，得到所需的炔丙氧基－N－乙酰苯胺，为褐色粉末（24.0g，96%，熔点142－5℃）。

向配有高架搅拌器、温度计和冷凝器的250ml三颈圆底烧瓶中加入炔丙氧基－N－乙酰苯胺（9.64g，40mmol）、乙醇（无水，43ml）、水（56ml）和浓盐酸（H 1）（35%，W／W，37.5ml）。在搅拌下，用加热夹套将混合物加热至回流。回流（92℃）1小时后，对碱化的试样进行薄层色谱分析（硅胶，3：1已烷／EtoAc，V／V），表明反应已完全。将混合物倾入冰水（200ml）中，并用50%氢氧化钠（NaoH）水溶液（25ml）将PH值调节至10．其间析出棕色固体。混合物用乙醚（3×100ml）萃取，合并的有机层用水洗（2×50ml

水，1×50ml盐水）．并于无水硫酸镁（$MgSO_4$）中干燥。过滤混合物；真空蒸发溶剂并于25℃干燥过夜，得到所需的苯胺，为棕色油状物。

实例B：3—（三氟甲基）戊二酸酐

向于5ml THF中的115mg（5mmol）金属钠（切割成细条并用已烷洗涤）中加入于10ml THF中的丙二酸二乙酯（800mg，5mmol）溶液。混合物在室温下搅拌，直至金属钠全部耗尽（2～3小时）。加入催化量的溴化四丁铵，随后加4，4，4—三氟巴豆酸乙酯（0．84g，5mmol）的THF溶液（10ml）。加热该混合物至40℃并搅拌17小时。冷至10℃后，加入冰醋酸（300mg，5mmol），并且真空除去THF。所得残余物用在10ml水中的87．3%KOH（1．28g，20mmol）处理并回流4．5小时。冷至10℃后，通过移液管滴加2．5ml（26mmol）浓HCl，并将混合物再加热至回流，直至停止释放CO_2（约1小时）。将溶液冷至15℃并用Et_2O（3×10ml）萃取。合并的有机相在Na_2SO_4中干燥，过滤并真空浓缩，得到3—（三氟甲基）戊二酸，为白色固体，产率95%（熔点100—100．5℃）。

向配有机械搅拌器和回流冷凝器的2升三颈烧瓶中加入320g（1．6mol）3—（三氟甲基）戊二酸和775ml乙酐。溶液回流2．5小时，然后冷却至室温。真空（80℃）除去大部分乙酐，得到的棕色固体溶于位于蒸汽浴之上的800ml $CHCl_3$中。随着加入200ml已烷，白色固体开始析出。在冷藏室中存放进一步诱发结晶。滤出白色絮凝物并在烘箱中干燥（50℃，30mmHg），得到261g（产率89%）所需产物，熔点88—91℃。

实例1

N—(4'—氯—2'—氟—5'—炔丙氧基苯基)—3—(三氟甲基)戊酰胺酸

向配有高架搅拌器、滴液漏斗、温度计和氮气(N_2)导管的1升三颈圆底烧瓶内加入3—(三氟甲基)戊二酸酐(18.2g，0.100mol)和二氯甲烷(CH_2Cl_2)(250ml)。混合物搅拌至均匀，然后滴加4—氯—2—氟—5—炔丙氧基苯胺(19.9g，0.100mol)在CH_2Cl_2(50ml)中的溶液，历时10分钟。得到澄清的溶液。混合物在室温下搅拌过夜，其间形成白色沉淀。

早晨，真空过滤反应混合物并用CH_2Cl_2略微洗涤，得到36.6g戊酰胺酸白色固体，(产率96%)，熔点140—2℃。

实例2：N—(4'—氯—2'—氟—5'—炔丙氧基苯基)—3—(三氟甲基)戊二酰亚胺(化合物10)

向配有磁力搅拌棒、冷凝器、温度计和氮气导入接管的500ml三颈圆底烧瓶加入N—(4'—氯—2'—氟—5'—炔丙氧基苯基)—3—(三氟甲基)戊酰胺酸(13.1g，0.034mol)、乙酐(150ml)和乙酸钠(0.45g)。通宵搅拌混合物并加热至95℃。在最高温度不超过50℃(1—5 mmH_g)下，采用短路蒸馏除去易挥发成分。将残余物溶于EtOAC(150ml)并且洗涤(1×100ml饱和碳酸氢钠($NaHCO_3$)水溶液，1×100ml水和1×100ml盐水)，干燥($MgSO_4$)和真空蒸发，得到棕色油状物，于50℃真空干燥，得到浅棕色固体(9.8g，产率79%，熔点80—82℃)。甲醇/水中重结晶，得到褐色戊二酰亚胺固体，熔点88—91℃。

采用实施例1和2所述的相同方法，制备表Ⅰ、Ⅱ和Ⅳ所述化合物1—9，11，16—18，20，21，23—28，33，39—41，50，51，56，57，59—62，64，65，71，72，79—83，86，92，94，95，99，106—109，115，119，120，125，132，144，152，160，180，185，191，192，203，206，207，209，212，214，223，224，228，229，241和275，不同的是苯胺基或氨基化合物(式ⅠⅠ)为：

4—氯—2—氟—5—甲氧基苯胺，4—氯—2—氟—5—乙氧基苯胺，4—氯—2—氟—5—正丙氧基苯胺，4—氯—2—氟—5—正丁氧基苯胺，4—氯—2—氟—5—异丙氧基苯胺，4—氯—2-氟—5—仲丁氧基苯胺，4—氯—2—氟—5—异丁氧基苯胺，4—氯—2—氟—5—羟基苯胺，4—氯—2—氟—5—烯丙氧基苯胺，4—氯—2—氟—5—氰基甲氧基苯胺，2，4，6—三氟苯胺，4—溴—2—氟苯胺，2，4—二氟苯胺，3，4—二氯苯胺，4—溴—3—(三氟甲基)苯胺，对甲苯胺，4—氯—3—炔丙氧基苯胺，2，4—二氯—5—炔丙氧基苯胺，5—氨基—2—氯吡啶，4—氯—2—氟苄基胺，4—氯苄基胺，2—氨基—5—氯苄腈，4—(甲硫基)苯胺，4—氯—2—氟—5—(异丙硫基)苯胺，4—氯—2—氟—5—〔(异丙氧基羰基)甲硫基〕苯胺，5—氨基—2—氯—4—氟苯甲酸异丙基酯，4—氯—2—氟—5—〔(甲氧羰基)甲硫基〕苯胺，4—氯—2—氟—5—〔(羧基)甲硫基〕苯胺，5—氨基—2—氯—4—氟苯硫酚，4—氯—2—氟—5—(甲硫基)苯胺，5—氨基—2—氯—4—氟苯甲酸

甲酯，5－氨基－2－氯－4－氟苯甲酸，4－氯苯氧基胺，3－甲氧基羰基－4－硝基苯氧基胺，5－氨基－2－氯－4－氟苯甲酸乙酯，5－氨基－2－氯－4－氟苯甲酸正丙基酯，4－氯－2－氟－5－(羟甲基)苯胺，5－氨基－2，4－二氯苯甲酸异丙基酯，4－氯－2－氟－5－(甲氧基甲基)苯胺，4－氯－2－氟－5－(异丙氧基)苯胺，4－氯－2－氟－5－(炔丙氧基甲基)苯胺，6－氨基吲唑，5－氨基－2－氯－4－氟甲苯，5－氨基－2－氯－4－氟苯甲醛，3－炔丙氧基苯胺，3，4－(亚甲二氧　基)苯胺，1，4－苯并二噁唑－6－胺，5－氨基－2－甲基苯并噻唑，4－氯－2－氟－5－(异丙硫基甲基)苯胺，4－氯－2－氟－5－(乙硫基甲基)苯胺，4－氯－2－氟－5－(苯氧基甲基)苯胺，4－氯－2－氟－5－(苯硫基甲基)苯胺，4－氯－2－氟－5－〔(1－乙氧基羰基)乙氧基甲基〕苯胺，4－氯－2－氟－5－〔(3－丁炔－2－氧基)甲基〕苯胺，4－氯－2－氟－5－(甲氧基乙氧基)苯胺，3－氨基－4－氟－苯甲酸异丙基酯，4－氯－2，6－二氟苯胺，4－氰基－2－氟苯胺，5－氨基－2－氯－4－氟乙酰酮，6－氨基－3，4－苯并香豆素，4－(三氯甲氧基)苯胺，4－硝基苯胺，4－(三氟甲基)苯胺，4－氯－5－环戊氧基－2－氟苯胺，4－氯－2－氟－5－(异丁硫基)苯胺，5－氨基－2－溴－4－氟苯甲酸异丙基酯，5－氨基－2－氯苯甲酸异丙基酯，2，4，5－三氟苯胺，2，4－二氟－5－炔丙氧基苯胺，3－氯－4－甲基苯胺，5－氨基－2，4－二氟苯甲酸异丙基酯，4－溴－2－氟－5－炔丙氧基苯胺，5－氨基－4－氟－2－(三氟甲基)苯甲酸异丙基酯，2－氟－4，5－二甲氧基苯胺或4－氯－5－(2－氯烯丙氧基)－2－氟苯胺。

此外，采用实施例1和2的方法制备表Ⅰ、Ⅱ和Ⅲ所述化合物30，35，38，43－49，91，201和237，不同的是合适的式（Ⅲ）戊二酸酐（即：3－甲基戊二酸酐，3－乙基戊二酸酐，3，3－二甲基戊二酸酐，3－（氟甲基）戊二酸酐，3－（二氟甲基）戊二酸酐，3－（五氟乙基）戊二酸酐，3－异丙基戊二酸酐，3－苯基戊二酸酐或高邻苯二酸）与如下的氨基化合物（式Ⅱ）反应：

4－氯－2－氟－5－异丙氧基苯胺，4－氯－2－氟－5－炔丙氧基苯胺，4－溴－2－氟苯胺，5－氨基－2－氯－4－氟苯甲酸异丙基酯或5－氨基－2－氯吡啶。

实例3：N－（4'－氯－2'－氟－5'－（甲氧基甲氧基）苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物12）

a．4－氯－2－氟－5－（甲氧基甲氧基）硝基苯

向1．12g（5．9mmol）2－氯－4－氟－5－硝基苯酚在100ml CH_2Cl_2 中的溶液中加入2ml二甲氧基甲烷，随后加7．48g（53mmol）五氧化二磷。反应物在室温下搅拌3小时，随后另加100ml CH_2Cl_2。将反应混合物倾在200ml冰上，并分离形成的液层。水相用 CH_2Cl_2 萃取一次（1×100ml），而合并的有机相用水洗涤（2×100ml），在 $MgSO_4$ 中干燥并浓缩，得到1．16g（产率95%）浅黄色固体4－氯－2－氟－5－（甲氧基甲氧基）硝基苯。

按实例13 C所述，采用铁和乙酸将硝基苯中间体转化成相应的苯胺。按实例1和2所述方法将苯胺转化成表Ⅰ中的化合物12。

实例4：N－（4'－氯－2'－氟－5'－苯磺酰氧基）苯基）－

3－（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物13）

用注射器向N－（4'－氯－2'－氟－5'－羟基苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺（1.649，5.05mmol，化合物19）在约20ml二氯甲烷中的溶液中加入约2.5当量自CaH_2中新蒸馏过的吡啶（1ml），然后在冰浴冷却下，向反应混合物中缓慢滴加苯磺酰氯（0.64ml，5.0mmol）在4.5ml二氯甲烷中的溶液。将反应混合物加热至室温并搅拌12小时。随后另加入0.179戊二酰亚胺并且使反应混合物在室温下另搅拌12小时。将反应混合物倾入50ml水中，分离液层。真空蒸发有机层，残余物在真空烘箱中干燥（20－50毛，50℃）。用约5ml二氯甲烷漂洗所得棕色固体并且抽吸过滤，得到1.9g（产率82%）所需产物，为灰白色粉末，熔点214－215℃。

按照与本实例所述相同的方法，用乙磺酰氯代替苯磺酰氯，制备化合物190。

实例5：N－（4'－氯－2'－氟－5'－异丙氧基苯基）－4－（三氟甲基）－2－哌啶酮（化合物14）

a. N－（4'－氯－2'－氟－5'－异丙氧基苯基）－5－羟基－3－（三氟甲基）戊酰胺

用注射器向N－（4'－氯－2'－氟－5'－异丙氧基苯基）－3－（三氟甲基）戊酰胺酸（4.32g，11.4mmol）在20ml四氢呋喃（自钠／二苯甲酮新蒸过）的溶液缓慢加入10M甲硼烷－二甲硫配合物（1.18ml）。利用冰浴将温度维持在10—20℃，出现明显的剧烈鼓泡。将混合物缓慢加热至室温并在氮气下搅拌150小时，于55℃加热6小时，然后冷却至室温并静

置16小时。将烧瓶在冰／水浴中冷却，然后通过漏斗缓慢加入7ml甲醇（MeOH）。反应混合物变得非常粘稠难以继续搅拌。使温度缓慢升至室温，使搅拌棒能够继续搅拌混合物。真空（20－50毛）除去MeOH和THF，残余物借助快速色谱分离（2"×7"柱，3：1已烷／乙酸乙酯，75ml馏分）。合并馏分18－45并真空除去溶剂。残余物于50℃真空干燥，得到1.669（产率39%）戊酰胺，为近无色油状物。

b. N－（4'－氯－2'－氟－5'－异丙氧基苯基）－5－氯－3－（三氟甲基）戊酰胺

用移液管向N－（4'－氯－2'－氟－5'－异丙氧基苯基）－5－羟基－3－（三氟甲基）戊酰胺（1.29，3.2mmol）在100ml二氯甲烷中的溶液，一次加入亚硫酰二氯（0.24ml）。溶液变为棕色。将其于40－50℃加热约7小时，室温下静置64小时，于40℃加热3小时，然后在室温下搅拌18小时。然后另加入亚硫酰二氯（0.1ml），加热至40℃并保持约4小时。将反应混合物冷却至室温并且真空除去溶剂。真空干燥残余物（50℃），所得金黄棕色半固体混合物借助快速色谱法（20ml馏分，2"×7"柱，1：9乙酸乙酯／已烷）提纯，得到棕色固体，熔点57—63℃。

c. N－（4'－氯－2'－氟－5'－异丙氧基苯基）－4－（三氟甲基）－2－哌啶酮

向1.49（3.6mmol）N－（4'－氯－2'－氟－5'－异丙氧基苯基）－5－氯－3－（三氟甲基）戊酰胺的四氢呋喃（16ml）溶液中加入16ml水和2ml50%NaOH（水溶液）。

将混合物加热至50℃并剧烈搅拌。6小时后使反应混合物冷却至室温，停止搅拌并除去水层。有机层在真空中蒸发，然后将残余物置于乙醚（50ml），用水（2×50ml）随后用盐水洗涤。最初的水层用50ml乙醚萃取，合并的有机层用盐水（50ml）洗涤并干燥（$MgSO_4$）。真空除去溶剂,得到1.3g棕色固体，自己烷中重结晶得到0.81g（产率64%）棕色固体，熔点98－102℃。

实例6：N－（4'－氯－2'－氟－5'－炔丙氧基苯基）－4－（三氟甲基）哌啶（化合物15）

向三颈圆底烧瓶中加入0.56g（15mmol）氢化锂铝和60ml四氢呋喃。将含有3.60g（10.0mmol）N－（4'－氯－2'－氟－5'－炔丙氧基苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺的套管装入索格利特萃取器并连接在反应容器上。将油浴加热至85℃并加入11mlTHF和25ml乙醚。6小时后，大部分的戊二酰亚胺被萃取到反应混合物中，在反应烧瓶中生成灰色固体妨碍了搅拌。将反应混合物冷却至室温。缓慢加入水（0.56ml），随后加15%NaOH（0.5ml）。然后另加水（1.68ml）以使锂盐沉淀。吸滤混合物，固体用乙醚漂洗。真空蒸发滤液，得到3.4克棕色油状物。借助色谱法（硅胶，3：1己烷／二氯甲烷）提纯油状物，得到100mg（产率3%）所需产物，为油状物。

实例7：N－（4'－氯－2'－氟－5'－羟基苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物19）

a. N－（4'－氯－2'－氟－5'－羟基苯基）－3－（三氟甲基）戊酰胺酸

向配有磁力搅拌棒、温度计、滴液漏斗、冷凝器和N_2导管的

1升三颈圆底烧瓶中加入4－氯－2－氟－5－羟基苯胺（25.7g，0.159mol）、水（24ml）、乙酸（8.4ml）和四氢呋喃（THF）（48ml）。将混合物搅拌至均匀后，加热至40℃并通过加料漏斗滴加3－（三氟甲基）戊二酸酐（34.8g，0.191mol）在THF（60ml）中的溶液，观察到反应放热3—4℃。将反应混合物于50℃加热3小时，然后冷却至室温。

将反应混合物倾在600ml冰上。待冰融化后，固体通过粗烧结玻璃板漏斗吸滤分离。固体用水彻底洗涤，并于50℃真空干燥，得到灰色的戊酰胺酸固体（51，91g，产率95%，熔点171—174℃）。

b. N－（4'－氯－2'－氟－5'－羟基苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺

向配有搅拌棒、N_2导管和橡胶隔片的250ml三颈圆底烧瓶中加入N－（4'－氯－2'－氟－5'－羟基苯基）－3－（三氟甲基）戊酰胺酸（9.51g，24mmol）和EtOAc（75ml）。将混合物搅拌至均匀并经注射器加入亚硫酰二氯（99+%，3.87ml，2当量），随后加入0.25当量无水N，N－二甲基甲酰胺。将反应物加热至80℃并保持6小时，然后在室温下静置过夜。

将反应混合物倾入125ml水中并用总共100ml EtOAc萃取两次。合并有机层，然后用100ml水洗两次并用50ml盐水洗一次。分离有机层，用$MgSO_4$干燥，减压下蒸发并真空干燥（20—50毛，50℃）。静置，残余物固化，得到8.6g（产率99%）深棕色戊二酰亚胺固体，熔点112—114℃

按照与该例的相同方法，采用苯胺基化合物（式Ⅱ）5－氨基－2－氯－4－氟苯硫酚，制备上表Ⅰ所述的化合物58。

实例8：N－（4'－溴苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物22）

向装有搅拌棒的50ml单口圆底烧瓶中，加入2.509（7.96mmol）N－（4'－溴苯基）－3－（三氟甲基）戊酰胺酸（如实施例1所述，自适当的苯胺和戊二酸酐制备）和乙酰氯（15ml）。加热混合物至回流并保持6小时，产生澄清、亮灰色溶液。利用一个短路蒸馏头通过常压蒸馏除去乙酰氯。所得亮灰色结晶固体用已烷研制，过滤并用已烷洗涤。得到灰白色结晶固体，于50℃真空干燥，得到2.109（产率89%）产物，熔点163－4℃。

按照该例所述相同方法，制备表Ⅰ和Ⅱ中所述的化合物29，34，37，42，63，66，68，69和70。

实例9：N－（4'－氟苯基）－3－甲硫基戊二酰亚胺（化合物36）

将盛于50ml圆底烧瓶中的由1.029（4.68mmol）N－（4'－氟苯基）－3－甲基戊二酰亚胺（化合物66）。0.889（2.2mmol）2，4－双（4－甲氧基苯基）－1，3－二硫－2，4－二磷丁环－2，4－二硫化物（称作劳伦森试剂）和6ml六甲基磷酰胺组成的混合物加热至95－100℃并保持21小时。另加入1.059（2.5mmol）劳伦森试剂并加热至100℃并另保持30小时。混合物冷却至室温并加入水（50ml）。混合物用乙醚萃取（4×50ml）。合并有机相，

在$MgSO_4$中干燥并真空除去溶剂。所得2g橙色油借助快速色谱法（硅胶，1：1已烷／二氯甲烷）纯化，得到300mg（产率28%）黄色油，固化成固体，熔点84.5—87.5℃。

实例10：　N—〔4'—氯—2'—氟—5'—〔（苯硫基）甲氧基〕—苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物52）

在N_2下，0.15g（3.7mmol，60%油悬浮液）氢化钠用戊烷洗涤（2×0.5ml），然后悬浮于2ml无水THF（自钠／二苯甲酮中新蒸过）中。向在冰浴中冷却的悬浮液中加入溶解于3.5ml无水THF（自钠／二苯甲酮新蒸过）中的1.1g（3.4mmol）N—（4'—氯—2'—氟—5'—羟基苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物19）并用两份1ml无水THF冲洗。然后使反应物温热至室温并搅拌15分钟。将烧瓶于冰浴中再次冷却，同时滴加氯甲基苯基硫醚（0.46ml，0.54g，3.4mmol）在3ml无水THF中的溶液。将反应混合物缓慢加热至室温并搅拌约24小时，然后加热至50℃并保持54小时。真空（2—10毛）蒸发THF并将反应混合物溶于12ml无水二甲基甲酰胺中。将反应加热至100℃并保持8小时，然后冷却至室温。反应混合物通过天然二氧化铝薄滤板吸滤并用30mlEtoAc洗涤。滤液在真空中蒸发，残余物在真空烘箱中干燥12小时（20—50毛，50℃）。真空蒸馏所得残余物（2—10毛，70℃）。残余物借助色谱法（硅胶，1：1已烷／二氯甲烷）纯化，得到所需产品，为白色固体，熔点108—109.5℃。

按照该例所用的方法，采用适当的取代的烷基卤化物（例如，制备化合物73时采用苄基氯）代替氯甲基苯基硫醚，制备表I中所述

的化合物53，54，55，73和76。

实例11：N—（4'—氯苯基）—3—甲基戊二酰亚胺（化合物67）

在装有搅拌棒的500ml单口圆底烧瓶中，将3—甲基戊二酸酐（6.41g，0.05mol）、对氯苯胺（6.399g，0.05mol）和四氢呋喃（50ml）混合。将混合物搅拌至均匀，反应有延迟（5分钟）的温和放热。将浅黄色溶液放置过夜。

真空蒸发混合物，然后真空（约2—10毛）加热干燥，得到褐色固体。固体在真空烘箱中干燥过夜，得到褐色的N—（4'—氯苯基）—3—甲基—戊酰胺酸固体（12.72g，99.4%），熔点116—118。

按实例8所述方法处理戊酰胺酸，得到N—（4'—氯苯基）—3—甲基戊二酰亚胺（产率96%），熔点163—164℃。

按该例所用方法，还制备了表I所述的化合物31和32。

实例12：N—〔5'—（2—甲基丙氧基羰基）—4'—氯—2'—氟苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物75）

a．N-(5'-氯羰基-4'-氯-2'-氟苯基)-3-(三氟甲基)戊二酰亚胺

向N—（5'—羧基—4'—氯—2'—氟苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物62）（3.0g，8.5mmol）和35ml甲苯的混合物加入亚硫酰二氯（0.80ml，1.3g，1.1mmol），随后滴加两滴N，N—二甲基甲酰胺，加热悬浮液至90℃并保持2小时。将所得澄清、橙色溶液冷却至室温并真空除去溶剂（1mmHg）。所得N—（5'—氯羰基—4'—氯—2'

—氟苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺黑色半固体不必进一步提纯便可使用。

b．N－〔5'（2－甲基丙氧基羰基）－4'－氯－2'－氟苯基〕－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺

将由N－（5'－氯羰基－4'－氯－2'－氟苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺（3．1g，8．3mmol）和20ml THF组成的混合物冷却至0－10℃并加入2－甲基丙醇（0．80ml，0．64g，8．6mmol），随后加三乙胺（1．2ml，0．86g，8．5mmol）。在反应混合物加热至室温时，开始生成白色沉淀。悬浮液在室温搅拌过夜，生成粘稠的白色浆液。反应混合物在水（50ml）和乙酸乙酯（50ml）中分配，并分离液层。水相用乙酸乙酯（3×25ml）萃取，洗涤合并的有机层（1×25ml饱和的$NaHCO_3$，1×25ml盐水）并在$MgSO_4$中干燥。浓缩得到的3．1g橙棕色固体，通过硅胶柱（100g）并用50%乙酸乙酯／已烷洗脱。自甲醇／水中重结晶，得到2．8g（产率82%，自羧酸）所需产物，为褐色固体，熔点82－85℃

按照与该例所用相同的方法，分别采用适当取代的醇、硫醇、肟、肟盐、胺或胺盐酸盐（例如制备化合物78时用异丙胺）代替2－甲基丙醇，制备表I所述的化合物74，77，78，100—104，110—114，116—118，127，130，133，135，161—164，194，195，197，199，215，218—221和242。

实例13：4－炔丙基-6-（N－（3－（三氟甲基）戊二酰亚胺基））－2H－1，4－苯并噁嗪－3（4H）－酮（化合物85）

a．6－硝基－2H－1，4－苯并噁嗪－3（4H）－酮

向10.6g（182mmol）氟化钾和55ml无水二甲基甲酰胺的混合物中加入7.76ml（72mmol）溴代乙酸乙酯，反应混合物在室温下搅拌15分钟。然后加入10.799g（70.0mmol）2－氨基－4－硝基苯酚，并将反应混合物加热至55℃并保持6小时。将反应混合物缓慢地冷却至室温，搅拌12小时，然后倾入300ml冰中。滤出生成的固体，水洗並干燥（20—50℃，50℃，16小时）。将生成的橙色固体溶于100ml EtOAc和100ml H_2O中。用EtOAc（2×100ml）萃取水层。然后合并有机层并用水（3×150ml）和10%HCl洗涤并干燥（$MgSO_4$）。真空除去溶剂，生成的固体自二氯乙烷中重结晶，得到3.6g（产率27%）6－硝基－2H－1，4－苯并噁嗪－3（4H）－酮橙色固体，熔点221－223℃。

b. 6－硝基－4－炔丙基－2H－1，4－苯并噁嗪－3（4H）－酮

在N_2下，0.81g（20mmol）氢化钠（60%油悬浮液）用3ml戊烷洗涤并悬浮于20ml无水二甲基甲酰胺中。在用冰／盐水浴冷却的同时，通过干燥的填料斗加入3.59g（18.5mmol）6－硝基－2H－1，4－苯并噁嗪－3（4H）酮（放热约5℃）。另加入10ml DMF，混合物在0℃下搅拌30分钟。然后加入2.06ml（18.5mmol）炔丙基溴在甲苯中的80%溶液，反应混合物在室温下搅拌12小时。将反应混合物倾入50ml水中并用EtOAC（2×50ml）萃取。合并有机相，水洗（2×50ml）并干燥（$MgSO_4$）。真空除去溶剂，得到4g6－硝基－4－炔丙基－2H－1，4－苯并噁嗪－3（4H）－酮黄

色固体(产率93%)。

c. 6—氨基—4—炔丙基—2H—1，4—苯并噁嗪—3(4H)—酮

向5.1g(91mmol)铁粉在42.5ml5%乙酸水溶液中的淤浆中，滴加4g(17mmol)溶解于42.5ml冰醋酸和42.5mlEtOAc中的6—硝基—4—炔丙基—2H—1，4—苯并噁嗪—3(4H)—酮。加热反应混合物至温和回流1小时，然后冷却至室温。通过吸滤除去铁粉。将EtOAc(50ml)加入到滤液中并分离液层。水相用EtOAc(2×50ml)萃取并合并有机层，用饱和碳酸氢钠水溶液洗涤(100ml)，并且干燥($MgSO_4$)。真空除去溶剂，将得到的浅棕色的油状物溶于50ml水中并用$EtOAc$(3×50ml)再次萃取，然后干燥($MgSO_4$)。真空除溶剂，得到2.55g(产率75%)深棕色6—氨基—4—炔丙基—2H—1，4—苯并噁嗪—3(4H)—酮固体，熔点136—140℃。

按实例1和2所述的方法，使6—氨基—4—炔丙基—2H—1，4—苯并噁嗪—3(4H)—酮与3—(三氟甲基)戊二酸酐反应，得到所需产物，熔点203—204.5℃。

按照与该例所用相同的方法，制备表Ⅲ和Ⅳ所述的化合物84，90和171，不同的是，制备化合物84时，用2—氯丙酸甲酯代替溴代乙酸乙酯；制备化合物90时，用在乙酸乙酯中的光气与2—氨基—4—硝基苯酚反应；制备化合物171时，用3—甲基戊二酸酐代替3—(三氟甲基)戊二酸酐。

采用与本实例b和C部分相同的步骤，由6—硝基吲哚、6—硝基二氢吲哚和6—硝基吲唑，制备化合物87、123、153和170。

实例14

7-氟-2-甲基-4-炔丙基-6-(N-(3-(三氟甲基)戊二酰胺基))-2H-1,4-苯并噁嗪-3(4H)-酮（化合物88）

a. 2—(3'—氟苯氧基)丙酸

向用油浴加热至45℃的间氟苯酚（24.2g，0.22mol）的79.2ml 25%氢氧化钠水溶液中加入29.5ml（0.26mol）2—氯丙酸甲酯。将反应混合物加热至80℃，17小时后使之冷却。温度降至40℃时，加入浓HCl（25ml），然后冷却至室温。用100ml乙醚萃取反应混合物两次，合并有机层，用200ml 1.5M碳酸钠水溶液洗涤。分离出水相，加入浓HCl酸化至PH为1（用PH试纸试出）。用200ml乙醚萃取酸化的水相，分出有机层。经$MgSO_4$干燥后过滤。真空除去溶剂，得到17g（产率41%）2—(3'—氟苯氧基)丙酸，为黄色固体（m.P.72.5—74℃）。

b. 2—(2',4'—二硝基—5'—氟苯基)丙酸

向5g（25mmol）2—(3'-氟苯氧基)丙酸的11.55ml浓硫酸（H_2SO_4）溶液中经加料漏斗缓慢加入3.59ml 70%硝酸（2.1当量）和3.2ml浓H_2SO_4，加料过程在冰浴冷却下进行。然后使反应混合物缓慢升至室温，并搅拌3小时。将反应混合物倾入200ml冰水中，过滤收集生成的固体，干燥（20—50毛，50℃）12小时，得到3.6g（产率50%）2—(2',4'—二硝基—5'—氟苯基)丙酸，m.P.141—142℃。

c. 6—氨基—7—氟—2—甲基—2H—1,4—苯并噁嗪—

3（4H）—酮

向5.05g（90mmol）铁粉于26.5ml 5%乙酸水溶液的悬浮液中滴加3.6g（12.5mmol）2—（2'，4'-二硝基—5'—氟苯基）丙酸于26.5mlEtOAc和26.5ml冰醋酸中的溶液。将反应混合物加热至轻度回流并保持1小时，然后冷却至室温。用抽滤法经Celite®膜滤板脱除铁粉，过滤板用50mlEtOAc冲洗。将滤液移至分液漏斗分开各相。水相用EtOAc萃取（3×50ml），合并的有机相用碳酸氢钠洗涤（2×50ml），经$MgSO_4$干燥后过滤。真空下从滤液中脱除溶剂，得到1.5g（产率61%）6—氨基—7—氟—2—甲基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮，为褐色固体，m.P.208—211℃。

d. 6—氨基—7—氟—2—甲基—4—炔丙基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮

氮气下用1ml戊烷洗涤0.30g（7.4mmol）氢化钠（60%分散于油中），然后将其悬浮于2ml无水二甲基甲酰胺。冰冷却下将1.36g（6.9mmol）6—氨基—7—氟—2—甲基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮的10ml二甲基甲酰胺溶液用注射器缓慢加到上述氢化钠浆液中，室温下搅拌混合物0.5小时。然后在冰冷却下用注射器加入0.77ml（8.6mmol）炔丙基溴。使反应混合物升至室温，搅拌84小时，然后倾入50ml水中。所得混合物用EtOAc萃取（2×50ml），合并有机相，用水洗涤（3×50ml），经$MgSO_4$干燥后过滤。真空脱除溶剂，得到金色固体，由氯仿重结晶，得到0.66g

6—氨基—7—氟—2—甲基—4—炔丙基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮，为褐色固体，m．P．142—145℃。

6—氨基—7—氟—2—甲基—4—炔丙基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮按实例1和2所述与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应，得到目的化合物，m．P．147—148℃。

采用与本实例相同的步骤，不同之处是用实例17a代替a部分，用适当取代的烷基卤或甲磺酰酯（如化合物97用烯丙基溴），制备表ⅢⅠ所述化合物89、97、137—139、155、182、208、210、226、230和233。

采用与本实例相同的步骤，不同的是用实例17a代替a部分，用2—溴丁酸乙酯代替溴乙酸甲酯，制备化合物235。

还采用本实例步骤制备化合物145，不同之处是用3—甲基戊二酸酐代替3—（三氟甲基）戊二酸酐。

实例15

N—〔4'—氯—2'—氟—5'—（0—甲基肟基）苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物93）

用移液管向甲氧基胺盐酸盐（0．55g，6．6mmol）于无水乙醇（10ml）的悬浮液中加入吡啶（0．52g，6．6ml）。室温下搅拌反应物1小时，然后加入N—（4'—氯—2'—氟—5'-甲酰苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（2．03g，6．0mmol）（化合物94）固体。再加乙醇（31ml），得到的琥珀色溶液在氮气下搅拌过夜。真空脱除溶剂，剩余物 在乙酸乙酯和水间分配。有机相用2．5%HCl（1×25ml）和盐水（1×25ml）洗涤，然后用$MgSO_4$干燥。浓缩后得到棕色固

体，经MeOH／H_2O重结晶，得到目的化合物戊二酰亚胺，为棕色晶体（1.33g，产率60%，m.p.150.5—152.5℃）。

采用与本实例相同的步骤，使用适当取代的烷氧基胺或烷氧基胺盐代替甲氧基胺盐酸盐，制备表I所述化合物150、156、158、159、168、186、187和205。

采用与本实例相同的步骤，不同的是用N—（4'—氯—2'—氟—5'—乙酰苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物95）代替化合物94与适当取代的烷氧基胺或烷氧基胺盐反应，制备化合物172—176和178。

实例16

4—炔丙基—6—（N—（3—（三氟甲基）戊二酰亚胺基））—2H—1，4—苯并噻嗪—3（4H）—酮（化合物124）

a. S—（2，4—二硝基苯基）巯基乙酸乙酯

向100ml圆底烧瓶中装入14.8g（10ml，79.6mmol）2，4—二硝基氟代苯、THF（20ml，自二苯酮／钠新鲜蒸馏）和三乙胺（11.1ml，79，6mmol）。反应物于冰浴中冷却，同时滴加9.55g（8.73ml，79.6mmol）2—巯基乙酸乙酯的THF（10ml）溶液。将得到的近黑色溶液缓慢升至室温，搅拌18小时。将反应混合物倾在150ml冰水中，分离各层。水相用EtOAc萃取（2×125ml）。合并有机相，用水洗涤（100ml），经$MgSO_4$干燥后真空浓缩至干，得到16.9红 褐色固体（产率74.1%）。

b. 6—氨基—2H—1，4—苯并噻嗪—3（4H）—酮

向铁粉（15g，0.27mol）在21.7ml 5%乙酸水溶液的悬浮液中经加料漏斗滴加S—（2，4—二硝基苯基）巯基乙酸乙酯（5.91g，20.6mmol）的20.6ml冰醋酸和21mlEtOAc 溶液。将反应混合物加热至80℃，2小时后冷却至室温。抽滤出铁粉，滤液用EtOAc萃取（3×75ml）。合并的有机相用100ml水洗涤1次，100ml饱和碳酸氢钠水溶液洗涤两次，干燥（$MgSO_4$）并真空浓缩至干，得到2.3g暗褐色固体。

6—氨基—2H—1，4—苯并噻嗪—3（4H）—酮按实例13b用炔丙基溴烷基化，然后按实例1和2的步骤转化为化合物124。

采用上述步骤，但用2，4—二硝基—1，5—二氟苯代替2，4—二硝基氟代苯，制备化合物184。

实例17

7—氟—4—异丁基—6—N—（3—（三氟甲基）戊二酰胺基））—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮（化合物128）

a。5—氟—2—硝基苯氧基乙酸甲酯

向10g（63.7mmol）5—氟—2—硝基苯酚的100ml甲乙酮溶液中加入10.5g（76.4mmol）研碎的碳酸钾，然后加10.7g（70.1mmol）溴代乙酸甲酯。将所得悬浮液回流6小时，室温下搅拌过夜。在这期间，反应混合物由深红色变为浅黄色。将混合物倾入1升水中，分离各层，水相用EtOAc萃取（2×100ml）。合并有机相，干燥（Na_2SO_4），过

滤并真空蒸发至干，得到13.3g（产率91%）5—氟—2—硝基苯氧基乙酸甲酯为淡黄色固体（m.P.85—87℃）。

b. 7—氟—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮

将500mg5%Pd／C装入帕尔烧瓶，加入100ml EtOH，然后加入5.0g（21.8mmol）5—氟—2—硝基苯氧基乙酸甲酯。将烧瓶置于帕尔仪上，抽真空后充入氢气。然后震摇悬浮液2小时。再将烧瓶抽真空，充入氮气，经Celite®真空过滤除去固体。由于一些产物尚未析出，滤饼反复用EtOAc（200ml）冲洗。滤液回流4小时，然后真空蒸发至干，得到定量产率的目的产物7—氟—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮，为白色固体（m.P.201—202℃）。

C. 7—氟—4—异丁基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮

向3.96g（99mmol）经已烷洗涤过的60%氢化钠的150ml N，N—二甲基甲酰胺溶液中分批加入15g（90mmol）7—氟—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮固体。加完后，室温下搅拌反应物10分钟，然后加入19.8g异丁基碘。反应混合物搅拌过夜，然后倾入200ml水中。水相用EtOAc萃取（2×150ml），合并的有机相经Na_2SO_4干燥，过滤和真空蒸发，得到目的烷基化产物，为黄色油体（13g，产率65%）。

d. 7—氟—4—异丁基—6—硝基—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮

向2.50g（11.2mmol）7—氟—4—异丁基—2H

—1，4—苯并噁嗪—3（4H）酮的25ml乙酐溶液中用10分钟滴加2.5g（26.9mmol）70%硝酸的5ml冰醋酸溶液。加完后，室温下搅拌反应物1小时，然后倾入50ml冰／水中。真空过滤收集形成的白色沉淀，在真空箱中于60℃干燥过夜，得到2.71g（产率90%）目的硝酸化产物，m.P.108—110℃。

e. 6—氨基—7—氟—4—异丁基—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮

向2.82g（50.5mmol）铁粉在30ml 5%冰醋酸的悬浮液中用0.5小时滴加2.71g（10.1mmol）7—氟—4—异丁基—6—硝基—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮的60mlEtOAc／冰醋酸（1：1）溶液。加完后，回流反应物2小时，真空过滤除去固体。滤液用EtOAc萃取（2×100ml），合并的有机相用NaHCO，饱和水溶液洗涤（2×150ml），经Na_2SO_4干燥后过滤并浓缩(真空)，得到2.32g（产率96%）目的苯胺，6—氨基—7—氟—4—异丁基—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮，为红色半固体。

6—氨基—7—氟—4—异丁基—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮按实例1和2所述与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应，得到目的产物，m.P.180—181℃。

照使适当的烷基化剂代替步骤C中的异丁基碘，采用上述方法制备化合物96、98、122、126、129、131、134、143、146、149、165、166、089和204。基本采用与上述相同的步骤，但在C中使用实例3a的反应条件，制备化

合物188。

采用上述步骤，但使用炔丙基溴代替异丁基碘，并使所得6—氨基—7—氟—4—炔丙基—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮按实例1和2所述与3—（二氟甲基）戊二酸酐反应，制备化合物238。

实例18

4—（正丙基）—6—（N—（3—（三氟甲基）戊二酰亚胺基））—1，4—苯并噁唑啉（化合物136）

向氢化铝锂（1.2g，31.6mmol）的100ml THF（自钠／二苯酮新鲜蒸馏过）浆液中，用加料漏斗滴加6—氨基—4—正丙基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮（1.89g，9.16mmol，用实例13所述的方法制备）的60ml THF溶液。缓慢加料产生轻度回流。加完后，回流反应72小时，然后冷却至室温。加水（1.2ml）后加入3.6ml 15% NaOH水溶液，然后再加水（1.2ml）。轻度温升消失后，抽滤反应混合物，固体用100ml THF洗涤。真空浓缩滤液至干，得到1.43g（产率74%）6—氨基—4—正丙基—1，4—苯并噁唑啉，为褐色油体。

使苯胺按实例1和2所述进行反应，得到目的戊二酰亚胺。

实例19

N—〔5'—（3—丁炔氧基）—4'—氯—2'—氟苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物140）

将碳酸钾（7.8g，56mmol）加到5—氨基—2—氯—4—氟苯酚（3.23g，19.9mmol）的50ml甲乙酮溶

液中，室温下搅拌反应混合物1小时。然后加入4．2g（19．9mmol）4—苯磺酰氧基－1—丁炔（按已知方法由苯磺酰氯和3—丁炔—1—醇制备），回流反应混合物24小时。将反应混合物倾入50ml水中，分开各相。水相用EtoAc萃取（1×50ml），合并的有机相用水洗涤（3×50ml），$MgSO_4$干燥并浓缩。将剩余物溶于110mlCH_2Cl_2，经硅胶薄填料层过滤，填料层反复用CH_2Cl_2冲洗（4×100ml）。真空浓缩合并的有机相，得到0．95g（产率22%）目的产物，为褐色油体。

将苯胺按实例1和2所述与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应，得到目的产物，m．P．89—91℃。

采用与本例相同的步骤，不同的是使用适当的烷基化剂（由甲磺酰氯和醇按已知方法制备）代替4—苯磺酰氧基—1—丁炔，制备化合物141、196、216、231—234和236。

实例20

7—氟—4—甲氧羰基—6—（N—（3—（三氟甲基）戊二酰亚胺基））—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮（化合物142）

向0．165g（4．13mmol）氢化钠（已烷洗涤）的10mlDMF溶液中加入1．3g（3．75mmol）7—氟—6—（N—（3—（三氟甲基）—戊二酰亚胺基））—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮（化合物138）的20mlDMF溶液。室温下搅拌反应物10分钟，然后加入0．425g（450mmol）氯甲酸甲酯。搅拌混合物1小时，然后倾入50ml冰／

水中，用EtOAc萃取（2×50ml）。合并有机相，经无水Na_2SO_4干燥后真空浓缩至干。剩余物经色谱层析（硅胶，已烷／EtOAc＝1：1），得到0.58g（产率38%）目的化合物，为黄色油体。

采用相同的步骤，但采用适当的烷基化剂代替氯甲酸甲酯，制备化合物121、179和200。

实例21

N—（3—乙酰氨基—4—甲氧苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物148）

购得2—甲氧基—5—硝基苯胺，按已知方法使用HOAc／Ac_2O的H_2O／THF溶液使其乙酰化，制备出2—甲氧基—5—硝基乙酰苯胺。采用催化氢化法（PtO_2，H_2，EtOH）使之还原，得到3—乙酰氨基—4—甲氧基苯胺，再按实例1和2所述进行反应，得到目的戊二酰亚胺。

实例22

4—甲氧基甲基—6—（N—（3—（三氟甲基）戊二酰胺基））—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮（化合物151）

a。6—硝基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮

向2—氨基—4—硝基苯酚（10.7g，69.4mmol）的150mlCH_2Cl_2浆液中加入19.37ml（139mmol）三乙胺，搅拌混合物至均相。然后将反应烧瓶冷却至0℃，同时滴加氯乙酰氯（11.06ml，139mmol）的CH_2Cl_2（50ml）溶液，使反应物升至室温，搅拌16小时，然后将其倾倒在250ml冰上。真空过滤收集形成的白色沉

淀，用CH_2Cl_2（25ml）洗涤，真空烘箱50℃干燥，得到20.56g（产率90%）目的中间产物。

向7.82g（25.6mmol）N，O—双—（氯甲基羰基）—2—氨基—4—硝基苯酚的25ml THF溶液中加入2.67ml（51.2mmol）50% NaOH和10ml水。室温下搅拌两相反应混合物16小时，然后真空脱除溶剂。将剩余物分布于Et_2O（100ml）和水（100ml）并分开各相。水相用Et_2O（2×100ml）和EtOAc（2×100ml）相继萃取，合并的有机相经$MgSO_4$干燥并真空浓缩，得到1.3g（产率26%）目的产物（m.P.223—228℃），为黄色固体。

b. 4—甲氧基甲基—6—硝基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮

向0.976g（5.02mmol） 6—硝基—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮的100ml氯仿溶液中加2ml二甲氧基甲烷。加五氧化二磷（5g，35mmol），室温下搅拌反应混合物16小时。TLC分析表明仍有初始物存在，因此再加二甲氧基甲烷（2ml）和几份五氧化二磷（2×1.2g和2.0g）以及氯仿（50ml）。再搅拌反应物16小时，然后加水（50ml）中止反应。用50ml 1N NaOH缓慢中和反应混合物，在此期间出现升温。反应混合物冷至室温后，分开各相，水相用氯仿萃取（2×50ml）。合并的有机相用水洗涤（2×50ml），经$MgSO_4$干燥和浓缩，得到中间产物（0.5g，产率42%），为浅黄色固体。

采用实例13c的步骤还原该硝基化合物，得到6—氨基—4—甲氧基甲基—2H—1，4—苯并噁嗪—3—酮，再使之按实例1和2所述与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应，得到目的产物，m．P．138—140℃。

采用与本例相同的步骤，不同之处是用实例13b代替b部分，使用适当的烷基化剂，制备化合物105、147、154、157、167、211和217。

实例23

N—（4'—氯—5'—氰基—2'—氟苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物169）

向1．07g（3．03mmol）N—〔4'—氯—2'—氟—5'—（N'—醛肟基苯基）〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物159）的CH_2Cl_2（30ml，含有2．0g无水$MgSO_4$）溶液中加0．40g（0．25ml，3．36mmol）亚硫酰氯。室温下强烈搅拌反应混合物3天，TLC分析表明仍有初始物存在。再加亚硫酰氯（0．1ml），回流反应3小时。TLC表明此时初始物已完全反应。滤出$MgSO_4$，真空脱除溶剂，得到浅黄色固体（0．90g，产率89%），NMR表明其为目的氰基化合物，m．P．210—212℃。

实例24

N—〔5'—（异丙基羧酸铵）—4'—氯—2'—氟苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物177）

向N—（5'—羧基—4'—氯—2'—氟苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物62，1．3g，3．6mmol）的

10mlEtOAc溶液中加0.31ml（0.21g，3.6mmol）异丙基胺。室温下搅拌15分钟后形成白色沉淀。滤出该粉末并真空干燥，得到0.95g（产率75%）目的产物盐，m.P.168—173℃（分解）。

实例25

N—〔5'—（羧酸钾）—4'—氯—2'—氟苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物213）

向KH（0.6g，以35%（重量）分散于矿物油，用2×5ml已烷洗涤过）的5mlTHF溶液中滴加N—（5'—羧基—4'—氯—2'—氟苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物62，1.8g，5.1mmol）的20mlTHF溶液中。氢逸出消失后，搅拌清澈的溶液10分钟，过滤脱除残存的颗粒物。浓缩滤液得到1.8g（产率90%）目的产物钾盐，为白色固体，m.P.133—143℃。

实例26

N—〔3'—（N—甲基乙酰氨基）—4'—氯苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物183）

a．N—甲基—2—氯—5—硝基乙酰苯胺

氮气下用戊烷（2×2.5ml）洗涤3.12g氢化钠（78mmol，60%分散于油中），然后将其悬浮于150ml无水DMF。向该悬浮液中加14.0g（65.1mmol）2—氯—5—硝基乙酰苯胺，接着加50mlDMF冲洗。室温下搅拌15分钟，然后加甲基碘（20ml，45g，32mmol），加热至45℃，3小时后再于室温下搅拌85小时。将反应混合

物倾入500ml水中，用500mlEtOAc萃取。有机相用水（3×200ml）和盐水（1×200ml）洗涤，干燥（$MgSO_4$）并真空浓缩，得到13.3g（产率89%）N—甲基—2—氯—5—硝基乙酰苯胺，为黄色固体。

b. N—甲基—4—氨基—2—氯乙酰苯胺

在帕尔烧瓶中装入300ml无水乙醇，向其中加12.55g（54.9mmol）N—甲基—2—氯—5—硝基乙酰苯胺。向溶液中鼓入氮气15分钟后，加入300mg氧化铂（IV）。将烧瓶置于帕尔仪器上氢气氛下振摇20分钟。经Celite滤除催化剂，真空浓缩滤液得到10.25g（产率94%）目的苯胺，为黄色固体。

使N—甲基—4—氨基—2—氯乙酰苯胺按实例1和2所述与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应，得到目的产物，m.P. 203—204℃。

实例27

N—〔4'—氯—2'—氟—5'—（1，3—二氧杂环已基）苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物193）

向3.4g（10mmol）N—（4'—氯—2'—氟—5'—甲酰苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物94）的110ml甲苯溶液中加0.94g（15mmol）1.2—亚乙基二醇和催化量对甲苯磺酸一水合物（0.48g，2mmol）。混合物回流72小时，同时用迪安—斯达克汽水阀脱除水。真空脱除溶剂，剩余物分布于EtOAc和水。有机相用水和盐水洗涤，经$MgSO_4$干燥后过滤并浓缩，得到4.1g（产率105%）油状

乳脂，NMR分析表明其主要含有产物。由Et_2O重结晶，得到1.0g1.3—二噁烷，为浅黄色固体，m.P.158—161℃。

实例28

N—(5'—异丁基磺酰基—4'—氯—2'—氟苯基)—3—(三氟甲基)戊二酰亚胺(化合物202)

a. 4—氯—2—氟—5—(异丁硫基)乙酰苯胺

将碳酸钾(26g，188mmol)加到5—乙酰氨基—2—氯—4—氟硫代苯酚(11.35g，52.4mmol)的50ml无水DMF溶液中，室温下搅拌反应混合物10分钟。然后加6.63ml(57.0mmol)1—碘—2—甲基丙烷，加热反应混合物至50℃，保持18小时。将反应混合物倾入200ml水中，然后抽滤分离出近白色固体，真空干燥后得到13.31g(产率93%)烷基化产物，为灰白色固体。

b. 4—氯—2—氟—5—(异丁基磺酰基)乙酰苯胺

将间—氯过氧苯甲酸(7.7g，36.6mmol)加到4—氯—2—氟—5—(异丁硫基)乙酰苯胺(4.9g，17.8mmol)的50mlCH_2Cl_2溶液中。在室温下搅拌反应物2.5小时后，再加间—氯过氧苯甲酸(4.6g，21.9mmol)，搅拌 30分钟后将反应混合物倾入50ml水中。分离有机相，用碳酸氢钠饱和水溶液(2×50ml)、水(1×50ml)和碳酸氢钠饱和水溶液(2×50ml)相继洗涤。真空脱除溶剂，将剩余物溶于100mlCH_2Cl_2，用10%亚硫酸钠水溶液(1×100ml)和碳酸氢钠水溶液(1×10ml)洗

涤。有机相真空浓缩至干，得到5．5g黄色固体，NMR鉴定主要含目的产物。这一相产物用于下一反应。

C，4—氯—2—氟—5—（异丁基磺酰基）苯胺

将浓盐酸（16．65ml，200mmol）加到4—氯—2—氟—5—（异丁基磺酰基）乙酰苯胺（5．46g，17．7mmol）的水（24．85ml）和乙醇（19．08）浆液中。反应混合物回流2小时，倾在200ml冰上，通过加50%NaOH使其呈强碱性。水相用Et_2O萃取（2×100ml），合并的有机相用水（1×100ml）和盐水（1×100ml）洗涤，干燥（Na_2SO_4）和真空浓缩。得到的褐色固体（3．8g，产率81%）经NMR证实主要含有目的苯胺。

上述4—氯—2—氟—5—（异丁基磺酰基）苯胺按实例1和2所述与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应，制备化合物202，m．P。48—51℃。

实例29

N—（5'—双—乙酰氨基—4'—氯—2'—氟苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物225）

将100ml无水乙醇装入帕尔烧瓶，向其中加3．21g（8．61mmol）N—（4'—氯—2'—氟—5'—硝基苯基）—3—（三氟甲基）戊酰胺酸（采用实例1的方法由4—氯—2—氟—5—硝基苯胺和3—（三氟甲基）戊二酸酐制备）。向溶液中鼓入氮气15分钟后，加100mg氧化铂（IV）。将烧瓶置于帕尔仪器上于氢气氛下振摇1小时。经Celite过滤脱除固体物，滤液浓缩至干，得到3．1g（产率100%）含有N—（5'—氨基

—4'氯—2'—氟苯基）—3—（三氟甲基）戊酰胺酸的灰白色固体。

采用实例2所述的步骤，将N—（5'—氨基—4'—氯—2'—氟苯基）—3—（三氟甲基）戊酰胺酸转化为化合物225，m.P.164—160℃。

实例30

N—〔4'—氯—2'—氟—5'—（4"，4"—二甲基—2—噁唑啉—2—基）苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物227）

a．2—氯—4—氟—5—硝基苯甲酰氯

向2—氯—4—氟—5—硝基苯甲酸（4.0g，18mmol）的65ml甲苯溶液中加2滴DMF，接着加1.8ml（25mmol）亚硫酰氯。混合物加热至回流18小时，冷却至室温，真空脱除溶剂，得到4.0g（产率93%）白色固体，IR和NMR鉴定为目的产物苯甲酰氯，这一粗产物直接用于下一步骤。

b．N—（1，1—二甲基—2—羟乙基）—2—氯—4—氟—5—硝基苯甲酰胺

向冷却的（0℃）2—氨基—2—甲基—1—丙醇（2.4ml，2.2g，25mmol）的CH_2Cl_2（10ml）溶液中用加料漏斗滴加3.0g（12mmol）2—氯—4—氟—5—硝基苯甲酰氯的20ml CH_2Cl_2 溶液。加完后使反应混合物升至室温，形成白色沉淀。1.5小时后，加入10ml水，过滤，得到2.1g浅黄色固体，NMR鉴定为目的产物。滤液用EtOAc萃取（3×75ml），合并的有机相用盐水、饱和碳酸钠和再次用盐水

洗涤。然后用MgSO4干燥。浓缩后 得到1.0g产物（3.1g，总产率86%）。

c. 2—（2'—氯—4'—氟—5'—硝基苯基）—4，4—二甲基—2—噁唑啉

向N—（1，1—二甲基—2—羟乙基）—2—氯—4—氟—5—硝基苯甲酰胺（2.0g，6.9mmol）的30mlEtOAc溶液中滴加1.6ml（2.6g，22mmol）亚硫酰氯。得到的清澈黄色溶液在室温下搅拌25分钟，在此期间形成白色沉淀。用30ml10%NaOH处理反应混合物，由于固体溶解而导致轻微放热。水相用EtOAc萃取（3×25ml），合并的有机相用盐水洗涤，干燥（MgSO4），浓缩，得到1.85g（产率98%）产物，为黄色固体。

如实例13c所述将2—（2'—氯—4'—氟—5'—硝基苯基）—4，4—二甲基—2—噁唑啉还原为相应的苯胺，再采用实例1和2的步骤将其转化为戊二酰亚胺（化合物227）。

实例31

6—氟—3—正丙基—5—N—（3—（三氟甲基）戊二酰亚胺基））—1，3—苯并噁唑啉—2（3H）—酮（化合物181）

a. 2—氨基—5—氟苯酚

将500mg10%钯／碳催化剂装入含有50ml无水乙醇的帕尔烧瓶中，向其中加入10g（64mmol）5—氟—2—硝基苯酚的150ml乙醇溶液。将烧瓶抽真空，充入氢气，在帕尔仪器上振摇1小时。经Celite®滤除催化剂，真空蒸发滤液至干，得到7.54g（产率93%）黑色固体。

b．6—氟—1，3—苯并噁唑啉—2（3H）—酮

向置于0℃下的5．0g（39．3mmol）2—氨基—5—氯苯酚的150ml CH_2Cl_2 溶液中加13．4g（98mmol）碳酸钾和23g（47mmol）碳酰氯的20%（重）甲苯溶液。升至室温后，搅拌反应1小时，然后倾入200ml冰／水中。分离各相，用EtOAc萃取（1×100ml），然后合并有机相并用 Na_2SO_4 干燥。真空脱除溶剂，得到5．76g（产率96%）目的产物，由 ^1H—NMR测定。

c．6—氟—3—正丙基—1，3—苯并噁唑啉—2（3H）—酮

向670mg（16．74mmol）氢化钠（用已烷洗涤过的）20ml DMF溶液中加2．33g（15．22mmol）6—氟—1，3—苯并噁唑啉—2（3H）—酮的40ml DMF溶液。搅拌反应10分钟，加入3．11g（18．3mmol）1—碘代丙烷，然后在室温下搅拌3小时。将其倾入50ml冰／水后，水相用EtOAc萃取（2×100ml）。合并的有机相用水洗涤（1×100ml），Na_2SO_4 干燥并真空蒸发至干，得到2．2g（产率75%）烷基化产物，为褐色固体。

d．6—氟—5—硝基—3—正丙基—1，3—苯并噁唑啉—2（3H）—酮

向2．0g（10．3mmol）6—氟—3—正丙基—1，3—苯并噁唑啉—2（3H）—酮的25ml乙酐溶液中滴加2．3g（24．7mmol）70%硝酸的2ml冰醋酸溶液。加完后，室温下搅拌反应2小时，然后将其倾入50ml冰／水中。水相用

EtOAc萃取（2×70ml），合并的有机相经Na_2SO_4干燥并真空蒸发至干，得到1.66g（产率67%）硝酸化产物，为黄色油体。

按实例17e的步骤将上述制备的6—氟—5—硝基—3—正丙基—1，3—苯并噁唑啉—2（3H）—酮还原为相应的苯胺，再按实例1和2的步骤使其与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应，得到目的产物，m.P.198—152℃。

实例32

N—（6—氟—1—正丙基—4H—3，1—苯并噁嗪—2（H）—酮—7—基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物198）

a.3，1，4—苯并噁嗪—2（1H）—酮

向置于0℃的4.0g（32.5mmol）2—氨基苄醇的200mlCH_2Cl_2溶液中加11.12g（81.2mmol）碳酸钾，接着加19.3g（39.0mmol）碳酰氯的20%（重）甲苯溶液。将反应混合物缓慢升至室温，然后搅拌5小时。将反应混合物倾入200ml饱和$NaHCO_3$，分离各相，有机相用Na_2SO_4干燥，浓缩后得到4.55g（产率84%）产物，为白色固体。

按实例17c—e和实例1和2所述，但使用1—碘代丙烷代替异丁基碘，将上述3，1，4—苯并噁嗪—2（1H）—酮转化为目的产物戊二酰亚胺（m.P.158—160℃）。

实例33

7—氯—4—环氧丙基—6—N—（3—三氟甲基）戊二酰亚胺基））—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮（化合物239）

向1．0g（2．6mmol）4—烯丙基—7—氟—6—N—（3—三氟甲基）戊二酰亚胺基））—2H—1，4—苯并噁嗪—3（4H）—酮（化合物97）的50ml CH_2Cl_2 溶液中加2．45g（7．8mmol）间—氯过氧苯甲酸。室温下搅拌混合物过夜，然后将其倾入50ml饱和NaHCO，中。分离各相，有机相用 Na_2SO_4 干燥并真空浓缩至干。粗产物用制备薄层色谱提纯（60／40正烷：EtOAc），得到400mg（产率38%）目的环氧化物，为清澈的油。

采用上述步骤，不同的是初始物为N—（5'—烯丙基氧基—4'—氯—2'—氟苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物9）以及反应在CHCl，中回流过夜，制备化合物245。

实例34

N—〔4'—氯—5'—（3，3—二氯烯丙氧基）—2'—氟苯基〕—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物244）

将溶于5ml水的氢氧化钾（1．95g，34．8mmol）加到5—氨基—2—氯—4—氟苯酚（5．65g，34．8mmol）的40ml二甲亚砜溶液中。室温下搅拌所得混合物18小时，然后将其倾入100ml水，用 Et_2O 萃取（2×100ml）。合并的有机相用水洗涤（2×100ml），Na_2SO_4 干燥并经中性二氧化铝薄填料层过滤（伴随 Et_2O 冲洗，3×50ml）。真空浓缩滤液，得到7．56g（产率74%）主要含产物（^1H—NMR鉴定）的褐色油。

使上述粗产物苯胺按实例1和2所述与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应，得到目的产物，m．P．106—108℃。

采用与本例相同的步骤，但使用的烷基化剂是3—氯—1—丁烯，制备化合物240。采用这一步骤也制备了化合物243，只是用炔丙基溴作为烷基化剂并使所得苯胺与3—（二氟甲基）戊二酸酐反应，而不是与3—（三氟甲基）戊二酸酐反应。

实例35

N—（4'—氯—2'—氟—5'—硝基苯基）—3—（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物222）

a。4—氯—2—氟—5—硝基乙酰苯胺

向装有机械搅拌器的500ml三颈圆底烧瓶中装入4—氯—2—氟代乙酰苯胺（56.3g，0.3mmol）和浓H_2SO_4（100ml）。将其冷却至0℃，用30分钟加入发烟硝酸（21g，0.33mol），然后将反应混合物倾在2升冰上。待冰融化后，过滤收集固体物，水洗并在减压下干燥，得到44 g（产率63%）硝酸化物，为褐色固体。

b。4—氯—2—氟—5—硝基苯胺

将4—氯—2—氟—5—硝基乙酰苯胺（10.88g，46.8mmol）、50.4ml乙醇、65.7ml水和43.8ml（526mmol）浓盐酸的混合物回流1小时，然后倾在300ml冰上。加入50%氢氧化钠水溶液使水相呈强碱性，用2×200mlEt_2O萃取。合并的有机相用水（200ml）和盐水（200ml）洗涤，Na_2SO_4干燥并真空浓缩至干，得到8g（产率90%）目的产物苯胺，为黄色固体。

按实例1和2所述，将该苯胺与3－（三氟甲基）戊二酐反应，得到所需的戊二酰亚胺，熔点为164－167℃。

实例36

N－（5'－异丁基亚砜－4'－氯－2'－氟苯基）－3－（三氟甲基）戊二酰亚胺（化合物246）

向已冷却至0℃的4－氯－2－氟－5－（异丁硫基）N－乙酰苯胺（见实例28a）（1.04g，3.8mmol）于30ml乙醇的溶液中加入高碘酸钠(1.29g，6.0mmol）于30ml水的溶液。使反应温热至室温并搅拌18小时。抽滤除去固体，将滤液溶于75ml二氯甲烷，然后用水（50ml）洗涤。用Na_2SO_4干燥有机层，浓缩至干，得到1g（产率90%）白色固状的所需亚砜。

采用实例28C的步骤制备相应的苯胺，按实例1和2所述，将苯胺与3－（三氟甲基）戊二酐反应，得到所需的戊二酰亚胺，熔点为133—134℃。

本发明的化合物是广谱除草剂，可用于选择性地防治农艺和园艺作物、森林、果园、草场、葡萄园中的单子叶和／或双子叶杂草或用于杂草的全面防治。

本发明的化合物具有选择性或非选择性，这取决于施用量、所施用的植物的组合情况以及芽前或芽后施用。这些变化对本专业领域的熟练技术人员来说是可理解的。当剂量较高时，它们往往是非选择性的，而当剂量较低时，它们往往是选择性的。例如，上述醚和硫醚戊二酰亚胺化合物均具有芽前和芽后活性并可芽后防治小麦中的双子叶杂草；酯戊二酰亚胺可芽前和芽后防治单子叶和双子叶杂草，防治双子叶杂草的所需剂量通常比防治单子叶杂草的低；杂环戊二酰亚胺在

作物如小麦、玉米、稻谷、大豆、向日葵、花生和棉花中具有芽前和/或芽后防治选择性。

本发明的戊二酰亚胺可按能控制不需要的植物生长所需的任何剂量施用。本发明的除草剂的用量通常约为0.0001至12，较好为约0.001至5磅戊二酰亚胺化合物/英亩，最好为约0.002至2磅戊二酰亚胺化合物/英亩(分别为1.12×10^{-5}—1.344克/米^2，11.2×10^{-5}—0.56克/米^2，22.4×10^{-5}—0.224克/米^2)。

本发明的化合物可用作芽前和芽后除草剂，芽前除草剂可施用在土壤表面或掺入土壤中。芽后除草剂可在植物出芽后和生长期间施用。本发明的戊二酰亚胺可在植物出芽前施用在土壤表面或在种植前掺入土壤或其它生长介质中。可采用任何常规方法进行掺和，包括与土壤简单混合；将戊二酰亚胺施用在土壤表面，然后翻入或耙入土壤中至所需深度；或用液态载体进行必要的渗透和浸透。

本发明的戊二酰亚胺可单独或通常作为其中还含有农用载体的除草组合物或制剂的一个组分在芽后施用于生长介质或要处理的植物。除草组合物中的戊二酰亚胺的浓度可在约1至98%范围内变化。

所谓农用载体是指任何能用于溶解、分散或扩散组合物中的除草化合物而不减弱除草化合物的作用且其本身对土壤、农机、作物或农业环境无有害作用的物质。本发明的戊二酰亚胺的混合物也可用于任何除草制剂。本发明的除草组合物可以是固体或液态制剂或溶液。可将戊二酰亚胺制成本领域熟练技术人员已知的剂型，例如可湿性粉剂、溶液、浓乳液、粉剂、颗粒剂、喷雾剂、水分散性颗粒剂或可流动浓缩液。在这些制剂中，化合物与液态或固态载体混匀，如果需要，可加入合适的表面活性剂或乳化剂。可用于本发明的溶剂的例子有水、醇类、酮类、芳族烃、卤代烃、二甲基甲酰胺、二噁烷、二甲亚

砜等。也可使用这些溶剂的混合物。

根据农用实际情况，特别是在芽后应用下，通常需要使除草剂含有助剂，如湿润剂、扩展剂、分散剂、附着剂、粘合剂等。本领域常用的助剂的例子可在John W. McCutcheon, Inc. Publication "Detergents and Emulsifiers Annual"中找到。

本发明的戊二酰亚胺在施用前可与肥料或具有肥料作用的物料混合。在一类可使用戊二酰亚胺的固态肥料组合物中，可用一种或多种戊二酰亚胺涂覆肥料或　　肥料组分如硫酸铵、硝酸铵或磷酸铵的颗粒。固态戊二酰亚胺和固态肥料也可在掺合或混合装置中混合，或将它们与肥料一起合并在颗粒制剂中。可采用任何适合于作物生长和杂草处理的戊二酰亚胺与肥料的相对比例。

本发明的戊二酰亚胺可作为除草喷洒剂用常规方法如加仑液压喷洒、低加仑液压喷洒、空气喷洒、气雾喷洒或粉尘喷洒的方法施用。对于某些应用，可使用本发明的二种或多种戊二酰亚胺，以提供附加的优势和作用。当使用本发明的戊二酰亚胺的混合物时，所用的各个化合物的相对比例取决于混合物中化合物对要处理的植物的相对效应。

对于某些应用而言，可往本发明的戊二酰亚胺中加入一种或多种其它除草剂，从而提供附加的优势和作用。当使用除草剂的混合物时，所用的相对比例取决于混合物中化合物对要处理的植物的相对效应。可与本发明的戊二酰亚胺组合的其它除草剂的例子包括：

羧酸和衍生物

2，3，6—三氯苯甲酸和其盐；

2，3；5，6-四氯苯甲酸和其盐；

2－甲氧基－3，5，6－三氯苯甲酸和其盐；

2－甲氧基－3，6－二氯苯甲酸和其盐；

2－甲基－3，6－二氯苯甲酸和其盐；

2，3－二氯－6－甲基苯甲酸和其盐；

2，4－二氯苯氧乙酸和其盐和酯；

2，4，5－三氯苯氧乙酸和其盐和酯；

2－甲基－4－氯苯氧乙酸和其盐和酯；

2－（2，4，5－三氯苯氧基）丙酸和其盐和酯；

4－（2，4－二氯苯氧基）丁酸和其盐和酯；

4－（2－甲基－4－氯苯氧基）丁酸和其盐和酯；

2，3，6－三氯苯基乙酸和其盐；

3，6－环氧六氢化邻苯二甲酸和其盐；

2，3，5，6－四氯对苯二甲酸二甲酯；

三氯乙酸和其盐；

2，2－二氯丙酸和其盐；

2，3－二氯异丁酸和其盐；

2－（4－异丙基－4－甲基－5－氧－2－咪唑啉－2－基）烟酸异丁铵；

2，〔4，5－二氢－4－甲基－4－（1－甲基乙基）－5－氧－1H－咪唑－2－基〕－3－喹啉羧酸；

6－（4－异丙基－4－甲基－5－氧－2－咪唑啉－2－基）－间甲苯甲酸甲酯和6－（4－异丙基－4－甲基－5－氧－2－咪唑啉－2－基）对甲苯甲酸甲酯；

N－（磷酰基甲基）甘氨酸异丙铵盐；

〔3，5，6－三氯－（2－吡啶－）氧基〕乙酸；

3，7－二氯－8－喹啉羧酸；

dl－同型丙氨－4－酰基（甲基）次膦酸铵；

氨基甲酸衍生物

N，N－二正丙基硫羟氨基甲酸乙酯；

N，N－二正丙基硫羟氨基甲酸正丙酯；

N－乙基－N－（正丁基）硫羟氨基甲酸乙酯；

N－乙基－N－（正丁基）硫羟氨基甲酸正丙酯；

N，N－二乙基二硫代氨基甲酸2－氯烯丙酯；

N－甲基二硫代氨基甲酸盐；

1－六亚甲基亚胺硫代羧酸乙酯；

N－苯基氨基甲酸异丙酯；

N－（间氯苯基）氨基甲酸异丙酯；

4－氯－2－丁炔基－N－（间氯苯基）氨基甲酸酯；

N－（3，4－二氯苯基）氨基甲酸甲酯；

二硝基－邻－（仲丁基）苯酚和其盐；

五氯苯酚和其盐；

S－（4－氯苄基）－N，N－二乙基硫羟氨基甲酸酯；

取代的脲

2－氯－N－〔（4－甲氧基－6－甲基－1，3，5－三嗪－2－基）氨基羰基〕－苯磺酰胺；

3－（3，4－二氯苯基）－1，1－二甲基脲；

3－苯基－1，1－二甲基脲；

3－（3，4－二氯苯基）－3－甲氧基－1，1－二甲基脲；

3－（4－氯苯基）－3－甲氧基－1，1－二甲基脲；

3－（3，4－二氯苯基）－1－正丁基－1－甲基脲；

3－（3，4－二氯苯基）－1－甲氧基－1－甲基脲；

3－（4－氯苯基）－1－甲氧基－1－甲基脲；

3－（3，4－二氯苯基）－1，1，3－三甲基脲；

3－（3，4－二氯苯基）二乙基脲；

二氯脲；

2－〔〔〔〔（4，6－二甲基－2－嘧啶基）氨基〕羰基〕氨基〕磺酰基〕苯甲酸甲酯；

N－（（6－甲氧基－4－甲基－1，3，5－三嗪－2－基）氨基羰基）－2－（2－氯乙氧基）苯磺酰胺；

2－〔〔〔（4－氯－6－甲氧基嘧啶－2－基）氨基羰基〕氨基〕－磺酰基〕苯甲酸乙酯；

2－〔〔〔〔（4－甲氧基－6－甲基－1，3，5－三嗪－2－基）氨基〕羰基〕氨基〕磺酰基〕苯甲酸甲酯；

3－〔〔〔〔（4－甲氧基－6－甲基－1，3，5－三嗪－2－基）氨基〕羰基〕氨基〕磺酰基〕－2－噻吩羧酸甲酯；

2－〔〔〔〔（4，6－二甲氧基嘧啶－2－基）氨基〕羰基〕氨基〕磺酰基〕甲基〕苯甲酸甲酯；

2－〔〔〔〔（4－甲氧基－6－甲基－1，3，5－三嗪－2－基）甲基氨基〕羰基〕氨基〕磺酰基〕苯甲酸甲酯；

取代的三嗪

2－氯－4，6－二（乙基氨基）－仲三嗪；

2－氯－4－乙基氨基－6－异丙基氨基－仲三嗪；

2－氯－4，6－二（甲氧基－正丙基氨基－仲三嗪；

2－甲氧基－4，6－二（异丙基氨基）－仲三嗪；

2－氯－4－乙基氨基－6－（3－甲氧基－正丙基氨基）－仲三嗪；

2－甲基巯基－4，6－二（异丙基氨基）－仲三嗪；

2－甲基巯基－4，6－二（乙基氨基）－仲三嗪；

2－甲基巯基－4－乙基氨基－6－异丙基氨基－仲三嗪；

2－氯－4，6－二（异丙基氨基）－仲三嗪；

2－甲氧基－4，6－二（乙基氨基）－仲三嗪；

2－甲氧基－4－乙基氨基－6－异丙基氨基－仲三嗪；

2－甲基巯基－4－（2－甲氧基乙基氨基）－6－异丙基氨基－仲三嗪；

4－氨基－6－（叔丁基）－3－（甲巯基）－1，2，4－三嗪－5（4H）酮；

二苯醚衍生物

2，4－二氯－4′－硝基二苯醚；

2，4，6－三氯－4′－硝基二苯醚；

2，4－二氯－6－氟－4′－硝基二苯醚；

3－甲基－4′－硝基二苯醚；

3，5－二甲基－4′－硝基二苯醚；

2，4－二硝基－4－（三氟甲基）二苯醚；

2，4－二氯－3′－甲氧基－4′－硝基二苯醚；

5－（2－氯－4－（三氟甲基）苯氧基）－2－硝基苯甲酸钠；

2－氯－1－（3－乙氧基－4－硝基苯氧基）－4－（三氟甲基）苯；

5－〔2－氯－4－（三氟甲基）苯氧基〕－2－硝基苯甲酸－1－（乙酯基）乙酯；

5－〔2－氯－4－（三氟甲基）苯氧基〕－N－（甲基磺酰基）－2－硝基苯甲酰胺；

N－酰苯胺

2－氯－N－（2－乙基－6－甲基苯基）－N－（2－甲氧基－1－甲基乙基）乙酰胺；

2－氯－2′，6′－二乙基－N－（2－丙氧基乙基）乙酰苯胺；

N－（3，4－二氯苯基）丙酰胺；

N－（3，4－二氯苯基）甲基丙烯酰胺；

N－（3－氯－4－甲基苯基）－2－甲基戊酰胺；

N－（3，4－二氯苯基）三甲基乙酰胺；

N－（3，4－二氯苯基）－α，α－二甲基正戊酰胺；

N－异丙基－N－苯基氯乙酰胺；

N－正丁氧基甲基－N－（2，6－二乙基苯基）氯乙酰胺；

N－甲氧基甲基－N－（2，6－二乙基苯基）氯乙酰胺；

氧苯氧基除草剂

丙酸2－（4－（2，4－二氯苯氧基）苯氧基）甲酯；

2－（4－（3－氯－5－（三氟甲基）－2－吡啶基氧基）苯氧基）丙酸甲酯；

（R）－L－〔4－〔5－（三氟甲基）－2－吡啶基氧基）苯

氧基〕丙酸丁酯；

2－〔4－〔（6－氯－2－苯并噁唑基）氧基〕苯氧基〕丙酸乙酯；

2－〔4－〔〔5－（三氟甲基）－2－吡啶基〕氧基〕苯氧基〕丙酸丁酯；

2－〔4－〔（6－氯－2－喹喔啉基）氧基〕苯氧基〕丙酸乙酯；

尿嘧啶

5－溴－3－仲丁基－6－甲基尿嘧啶；

5－溴－3－环已基－1，6－二甲基尿嘧啶；

3－环已基－5，6－亚丙基尿嘧啶；

5－溴－3－异丙基－6－甲基尿嘧啶；

3－叔丁基－5－氯－6－甲基尿嘧啶；

腈

2，6－二氯苄腈；二苯乙腈；3，5－二溴－4－羟基苄腈；3，5－二碘－4－羟基苄腈；

其它有机除草剂

2－氯－N，N－二烯丙基乙酰胺；

N－（1，1－二甲基－2－丙炔基）－3，5－二氯苯甲酰胺；

马来酰肼；

3－氨基－1，2，4－三唑；

甲胂酸一钠；

甲胂酸二钠；

N，N－二甲基－α，α－二苯基乙酰胺；

N，N－二正丙基－2，6－二硝基－4－（三氟甲基）苯胺；

N，N－二正丙基－2，6－二硝基－4－甲基苯胺；

N，N－二正丙基－2，6－二硝基－4－甲基磺酰基苯胺；

异丙基氨基硫基磷酸O－（2，4－二氯苯基）－O－甲酯；

4－氨基－3，5，6－三氯吡啶甲酸；

2，3－二氯－1，4－萘醌；

二（甲氧基硫基羰基）二硫化物；

3－（1－甲基乙基）－1H－2，1，3－苯并噻二嗪－（4）3H－酮－2，2－二氧化物；

6，7－二氢联吡啶醇〔1，2－a：2'，1'－C〕吡嗪二盐；

1，1'－二甲基－4，4'－联吡啶 盐；

3，4，5，6－四氢－3，5－二甲基－2－硫基－2H－1，3，5－噻二嗪；

2－〔1－乙氧基亚氨基）丁基〕－5－〔2－（乙基硫基）丙基〕－3－羟基－2－环已－1－酮；

2－（2－氯苯基）甲基－4，4－二甲基－3－异噁唑烷酮；

N－（1－乙基丙基）－3，4－二甲基）－2，6－二硝基苯甲酰胺；

4－氯－5－（甲基氨基）－2－（α，α，α－三氟－1－甲苯甲酰）－3－（2H）－哒嗪酮；

2－（3，5－二氯苯基）－2－（2，2，2－三氯甲基）环氧乙烷。

采用温室测试方法评估本发明的戊二酰亚胺对几种常规杂草的除草活性。采用下述步骤评估本发明的戊二酰亚胺对下述杂草的防治效果：

单子叶

稗子（BYG）	Echinochloa crus-galli
马唐（CRB）	Digitaria sanguinilis
狗尾草（FOX）	Setaria viridis
石茅高粱（JON）	Sorghum halepense
草原看麦娘（MF）	Alopecurus pratensis
油莎草（NUT）	Cyperus esculentus
野燕麦（WO）	Avena fatua

双子叶

鬼针草（BID）	Bidens pilosa
苍耳（CKL）	Xanthium strumarium
朝颜草（MG）	Ipomoea lacunosa
龙葵（NS）	Solanum nigrum
藜 （PIG）	Amaranthus retroflexus
大马蓼（SMT）	Polygonum lapathifolium
绒毛贡（VEL）	Abutilon theophrasti

采用下列试验步骤，将选择植物的种子种植在平地或盆内。对于芽前试验，在种植后立即将试验化合物直接喷洒到土壤表面。然后用顶部灌溉法往平地或盆内浇水。对于芽后试验，让种子发芽并生长10至21天。从生长的均匀性、大小和叶龄的角度出发选择各组试

验植物，然后用试验化合物处理试验植物。芽后试验植物仅用地下灌溉的方法浇水。

将要评估的化合物溶于一种合适的溶剂（通常为丙酮）中，使用体积等于25或50加仑／英亩的载体，以表中所定的施用量磅／英亩）喷洒在平地或盆内。施用试验化合物约10至21天后，观察植物的生长情况。以0－100的等级评估各组植物，其中0等于无效，100等于全部控制，下列各表（表Ⅵ和Ⅶ）给出了在所述用量下试验化合物所获得的结果。表中，

PRE表示芽前，POST表示芽后。

表 VI

除草活性

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	CKL	MG	PIG	VEL	SMT	BYG	FOX	ION	NUT	WO
1.	2	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	2	POST	100	100	100	100	-*	100	100	99	98	100
2.	2	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	2	POST	100	100	100	100	-	100	100	99	5	100
3.	2	PRE	100	100	100	100	-	100	100	100	80	99
	2	POST	100	100	100	100	100	100	100	99	80	90
4.	2	PRE	0	100	100	100	100	100	100	85	10	90
	2	POST	99	100	100	100	100	100	100	65	10	70
5.	1	PRE	71	100	100	100	100	100	100	100	65	100
	1	POST	100	100	100	100	100	99	100	90	90	100
6.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	98	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	0	60
7.	1	PRE	100	100	100	100	100	99	100	100	0	100
	1	POST	100	99	100	100	100	100	100	100	0	35
8.	1	PRE	0	90	0	100	15	41	98	0	0	0
	1	POST	45	15	100	100	100	45	75	15	0	35
9.	2	PRE	75	100	100	100	-	100	100	90	80	90
	2	POST	100	100	100	100	100	100	100	70	65	100
10.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	30	100
	1	POST	71	100	100	100	100	100	100	100	100	100
11.	1	PRE	0	0	0	100	0	0	21	15	0	0
	1	POST	70	60	95	100	100	15	25	5	0	0
12.	1	PRE	0	100	100	100	100	99	100	95	80	98
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	98	10	100
13.	4	PRE	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	4	POST	15	45	100	45	15	10	30	10	0	10
14.	4	PRE	80	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	4	POST	0	100	100	100	0	100	100	98	45	98
15.	4	PRE	0	0	100	100	100	10	100	20	0	0
	4	POST	5	35	20	60	10	15	90	10	0	5
16.	4	PRE	0	95	100	100	0	0	95	0	0	27
	4	POST	0	80	100	100	10	20	100	10	0	10
17.	4	PRE	100	100	100	100	100	100	100	98	100	75
	4	POST	100	100	100	100	100	100	99	25	65	65

表 VI（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	CKL	MG	PIG	VEL	SMT	BYG	FOX	ION	NUT	WO
18.	4	PRE	0	100	100	100	50	100	100	70	98	65
	4	POST	35	55	100	100	98	85	100	10	80	10
19.	4	PRE	0	90	100	100	0	45	100	0	20	25
	4	POST	100	90	98	100	20	100	100	25	10	85
20.	4	PRE	0	0	100	100	50	0	0	0	0	0
	4	POST	100	20	100	100	100	90	100	20	10	15
21.	4	PRE	31	61	100	100	100	0	100	0	0	0
	4	POST	15	10	100	95	100	0	0	0	0	0
22.	4	PRE	98	100	100	100	100	100	100	80	75	51
	4	POST	55	55	100	100	85	20	100	5	45	5
23.	4	PRE	0	0	100	100	0	90	100	15	0	0
	4	POST	0	0	25	0	0	0	0	0	0	0
24.	1	PRE	0	100	100	100	100	70	100	85	70	10
	1	POST	100	99	100	100	100	40	100	20	10	20
25.	1	PRE	0	100	100	100	100	99	100	85	85	90
	1	POST	40	100	100	100	100	100	100	30	10	25
26.	4	PRE	0	0	100	15	0	15	100	20	0	0
	4	POST	15	15	90	100	35	0	15	5	0	0
27.	4	PRE	0	0	100	20	-	75	100	51	0	20
	4	POST	0	70	100	35	100	70	45	15	0	15
28.	4	PRE	0	90	100	100	100	98	100	95	25	85
	4	POST	0	5	100	100	100	5	5	0	0	0
29.	2	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	2	POST	100	100	100	100	100	100	100	85	95	99
30.	1	PRE	0	100	100	100	100	100	100	80	85	80
	1	POST	45	100	90	100	100	95	95	40	0	45
31.	4	PRE	0	0	100	100	-	50	100	85	-	0
	4	POST	0	0	5	0	-	0	0	0	0	0
32.	4	PRE	0	15	100	100	80	75	100	0	60	21
	4	POST	0	5	10	5	10	0	0	0	0	0
34.	4	PRE	0	5	100	100	0	75	100	5	5	0
	4	POST	5	45	90	100	98	20	15	5	0	5

表 Ⅵ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	CKL	MG	PIG	VEL	SMT	BYG	FOX	ION	NUT	WO
35.	4	PRE	0	0	-	100	0	0	21	0	0	0
	4	POST	0	10	0	0	0	0	0	0	0	0
36.	4	PRE	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	4	POST	0	20	15	25	0	10	5	0	0	0
37.	4	PRE	0	0	0	21	51	21	51	51	51	61
	4	POST	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
38.	1	PRE	0	0	100	100	100	60	100	25	0	15
	1	POST	5	10	15	10	10	0	0	0	0	0
39.	4	PRE	0	0	-	45	0	0	0	0	0	0
	4	POST	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
40.	4	PRE	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	4	POST	0	0	0	0	10	0	0	0	0	0
41.	1	PRE	0	100	-	100	100	98	100	100	0	98
	1	POST	100	70	100	100	100	80	75	15	10	65
42.	4	PRE	0	15	0	100	70	0	85	0	10	0
	4	POST	15	25	10	5	10	10	25	0	0	5
43.	2	PRE	100	100	100	100	100	100	100	90	100	100
	2	POST	100	100	100	100	100	100	100	90	100	100
44.	1	PRE	0	50	100	100	100	100	100	15	100	75
	1	POST	100	100	100	100	100	80	100	70	0	30
45.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	99	55	100
	1	POST	100	100	100	100	100	99	85	70	20	85
46.	1	PRE	15	70	100	100	100	100	100	90	100	80
	1	POST	100	80	100	100	100	80	60	45	10	25
47.	1	PRE	10	100	100	100	100	98	100	45	11	90
	1	POST	90	90	100	100	100	20	5	5	5	15
48.	1	PRE	0	90	100	100	100	85	100	15	0	60
	1	POST	95	90	100	100	100	25	10	10	0	10
49.	4	PRE	0	0	-	90	20	0	15	0	0	0
	4	POST	0	10	0	0	-	0	0	0	0	0
50.	1	PRE	0	100	100	100	100	95	100	80	0	10
	1	POST	100	100	70	100	100	80	40	30	0	20

表 Ⅵ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	CKL	MG	PIG	VEL	SMT	BYG	FOX	ION	NUT	WO
51.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	80	65	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	45	100
53.	1	PRE	61	100	100	100	100	25	100	75	20	15
	1	POST	100	20	98	100	95	10	35	0	0	10
54.	1	PRE	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	1	POST	0	100	100	100	100	95	15	0	0	10
55.	4	PRE	0	85	100	20	90	0	15	0	0	0
	4	POST	80	100	100	100	100	45	40	5	0	5
56.	1	PRE	0	0	-	0	-	0	0	0	0	0
	1	POST	80	100	100	100	100	100	35	90	10	60
57.	1	PRE	0	100	0	100	100	0	0	-	0	0
	1	POST	100	100	100	100	90	20	25	0	0	0
58.	1	PRE	0	20	100	100	25	0	0	-	0	0
	1	POST	5	80	65	70	100	0	0	25	0	0
59.	1	PRE	0	0	100	100	0	0	0	0	0	0
	1	POST	100	100	100	75	100	15	70	10	0	0
60.	1	PRE	51	100	100	100	100	70	100	90	0	0
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	20	25
61.	1	PRE	0	0	0	50	0	0	85	0	0	0
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	30	45
62.	1	PRE	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	1	POST	98	70	100	100	85	90	100	35	0	0
63.	4	PRE	0	0	0	100	100	0	75	0	0	10
	4	POST	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0
64.	2	PRE	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	2	POST	-	0	85	15	100	15	0	0	0	0
65.	2	PRE	-	0	100	0	0	0	0	0	0	0
	2	POST	30	30	100	90	100	0	10	10	0	0
66.	4	PRE	0	0	0	25	0	0	5	0	0	0
	4	POST	0	0	10	35	0	0	0	0	0	0
67.	4	PRE	-	0	100	0	100	-	0	90	0	0
	4	POST	0	5	5	10	0	0	0	0	0	5

表 Ⅵ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	CKL	MG	PIG	VEL	SMT	BYG	FOX	ION	NUT	WO
68.	4	PRE	0	0	-	100	25	0	5	0	0	0
	4	POST	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
69.	4	PRE	0	0	0	100	0	90	0	0	0	0
	4	POST	0	15	5	0	5	0	0	0	0	0
70.	4	PRE	0	0	-	100	0	0	11	0	0	0
	4	POST	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0
71.	1	PRE	36	100	100	100	-	80	100	25	0	0
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	60	75
72.	1	PRE	0	100	-	100	-	90	100	0	0	60
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	85	5	65
73.	1	PRE	0	95	-	0	-	75	100	0	0	20
	1	POST	60	20	80	100	100	15	80	5	15	5
74.	1	PRE	0	0	0	100	0	0	15	5	0	0
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	95	10	25
75.	1	PRE	15	100	100	100	100	70	100	60	0	70
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	75	0	10
76.	1	PRE	0	100	100	100	100	100	100	90	35	90
	1	POST	55	100	100	100	25	80	95	80	10	40
77.	4	PRE	30	100	100	100	100	99	100	80	0	55
	4	POST	45	70	100	95	100	15	40	0	0	0
78.	4	PRE	90	100	100	100	100	100	100	99	45	75
	4	POST	25	20	20	100	100	0	25	0	0	0
79.	4	PRE	0	100	100	100	100	99	95	95	0	15
	4	POST	35	50	55	95	100	0	0	10	10	10
80.	4	PRE	90	100	100	100	100	100	100	100	15	99
	4	POST	60	85	100	100	100	100	100	85	30	45
81.	1	PRE	80	100	100	100	100	100	100	100	75	90
	1	POST	55	100	100	100	98	30	60	15	20	30
82.	1	PRE	0	100	100	100	100	100	100	98	25	85
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	95	35	80
83.	1	PRE	25	100	100	100	100	100	100	95	25	50
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	70	20	0

表 Ⅵ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	CKL	MG	PIG	VEL	SMT	BYG	FOX	ION	NUT	WO
84.	4	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	70	98
	4	POST	30	100	100	100	100	15	70	100	100	70
85.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	60	100	100	100	100	0	100	100	0	0
86.	4	PRE	0	0	-	0	0	0	20	0	0	0
	4	POST	0	0	100	99	0	80	100	70	0	10
87.	4	PRE	30	100	100	100	100	100	100	100	98	90
	4	POST	45	10	100	100	100	50	65	55	35	15
88.	1	PRE	80	100	100	100	100	100	100	100	15	95
	1	POST	70	100	90	100	100	25	50	50	0	0
89.	0.3	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	80	100
	0.3	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	85	100
90.	0.3	PRE	60	100	100	100	100	55	100	60	0	0
	0.3	POST	100	100	100	100	100	20	35	25	15	25
91.	4	PRE	0	0	100	60	100	0	100	15	0	20
	4	POST	5	0	20	0	0	0	0	0	0	0
92.	1	PRE	95	15	100	100	100	100	100	100	100	80
	1	POST	100	75	100	100	100	100	100	95	100	40
96.	1	PRE	100	100	-	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	75	100	100	100	100	85	90	35	100	0
97.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	100	75
98.	1	PRE	100	100	-	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	98	100	100	100	100	100	100	100	100	95
99.	4	PRE	0	0	0	20	-	0	45	0	0	0
	4	POST	0	25	45	70	0	5	10	0	0	0
100.	1	PRE	0	20	100	100	65	0	30	10	0	0
	1	POST	35	90	100	100	65	25	15	15	10	15
101.	1	PRE	0	0	100	50	100	0	0	0	0	0
	1	POST	20	25	10	65	100	25	0	0	0	0
102.	1	PRE	100	100	100	100	100	90	100	85	0	15
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	60	10	0

表 VI（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	CKL	MG	PIG	VEL	SMT	BYG	FOX	ION	NUT	WO
103.	1	PRE	0	0	100	90	99	0	25	0	0	0
	1	POST	100	98	100	100	100	50	98	20	0	0
104.	1	PRE	100	100	100	100	100	95	100	95	0	50
	1	POST	100	100	100	100	100	40	95	10	0	0
105.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	65	100
	1	POST	85	100	100	100	100	55	85	85	35	-
106.	1	PRE	0	50	100	100	100	85	100	60	0	95
	1	POST	10	10	70	100	60	15	30	10	0	15
107.	1	PRE	0	90	100	100	100	90	100	60	0	75
	1	POST	15	30	100	100	95	15	20	15	0	15
108.	1	PRE	10	20	100	100	100	55	100	70	0	10
	1	POST	30	65	35	100	100	0	0	10	15	15
109.	1	PRE	0	0	100	10	0	55	10	0	0	0
	1	POST	40	65	10	99	95	0	0	0	0	0
110.	1	PRE	10	20	100	100	100	90	100	30	5	10
	1	POST	95	100	100	100	90	100	100	85	20	15
111.	1	PRE	100	95	100	100	100	100	100	90	20	95
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	80	95
112.	1	PRE	15	90	100	100	100	100	100	45	10	45
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	20	80	100
113.	1	PRE	50	85	-	100	100	95	100	75	0	10
	1	POST	75	90	100	100	100	100	100	30	15	90
114.	1	PRE	90	100	100	100	100	100	100	95	25	99
	1	POST	50	35	95	95	99	70	100	70	0	45
115.	1	PRE	75	65	100	100	100	100	100	100	35	80
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	15	80
116.	1	PRE	100	100	100	100	100	98	100	85	15	98
	1	POST	95	95	100	100	100	100	100	65	15	80
117.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	99	65	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	55	100
118.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	45	100

表 Ⅵ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	CKL	MG	PIG	VEL	SMT	BYG	FOX	ION	NUT	WO
119.	4	PRE	10	0	100	100	0	85	100	45	0	15
	4	POST	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
120.	4	PRE	0	0	95	100	85	95	100	80	0	15
	4	POST	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
122.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100	100	99
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
124.	1	PRE	85	100	100	100	100	100	-	100	100	70
	1	POST	10	0	100	100	100	35	15	100	35	0
125.	4	PRE	0	0	100	100	55	95	100	-	10	10
	4	POST	0	0	70	100	0	0	20	0	0	0
126.	1	PRE	95	100	-	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	65	35	30	100	70	75	100	85	0	0
128.	1	PRE	100	100	-	100	100	100	100	100	98	100
	1	POST	55	98	100	100	100	100	100	98	75	90
129.	1	PRE	100	100	-	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	80	100	100	100	100	100	95	65	40	80
131.	1	PRE	100	100	-	100	100	100	100	100	100	95
	1	POST	25	100	100	100	65	95	30	100	60	0
132.	4	PRE	80	100	-	100	100	100	100	85	98	95
	4	POST	25	100	100	100	60	85	98	25	0	35
134.	1	PRE	100	90	-	100	100	100	100	65	20	60
	1	POST	75	50	100	80	100	0	25	15	0	0
136.	1	PRE	35	55	-	100	100	100	100	100	30	85
	1	POST	35	40	100	100	100	0	100	60	0	0
137.	1	PRE	75	100	-	100	100	100	100	100	0	95
	1	POST	55	70	100	75	100	0	15	10	40	0
138.	1	PRE	85	100	-	100	100	100	100	100	0	95
	1	POST	70	55	100	100	100	70	98	55	25	0

* “-”表示未试验

表 . VII

除草活性

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	BID	NS	SMT	VEL	BYG	CRB	FOX	MF
33.	1	PRE	50	0	100	100	100	95	100	80
	1	POST	40	100	100	100	95	20	75	20
52.	2	PRE	100	-	100	100	95	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	40	20	10	0
93.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
94.	1	PRE	95	40	100	100	0	100	90	0
	1	POST	40	100	70	100	20	40	25	0
95.	1	PRE	100	100	100	100	95	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	95	100	100	95
121.	1	PRE	100	-	100	100	100	100	100	75
	1	POST	100	100	100	100	75	75	85	20
123.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	10
	1	POST	75	-	75	100	20	20	90	0
127.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	90	20	100	40
130.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	60	100	20
133.	1	PRE	100	100	100	100	95	100	100	100
	1	POST	100	-	100	100	95	100	100	25
135.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	-	100	100	100	100	100	95
139.	3	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	3	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
140.	1	PRE	-	100	100	100	98	-	100	-
	1	POST	-	100	15	100	100	-	70	-
141.	1	PRE	-	100	100	100	99	-	100	-
	1	POST	-	100	100	100	100	-	100	-
142.	1	PRE	80	90	100	100	95	100	100	80
	1	POST	90	100	100	100	25	40	50	0

表 Ⅶ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	BID	NS	SMT	VEL	BYG	CRB	FOX	MF
143.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
144.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	95	100	100	100	100	100	100	100
145.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	-	100	100	100	100	100	100
146.	1	PRE	100	100	100	-	100	-	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	95
147.	1	PRE	100	100	-	100	95	-	100	100
	1	POST	100	100	100	100	98	85	80	70
148.	1	PRE	90	90	0	100	0	0	0	0
	1	POST	0	0	0	0	0	0	0	0
149.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	95
150.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	-	100	100	100	100	100	70
151.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	-	100	100	100	100	100	90
152.	1	PRE	100	60	80	100	40	0	0	0
	1	POST	80	-	0	100	0	40	20	0
153.	1	PRE	75	50	0	100	25	80	70	0
	1	POST	75	80	0	20	10	0	20	0
154.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
155.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
156.	1	PRE	90	100	100	100	0	100	100	90
	1	POST	40	100	80	100	10	0	0	30
157.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	90	60
158.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100

表 Ⅶ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	BID	NS	SMT	VEL	BYG	CRB	FOX	MF
159.	1	PRE	95	100	100	100	10	100	100	10
	1	POST	80	100	100	100	10	80	20	10
160.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
161.	1	PRE	100	100	100	100	0	95	100	0
	1	POST	35	100	100	100	40	80	50	0
162.	1	PRE	100	100	100	100	50	100	100	95
	1	POST	95	100	100	100	100	85	90	60
163.	1	PRE	100	100	100	100	90	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	80	90	50
164.	1	PRE	100	100	100	100	85	95	100	95
	1	POST	75	100	100	100	60	80	60	20
165.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
166.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
167.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	95
168.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
169.	1	PRE	100	100	100	100	80	100	100	10
	1	POST	75	100	100	100	10	90	25	10
170.	1	PRE	0	0	0	0	0	0	0	0
	1	POST	40	60	0	0	0	0	0	0
171.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	75	-	100	100	100	100	100	60
172.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
173.	1	PRE	95	100	100	100	80	100	100	50
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	50
174.	1	PRE	85	100	100	100	90	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100

表 Ⅶ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	BID	NS	SMT	VEL	BYG	CRB	FOX	MF
175.	1	PRE	25	100	100	100	0	100	100	100
	1	POST	30	-	100	100	60	90	80	75
176.	1	PRE	95	100	100	100	95	100	100	95
	1	POST	95	-	100	100	95	100	95	75
177.	1	PRE	90	100	100	100	95	100	100	40
	1	POST	100	-	100	100	95	100	100	50
178.	1	PRE	40	0	100	90	0	100	100	25
	1	POST	100	100	100	100	75	60	90	50
179.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	95	100
180.	1	PRE	10	100	0	95	0	95	95	0
	1	POST	75	80	0	40	0	90	40	0
181.	1	PRE	100	100	100	100	75	100	100	95
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	75
182.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
183.	1	PRE	0	0	0	0	0	0	0	0
	1	POST	10	20	20	0	0	0	0	0
184.	1	PRE	100	0	100	100	95	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	70
185.	1	PRE	0	0	0	50	0	0	0	0
	1	POST	50	75	0	35	0	20	0	0
186.	1	PRE	95	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	60
187.	1	PRE	90	100	100	100	95	100	100	95
	1	POST	95	100	100	100	100	100	100	50
188.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
189.	1	PRE	100	100	100	100	95	100	100	100
	1	POST	95	100	100	100	95	95	100	80
190.	1	PRE	100	100	100	100	90	100	100	95
	1	POST	100	100	95	100	95	100	100	95

表 Ⅶ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	BID	NS	SMT	VEL	BYG	CRB	FOX	MF
191.	1	PRE	100	50	0	100	0	100	95	25
	1	POST	80	95	20	95	20	50	40	0
192.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
193.	1	PRE	100	100	95	100	95	100	100	95
	1	POST	100	100	100	100	95	90	95	75
194.	1	PRE	95	100	100	100	100	100	100	95
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	95
195.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
196.	1	PRE	100	100	-	100	95	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
197.	1	PRE	100	80	100	100	100	100	100	95
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	95
198.	1	PRE	75	90	0	100	0	60	0	0
	1	POST	0	0	0	0	0	0	0	0
199.	1	PRE	100	0	100	100	95	100	100	75
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	95
200.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	90	100	100	100	80	50	90	10
201.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	100
202.	1	PRE	50	85	100	100	10	95	100	90
	1	POST	20	20	60	20	0	0	0	0
203.	1	PRE	100	100	100	100	80	100	100	90
	1	POST	100	100	100	100	95	95	100	95
204.	1	PRE	95	100	100	100	95	100	100	100
	1	POST	95	100	100	100	80	0	60	50
205.	1	PRE	90	90	90	100	20	80	95	40
	1	POST	10	100	90	50	0	0	0	0
206.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100

表 Ⅶ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	BID	NS	SMT	VEL	BYG	CRB	FOX	MF
207.	1	PRE	95	100	100	100	95	95	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	85	100	95
208.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	95	75	100	100
209.	1	PRE	40	20	100	100	0	95	100	80
	1	POST	85	100	95	100	60	60	85	40
210.	1	PRE	100	100	100	100	95	100	100	100
	1	POST	95	100	100	100	95	80	95	90
211.	1	PRE	100	40	100	100	40	100	100	90
	1	POST	90	60	100	95	60	10	40	10
212.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
213.	1	PRE	0	0	0	100	0	0	0	0
	1	POST	100	100	100	100	100	95	100	75
214.	1	PRE	0	0	100	0	0	0	0	0
	1	POST	0	0	0	0	0	0	0	0
215.	1	PRE	95	90	100	100	35	90	100	90
	1	POST	100	100	100	100	95	100	100	90
216.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
217.	1	PRE	100	95	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	75	100	80
218.	1	PRE	100	90	100	100	100	100	100	95
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	95
219.	1	PRE	80	70	100	100	95	100	100	50
	1	POST	100	100	100	100	95	100	100	70
220.	1	PRE	80	0	95	100	80	100	100	40
	1	POST	100	95	100	100	60	30	100	20
221.	1	PRE	0	10	100	100	25	80	95	0
	1	POST	100	100	100	100	70	95	100	25
222.	1	PRE	0	0	0	0	0	0	0	0
	1	POST	25	80	0	95	0	0	0	0

表 Ⅶ（续）

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	BID	NS	SMT	YEL	BYG	CRB	FOX	MF
223.	1	PRE	70	10	100	100	100	100	100	80
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	50
224.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
225.	1	PRE	0	0	0	75	0	0	0	0
	1	POST	90	100	80	100	0	0	20	0
226.	1	PRE	70	10	20	75	40	80	100	25
	1	POST	90	100	100	90	25	0	60	10
227.	1	PRE	95	90	80	100	70	100	100	80
	1	POST	100	100	100	100	100	80	100	90
228.	1	PRE	90	95	100	100	95	100	100	100
	1	POST	75	100	100	100	95	90	70	70
229.	1	PRE	95	100	0	95	0	70	90	0
	1	POST	80	100	10	100	10	20	25	0
230.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
231.	1	PRE	70	80	90	100	90	100	100	95
	1	POST	0	0	0	0	0	0	0	0
232.	1	PRE	85	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	95	100	100	100	100	75	100	80
233.	1	PRE	85	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	40	100	100	95	100	25	90	40
234.	1	PRE	95	100	100	100	10	90	100	90
	1	POST	40	100	100	100	0	0	50	0
235.	1	PRE	100	-	-	100	95	100	100	100
	1	POST	95	100	100	100	100	70	95	80
236.	1	PRE	100	100	100	100	95	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	85	75	80	20
237.	1	PRE	100	100	100	100	95	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
238.	1	PRE	100	100	100	100	100	100	100	100
	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100

表 VII(续)

化合物编号	应用比例 (lb./A)	类型	BID	NS	SMT	VEL	BYG	CRB	FOX	MF
239.	1	PRE	95	100	100	100	25	100	100	10
	1	POST	100	100	100	100	60	75	85	0
240.	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	100
241.	1	POST	95	100	100	100	95	95	60	95
242.	1	POST	100	100	100	100	100	100	100	95
243.	1	PRE	100	100	100	100	80	100	90	100
	1	POST	100	100	100	100	100	95	50	80
244.	1	PRE	60	95	0	95	40	100	80	85
	1	POST	70	100	100	100	10	10	35	20
245.	1	PRE	0	80	0	90	0	95	80	0
	1	POST	90	100	85	100	10	25	30	0
246.	1	PRE	60	90	40	100	0	80	20	10
	1	POST	75	95	95	50	0	0	10	0

* "—"表示未试验

本发明的戊二酰亚胺也可用作杀藻剂。这些化合物宜用于防止或控制藻类的生长。所需戊二酰亚胺的实际用量当然随要保护的介质、要防治的藻类、所用的具体戊二酰亚胺和本领域技术人员已知的其它因素而异。

当本发明的戊二酰亚胺用于控制藻类时，能以任何防除不需要的植物所述的制剂形式使用。这些制剂包括液态溶液，如浓乳剂和稀喷洒剂，和干粉，如可湿性粉剂和粉尘剂。

采用下列步骤测定本发明化合物的杀藻活性和抑藻活性。在微滴定板（板A）的各孔中加入受试化合物的100μl如下所述的改性Allen 介质的系列稀释液。另外，其中一个孔仅含改性的Allen 介质（无化合物），作为对照。然后在滴定板的每个孔中接种混合藻类培养物。4小时后，从各孔中取出5μl等分试样并将其放在含100μl Allen 改性介质的另一不同微滴定板的孔（板B）中。两块滴定板用透明的塑料罩盖上，并同一些湿纸巾一起放在透明的塑料袋中，上述纸巾能产生高湿度并防止由板上蒸发。

将装滴定板的塑料袋在室温下放在强光条件（200—700英尺烛光）下。5或14天后由板A测定抑制生长所需的最低抑制浓度（MIC）。抑制生长的作用被定义为静作用。8至10天后，由板B测定化合物的4一小时灭杀作用（杀死生物体）。为了由微滴定板读出静活性或灭杀活性，用体视镜在低放大率下观察各孔中的生长或不生长。也可用读板器读出生长和非生长。

下列步骤用于制备改性的Allen 介质。

制备如下7种溶液：

$NaNO_3$	10.0g在400ml去离子水中
$CaCl_2$	1.0g在400ml去离子水中
$MgSO_4 \cdot 7H_2O$	3.0g在400ml去离子水中
K_2HPO_4	3.0g在400ml去离子水中
KH_2PO_4	7.0g在400ml去离子水中
NaCl	1.0g在400ml去离子水中
$FeCl_3$	1.0g在400ml去离子水中

上述各种溶液均过滤灭菌。

往940ml灭菌的去离子水中加入1滴$FeCl_3$溶液和10.0ml所有的其它种溶液。该介质的环境条件下的PH值约为6.1，用碳酸钙表示的水硬度约为65PPm。用灭菌的1N KOH或HCl将PH值调至表Ⅷ的PH值，用灭菌的$NaHCO_3$溶液（将56.03g $NaHCO_3$溶于1.0升煮沸和蒸馏的水中，然后过滤并灭菌）调至表Ⅷ的水硬度。

混合藻培养物取自工业冷却塔（Spring House，PA）并根据已知方法保存于实验室中，混合的培养物含绿藻和兰绿菌。

在750英尺烛光的光度条件下本发明的化合物于改性的Allen 介质中的杀藻活性（PPm）示于表Ⅷ中。

表 VIII

杀藻活性

	化合物序号	天数	pH 6.1 393 ppm*		pH 8 200 ppm
			静	灭菌	静
试验1	10	5	<0.015	<2	-**
试验2	10	5	0.25	-	-
	85	5	0.125	-	-
	51	5	0.25	-	-
试验3	2	14			32
	12	14			32
	19	14			125
	27	14			125
	34	14			125
	38	14			63
	41	14			63
	45	14			<2
	46	14			4
	49	14			32
	56	14			250
	57	14			32
	62	14			63
	64	14			125
	76	14			125
	78	14			250
	80	14			63
	81	14			63
	87	14			125
	91	14			63
	92	14			125
	99	14			250
	110	14			63
	114	14			<2
	148	14			125

* 用碳酸钙表示的ppm水硬度

** 未试验

应当明白，在不偏离本发明的精神和范围的情况下，可对本发明进行修改和变动。