

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07C 67/22

C07C249/08

[12] 发明专利说明书

C07C249/12 C07C251/48

C07C 69/738 C07C251/60

[21] ZL 专利号 95194276. X

C07C235/78 C07D249/12

[45] 授权公告日 2002 年 4 月 10 日

[11] 授权公告号 CN 1082503C

[22] 申请日 1995.5.26 [24] 颁证日 2002.4.10

[21] 申请号 95194276. X

[30] 优先权

[32] 1994.6.10 [33] DE [31] P4420416.7

[86] 国际申请 PCT/EP95/02013 1995.5.26

[87] 国际公布 WO95/34526 德 1995.12.21

[85] 进入国家阶段日期 1997.1.21

[73] 专利权人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72] 发明人 H·巴也 H·依萨克 H·威格特

H·萨奥特 M·克伊

M·耐特·R·贝诺特 R·穆勒

[56] 参考文献

DE4042273

.. -

EPO585751

1994.3.9

C07C251/60

基础有机化学第一版 1980. 6. 1 邢其毅等, 高等教育出版社
BULL CHEM SOC JAPAN VOL58, NO 9 1985. 1. 1 T. SHIMI-
ZU ET AL A NEW SYNTYETIC METHOD FOR ALKYL CAR-
BONOCYANIDATE N OCIDES

BULL CHEM SOC JAPAN VOL58, NO 9 1985. 1. 1 T. SHIMI-
ZU ET AL A NEW SYNTYETIC METHOD FOR ALKYL CAR-
BONOCYANIDATE N OCIDES

BULL CHEM SOC JAPAN VOL58, NO 9 1985. 1. 1 T. SHIMI-
ZU ET AL A NEW SYNTYETIC METHOD FOR ALKYL CAR-
BONOCYANIDATE N OCIDES

CHEM ABS VOL. 100, NO 15665P 1984. 1. 1 L. P. SHADRINA
ET AL SPECTROSCOPIC STUDY OF OXO AND OXY COM-
POUNDS

审查员 吕青

[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

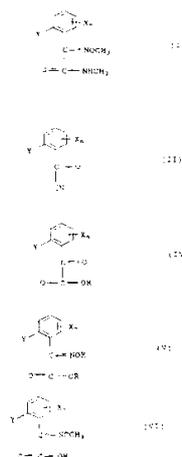
代理人 樊卫民

权利要求书 5 页 说明书 134 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 α -甲氧基亚氨基酸的甲基酰胺的制备
方法及其中间体

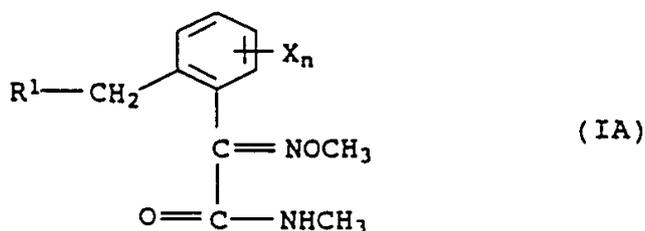
[57] 摘要

本发明描述了制备式 I α -甲氧基亚氨基酸的甲基酰胺的方法和中间体: (X = 硝基, 三氟甲基, 卤素, 烷基或烷氧基; n = 0, 1, 2, 3 或 4; Y = C-有机基团), 该方法包括使式 II 酰基氰与醇进行 Pinner 反应, 随后使 Pinner 反应中形成的式 IV 酯: 与羟胺反应生成式 V 肟: 甲基化 V, 得式 VI 肟醚: 接着将 VI 与甲胺反应。



权 利 要 求 书

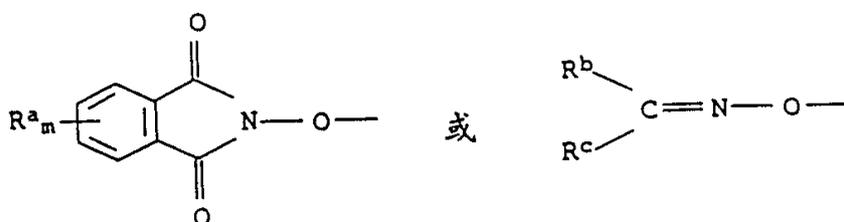
1. 制备式 IA α -甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺的方法:



式中各取代基和符号具有下述含义:

n 代表 0

R^1 代表氢, 羟基, 巯基, 氰基, 硝基, 卤素, 未取代的或取代的烷基磺酰基, 未取代或取代的烷基磺酰氧基, 未取代的或取代的环烷基, 未取代的或取代的芳氧基, 未取代的或取代的芳基磺酰基, 未取代的或取代的芳基磺酰氧基, 未取代的或取代的杂环基或未取代的或取代的杂芳氧基,



R^a 代表氰基, 硝基, 卤素, C_1-C_4 -烷基, C_1-C_4 -卤代烷基, C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基,

m 代表 0 或整数 1 至 4, 其中当 $m > 1$ 时, R^a 基团可以不同,

R^b 代表氢, 未取代的或取代的烷基, 环烷基, 链烯基, 环烯基, 炔基, 杂环基, 烷基羰基, 环烷基羰基, 链烯基羰基, 炔基羰基, 杂环基羰基, 烷氧基羰基, 芳基, 杂芳基, 芳基羰基, 杂芳基羰基, 芳基磺酰基, 杂芳基磺酰基或 $C(R')=NOR'$ 基团;

R' 代表氢, 羟基, 氰基, 硝基, 氨基, 卤素,

未取代的或取代的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基,

链烯基, 链烯氧基, 链烯硫基, 链烯基氨基, 炔基, 炔氧基, 炔硫基, 炔基氨基, 环烷基, 环烷氧基, 环烷硫基, 环烷基氨基, 环烯基, 环烯氧基, 环烯硫基, 环烯基氨基, 杂环基, 杂环氧基, 杂环基硫基, 杂环基氨基, 芳基, 芳氧基, 芳硫基, 芳基氨基, 杂芳基, 杂芳氧基, 杂芳硫基或杂芳基氨基;

R' 代表氢,

未取代的或取代的烷基, 环烷基, 链烯基, 炔基, 杂环基, 芳基或杂芳基,

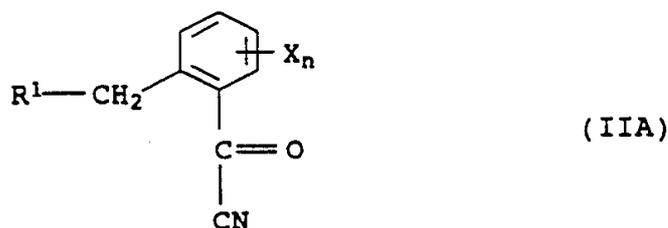
R^o 代表 R^b 中所述基团或者代表

羟基, 氰基, 硝基, 氨基, 卤素,

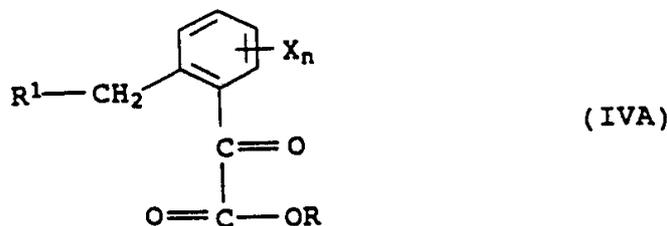
未取代的或取代的烷氧基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 芳氧基, 芳硫基, 芳基氨基, 杂芳氧基, 杂芳硫基或杂芳基氨基;

或者 R^b 和 R^c 与它们所键合的碳原子一同表示碳环或杂环环,

该方法包括使式 IIA 酰基氰

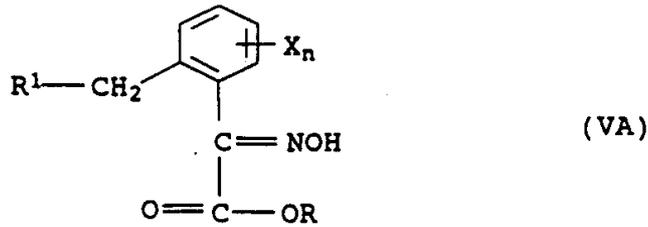


与醇进行 Pinner 反应, 随后使 Pinner 反应中形成的式 IVA 酯

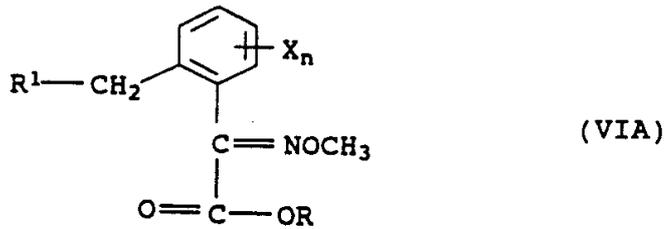


进行下述反应:

a) 与羟胺反应生成式 VA 肟:



甲基化 VA，得式 VIA 脞醚：

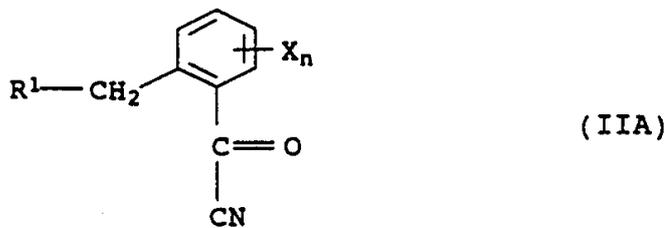


或者

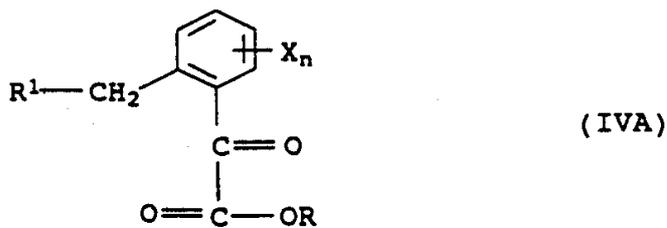
b) 与 O-甲基羟胺反应得到式 VIA 脞醚，
并接着将 VIA 与甲胺反应，其特征在于，在 Pinner 反应中使用沸点
高于 75°C 的式 III 醇：



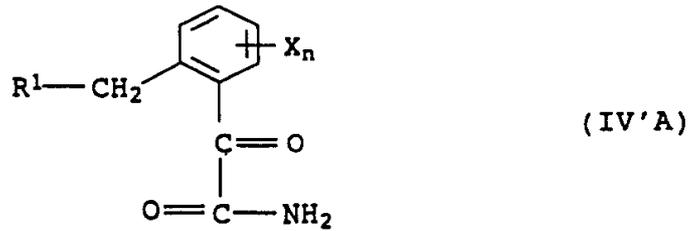
2. 权利要求 1 中所述的式 IA α -甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺的
制备方法，该方法包括使式 IIA 酰基氰



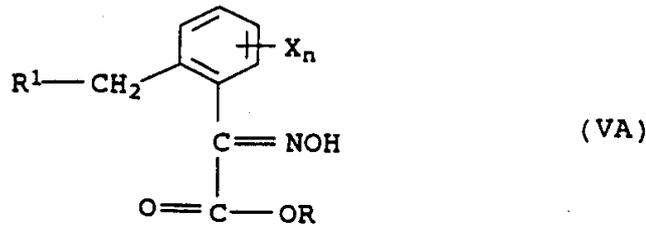
与醇进行 Pinner 反应，随后使 Pinner 反应中形成的式 IVA 酯



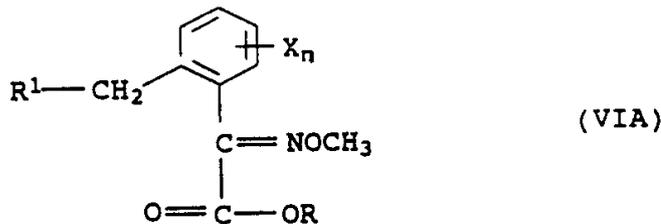
和式 IV'A 酰胺的混合物进行下述反应：



a) 与羟胺反应生成式 VA 肟:



甲基化 VA, 得式 VIA 肟醚:



或者

b) 与 O-甲基羟胺反应得到式 VI 肟醚,

并接着将 VIA 与甲胺反应, 其特征在于, 在 Pinner 反应中使用沸点高于 75°C 的式 III 醇:

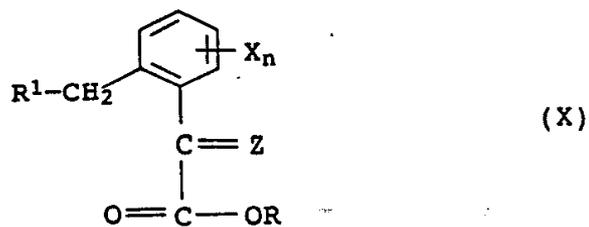


3. 权利要求 1 或 2 所述的式 IA α -甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺的制备方法, 其中得到式 VA 肟的反应是在 Pinner 反应中所用的醇 III 存在下进行。

4. 权利要求 1 或 2 所述的式 IA α -甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺的制备方法, 其中得到式 VIA 肟醚的反应是在 Pinner 反应中所用的醇 III 存在下进行。

5. 权利要求 1 或 2 所述的方法, 其中所用的醇 III 的沸点高于 90°C。

6. 通式 X 化合物:



其中 R¹ 为氯

n 为 0,

其中,

z 代表 O, NOH 或 NOCH₃, 以及

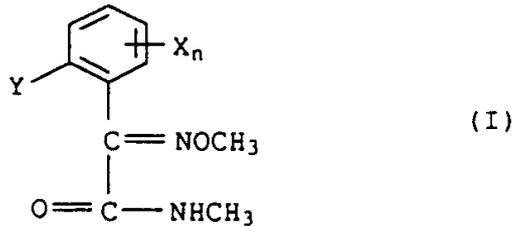
R 代表沸点高于 75℃ 的醇 (R-OH) 的残基。

7. 权利要求 6 中所述的式 X 化合物在制备权利要求 1 中所述的式 IA α-甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺方面的应用。

说明书

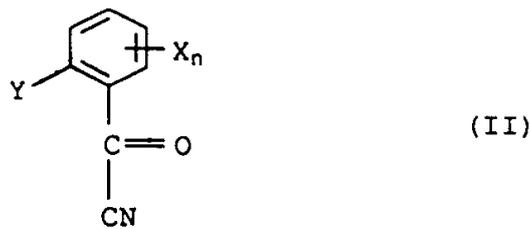
α -甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺的制备方法及其中间体

本发明涉及式 I α -甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺的制备方法

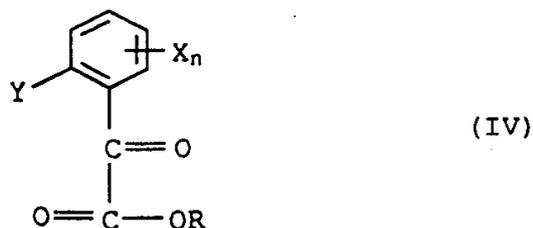


式中

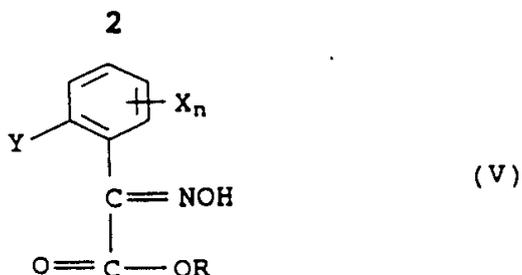
X 代表硝基, 三氟甲基, 卤素, C_1 - C_4 -烷基或 C_1 - C_4 烷氧基,
n 代表 0 或整数 1 至 4, 其中当 $n > 1$ 时, X 基团可以不同, 以及
Y 代表 C-有机基团, 该方法包括: 使式 II 酰基氰



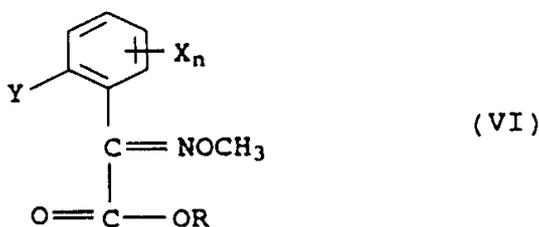
与醇进行 Pinner 反应, 随后使 Pinner 反应中形成的式 IV 酯进行下述反应:



a) 与羟胺反应生成式 V 脞:



甲基化 V, 得式 VI 脞:



或者

b) 与 O-甲基羟胺反应得到式 VI 脞,
并接着将 VI 与甲胺反应。

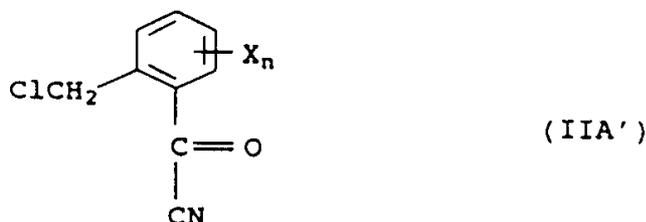
文献中已公开了制备 α -甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺的种种方法。然而由于这些方法需要众多步骤,因此它们不能提供令人满意的产率或者它们需要昂贵或难以在工业方法中操作的试剂(参见 EP-A 398692, EP-A 463488, EP-A477631, EP-A 579 124, EP-A 582 925, EP-A 585 751, EP-A 617 011, EP-A 617 014, WO-A 92/13830, WO-A 93/07116, WO-A 93/08180, WO-A 94/08948, WO-A 94/11334,

WO-A 94/14322 , WO-A 94/14761 , WO-A 94/19331 , WO-A 94/22812 , JP-A 04/182461 , JP-A 05/201946 , JP-A 05/255012 , 德国专利申请 4410424 . 3 和 4421182 . 1 号) .

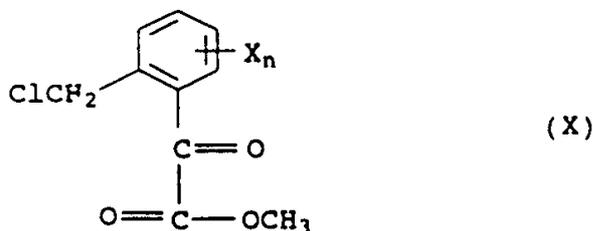
另外, 文献 (EP-A 493 711) 公开了式 II 氯基酮与甲醇的 Pinner 反应以及得到相应的 α -甲氧基亚氨基羧酸甲酯 I' 的后续反应. 但此方法则具有下述缺点: 一方面, 除所希望的酮酯苯甲酸酯外, 还产生相当量缩酮酯和酰胺.

另外已知方法还具有下述缺点:

如果特别优选的化合物 IIA' (Y 代表氯甲基)



通过如 DE-A 4223382 和 DE-A4311722 中所给出的方法制得, 且然后与甲醇反应, 制得酮酯 X



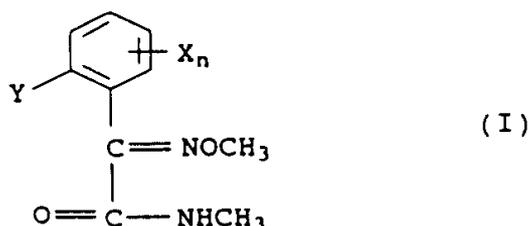
则很难制得纯净形式 X . 其原因为, 酮酯 X 和最初两步反应 (按照 DE-A 4223382 和 DE-A4311722) 中产生的副产物 (尤其取代的 2 - 苯并 [C] 咪喃酮以及取代的 2 - 氯甲基苯甲酰氯的物理性质十分相似, 以至即使能

纯化如通过蒸馏方式，也只能是十分困难和比较昂贵的。

因此使用采用已知方法所得到的酯会产生污染的二次产物，它们只能艰难地纯化。

本发明一方面提供了制备 α -甲氧基亚氨基羧酰胺的方法，此方法十分简单且可以工业规模使用，特别是不需要采用昂贵或危险试剂来进行，另外能够制得纯净形式所希望的中间体和最终产物。

我们已发现，本发明的目的通过下述式 I α -甲氧基亚氨基羧酸的甲基酰胺的制备方法实现：



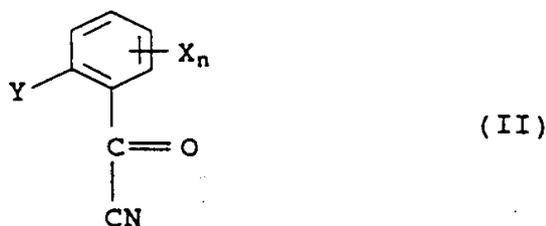
式中

X 代表硝基，三氟甲基，卤素， C_1 - C_4 -烷基或 C_1 - C_4 烷氧基，

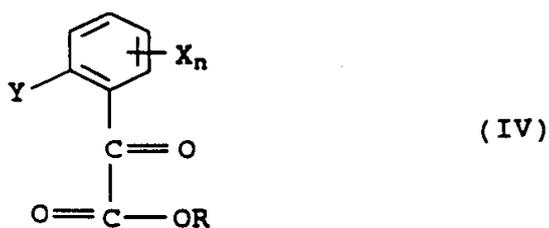
n 代表 0 或整数 1 至 4，其中当 $n > 1$ 时，X 基团可以不同，以及

Y 代表 C-有机基团，

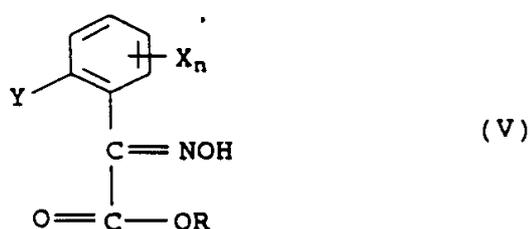
该方法为使式 II 酰基氟



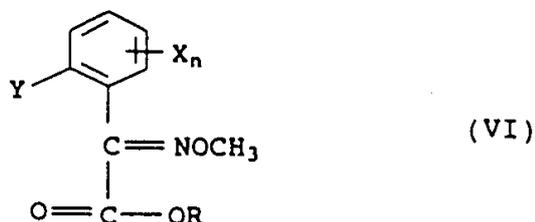
与醇进行 Pinner 反应，随后使 Pinner 反应中形成的式 IV 酯进行下述反应：



a) 与羟胺反应生成式 V 脞:



甲基化 V, 得式 VI 脞醚:



或者

b) 与 O-甲基羟胺反应得到式 VI 脞醚,

并接着将 VI 与甲胺反应, 所述方法包括在 Pinner 反应中使用式 III 醇, 其沸点高于 75 °C:



此方法基本上是以以下事实为基础的: 在 Pinner 反应中使用相对高沸点醇, 从而形成同样具有较差挥发性的 α -酮酯。由此使得所要产物与不希望的副产物之间的沸点范围加大并可能通过蒸馏分离。当使用相对高沸点的醇时, 副产物的形成也被减少, 以至能够以较高选择性和较高产率得到

所要产物。

在本发明方法中，一般采用在 $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ 至 $150\text{ }^{\circ}\text{C}$ ，优选 $20\text{ }^{\circ}\text{C}$ 至 $130\text{ }^{\circ}\text{C}$ ，尤其是在 $50\text{ }^{\circ}\text{C}$ 至 $110\text{ }^{\circ}\text{C}$ 下，用酰基氯 II 处理含醇、酸，和如果需要，惰性溶剂的混合物这一步骤。

所有常压下沸点高于 $75\text{ }^{\circ}\text{C}$ ，优选高于 $90\text{ }^{\circ}\text{C}$ ，尤其是高于 $120\text{ }^{\circ}\text{C}$ 的醇基本上都适合本发明。此类醇的实例有乙醇，正-丙醇，异丙醇，正丁醇，仲丁醇，异丁醇，叔丁醇，正戊醇及其异构体，正己醇及其异构体，庚醇，辛醇，壬醇或癸醇和各自的异构卤代醇如 2-氯乙醇，3-氯丙醇，4-氯丁醇，5-氯戊醇，6-氯己醇，7-氯庚醇，8-氯辛醇或 9-氯壬醇及其各自异构体，以及还有烷氧基链烷醇如 2-甲氧基乙醇，2-乙氧基乙醇，3-甲氧基丙醇，3-乙氧基丙醇，4-甲氧基丁醇，4-乙氧基丁醇，5-甲氧基戊醇，5-乙氧基戊醇，6-甲氧基己醇，6-乙氧基己醇，7-甲氧基庚醇，7-乙氧基庚醇，8-甲氧基辛醇，8-乙氧基辛醇，9-甲氧基壬醇或 9-乙氧基壬醇及其各自异构体。

特别优选乙醇，1-丙醇，2-丙醇，1-丁醇，2-丁醇，2-甲基-1-丙醇，1-戊醇，2-戊醇，3-戊醇，3-甲基-1-丁醇，2，2-二甲基-1-丙醇，1-甲基-2-丁醇，2-甲基-1-丁醇，3-甲基-2-丁醇，1-己醇，2-甲氧基乙醇，2-乙氧基乙醇，3-辛醇，1-庚醇，1-辛醇和 2-氯乙醇，更特别优选正戊醇。

对本发明方法而言，所用的醇的量并不重要。一般来讲，使用每摩尔酰基氯 II，则可使用 1 至 10 摩尔 III，优选使用 1 至 5 摩尔 III，尤其是 1 至 3 摩尔 III。醇也可用做溶剂。在这种情况下，每摩尔酰基氯 II 使用至少 20 摩尔过量，优选至少 10 摩尔过量，尤其是至少 5 摩尔过量醇。

根据文献，所有可用于 Pinner 反应的无机或有机酸均可用做酸。优选使用无机酸（如，硫酸和磷酸，特别是氢卤酸如氢氯酸和氢溴酸）。

所用酸的量相对于每摩尔酰基氯 II，一般为 1 至 5 摩尔过量，优选 2 至 5 摩尔过量，尤其是 2.5 摩尔至 3.5 摩尔过量。

适宜的惰性溶剂为非质子传递极性或非极性有机溶剂，例如烃类（如戊烷，己烷，环己烷，石油醚），芳烃溶剂（如苯，甲苯，邻-，间-或对-二甲苯，氯苯，硝基苯和苯甲醚），卤代烃（如二氯甲烷，三氯甲烷，四氯甲烷和 2，2¹-二氯乙烷）和醚类（如乙醚，二异丙醚，叔丁基甲基醚，

四氢呋喃，四氢吡喃，二恶烷或苯甲醚)，或上述溶剂混合物。

Pinner 反应优选在水存在下进行，通常所用的水量为每摩尔酰基氟 0.5 至 1.5 摩尔。

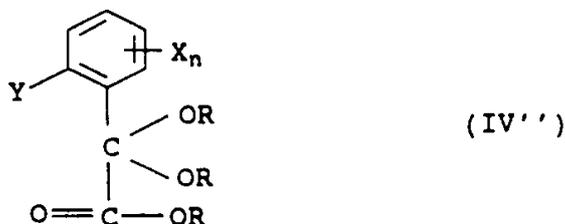
惰性溶剂的量对本发明的方法并不重要。一般使用占酰基氟 II 重量 2% 至 40% 重量溶剂。

反应通常是在大气压下或在相应的反应混合物的自压力下进行。也可以在高或低压下进行，但在这种情况下一般不会带来任何更多优点。

反应混合物按常规方式处理，例如与水混合，分离各相，并且如果需要，通过色谱法纯化粗产物。在有些情况下中间体和最终产物以无色或稍微带棕色的粘性油形式得到，它们在减压和适当升高的温度下与挥发性组分分离或被纯化（如果需要采用预蒸馏方法）。如果中间体和最终产物以固体形式得到，纯化也可通过重结晶或浸提方式实施。

反应所需的酰基氟可通过如 DE-A4223382，EP-A-493711，EP-A-564984 以及 DE-A-4311722 中所述的方法由相应的 2-苯并[c]呋喃酮制得。由此本发明还包括这些说明书所公开得内容。

在本发明的方法中，迄今仍不可能观察到式 IV'' 缩酮酯的形成：



尽管如此，但如果有时候这些缩酮 IV'' 以副产物存在，这些副产物 IV'' 无论如何也不会干扰用于合成化合物 I 的酮酯 IV 的进一步用途，因为它们在接受反应的反应条件下将被解离且又被反应。然而，如果需要，酮羧酸酯酮缩二烷基醇 IV'' 也可以在酸性条件下，例如在惰性溶剂存在下在氢氟酸中转化成酮酯 IV。

此外，Pinner 反应中也可能形成相应的 α -酮羧酰胺 IV'。如果 α -酮羧酰胺 IV' 是不需要的，适宜的方法是将粗产物混合物再次进行 Pinner 反应，即如果需要进行数次，从而将 α -酮羧酰胺 IV' 转化成酮酯 IV。较之已知方

法，本发明方法形成的式 IV' 副产物的量相当低。

然而， α -酮酸酰胺 IV' 的醇解也可以采用独立的方法步骤进行，例如通过酸和醇 R-OH 处理，如果需要，在稀释剂存在下进行，稀释剂如烃类如甲苯，卤代烃如二氯甲烷，三氯甲烷或四氯化碳或醚如乙醚，二甘醇，四氢呋喃或二噁烷。适宜的酸包括，无机酸诸如例如盐酸，硫酸或磷酸，羧酸如乙酸或三氟乙酸，或磺酸如对-甲苯磺酸。优选的酸为硫酸，特别是其浓水溶液，和氢氟酸，该酸特别优选以气体通入。

脲 VI 的形成可通过酮酯 IV 或 α -酮羧酰胺 IV' 与 O-甲基羟胺或其任一种酸加成物反应进行。此外这些化合物的混合物也适宜作为起始物，同样 Pinner 反应所得到的粗产物混合物毋需进一步纯化而用于进一步反应也是可能的。

O-甲基羟胺或以酸加成盐形式或以游离碱形式使用，通过加入强碱从盐中释出未质子化化合物也是可能的。O-甲基羟胺的适宜盐包括与一元至三元酸如尤其是盐酸和硫酸形成的盐。优选使用酸加成盐。

一般说来，反应是在溶剂或稀释剂存在下进行。适宜的溶剂优选芳烃如苯，甲苯和邻-，间-或对-二甲苯，氯化烃如二氯甲烷，醇类如甲醇，乙醇，正-丙醇，正-戊醇，正-丁醇，3-甲基-1-丁醇或正-己醇和醚如二噁烷，四氢呋喃和乙醚。特别优选甲醇，乙醇或正-戊醇。

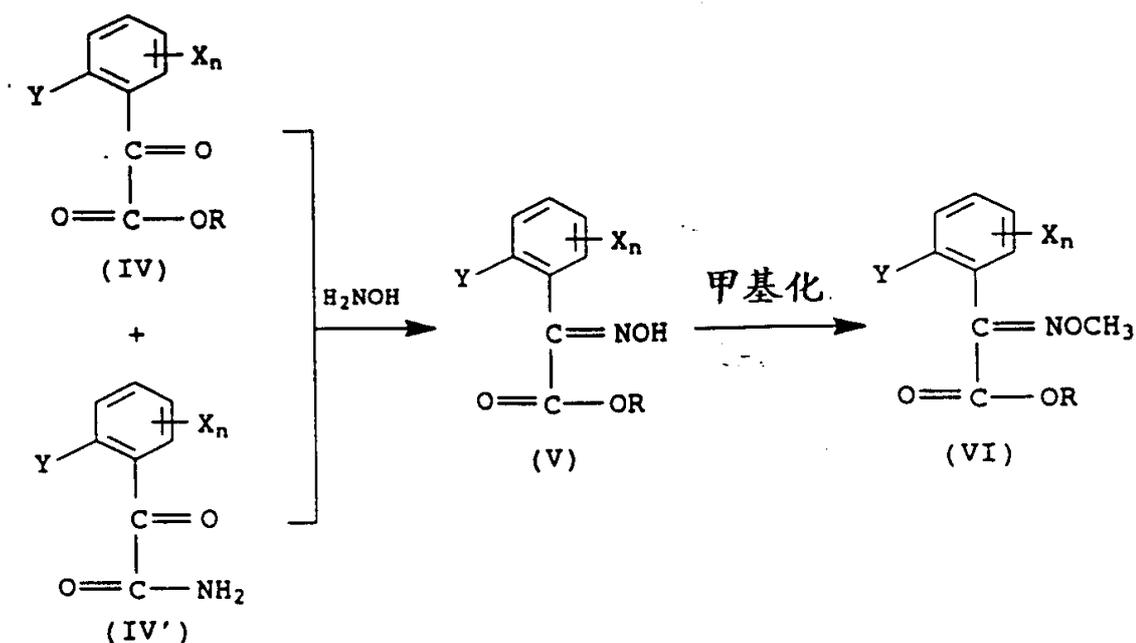
原料的用量比并不重要；较适宜使用化学计算量原料化合物，如果一种或另一种组分过量，如过量 10mol%，未被推荐。

反应温度一般为 0℃ 至 100℃，优选 20 至 80℃。

尤其是如果另外采用酰胺 IV' 作为原料时，反应应当在醇 R-OH 存在下进行。

一种方法变型包括将由 Pinner 反应得到的粗混合物（毋需从反应混合物中分离出）与 O-甲基羟胺或其一种酸加成盐反应。

该方法的另一种替换方法是，将酮酯 IV 或 α -酮羧酰胺 IV' 或化合物 IV 和 IV' 的混合物与羟胺或其一种酸加成物反应，得到脲 V 且随后用甲基化剂处理此产物，如果需要在碱和合适的溶剂存在下进行。



在此情况下，羟胺或以酸加成盐形式或以游离碱形式使用，通过加入强碱从盐中释出未质子化化合物也是可能的。羟胺的适宜盐包括与一元-至三元酸如尤其是盐酸和硫酸形成的盐。优选使用酸加成盐。

肟的形成是例如在溶剂或稀释剂存在下进行的。适宜的溶剂优选芳烃如苯，甲苯和邻-，间-或对-二甲苯，氯化烃如二氯甲烷，醇类如甲醇，乙醇，正-丙醇，正-戊醇，正-丁醇，3-甲基-1-丁醇和正-己醇。特别优选甲醇，乙醇或正-戊醇。

原料的用量比并不重要；较适宜使用化学计算量原料化合物，如果一种或另一种组分过量，如过量10mol%，未被推荐。

反应温度一般为0℃至100℃，优选20至80℃。如果另外采用酰胺IV'作为原料时，反应必须在醇R-OH存在下进行。一种方法变型包括将由Pinner反应得到的粗混合物（毋需从反应混合物中分离出）与羟胺或其一种酸加成盐反应。

甲基化作用可以通过例如下述方式进行：在稀释剂存在下采用碱使肟V转化成相应的盐，并将此盐与甲基化剂反应。在这种情况下，肟盐可以在与甲基化剂反应之前分离出或者也可直接进一步反应。

优选的碱为氢氧化钾，氢氧化钠，碳酸钾，碳酸钠，甲醇钠，乙醇钠，正戊醇钠和叔丁醇钾。

适宜的甲基化剂为甲基卤化物，尤其是氯代甲烷或者为硫酸二甲酯。

既可用于胍盐形成又可用于甲基化作用的有机稀释剂为溶剂，例如，丙酮，二噁烷，四氢呋喃，醇类如甲醇，乙醇，正丙醇或正戊醇；亚砷如二甲亚砷，二乙基亚砷，二甲砷，二乙砷，甲基乙基砷，环丁砷，腈如乙腈，苄腈，丁腈，异丁腈，间-氯苄腈；N,N-二取代羧酰胺如二甲基甲酰胺，四甲基脲，N,N-二甲基苯甲酰胺，N,N-二甲基乙酰胺，N,N-二甲基苯基乙酰胺，N,N-二甲基环己烷羧酰胺，N,N-二甲基丙酰胺和同系羧酸的N-酰基哌啶，羧酸的N-酰基吗啉或羧酸的N-酰基吡咯烷；相应的N,N-二乙基，N,N-二丙基，N,N-二异丙基，N,N-二异丁基，N,N-二苄基，N,N-二苯基，N-甲基-N-苯基，N-环己基-N-甲基或N-乙基-N-叔丁基化合物，N-甲基甲酰胺，N-乙基吡咯烷酮，N-丁基吡咯烷酮，N-乙基-6-哌啶酮，N-甲基吡咯烷酮；六甲基磷酰胺；以及适当的混合物。优选二甲基乙酰胺，N-甲基吡咯烷酮，二甲基甲酰胺，二甲亚砷和环丁砷。特别优选N-甲基吡咯烷酮和二甲基甲酰胺。

胍 V 转化成其阴离子的反应以及随后的甲基化作用一般在-20 至 100 °C，优选 0 至 80 °C，尤其是在 20 至 80 °C 下进行。

胍 V，碱和烷基化剂以化学计算量使用或者使用过量碱和烷基化剂，每摩尔胍 V 优选使用 1.05 至 1.5 摩尔烷基化剂和 1 至 1.5 摩尔碱。

一种方法变型在于不移出稀释剂而使胍盐进一步反应。

通常胍醚 VI 以异构体混合物形式得到，胍键 ($C=NOCH_3$) 部分以 E 构型以及部分以 Z 构型存在。如果需要，在有机稀释剂中用催化剂（优选酸）处理 VI 异构体混合物，能够使胍醚重排成 E 构型。

适宜的溶剂优选为丙酮，芳烃如苯，甲苯和邻-，间-或对-二甲苯，氯化烃如二氯甲烷，醇类如甲醇，乙醇，正-丙醇，正-丁醇，正-戊醇，3-甲基-1-丁醇和正-己醇，醚如乙醚，二噁烷，四氢呋喃，叔丁基甲基醚和二异丙基醚，亚砷如二甲亚砷，二乙基亚砷，二甲砷，二乙砷，甲基乙基砷，环丁砷；腈如乙腈，苄腈，丁腈，异丁腈，间-氯苄腈；N,N-二取代羧酰胺如二甲基甲酰胺，四甲基脲，N,N-二甲基苯甲酰胺，N,N-二甲基乙酰胺，

N,N-二甲基苯基乙酰胺, N,N-二甲基环己烷羧酰胺, N,N-二甲基丙酰胺和同系羧酸的 N-酰基哌啶, 羧酸的 N-酰基吗啉或羧酸的 N-酰基吡咯烷; 相应的 N,N-二乙基, N,N-二丙基, N,N-二异丙基, N,N-二异丁基, N,N-二苄基, N,N-二苯基, N-甲基-N-苯基, N-环己基-N-甲基和 N-乙基-N-叔丁基化合物, N-甲基甲酰苯胺, N-乙基吡咯烷酮, N-丁基吡咯烷酮, N-乙基-6-哌啶酮, N-甲基吡咯烷酮; 六甲基磷酰胺; 和适当的混合物以及与水的混合物。

特别优选甲醇, 乙醇, 正戊醇, 甲苯和乙醚。

适宜的酸尤指无机酸, 例如高氯酸, 硫酸, 磷酸和氢卤酸如氢氯酸, 脂族磺酸如三氟甲磺酸, 芳族磺酸如对-甲苯磺酸, 以及卤代链烷羧酸如三氟乙酸。特别优选氯化氢气体。

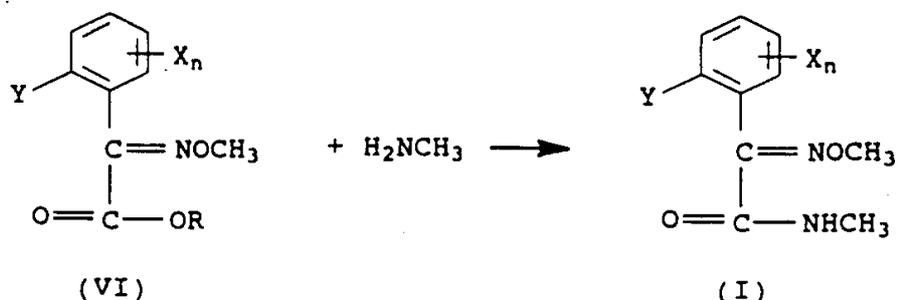
按异构体混合物 VI 的量计, 一般使用 0.01 倍至 10 倍, 尤其是 0.01 至 5 倍摩尔量酸。

异构化反应温度一般为 -20 至 100 °C, 尤为 0 至 80 °C。

脞醚的重排需要一定时间, 这主要取决于反应温度以及尤其是使用酸的量, 例如反应 1 至 90 小时, 优选 2 至 10 小时。

在可能的异构化步骤之前, 脞醚 VI 形成后的粗溶液可以先浓缩或者进一步被稀释。一种优选的变型方法在于脞醚形成后得到的粗溶液不需进一步浓缩或稀释而直接用酸处理。

如此得到的脞醚 VI 然后用甲胺处理转化成相应的 α -甲氧基亚氨基羧酸甲酰胺 I。



反应按本领域已知的方式在惰性有机溶剂中于 0 至 100 °C, 优选 10 至

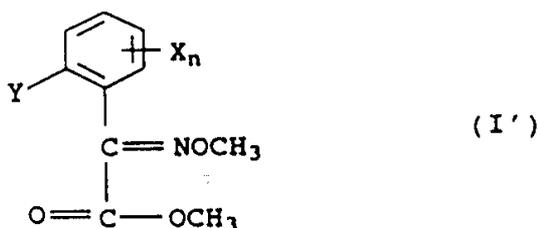
70 °C 下进行。

具体讲，所用溶剂为乙腈，四氢呋喃，二恶烷，甲醇，乙醇，正戊醇，N-甲基吡咯烷酮，二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和二甲基亚砷。

通常使用过量甲胺，甲胺或以气体形式通入到反应混合物内或者以甲胺的水或醇溶液形式处理反应混合物。

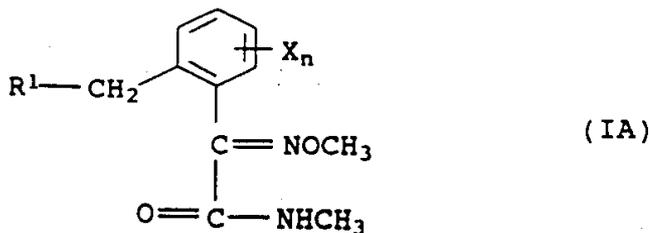
当制备过程中相对于基团 $C=NOCH_3$ 的双键，酰胺 I 以异构体混合物形式形成时，如果需要，它们可按照有关脞醚 VI 所述的方法用酸处理转化成相应的 E 异构体。

如果以本领域共知的方式将式 VI 脞醚进行酯基转移作用 (Houben-Weyl, Vol.E5, p.702-707; 四面体 42 (1986), 6719), 则本发明方法还适于制备式 I' α -甲氧基亚氨基羧酸甲酯:



一般说来，酯基转移作用按下所述方式进行：将粗产物吸收于过量甲醇内并按照已知方式或通过加入无机酸或通过加入碱（如甲醇钠）进行酯基转移作用。

本发明方法另外还特别适于制备式 IA α -甲氧基亚氨基羧酸甲基酰胺:

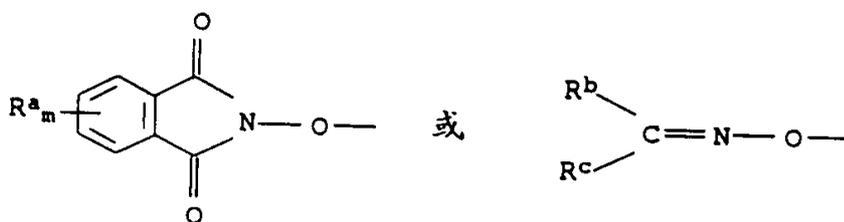


式中各取代基和符号具有下述含义:

X 代表硝基, 三氟甲基, 卤素, C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 烷氧基,

n 代表 0 或整数 1 至 4, 其中当 $n > 1$ 时, X 基团可以不同,

R^1 代表氢, 羟基, 巯基, 氰基, 硝基, 卤素, 未取代的或取代的烷基磺酰基, 未取代的或取代的烷基磺酰氧基, 未取代的或取代的环烷基, 未取代的或取代的芳氧基, 未取代的或取代的芳基磺酰基, 未取代或取代的芳基磺酰氧基, 未取代的或取代的杂环基或未取代的或取代的杂芳氧基,



R^a 代表氰基, 硝基, 卤素, C_1-C_4 -烷基, C_1-C_4 -卤代烷基, C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基,

m 代表 0 或整数 1 至 4, 其中当 $m > 1$ 时, R^a 基团可以不同,

R^b 代表氢, 未取代的或取代的烷基, 环烷基, 链烯基, 环烯基, 炔基, 杂环基, 烷基羰基, 环烷基羰基, 链烯基羰基, 炔基羰基, 杂环基羰基, 烷氧基羰基, 芳基, 杂芳基, 芳基羰基, 杂芳基羰基, 芳基磺酰基, 杂芳基磺酰基或 $C(R')=NOR''$ 基团;

R' 代表氢, 羟基, 氰基, 硝基, 氨基, 卤素,

未取代的或取代的烷基, 烷氧基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 链烯基, 链烯氧基, 链烯硫基, 链烯基氨基, 炔基, 炔氧基, 炔硫基, 炔基氨基, 环烷基, 环烷氧基, 环烷硫基, 环烷基氨基, 环烯基, 环烯氧基, 环烯硫基, 环烯基氨基, 杂环基, 杂环氧基, 杂环基硫基, 杂环基氨基, 芳基, 芳氧基, 芳硫基, 芳基氨基, 杂芳基, 杂芳氧基, 杂芳硫基或杂芳

基氨基;

R''代表氢,

未取代的或取代的烷基, 环烷基, 链烯基, 炔基, 杂环基, 芳基或杂芳基,

R^c代表 R^b 中所述基团或者代表

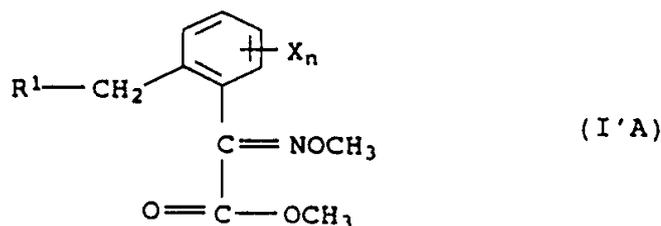
羟基, 氰基, 硝基, 氨基, 卤素,

未取代的或取代的烷氧基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 芳氧基, 芳硫基, 芳基氨基, 杂芳氧基, 杂芳硫基或杂芳基氨基;

或者 R^b 和 R^c 与它们所键合的碳原子一同表示碳环或杂环环。

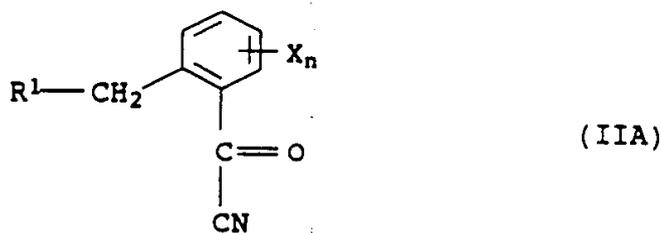
根据本发明一开始所引用的文献, 已知此类化合物用作防治有害真菌的活性化合物。

另外, 本发明方法还适于制备式 I'A α -甲氧基亚氨基羧酸甲酯:

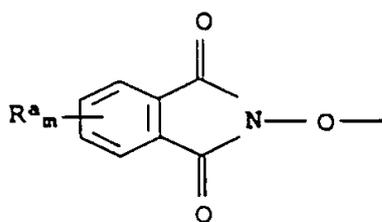


其中各取代基和符号的定义同上化合物 IA 中所述。此类化合物公开于下列文献中并用于防治有害真菌: EP-A253213, EP-A254426, EP-A363818, EP-A378308, EP-A385224, EP-A386561, EP-A400417, EP-A407873, EP - A 460 575, EP-A463488, EP-A472300, WO-A94/00436 和德国专利申请 4421180. 5号。

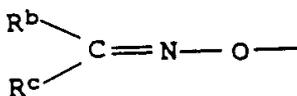
因此, 特别优选式 IIA 化合物作为起始物质:



对于文献中所公开的活性化合物的制备，不管是采用那些其中 R^1 代表氢，羟基，巯基，氰基，硝基，未取代的或取代的烷基磺酰氧基，未取代的或取代的芳基磺酰氧基或卤素的化合物，还是采用那些其中 R^1 代表未取代的或取代的烷基磺酰基，未取代的或取代的环烷基，未取代的或取代的芳氧基，未取代的或取代的芳基磺酰基，未取代的或取代的杂环基或未取代的或取代的杂芳氧基，
下式羟基苯二酰亚氨基：



或氧亚氨基：



的化合物作为化合物 IIA 并不重要。上述第一组中所述的基团 R^1 优选按照文献中所述方法，在 IV 和 V 阶段，尤其是在 VI 和 I 阶段转化成第二组取代基，由此本发明还包括所引用的文章的相关资料。

在上述各式所给出的定义和符号中，所用的各术语一般表示下述含义取代基：

卤素：氟，氯，溴和碘；

烷基：具有 1 至 4、6 或 10 个碳原子的饱和的直链或支链烃基，如 C_1 至 C_6 -烷基如甲基，乙基，丙基，1-甲基乙基，丁基，1-甲基丙基，2-甲基丙基，1，1-二甲基乙基，戊基，1-甲基丁基，2-甲基丁基，3-甲基丁基，2，2-二甲基丙基，1-乙基丙基，己基，1，1-二甲基丙基，1，2-二甲基丙基，1-甲基戊基，2-甲基戊基，3-甲基戊基，4-甲基戊基，1，1-二甲基丁基，1，2-二甲基丁基，1，3-二甲基丁基，2，2-二甲基丁基，2，3-二甲基丁基，3，3-二甲基丁基，1-乙基丁基，2-乙基丁基，1，1，2-三甲基丙基，1，2，2-三甲基丙基，1-乙基-1-甲基丙基和 1-乙基-2-甲基丙基；

烷基羰基：具有 1 至 10 个碳原子的直链或支链烷基（如上所述），此烷基通过羰基（ $-\text{CO}-$ ）与结构键合；

烷基磺酰氧基：具有 1 至 10 个碳原子的直链或支链烷基（如上所述），此烷基通过磺酰氧基（ $-\text{SO}_2-\text{O}-$ ）与结构键合；

卤代烷基：具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链烷基（如上所述），这些基团中的氢原子可能部分或全部被卤原子（如上所述）取代，象 C_1 - C_2 卤代烷基，如氟甲基，二氟甲基，三氟甲基，氯甲基，二氯甲基，三氯甲基，氟氯代甲基，二氟氯代甲基，氯二氟代甲基，1-氟乙基，2-氟乙基，2，2-二氟乙基，2，2，2-三氟乙基，2-氯-2-氟乙基，2-氯-2，2-二氟乙基，2，2-二氯-2-氟乙基，2，2，2-三氯乙基和五氟乙基；

烷氧基：具有 1 至 4 或 10 个碳原子的直链或支链烷基（如上所述），此烷基通过氧原子（ $-\text{O}-$ ）与结构键合；

烷氧羰基：具有 1 至 10 个碳原子的直链或支链烷氧基（如上所述），此烷氧基通过羰基（ $-\text{CO}-$ ）与结构键合；

卤代烷氧基：具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链卤代烷基（如上所述），此基团通过氧原子（ $-\text{O}-$ ）与结构键合；

烷基硫基：具有 1 至 10 个碳原子的直链或支链烷基（如上所述），此烷基通过硫原子（ $-\text{S}-$ ）与结构键合；

烷基氨基：具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链烷基（如上所述），此烷基通过氨基（ $-\text{NH}-$ ）与结构键合；

二烷基氨基: 两个具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链烷基(如上所述), 它们彼此独立并通过氮原子 (-N:) 与结构键合;

链烯基: 具有 2 至 10 个碳原子且在任何希望位置含有双键的不饱和直链或支链烃基, 如 C₂-C₆-链烯基如乙烯基, 1-丙烯基, 2-丙烯基, 1-甲基乙烯基, 1-丁烯基, 2-丁烯基, 3-丁烯基, 1-甲基-1-丙烯基, 2-甲基-1-丙烯基, 1-甲基-2-丙烯基, 2-甲基-2-丙烯基, 1-戊烯基, 2-戊烯基, 3-戊烯基, 4-戊烯基, 1-甲基-1-丁烯基, 2-甲基-1-丁烯基, 3-甲基-1-丁烯基, 1-甲基-2-丁烯基, 2-甲基-2-丁烯基, 3-甲基-2-丁烯基, 1-甲基-3-丁烯基, 2-甲基-3-丁烯基, 3-甲基-3-丁烯基, 1, 1-二甲基-2-丙烯基, 1, 2-二甲基-1-丙烯基, 1, 2-二甲基-2-丙烯基, 1-乙基-1-丙烯基, 1-乙基-2-丙烯基, 1-己烯基, 2-己烯基, 3-己烯基, 4-己烯基, 5-己烯基, 1-甲基-1-戊烯基, 2-甲基-1-戊烯基, 3-甲基-1-戊烯基, 4-甲基-1-戊烯基, 1-甲基-2-戊烯基, 2-甲基-2-戊烯基, 3-甲基-2-戊烯基, 4-甲基-2-戊烯基, 1-甲基-3-戊烯基, 2-甲基-3-戊烯基, 3-甲基-3-戊烯基, 4-甲基-3-戊烯基, 1-甲基-4-戊烯基, 2-甲基-4-戊烯基, 3-甲基-4-戊烯基, 4-甲基-4-戊烯基, 1, 1-二甲基-2-丁烯基, 1, 1-二甲基-3-丁烯基, 1, 2-二甲基-1-丁烯基, 1, 2-二甲基-2-丁烯基, 1, 2-二甲基-3-丁烯基, 1, 3-二甲基-1-丁烯基, 1, 3-二甲基-2-丁烯基, 1, 3-二甲基-3-丁烯基, 2, 2-二甲基-3-丁烯基, 2, 3-二甲基-1-丁烯基, 2, 3-二甲基-2-丁烯基, 2, 3-二甲基-3-丁烯基, 3, 3-二甲基-1-丁烯基, 3, 3-二甲基-2-丁烯基, 1-乙基-1-丁烯基, 1-乙基-2-丁烯基, 1-乙基-3-丁烯基, 2-乙基-1-丁烯基, 2-乙基-2-丁烯基, 2-乙基-3-丁烯基, 1, 1, 2-三甲基-2-丙烯基, 1-乙基-1-甲基-2-丙烯基, 1-乙基-2-甲基-1-丙烯基和 1-乙基-2-甲基-2-丙烯基;

链烯氧基: 具有 2 或 3 至 6 或 10 个碳原子且在任何希望位置含有双键的不饱和直链或支链烃基(如上所述), 此烃基通过氧原子 (-O-) 与结构键合;

链烯硫基: 具有 2 或 3 至 6 或 10 个碳原子且在任何希望位置含有双键的不饱和直链或支链烃基(如上所述), 此烃基通过硫原子 (-S-) 与结构键合;

链烯基氨基: 具有 2 或 3 至 6 或 10 个碳原子且在任何希望位置含有双

键的不饱和直链或支链烃基（如上所述），此烃基通过氨基（-NH-）与结构键合；

链烯基羰基：具有2至10个碳原子且在任何希望位置含有双键的不饱和直链或支链烃基（如上所述），此烃基通过羰基（-CO-）与结构键合；

炔基：具有2至10个碳原子且在任何希望位置含有三键的不饱和直链或支链烃基，如C₂-C₆-炔基如乙炔基，1-丙炔基，2-丙炔基，1-丁炔基，2-丁炔基，3-丁炔基，1-甲基-2-丙炔基，1-戊炔基，2-戊炔基，3-戊炔基，4-戊炔基，1-甲基-2-丁炔基，1-甲基-3-丁炔基，2-甲基-3-丁炔基，3-甲基-1-丁炔基，1，1-二甲基-2-丙炔基，1-乙基-2-丙炔基，1-己炔基，2-己炔基，3-己炔基，4-己炔基，5-己炔基，1-甲基-2-戊炔基，1-甲基-3-戊炔基，1-甲基-4-戊炔基，2-甲基-3-戊炔基，2-甲基-4-戊炔基，3-甲基-1-戊炔基，3-甲基-4-戊炔基，4-甲基-1-戊炔基，4-甲基-2-戊炔基，1，1-二甲基-2-丁炔基，1，1-二甲基-3-丁炔基，1，2-二甲基-3-丁炔基，2，2-二甲基-3-丁炔基，3，3-二甲基-1-丁炔基，1-乙基-2-丁炔基，1-乙基-3-丁炔基，2-乙基-3-丁炔基和1-乙基-1-甲基-2-丙炔基；

炔氧基：具有2或3至6或10个碳原子且在任何希望位置含有三键的不饱和直链或支链烃基（如上所述），此烃基通过氧原子（-O-）与结构键合；

炔硫基：具有2或3至6或10个碳原子且在任何希望位置含有三键的不饱和直链或支链烃基（如上所述），此烃基通过硫原子（-S-）与结构键合；

炔基氨基：具有2或3至6或10个碳原子且在任何希望位置含有三键的不饱和直链或支链烃基（如上所述），此烃基通过氨基（-NH-）与结构键合；

炔基羰基：具有2至10个碳原子且在任何希望位置含有三键的不饱和直链或支链烃基（如上所述），此烃基通过羰基（-CO-）与结构键合；

环烷基：具有3至12个碳环单元的单环烷基，如C₃-C₈-环烷基如环丙基，环丁基，环戊基，环己基，环庚基，和环辛基；

环烷氧基：具有3至6，8或12个碳环单元的单环烷基（如上所述），此环烷基通过氧原子（-O-）与结构键合；

环烷硫基: 具有 3 至 6, 8 或 12 个碳环单元的单环烷基(如上所述), 此环烷基通过硫原子 (-S-) 与结构键合;

环烷基氨基: 具有 3 至 6, 8 或 12 个碳环单元的单环烷基(如上所述), 此环烷基通过氨基 (-NH-) 与结构键合;

环烷基羰基: 具有 3 至 6, 8 或 12 个碳环单元的单环烷基(如上所述), 此环烷基通过羰基 (-CO-) 与结构键合;

环烯基: 具有 5 至 12 碳环单元且环中含有一或两个双键的单环烃, 如 C₃-C₈-环烯基如环丙烯基, 环丁烯基, 环戊烯基, 环己烯基, 环庚烯基, 环辛烯和环己二烯基;

环烯氧基: 具有 5 至 8 或 12 碳环单元和一或两个双键的单环环烯基(如上所述), 此环烯基通过氧原子 (-O-) 与结构键合;

环烯硫基: 具有 5 至 8 或 12 碳环单元和一或两个双键的单环环烯基(如上所述), 此环烯基通过硫原子 (-S-) 与结构键合;

环烯基氨基: 具有 3 至 8 或 12 碳环单元和一或两个双键的单环环烯基(如上所述), 此环烯基通过氨基 (-NH-) 与结构键合;

杂环基: 饱和或部分不饱和环状基团, 该基团除碳原子外还含有选自氧, 硫和氮的杂原子作为环原子: 如除碳环原子外还含有一至三个氮原子和/或氧或硫原子或一或两个氧和/或硫原子的、两个氧和/或硫原子的 5-或 6-节杂环(杂环基), 如 2-四氢呋喃基, 3-四氢呋喃基, 2-四氢噻吩基, 3-四氢噻吩基, 2-吡咯烷基, 3-吡咯烷基, 3-异噁唑烷基, 4-异噁唑烷基, 5-异噁唑烷基, 3-异噻唑烷基, 4-异噻唑烷基, 5-异噻唑烷基, 3-吡唑烷基, 4-吡唑烷基, 5-吡唑烷基, 2-恶唑烷基, 4-恶唑烷基, 5-恶唑烷基, 2-噻唑烷基, 4-噻唑烷基, 5-噻唑烷基, 2-咪唑烷基, 4-咪唑烷基, 1, 2, 4-恶二唑烷-3-基, 1, 2, 4-恶二唑烷-5-基, 1, 2, 4-噻二唑烷-3-基, 1, 2, 4-噻二唑烷-5-基, 1, 2, 4-三唑烷-3-基, 1, 3, 4-恶二唑烷-2-基, 1, 3, 4-噻二唑烷-2-基, 1, 3, 4-三唑烷-2-基, 2, 3-二氢呋喃-2-基, 2, 3-二氢呋喃-3-基, 2, 4-二氢呋喃-2-基, 2, 4-二氢呋喃-3-基, 2, 3-二氢噻吩-2-基, 2, 3-二氢噻吩-3-基, 2, 4-二氢噻吩-2-基, 2, 3-二氢吡咯-2-基, 2, 3-二氢吡咯-3-基, 2, 4-二氢吡咯-2-基, 2, 4-二氢吡咯-3-基, 2, 3-

异噁唑啉-3-基, 3, 4-异噁唑啉-3-基, 4, 5-异噁唑啉-3-基, 2, 3-异噁唑啉-4-基, 3, 4-异噁唑啉-4-基, 4, 5-异噁唑啉-4-基, 2, 3-异噁唑啉-5-基, 3, 4-异噁唑啉-5-基, 4, 5-异噁唑啉-5-基, 2, 3-异噻唑啉-3-基, 3, 4-异噻唑啉-3-基, 4, 5-异噻唑啉-3-基, 2, 3-异噻唑啉-4-基, 3, 4-异噻唑啉-4-基, 4, 5-异噻唑啉-4-基, 2, 3-异噻唑啉-5-基, 3, 4-异噻唑啉-5-基, 4, 5-异噻唑啉-5-基, 2, 3-二氢化吡唑-1-基, 2, 3-二氢化吡唑-2-基, 2, 3-二氢化吡唑-3-基, 2, 3-二氢化吡唑-4-基, 2, 3-二氢化吡唑-5-基, 3, 4-二氢化吡唑-1-基, 3, 4-二氢化吡唑-3-基, 3, 4-二氢化吡唑-4-基, 3, 4-二氢化吡唑-5-基, 4, 5-二氢化吡唑-1-基, 4, 5-二氢化吡唑-3-基, 4, 5-二氢化吡唑-4-基, 4, 5-二氢化吡唑-5-基, 2, 3-二氢化噁唑-2-基, 2, 3-二氢化噁唑-3-基, 2, 3-二氢化噁唑-4-基, 2, 3-二氢化噁唑-5-基, 3, 4-二氢化噁唑-2-基, 3, 4-二氢化噁唑-3-基, 3, 4-二氢化噁唑-4-基, 3, 4-二氢化噁唑-5-基, 3, 4-二氢化噁唑-2-基, 3, 4-二氢化噁唑-3-基, 3, 4-二氢化噁唑-4-基, 2-哌啶基, 3-哌啶基, 4-哌啶基, 1, 3-二恶烷-5-基, 2-四氢吡喃基, 4-四氢吡喃基, 2-四氢噻吩基, 3-四氢吡嗪基, 4-四氢吡嗪基, 2-四氢嘧啶基, 4-四氢嘧啶基, 5-四氢嘧啶基, 2-四氢吡嗪基, 1, 3, 5-四氢三嗪-2-基和1, 2, 4-四氢三嗪-3-基, 特别优选1-吡咯烷基, 1-吡唑烷基, 1-咪唑烷基, 2-异噁唑烷基, 3-噁唑烷基, 2-异噻唑烷基, 3-噻唑烷基, 2, 3-二氢化吡咯-1-基, 2, 5-二氢化吡咯-1-基, 2, 3-二氢化吡唑-1-基, 4, 5-二氢化吡唑-1-基, 2, 3-二氢化咪唑-1-基, 4, 5-二氢化咪唑-1-基, 2, 3-二氢化异噁唑-2-基, 2, 3-二氢化噁唑-3-基, 2, 3-二氢化异噻唑-2-基, 2, 3-二氢化噻唑-3-基, 哌啶-1-基, 吗啉-1-基和吡嗪-1-基。

杂环氧基: 饱和或部分不饱和环状基团, 该基团除碳原子外还含有选自氧, 硫和氮的杂原子作为环原子(如上所述): 此环状基团通过氧原子(-O-)与结构键合;

杂环硫基: 饱和或部分不饱和环状基团, 该基团除碳原子外还含有选自氧, 硫和氮的杂原子作为环原子(如上所述): 此环状基团通过硫原子(-S-)与结构键合;

杂环基氨基: 饱和或部分不饱和环状基团, 该基团除碳原子外还含有

选自氧, 硫和氮的杂原子作为环原子(如上所述): 此环状基团通过氨基(-NH-)与结构键合;

芳基或芳氧基, 芳硫基, 芳基氨基, 芳基羰基, 芳基磺酰基和芳基磺酰氧基: 直接或通过氧原子(-O-) (芳氧基) 或硫原子(-S-) (芳硫基), 氨基(-NH-) (芳基氨基), 羰基(-CO-) (芳基羰基), 磺酰基(-SO₂) (芳基磺酰基) 或通过磺酰氧基(-SO₂-O-) (芳基磺酰氧基) 与结构键合的芳香单-或多环烃基, 如苯基, 萘基和菲基或苯氧基, 萘氧基和菲氧基以及相应的硫基-, 羰基-, 磺酰基-, 磺酰氧基-的基团;

杂芳基或杂芳氧基, 杂芳硫基, 杂芳基氨基, 杂芳基羰基和杂芳基磺酰基: 芳香单-或多环基, 除碳原子外, 它们另外还含有一至四个氮原子或一至三个氮原子和一个氧或硫原子或含有一个氧或硫原子并且它们直接或通过氧原子(-O-) (杂芳氧基) 或硫原子(-S-) (杂芳硫基)、氨基(-NH-) (杂芳基氨基)、羰基(-CO-) (杂芳基羰基) 或通过磺酰基(-SO₂) (杂芳基磺酰基) 与结构键合, 如:

-- 含有一至三个氮原子的 5-节杂芳基: 除碳原子外可含有一至三个氮原子作为环原子的 5-节环杂芳基, 如 2-吡咯基, 3-吡咯基, 3-吡唑基, 4-吡唑基, 5-吡唑基, 2-咪唑基, 4-咪唑基, 1, 2, 4-三唑-3-基和 1, 3, 4-三唑-2-基;

-- 含有一至四个氮原子或一至三个氮原子和一个氧或硫原子或含有一个氧或硫原子的 5-节杂芳基: 除碳原子外可含有一至四个或三个氮原子和一个氧或硫原子或含有一个氧或硫原子作为环原子的 5-节环杂芳基, 如 2-咪唑基, 3-咪唑基, 2-噻吩基, 3-噻吩基, 2-吡咯基, 3-吡咯基, 3-异恶唑基, 4-异恶唑基, 5-异恶唑基, 3-异噻唑基, 4-异噻唑基, 5-异噻唑基, 3-吡唑基, 4-吡唑基, 5-吡唑基, 2-恶唑基, 4-恶唑基, 5-恶唑基, 2-噻唑基, 4-噻唑基, 5-噻唑基, 2-咪唑基, 4-咪唑基, 1, 2, 4-恶二唑-3-基, 1, 2, 4-恶二唑-5-基, 1, 2, 4-噻二唑-3-基, 1, 2, 4-噻二唑-5-基, 1, 2, 4-三唑-3-基, 1, 3, 4-恶二唑-2-基, 1, 3, 4-噻二唑-2-基, 1, 3, 4-三唑-2-基;

-- 含有一至四个氮原子或一至三个氮原子和/或一个氧或硫原子的稠合 5-节杂芳基: 5-节环杂芳基, 此杂芳基除碳原子外可含有一至四个氮原子或

一至三个氮原子和一个硫或氧原子或一个氧或硫原子作为环原子，且其中两个相邻碳环原子或一个氮原子和一个相邻碳环原子可桥连构成芳香或杂芳香二环或多环，如苯并呋喃基，异苯并呋喃基，苯并噻吩基，异苯并噻吩基，吲哚基，异吲哚基，苯并异恶唑基，苯并恶唑基，苯并异噻唑基，苯并噻唑基，吲唑基，苯并咪唑基，吡咯并吡啶基，吡咯并哒嗪基，吡咯并嘧啶基，吡咯并吡嗪基，吡咯并三嗪基，呋喃并吡啶基，呋喃并哒嗪基，呋喃并嘧啶基，呋喃并吡嗪基，呋喃并三嗪基，噻吩并吡啶基，噻吩并哒嗪基，噻吩并嘧啶基，噻吩并吡嗪基，噻吩并三嗪基，咪唑并吡啶基，咪唑并哒嗪基，咪唑并嘧啶基，咪唑并吡嗪基，咪唑并三嗪基，吡唑并吡啶基，吡唑并哒嗪基，吡唑并嘧啶基，吡唑并吡嗪基，吡唑并三嗪基，异恶唑并吡啶基，异恶唑并哒嗪基，异恶唑并嘧啶基，异恶唑并吡嗪基，异恶唑并三嗪基，恶唑并吡啶基，恶唑并哒嗪基，恶唑并嘧啶基，恶唑并吡嗪基，恶唑并三嗪基，异噻唑吡啶基，异噻唑哒嗪基，异噻唑嘧啶基，异噻唑吡嗪基，异噻唑三嗪基，噻唑并吡啶基，噻唑并哒嗪基，噻唑并嘧啶基，噻唑并吡嗪基，噻唑并三嗪基，三唑并吡啶基，三唑并哒嗪基，三唑并嘧啶基，三唑并吡嗪基，三唑并三嗪基；

-- 通过氮键合含有一至四个氮原子的 5-节杂芳基，或通过氮键合含有一至三个氮原子的苯并稠合 5-节杂芳基：5-节环杂芳基，此杂芳基除碳原子外还可含有一至四个氮原子或一至三个氮原子作为环原子，且其中两个相邻碳环原子或一个氮原子和一个相邻碳环原子可通过丁-1, 3-二烯-1, 4 二基桥连，其中这些环通过任一氮环原子与结构键合，如 1-吡咯基，1-咪唑基，1-吡唑基和 1, 2, 4-三唑-1-基；

-- 含有一至三个或一至四个氮原子的 6-节杂芳基：除碳原子外还可含有一至三个或一至四个氮原子作为环原子的 6-节环杂芳基，如 2-吡啶基，3-吡啶基，4-吡啶基，3-哒嗪基，4-哒嗪基，2-嘧啶基，4-嘧啶基，5-嘧啶基，2-吡嗪基，1, 3, 5-三嗪-2-基，1, 2, 4-三嗪-3-基和 1, 2, 4, 5-四嗪-3-基；

-- 含有一至四个氮原子的稠合 6-节杂芳基：其中两个相邻碳环原子可桥连构成芳香或杂芳香二环或多环的 6-节环杂芳基，所述环如喹啉，异喹啉，喹唑啉和喹喔啉，

或相应的氧基, 硫基, 氨基, 羰基或磺酰基的基团。

有关烷基, 烷基羰基, 烷基磺酰基, 烷氧基, 烷氧羰基, 烷硫基, 烷基氨基, 二烷基氨基, 链烯基, 链烯氧基, 链烯硫基, 链烯基氨基, 链烯基羰基, 炔基, 炔氧基, 炔硫基, 炔基氨基和炔基羰基的附加术语“未取代的或取代的”是指这些基团可以部分或全部卤代和/或可载有一至三个, 优选一个, 下述基团: 氰基, 硝基, 羟基, 巯基, 氨基, 羧基, 氨基羰基, 氨基硫代羰基, 卤素, C_1-C_6 烷氧基, C_1-C_6 -卤代烷氧基, C_1-C_6 -烷氧羰基, C_3-C_6 环烷基, C_1-C_6 烷基氨基(载有一个如上所述烷基的 NH 基团), 二- C_1-C_6 烷基氨基(载有两个如上所述彼此独立的烷基的氨基), 芳基, 芳氧基, 杂芳基或杂芳氧基, 芳硫基或杂芳硫基, 最后所述的芳香或杂芳香基团本身又可能部分或全部卤代和/或带有一至三个下述基团: 氰基, 硝基, 羟基, 氨基, 羧基, 氨基羰基, 氨基硫代羰基, C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 卤代烷氧基, C_1-C_4 烷硫基, C_1-C_4 烷基氨基, 二- C_1-C_4 -烷基氨基和 C_1-C_4 烷氧基羰基。

有关环烷基, 环烯基, 杂环基, 芳基-和杂芳基(或其相应的氧基, 硫基, 羰基, 磺酰基和磺酰氧基的基团)的附加术语“未取代的或取代的”是指这些基团可以部分或全部卤代和/或可载有一至四个, 优选一或两个, 下述基团: 氰基, 硝基, 羟基, 巯基, 氨基, 羧基, 氨基羰基, 氨基硫代羰基, 卤素, C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 -卤代烷基, C_1-C_6 -烷基羰基, C_1-C_6 烷氧基, C_1-C_6 -卤代烷氧基, C_1-C_6 -烷氧羰基, C_1-C_6 烷硫基, C_3-C_6 环烷基, C_1-C_6 烷基氨基(载有一个如上所述烷基的 NH 基团), 二- C_1-C_6 烷基氨基(载有两个如上所述彼此独立的烷基的氨基), C_1-C_6 烷基磺酰基, C_2-C_6 链烯基, C_2-C_6 链烯氧基, 芳基, 芳基- C_1-C_4 烷基, 芳氧基羰基, 芳氧基, 杂芳基, 杂芳氧基或 1-(C_1-C_6 烷氧基亚氨基)- C_1-C_6 烷基, 其中所述的芳香或杂芳香基团可以部分或全部卤代和/或带有一至三个下述基团: 氰基, 硝基, 羟基, 氨基, 羧基, 氨基羰基, 氨基硫代羰基, C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 卤代烷基, C_1-C_4 烷基羰基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 卤代烷氧基, C_1-C_4 烷氧基羰基, C_1-C_4 烷硫基, C_1-C_4 烷基氨基, 二- C_2-C_4 -烷基氨基。

术语“部分或全部卤代”是指在以这种方式表征的基团中, 与碳原子键合的氢原子可以部分或全部被相同或不同如上所述的卤原子, 尤其是

氟, 氯和/或溴取代。

特别重要的是其中 R^1 代表氢的式 IVA, IV'A, VA 和 VIA 中间体。

此外, 优选其中 R^1 代表羟基的式 IVA, IV'A, VA 和 VIA 中间体。

尤其优选其中 R^1 代表卤素 (氯和溴) 的式 IVA, IV'A, VA 和 VIA 中间体。

这些化合物很容易制得各种类现有文献中所述的活性化合物。

特别优选的中间体的代表性实例汇集在下列表内。

表 1

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $CH_2CH_2CH_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种。

表 2

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $(CH_2)_3CH_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种。

表 3

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $CH_2CH(CH_3)_2$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种。

表 4

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $CH(CH_3)CH_2CH_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种。

表 5

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $(CH_2)_4CH_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种。

表 6

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $CH_2CH_2CH(CH_3)_2$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种。

表 7

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $CH_2C(CH_3)_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种。

表 8

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $C(CH_3)_2CH_2CH_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 9

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表戊-2-基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 10

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表戊-3-基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 11

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 2-甲基丁-1-基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 12

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 3-甲基丁-2-基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 13

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $(CH_2)_5CH_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 14

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 2-乙基己-1-基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 15

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $(CH_2)_6CH_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 16

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 $(CH_2)_7CH_3$, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 17

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 2-甲氧基乙-1-基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 18

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 2-乙氧基乙-1-基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 19

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 2-氯乙-1-基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 20

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表乙基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 21

式 IVA, VA 和 VIA 化合物, 其中 X_n 代表氢, R 代表 1-甲基乙基, 以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 22

式 IV'A 化合物, 其中 X_n 代表氢以及每种情况下 R^1 表示表 A 中所列基团的一种.

表 A:

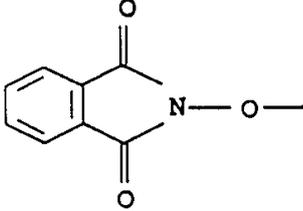
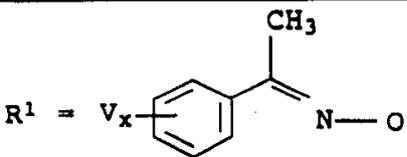
R^1
H
OH
Br
Cl
CH_3SO_2O
$C_6H_5SO_2O$
$4-CH_3-C_6H_4SO_2O$
$(CH_3)_2C=NO$
$CH_3O-C(CH_3)=NO$
$H_3CCH_2O-C(CH_3)=NO$


表 A (续):

$R^1 = V_x$ 
V_x
H
2-F
3-F
4-F
2,3-F ₂
2,4-F ₂
2,5-F ₂
2,6-F ₂
3,4-F ₂
3,5-F ₂
2-Cl
3-Cl
4-Cl
2,3-Cl ₂
2,4-Cl ₂
2,5-Cl ₂
2,6-Cl ₂
3,4-Cl ₂
3,5-Cl ₂
2,3,4-Cl ₃
2,3,5-Cl ₃
2,4,4-Cl ₃
3,4,5-Cl ₃
2-Br
3-Br
4-Br
2,3-Br ₂

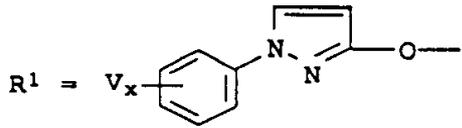
2,4-Br ₂
2,5-Br ₂
3,4-Br ₂
3,5-Br ₂
2-F, 3-Cl
2-F, 4-Cl
2-F, 5-Cl
3-F, 4-Cl
3-F, 5-Cl
3-F, 6-Cl
4-F, 5-Cl
3-Cl, 4-Br
3-Cl, 5-Br
4-Cl, 5-Br
2-NO ₂
3-NO ₂
4-NO ₂
2-CH ₃
3-CH ₃
4-CH ₃
2,3-(CH ₃) ₂
2,4-(CH ₃) ₂
2,5-(CH ₃) ₂
2,6-(CH ₃) ₂
3,4-(CH ₃) ₂
3,5-(CH ₃) ₂
2-C ₂ H ₅
3-C ₂ H ₅
4-C ₂ H ₅
2-(CH ₂) ₂ CH ₃
3-(CH ₂) ₂ CH ₃
4-(CH ₂) ₂ CH ₃
2-CH(CH ₃) ₂

3-CH(CH ₃) ₂
4-CH(CH ₃) ₂
2-C(CH ₃) ₃
3-C(CH ₃) ₃
4-C(CH ₃) ₃
3-C ₆ H ₅
4-C ₆ H ₅
3-CH ₃ , 4-CH(CH ₃) ₂
3,5-[C(CH ₃) ₃] ₂ , 4-CH ₃
2-OH
3-OH
4-OH
2-OCH ₃
3-OCH ₃
4-OCH ₃
2-OC ₂ H ₅
3-OC ₂ H ₅
4-OC ₂ H ₅
2-O(CH ₂) ₂ CH ₃
3-O(CH ₂) ₂ CH ₃
4-O(CH ₂) ₂ CH ₃
2-OCH(CH ₃) ₂
3-OCH(CH ₃) ₂
4-OCH(CH ₃) ₂
2-OC(CH ₃) ₃
3-OC(CH ₃) ₃
4-OC(CH ₃) ₃
2-OC ₆ H ₅
3-OC ₆ H ₅
4-OC ₆ H ₅
2-CF ₃
3-CF ₃
4-CF ₃

2-CH ₂ CH ₂ F
3-CH ₂ CH ₂ F
4-CH ₂ CH ₂ F
2-CH ₂ CF ₃
3-CH ₂ CF ₃
4-CH ₂ CF ₃
2-C ₂ F ₅
3-C ₂ F ₅
4-C ₂ F ₅
2-CF ₂ CHF ₂
3-CF ₂ CHF ₂
4-CF ₂ CHF ₂
2-OCF ₃
3-OCF ₃
4-OCF ₃
2-COCH ₃
3-COCH ₃
4-COCH ₃
2-CO ₂ CH ₃
3-CO ₂ CH ₃
4-CO ₂ CH ₃
2-CO ₂ C ₂ H ₅
3-CO ₂ C ₂ H ₅
4-CO ₂ C ₂ H ₅
2-CN
3-CN
4-CN
2-NH ₂
3-NH ₂
4-NH ₂
2-N(CH ₃) ₂
3-N(CH ₃) ₂
4-N(CH ₃) ₂

2-SCH ₃
3-SCH ₃
4-SCH ₃
2-SO ₂ CH ₃
3-SO ₂ CH ₃
4-SO ₂ CH ₃
3-Cl, 4-C(CH ₃) ₃
3-F, 4-CH ₃
3-F, 5-CH ₃
4-F, 3-CH ₃
4-Cl, 3-NO ₂
3-Cl, 4-OCH ₃
4-Cl, 3-OCH ₃
3-Cl, 4-CF ₃
4-Cl, 3-CF ₃
3-CH ₃ , 4-OCH ₃
4-CH ₃ , 3-OCH ₃

表 A (续) :

$R^1 = V_x$ 
V_x
H
2-Cl
3-Cl
4-Cl
2,3-Cl ₂
2,4-Cl ₂
2,5-Cl ₂
2,6-Cl ₂
3,5-Cl ₂
2-CH ₃
3-CH ₃
4-CH ₃
2,3-(CH ₃) ₂
2,4-(CH ₃) ₂
2,5-(CH ₃) ₂
2,6-(CH ₃) ₂
3,4-(CH ₃) ₂
3,5-(CH ₃) ₂
2-NO ₂
3-NO ₂
4-NO ₂
2-CN
3-CN
4-CN
2-OCH ₃
3-OCH ₃
4-OCH ₃

2-CF ₃
3-CF ₃
4-CF ₃
2-F
3-F
4-F
2,3-F ₂
2,4-F ₂
2,5-F ₂
2,6-F ₂
3,4-F ₂
3,5-F ₂
3,4-Cl ₂
2,3,4-Cl ₃
2,3,5-Cl ₃
2,3,6-Cl ₃
2,4,5-Cl ₃
2,4,6-Cl ₃
3,4,5-Cl ₃
2-Br
3-Br
4-Br
2,3-Br ₂
2,4-Br ₂
2,5-Br ₂
2,6-Br ₂
3,4-Br ₂
3,5-Br ₂
2-I
3-I
4-I
2,4-I ₂
2-F, 3-Cl

2-F, 4-Cl
2-F, 5-Cl
2-F, 6-Cl
3-F, 2-Cl
3-F, 4-Cl
3-F, 5-Cl
3-F, 6-Cl
4-F, 2-Cl
4-F, 3-Cl
2-F, 3-Br
2-F, 4-Br
2-F, 5-Br
2-F, 6-Br
3-F, 2-Br
3-F, 4-Br
3-F, 5-Br
3-F, 6-Br
4-F, 2-Br
4-F, 3-Br
2-Br, 3-Cl
2-Br, 4-Cl
2-Br, 5-Cl
2-Br, 6-Cl
3-Br, 2-Cl
3-Br, 4-Cl
3-Br, 5-Cl
3-Br, 6-Cl
4-Br, 2-Cl
4-Br, 3-Cl
2-Cl, 3-CN
2-Cl, 4-CN
2-Cl, 5-CN
2-Cl, 6-CN

3-Cl, 2-CN
3-Cl, 4-CN
3-Cl, 5-CN
3-Cl, 6-CN
4-Cl, 2-CN
4-Cl, 3-CN
2-F, 3-CN
2-F, 4-CN
2-F, 5-CN
2-F, 6-CN
3-F, 2-CN
3-F, 4-CN
3-F, 5-CN
3-F, 6-CN
4-F, 2-CN
4-F, 3-CN
2-Cl, 3-CH ₃
2-Cl, 4-CH ₃
2-Cl, 5-CH ₃
2-Cl, 6-CH ₃
3-Cl, 2-CH ₃
3-Cl, 4-CH ₃
3-Cl, 5-CH ₃
3-Cl, 6-CH ₃
4-Cl, 2-CH ₃
4-Cl, 3-CH ₃
2-F, 3-CH ₃
2-F, 4-CH ₃
2-F, 5-CH ₃
2-F, 6-CH ₃
3-F, 2-CH ₃
3-F, 4-CH ₃
3-F, 5-CH ₃

3-F, 6-CH ₃
4-F, 2-CH ₃
4-F, 3-CH ₃
2-CN, 3-CH ₃
2-CN, 4-CH ₃
2-CN, 5-CH ₃
2-CN, 6-CH ₃
3-CN, 2-CH ₃
3-CN, 4-CH ₃
3-CN, 5-CH ₃
3-CN, 6-CH ₃
4-CN, 2-CH ₃
4-CN, 3-CH ₃
2-Cl, 3-CF ₃
2-Cl, 4-CF ₃
2-Cl, 5-CF ₃
2-Cl, 6-CF ₃
3-Cl, 2-CF ₃
3-Cl, 4-CF ₃
3-Cl, 5-CF ₃
3-Cl, 6-CF ₃
4-Cl, 2-CF ₃
4-Cl, 3-CF ₃
2-F, 3-CF ₃
2-F, 4-CF ₃
2-F, 5-CF ₃
2-F, 6-CF ₃
3-F, 2-CF ₃
3-F, 4-CF ₃
3-F, 5-CF ₃
3-F, 6-CF ₃
4-F, 2-CF ₃
4-F, 3-CF ₃

2-Cl, 3-OCH ₃
2-Cl, 4-OCH ₃
2-Cl, 5-OCH ₃
2-Cl, 6-OCH ₃
3-Cl, 2-OCH ₃
3-Cl, 4-OCH ₃
3-Cl, 5-OCH ₃
3-Cl, 6-OCH ₃
4-Cl, 2-OCH ₃
4-Cl, 3-OCH ₃
2-F, 3-OCH ₃
2-F, 4-OCH ₃
2-F, 5-OCH ₃
2-F, 6-OCH ₃
3-F, 2-OCH ₃
3-F, 4-OCH ₃
3-F, 5-OCH ₃
3-F, 6-OCH ₃
4-F, 2-OCH ₃
4-F, 3-OCH ₃
2-CN, 3-OCH ₃
2-CN, 4-OCH ₃
2-CN, 5-OCH ₃
2-CN, 6-OCH ₃
3-CN, 2-OCH ₃
3-CN, 4-OCH ₃
3-CN, 5-OCH ₃
3-CN, 6-OCH ₃
4-CN, 2-OCH ₃
4-CN, 3-OCH ₃
2-CH ₃ , 3-OCH ₃
2-CH ₃ , 4-OCH ₃
2-CH ₃ , 5-OCH ₃

2-CH ₃ , 6-OCH ₃
3-CH ₃ , 2-OCH ₃
3-CH ₃ , 4-OCH ₃
3-CH ₃ , 5-OCH ₃
3-CH ₃ , 6-OCH ₃
4-CH ₃ , 2-OCH ₃
4-CH ₃ , 3-OCH ₃
2-CF ₃ , 3-OCH ₃
2-CF ₃ , 4-OCH ₃
2-CF ₃ , 5-OCH ₃
2-CF ₃ , 6-OCH ₃
3-CF ₃ , 2-OCH ₃
3-CF ₃ , 4-OCH ₃
3-CF ₃ , 5-OCH ₃
3-CF ₃ , 6-OCH ₃
4-CF ₃ , 2-OCH ₃
4-CF ₃ , 3-OCH ₃
2-Cl, 3-OCF ₃
2-Cl, 4-OCF ₃
2-Cl, 5-OCF ₃
2-Cl, 6-OCF ₃
3-Cl, 2-OCF ₃
3-Cl, 4-OCF ₃
3-Cl, 5-OCF ₃
3-Cl, 6-OCF ₃
4-Cl, 2-OCF ₃
4-Cl, 3-OCF ₃
2-F, 3-OCF ₃
2-F, 4-OCF ₃
2-F, 5-OCF ₃
2-F, 6-OCF ₃
3-F, 2-OCF ₃
3-F, 4-OCF ₃

3-F, 5-OCF ₃
3-F, 6-OCF ₃
4-F, 2-OCF ₃
4-F, 3-OCF ₃
2-CN, 3-OCF ₃
2-CN, 4-OCF ₃
2-CN, 5-OCF ₃
2-CN, 6-OCF ₃
3-CN, 2-OCF ₃
3-CN, 4-OCF ₃
3-CN, 5-OCF ₃
3-CN, 6-OCF ₃
4-CN, 2-OCF ₃
4-CN, 3-OCF ₃
2-CH ₃ , 3-OCF ₃
2-CH ₃ , 4-OCF ₃
2-CH ₃ , 5-OCF ₃
2-CH ₃ , 6-OCF ₃
3-CH ₃ , 2-OCF ₃
3-CH ₃ , 4-OCF ₃
3-CH ₃ , 5-OCF ₃
3-CH ₃ , 6-OCF ₃
4-CH ₃ , 2-OCF ₃
4-CH ₃ , 3-OCF ₃
2-CF ₃ , 3-OCF ₃
2-CF ₃ , 4-OCF ₃
2-CF ₃ , 5-OCF ₃
2-CF ₃ , 6-OCF ₃
3-CF ₃ , 2-OCF ₃
3-CF ₃ , 4-OCF ₃
3-CF ₃ , 5-OCF ₃
3-CF ₃ , 6-OCF ₃
4-CF ₃ , 2-OCF ₃

4-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-Cl, 3-OCHF ₂
2-Cl, 4-OCHF ₂
2-Cl, 5-OCHF ₂
2-Cl, 6-OCHF ₂
3-Cl, 2-OCHF ₂
3-Cl, 4-OCHF ₂
3-Cl, 5-OCHF ₂
3-Cl, 6-OCHF ₂
4-Cl, 2-OCHF ₂
4-Cl, 3-OCHF ₂
2-F, 3-OCHF ₂
2-F, 4-OCHF ₂
2-F, 5-OCHF ₂
2-F, 6-OCHF ₂
3-F, 2-OCHF ₂
3-F, 4-OCHF ₂
3-F, 5-OCHF ₂
3-F, 6-OCHF ₂
4-F, 2-OCHF ₂
4-F, 3-OCHF ₂
2-CN, 3-OCHF ₂
2-CN, 4-OCHF ₂
2-CN, 5-OCHF ₂
2-CN, 6-OCHF ₂
3-CN, 2-OCHF ₂
3-CN, 4-OCHF ₂
3-CN, 5-OCHF ₂
3-CN, 6-OCHF ₂
4-CN, 2-OCHF ₂
4-CN, 3-OCHF ₂
2-CH ₃ , 3-OCHF ₂
2-CH ₃ , 4-OCHF ₂

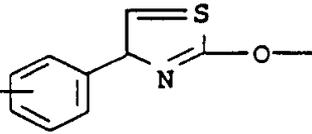
2-CH ₃ , 5-OCHF ₂
2-CH ₃ , 6-OCHF ₂
3-CH ₃ , 2-OCHF ₂
3-CH ₃ , 4-OCHF ₂
3-CH ₃ , 5-OCHF ₂
3-CH ₃ , 6-OCHF ₂
4-CH ₃ , 2-OCHF ₂
4-CH ₃ , 3-OCHF ₂
2-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-CF ₃ , 4-OCHF ₂
2-CF ₃ , 5-OCHF ₂
2-CF ₃ , 6-OCHF ₂
3-CF ₃ , 2-OCHF ₂
3-CF ₃ , 4-OCHF ₂
3-CF ₃ , 5-OCHF ₂
3-CF ₃ , 6-OCHF ₂
4-CF ₃ , 2-OCHF ₂
4-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-CSNH ₂
3-CSNH ₂
4-CSNH ₂
2, 4, 6-(CH ₃) ₃
3, 4, 5-(CH ₃) ₃
2-CH ₂ CH ₃
3-CH ₂ CH ₃
4-CH ₂ CH ₃
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃
3-CH ₂ CH ₂ CH ₃
4-CH ₂ CH ₂ CH ₃
2-CH(CH ₃) ₃
3-CH(CH ₃) ₃
4-CH(CH ₃) ₃
3-C(CH ₃) ₃

4-C(CH ₃) ₃
3-C ₆ H ₅
4-C ₆ H ₅
3,5-(CF ₃) ₂
2,3-(OCH ₃) ₂
2,4-(OCH ₃) ₂
2,5-(OCH ₃) ₂
2,6-(OCH ₃) ₂
3,4-(OCH ₃) ₂
3,5-(OCH ₃) ₂
3,4,5-(OCH ₃) ₃
2-OCH ₃
3-OCH ₃
4-OCH ₃
2-OCH ₂ CH ₃
3-OCH ₂ CH ₃
4-OCH ₂ CH ₃
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
3-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
4-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
2-OCH(CH ₃) ₃
3-OCH(CH ₃) ₃
4-OCH(CH ₃) ₃
3-OC(CH ₃) ₃
4-OC(CH ₃) ₃
2-OCF ₃
3-OCF ₃
4-OCF ₃
2-OCHF ₂
3-OCHF ₂
4-OCHF ₂
2-OCF ₂ CHF ₂
3-OCF ₂ CHF ₂

4-OCF ₂ CHF ₂
2-OH
3-OH
4-OH
2-NH ₂
3-NH ₂
4-NH ₂
2-NH(CH ₃)
3-NH(CH ₃)
4-NH(CH ₃)
2-N(CH ₃) ₂
3-N(CH ₃) ₂
4-N(CH ₃) ₂
2-SCH ₃
3-SCH ₃
4-SCH ₃
2-SO ₂ CH ₃
3-SO ₂ CH ₃
4-SO ₂ CH ₃
2-COCH ₃
3-COCH ₃
4-COCH ₃
2-CO ₂ H
3-CO ₂ H
4-CO ₂ H
2-CONH ₂
3-CONH ₂
4-CONH ₂
2-COOCH ₃
3-COOCH ₃
4-COOCH ₃
2-COOCH ₂ CH ₃
3-COOCH ₂ CH ₃

4-COOCH ₂ CH ₃
2-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
3-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
4-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
2-COOCH(CH ₃) ₃
3-COOCH(CH ₃) ₃
4-COOCH(CH ₃) ₃
3-COOC(CH ₃) ₃
4-COOC(CH ₃) ₃
2,3-[OCH ₂ O]
3,4-[OCH ₂ O]
2,3-[OC(CH ₃) ₂ O]
3,4-[OC(CH ₃) ₂ O]
2,3-[OCH ₂ CH ₂ O]
3,4-[OCH ₂ CH ₂ O]
2,3-[OCF ₂ O]
3,4-[OCF ₂ O]
2,3-[CH ₂] ₄
3,4-[CH ₂] ₄
2,3-[CH=CH-CH=CH]
3,4-[CH=CH-CH=CH]

表 A (续):

$R^1 = V_x$ 
V_x
H
2-Cl
3-Cl
4-Cl
2,3-Cl ₂
2,4-Cl ₂
2,5-Cl ₂
2,6-Cl ₂
3,5-Cl ₂
2-CH ₃
3-CH ₃
4-CH ₃
2,3-(CH ₃) ₂
2,4-(CH ₃) ₂
2,5-(CH ₃) ₂
2,6-(CH ₃) ₂
3,4-(CH ₃) ₂
3,5-(CH ₃) ₂
2-NO ₂
3-NO ₂
4-NO ₂
2-CN
3-CN
4-CN
2-OCH ₃
3-OCH ₃

4-OCH ₃
2-CF ₃
3-CF ₃
4-CF ₃
2-F
3-F
4-F
2,3-F ₂
2,4-F ₂
2,5-F ₂
2,6-F ₂
3,4-F ₂
3,5-F ₂
3,4-Cl ₂
2,3,4-Cl ₃
2,3,5-Cl ₃
2,3,6-Cl ₃
2,4,5-Cl ₃
2,4,6-Cl ₃
3,4,5-Cl ₃
2-Br
3-Br
4-Br
2,3-Br ₂
2,4-Br ₂
2,5-Br ₂
2,6-Br ₂
3,4-Br ₂
3,5-Br ₂
2-I
3-I
4-I
2,4-I ₂

2-F, 3-Cl
2-F, 4-Cl
2-F, 5-Cl
2-F, 6-Cl
3-F, 2-Cl
3-F, 4-Cl
3-F, 5-Cl
3-F, 6-Cl
4-F, 2-Cl
4-F, 3-Cl
2-F, 3-Br
2-F, 4-Br
2-F, 5-Br
2-F, 6-Br
3-F, 2-Br
3-F, 4-Br
3-F, 5-Br
3-F, 6-Br
4-F, 2-Br
4-F, 3-Br
2-Br, 3-Cl
2-Br, 4-Cl
2-Br, 5-Cl
2-Br, 6-Cl
3-Br, 2-Cl
3-Br, 4-Cl
3-Br, 5-Cl
3-Br, 6-Cl
4-Br, 2-Cl
4-Br, 3-Cl
2-Cl, 3-CN
2-Cl, 4-CN
2-Cl, 5-CN

2-Cl, 6-CN
3-Cl, 2-CN
3-Cl, 4-CN
3-Cl, 5-CN
3-Cl, 6-CN
4-Cl, 2-CN
4-Cl, 3-CN
2-F, 3-CN
2-F, 4-CN
2-F, 5-CN
2-F, 6-CN
3-F, 2-CN
3-F, 4-CN
3-F, 5-CN
3-F, 6-CN
4-F, 2-CN
4-F, 3-CN
2-Cl, 3-CH ₃
2-Cl, 4-CH ₃
2-Cl, 5-CH ₃
2-Cl, 6-CH ₃
3-Cl, 2-CH ₃
3-Cl, 4-CH ₃
3-Cl, 5-CH ₃
3-Cl, 6-CH ₃
4-Cl, 2-CH ₃
4-Cl, 3-CH ₃
2-F, 3-CH ₃
2-F, 4-CH ₃
2-F, 5-CH ₃
2-F, 6-CH ₃
3-F, 2-CH ₃
3-F, 4-CH ₃

3-F, 5-CH ₃
3-F, 6-CH ₃
4-F, 2-CH ₃
4-F, 3-CH ₃
2-CN, 3-CH ₃
2-CN, 4-CH ₃
2-CN, 5-CH ₃
2-CN, 6-CH ₃
3-CN, 2-CH ₃
3-CN, 4-CH ₃
3-CN, 5-CH ₃
3-CN, 6-CH ₃
4-CN, 2-CH ₃
4-CN, 3-CH ₃
2-Cl, 3-CF ₃
2-Cl, 4-CF ₃
2-Cl, 5-CF ₃
2-Cl, 6-CF ₃
3-Cl, 2-CF ₃
3-Cl, 4-CF ₃
3-Cl, 5-CF ₃
3-Cl, 6-CF ₃
4-Cl, 2-CF ₃
4-Cl, 3-CF ₃
2-F, 3-CF ₃
2-F, 4-CF ₃
2-F, 5-CF ₃
2-F, 6-CF ₃
3-F, 2-CF ₃
3-F, 4-CF ₃
3-F, 5-CF ₃
3-F, 6-CF ₃
4-F, 2-CF ₃

4-F, 3-CF ₃
2-Cl, 3-OCH ₃
2-Cl, 4-OCH ₃
2-Cl, 5-OCH ₃
2-Cl, 6-OCH ₃
3-Cl, 2-OCH ₃
3-Cl, 4-OCH ₃
3-Cl, 5-OCH ₃
3-Cl, 6-OCH ₃
4-Cl, 2-OCH ₃
4-Cl, 3-OCH ₃
2-F, 3-OCH ₃
2-F, 4-OCH ₃
2-F, 5-OCH ₃
2-F, 6-OCH ₃
3-F, 2-OCH ₃
3-F, 4-OCH ₃
3-F, 5-OCH ₃
3-F, 6-OCH ₃
4-F, 2-OCH ₃
4-F, 3-OCH ₃
2-CN, 3-OCH ₃
2-CN, 4-OCH ₃
2-CN, 5-OCH ₃
2-CN, 6-OCH ₃
3-CN, 2-OCH ₃
3-CN, 4-OCH ₃
3-CN, 5-OCH ₃
3-CN, 6-OCH ₃
4-CN, 2-OCH ₃
4-CN, 3-OCH ₃
2-CH ₃ , 3-OCH ₃
2-CH ₃ , 4-OCH ₃

2-CH ₃ , 5-OCH ₃
2-CH ₃ , 6-OCH ₃
3-CH ₃ , 2-OCH ₃
3-CH ₃ , 4-OCH ₃
3-CH ₃ , 5-OCH ₃
3-CH ₃ , 6-OCH ₃
4-CH ₃ , 2-OCH ₃
4-CH ₃ , 3-OCH ₃
2-CF ₃ , 3-OCH ₃
2-CF ₃ , 4-OCH ₃
2-CF ₃ , 5-OCH ₃
2-CF ₃ , 6-OCH ₃
3-CF ₃ , 2-OCH ₃
3-CF ₃ , 4-OCH ₃
3-CF ₃ , 5-OCH ₃
3-CF ₃ , 6-OCH ₃
4-CF ₃ , 2-OCH ₃
4-CF ₃ , 3-OCH ₃
2-Cl, 3-OCF ₃
2-Cl, 4-OCF ₃
2-Cl, 5-OCF ₃
2-Cl, 6-OCF ₃
3-Cl, 2-OCF ₃
3-Cl, 4-OCF ₃
3-Cl, 5-OCF ₃
3-Cl, 6-OCF ₃
4-Cl, 2-OCF ₃
4-Cl, 3-OCF ₃
2-F, 3-OCF ₃
2-F, 4-OCF ₃
2-F, 5-OCF ₃
2-F, 6-OCF ₃
3-F, 2-OCF ₃

3-F, 4-OCF ₃
3-F, 5-OCF ₃
3-F, 6-OCF ₃
4-F, 2-OCF ₃
4-F, 3-OCF ₃
2-CN, 3-OCF ₃
2-CN, 4-OCF ₃
2-CN, 5-OCF ₃
2-CN, 6-OCF ₃
3-CN, 2-OCF ₃
3-CN, 4-OCF ₃
3-CN, 5-OCF ₃
3-CN, 6-OCF ₃
4-CN, 2-OCF ₃
4-CN, 3-OCF ₃
2-CH ₃ , 3-OCF ₃
2-CH ₃ , 4-OCF ₃
2-CH ₃ , 5-OCF ₃
2-CH ₃ , 6-OCF ₃
3-CH ₃ , 2-OCF ₃
3-CH ₃ , 4-OCF ₃
3-CH ₃ , 5-OCF ₃
3-CH ₃ , 6-OCF ₃
4-CH ₃ , 2-OCF ₃
4-CH ₃ , 3-OCF ₃
2-CF ₃ , 3-OCF ₃
2-CF ₃ , 4-OCF ₃
2-CF ₃ , 5-OCF ₃
2-CF ₃ , 6-OCF ₃
3-CF ₃ , 2-OCF ₃
3-CF ₃ , 4-OCF ₃
3-CF ₃ , 5-OCF ₃
3-CF ₃ , 6-OCF ₃

4-CF ₃ , 2-OCHF ₂
4-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-Cl, 3-OCHF ₂
2-Cl, 4-OCHF ₂
2-Cl, 5-OCHF ₂
2-Cl, 6-OCHF ₂
3-Cl, 2-OCHF ₂
3-Cl, 4-OCHF ₂
3-Cl, 5-OCHF ₂
3-Cl, 6-OCHF ₂
4-Cl, 2-OCHF ₂
4-Cl, 3-OCHF ₂
2-F, 3-OCHF ₂
2-F, 4-OCHF ₂
2-F, 5-OCHF ₂
2-F, 6-OCHF ₂
3-F, 2-OCHF ₂
3-F, 4-OCHF ₂
3-F, 5-OCHF ₂
3-F, 6-OCHF ₂
4-F, 2-OCHF ₂
4-F, 3-OCHF ₂
2-CN, 3-OCHF ₂
2-CN, 4-OCHF ₂
2-CN, 5-OCHF ₂
2-CN, 6-OCHF ₂
3-CN, 2-OCHF ₂
3-CN, 4-OCHF ₂
3-CN, 5-OCHF ₂
3-CN, 6-OCHF ₂
4-CN, 2-OCHF ₂
4-CN, 3-OCHF ₂
2-CH ₃ , 3-OCHF ₂

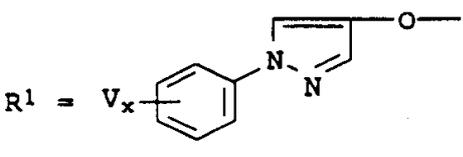
2-CH ₃ , 4-OCHF ₂
2-CH ₃ , 5-OCHF ₂
2-CH ₃ , 6-OCHF ₂
3-CH ₃ , 2-OCHF ₂
3-CH ₃ , 4-OCHF ₂
3-CH ₃ , 5-OCHF ₂
3-CH ₃ , 6-OCHF ₂
4-CH ₃ , 2-OCHF ₂
4-CH ₃ , 3-OCHF ₂
2-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-CF ₃ , 4-OCHF ₂
2-CF ₃ , 5-OCHF ₂
2-CF ₃ , 6-OCHF ₂
3-CF ₃ , 2-OCHF ₂
3-CF ₃ , 4-OCHF ₂
3-CF ₃ , 5-OCHF ₂
3-CF ₃ , 6-OCHF ₂
4-CF ₃ , 2-OCHF ₂
4-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-CSNH ₂
3-CSNH ₂
4-CSNH ₂
2,4,6-(CH ₃) ₃
3,4,5-(CH ₃) ₃
2-CH ₂ CH ₃
3-CH ₂ CH ₃
4-CH ₂ CH ₃
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃
3-CH ₂ CH ₂ CH ₃
4-CH ₂ CH ₂ CH ₃
2-CH(CH ₃) ₃
3-CH(CH ₃) ₃
4-CH(CH ₃) ₃

3-C(CH ₃) ₃
4-C(CH ₃) ₃
3-C ₆ H ₅
4-C ₆ H ₅
3,5-(CF ₃) ₂
2,3-(OCH ₃) ₂
2,4-(OCH ₃) ₂
2,5-(OCH ₃) ₂
2,6-(OCH ₃) ₂
3,4-(OCH ₃) ₂
3,5-(OCH ₃) ₂
3,4,5-(OCH ₃) ₃
2-OCH ₃
3-OCH ₃
4-OCH ₃
2-OCH ₂ CH ₃
3-OCH ₂ CH ₃
4-OCH ₂ CH ₃
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
3-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
4-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
2-OCH(CH ₃) ₃
3-OCH(CH ₃) ₃
4-OCH(CH ₃) ₃
3-OC(CH ₃) ₃
4-OC(CH ₃) ₃
2-OCF ₃
3-OCF ₃
4-OCF ₃
2-OCHF ₂
3-OCHF ₂
4-OCHF ₂
2-OCF ₂ CHF ₂

3-OCF ₂ CHF ₂
4-OCF ₂ CHF ₂
2-OH
3-OH
4-OH
2-NH ₂
3-NH ₂
4-NH ₂
2-NH(CH ₃)
3-NH(CH ₃)
4-NH(CH ₃)
2-N(CH ₃) ₂
3-N(CH ₃) ₂
4-N(CH ₃) ₂
2-SCH ₃
3-SCH ₃
4-SCH ₃
2-SO ₂ CH ₃
3-SO ₂ CH ₃
4-SO ₂ CH ₃
2-COCH ₃
3-COCH ₃
4-COCH ₃
2-CO ₂ H
3-CO ₂ H
4-CO ₂ H
2-CONH ₂
3-CONH ₂
4-CONH ₂
2-COOCH ₃
3-COOCH ₃
4-COOCH ₃
2-COOCH ₂ CH ₃

3-COOCH ₂ CH ₃
4-COOCH ₂ CH ₃
2-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
3-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
4-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
2-COOCH(CH ₃) ₃
3-COOCH(CH ₃) ₃
4-COOCH(CH ₃) ₃
3-COOC(CH ₃) ₃
4-COOC(CH ₃) ₃
2,3-[OCH ₂ O]
3,4-[OCH ₂ O]
2,3-[OC(CH ₃) ₂ O]
3,4-[OC(CH ₃) ₂ O]
2,3-[OCH ₂ CH ₂ O]
3,4-[OCH ₂ CH ₂ O]
2,3-[OCF ₂ O]
3,4-[OCF ₂ O]
2,3-[CH ₂] ₄
3,4-[CH ₂] ₄
2,3-[CH=CH-CH=CH]
3,4-[CH=CH-CH=CH]

表 A (续):

$R^1 = V_x$ 	
V _x	
H	
2-Cl	
3-Cl	
4-Cl	
2,3-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,5-Cl ₂	
2,6-Cl ₂	
3,5-Cl ₂	
2-CH ₃	
3-CH ₃	
4-CH ₃	
2,3-(CH ₃) ₂	
2,4-(CH ₃) ₂	
2,5-(CH ₃) ₂	
2,6-(CH ₃) ₂	
3,4-(CH ₃) ₂	
3,5-(CH ₃) ₂	
2-NO ₂	
3-NO ₂	
4-NO ₂	
2-CN	
3-CN	
4-CN	
2-OCH ₃	
3-OCH ₃	

4-OCH ₃
2-CF ₃
3-CF ₃
4-CF ₃
2-F
3-F
4-F
2,3-F ₂
2,4-F ₂
2,5-F ₂
2,6-F ₂
3,4-F ₂
3,5-F ₂
3,4-Cl ₂
2,3,4-Cl ₃
2,3,5-Cl ₃
2,3,6-Cl ₃
2,4,5-Cl ₃
2,4,6-Cl ₃
3,4,5-Cl ₃
2-Br
3-Br
4-Br
2,3-Br ₂
2,4-Br ₂
2,5-Br ₂
2,6-Br ₂
3,4-Br ₂
3,5-Br ₂
2-I
3-I
4-I
2,4-I ₂

2-F, 3-Cl
2-F, 4-Cl
2-F, 5-Cl
2-F, 6-Cl
3-F, 2-Cl
3-F, 4-Cl
3-F, 5-Cl
3-F, 6-Cl
4-F, 2-Cl
4-F, 3-Cl
2-F, 3-Br
2-F, 4-Br
2-F, 5-Br
2-F, 6-Br
3-F, 2-Br
3-F, 4-Br
3-F, 5-Br
3-F, 6-Br
4-F, 2-Br
4-F, 3-Br
2-Br, 3-Cl
2-Br, 4-Cl
2-Br, 5-Cl
2-Br, 6-Cl
3-Br, 2-Cl
3-Br, 4-Cl
3-Br, 5-Cl
3-Br, 6-Cl
4-Br, 2-Cl
4-Br, 3-Cl
2-Cl, 3-CN
2-Cl, 4-CN
2-Cl, 5-CN

2-Cl, 6-CN
3-Cl, 2-CN
3-Cl, 4-CN
3-Cl, 5-CN
3-Cl, 6-CN
4-Cl, 2-CN
4-Cl, 3-CN
2-F, 3-CN
2-F, 4-CN
2-F, 5-CN
2-F, 6-CN
3-F, 2-CN
3-F, 4-CN
3-F, 5-CN
3-F, 6-CN
4-F, 2-CN
4-F, 3-CN
2-Cl, 3-CH ₃
2-Cl, 4-CH ₃
2-Cl, 5-CH ₃
2-Cl, 6-CH ₃
3-Cl, 2-CH ₃
3-Cl, 4-CH ₃
3-Cl, 5-CH ₃
3-Cl, 6-CH ₃
4-Cl, 2-CH ₃
4-Cl, 3-CH ₃
2-F, 3-CH ₃
2-F, 4-CH ₃
2-F, 5-CH ₃
2-F, 6-CH ₃
3-F, 2-CH ₃
3-F, 4-CH ₃

3-F, 5-CH ₃
3-F, 6-CH ₃
4-F, 2-CH ₃
4-F, 3-CH ₃
2-CN, 3-CH ₃
2-CN, 4-CH ₃
2-CN, 5-CH ₃
2-CN, 6-CH ₃
3-CN, 2-CH ₃
3-CN, 4-CH ₃
3-CN, 5-CH ₃
3-CN, 6-CH ₃
4-CN, 2-CH ₃
4-CN, 3-CH ₃
2-Cl, 3-CF ₃
2-Cl, 4-CF ₃
2-Cl, 5-CF ₃
2-Cl, 6-CF ₃
3-Cl, 2-CF ₃
3-Cl, 4-CF ₃
3-Cl, 5-CF ₃
3-Cl, 6-CF ₃
4-Cl, 2-CF ₃
4-Cl, 3-CF ₃
2-F, 3-CF ₃
2-F, 4-CF ₃
2-F, 5-CF ₃
2-F, 6-CF ₃
3-F, 2-CF ₃
3-F, 4-CF ₃
3-F, 5-CF ₃
3-F, 6-CF ₃
4-F, 2-CF ₃

4-F, 3-CF ₃
2-Cl, 3-OCH ₃
2-Cl, 4-OCH ₃
2-Cl, 5-OCH ₃
2-Cl, 6-OCH ₃
3-Cl, 2-OCH ₃
3-Cl, 4-OCH ₃
3-Cl, 5-OCH ₃
3-Cl, 6-OCH ₃
4-Cl, 2-OCH ₃
4-Cl, 3-OCH ₃
2-F, 3-OCH ₃
2-F, 4-OCH ₃
2-F, 5-OCH ₃
2-F, 6-OCH ₃
3-F, 2-OCH ₃
3-F, 4-OCH ₃
3-F, 5-OCH ₃
3-F, 6-OCH ₃
4-F, 2-OCH ₃
4-F, 3-OCH ₃
2-CN, 3-OCH ₃
2-CN, 4-OCH ₃
2-CN, 5-OCH ₃
2-CN, 6-OCH ₃
3-CN, 2-OCH ₃
3-CN, 4-OCH ₃
3-CN, 5-OCH ₃
3-CN, 6-OCH ₃
4-CN, 2-OCH ₃
4-CN, 3-OCH ₃
2-CH ₃ , 3-OCH ₃
2-CH ₃ , 4-OCH ₃

2-CH ₃ , 5-OCH ₃
2-CH ₃ , 6-OCH ₃
3-CH ₃ , 2-OCH ₃
3-CH ₃ , 4-OCH ₃
3-CH ₃ , 5-OCH ₃
3-CH ₃ , 6-OCH ₃
4-CH ₃ , 2-OCH ₃
4-CH ₃ , 3-OCH ₃
2-CF ₃ , 3-OCH ₃
2-CF ₃ , 4-OCH ₃
2-CF ₃ , 5-OCH ₃
2-CF ₃ , 6-OCH ₃
3-CF ₃ , 2-OCH ₃
3-CF ₃ , 4-OCH ₃
3-CF ₃ , 5-OCH ₃
3-CF ₃ , 6-OCH ₃
4-CF ₃ , 2-OCH ₃
4-CF ₃ , 3-OCH ₃
2-Cl, 3-OCF ₃
2-Cl, 4-OCF ₃
2-Cl, 5-OCF ₃
2-Cl, 6-OCF ₃
3-Cl, 2-OCF ₃
3-Cl, 4-OCF ₃
3-Cl, 5-OCF ₃
3-Cl, 6-OCF ₃
4-Cl, 2-OCF ₃
4-Cl, 3-OCF ₃
2-F, 3-OCF ₃
2-F, 4-OCF ₃
2-F, 5-OCF ₃
2-F, 6-OCF ₃
3-F, 2-OCF ₃

3-F, 4-OCF ₃
3-F, 5-OCF ₃
3-F, 6-OCF ₃
4-F, 2-OCF ₃
4-F, 3-OCF ₃
2-CN, 3-OCF ₃
2-CN, 4-OCF ₃
2-CN, 5-OCF ₃
2-CN, 6-OCF ₃
3-CN, 2-OCF ₃
3-CN, 4-OCF ₃
3-CN, 5-OCF ₃
3-CN, 6-OCF ₃
4-CN, 2-OCF ₃
4-CN, 3-OCF ₃
2-CH ₃ , 3-OCF ₃
2-CH ₃ , 4-OCF ₃
2-CH ₃ , 5-OCF ₃
2-CH ₃ , 6-OCF ₃
3-CH ₃ , 2-OCF ₃
3-CH ₃ , 4-OCF ₃
3-CH ₃ , 5-OCF ₃
3-CH ₃ , 6-OCF ₃
4-CH ₃ , 2-OCF ₃
4-CH ₃ , 3-OCF ₃
2-CF ₃ , 3-OCF ₃
2-CF ₃ , 4-OCF ₃
2-CF ₃ , 5-OCF ₃
2-CF ₃ , 6-OCF ₃
3-CF ₃ , 2-OCF ₃
3-CF ₃ , 4-OCF ₃
3-CF ₃ , 5-OCF ₃
3-CF ₃ , 6-OCF ₃

4-CF ₃ , 2-OCHF ₂
4-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-Cl, 3-OCHF ₂
2-Cl, 4-OCHF ₂
2-Cl, 5-OCHF ₂
2-Cl, 6-OCHF ₂
3-Cl, 2-OCHF ₂
3-Cl, 4-OCHF ₂
3-Cl, 5-OCHF ₂
3-Cl, 6-OCHF ₂
4-Cl, 2-OCHF ₂
4-Cl, 3-OCHF ₂
2-F, 3-OCHF ₂
2-F, 4-OCHF ₂
2-F, 5-OCHF ₂
2-F, 6-OCHF ₂
3-F, 2-OCHF ₂
3-F, 4-OCHF ₂
3-F, 5-OCHF ₂
3-F, 6-OCHF ₂
4-F, 2-OCHF ₂
4-F, 3-OCHF ₂
2-CN, 3-OCHF ₂
2-CN, 4-OCHF ₂
2-CN, 5-OCHF ₂
2-CN, 6-OCHF ₂
3-CN, 2-OCHF ₂
3-CN, 4-OCHF ₂
3-CN, 5-OCHF ₂
3-CN, 6-OCHF ₂
4-CN, 2-OCHF ₂
4-CN, 3-OCHF ₂
2-CH ₃ , 3-OCHF ₂

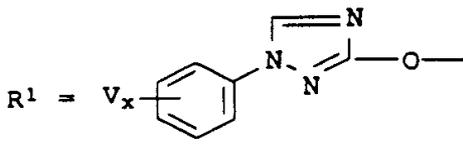
2-CH ₃ , 4-OCHF ₂
2-CH ₃ , 5-OCHF ₂
2-CH ₃ , 6-OCHF ₂
3-CH ₃ , 2-OCHF ₂
3-CH ₃ , 4-OCHF ₂
3-CH ₃ , 5-OCHF ₂
3-CH ₃ , 6-OCHF ₂
4-CH ₃ , 2-OCHF ₂
4-CH ₃ , 3-OCHF ₂
2-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-CF ₃ , 4-OCHF ₂
2-CF ₃ , 5-OCHF ₂
2-CF ₃ , 6-OCHF ₂
3-CF ₃ , 2-OCHF ₂
3-CF ₃ , 4-OCHF ₂
3-CF ₃ , 5-OCHF ₂
3-CF ₃ , 6-OCHF ₂
4-CF ₃ , 2-OCHF ₂
4-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-CSNH ₂
3-CSNH ₂
4-CSNH ₂
2,4,6-(CH ₃) ₃
3,4,5-(CH ₃) ₃
2-CH ₂ CH ₃
3-CH ₂ CH ₃
4-CH ₂ CH ₃
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃
3-CH ₂ CH ₂ CH ₃
4-CH ₂ CH ₂ CH ₃
2-CH(CH ₃) ₃
3-CH(CH ₃) ₃
4-CH(CH ₃) ₃

3-C(CH ₃) ₃
4-C(CH ₃) ₃
3-C ₆ H ₅
4-C ₆ H ₅
3,5-(CF ₃) ₂
2,3-(OCH ₃) ₂
2,4-(OCH ₃) ₂
2,5-(OCH ₃) ₂
2,6-(OCH ₃) ₂
3,4-(OCH ₃) ₂
3,5-(OCH ₃) ₂
3,4,5-(OCH ₃) ₃
2-OCH ₃
3-OCH ₃
4-OCH ₃
2-OCH ₂ CH ₃
3-OCH ₂ CH ₃
4-OCH ₂ CH ₃
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
3-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
4-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
2-OCH(CH ₃) ₃
3-OCH(CH ₃) ₃
4-OCH(CH ₃) ₃
3-OC(CH ₃) ₃
4-OC(CH ₃) ₃
2-OCF ₃
3-OCF ₃
4-OCF ₃
2-OCHF ₂
3-OCHF ₂
4-OCHF ₂
2-OCF ₂ CHF ₂

3-OCF ₂ CHF ₂
4-OCF ₂ CHF ₂
2-OH
3-OH
4-OH
2-NH ₂
3-NH ₂
4-NH ₂
2-NH(CH ₃)
3-NH(CH ₃)
4-NH(CH ₃)
2-N(CH ₃) ₂
3-N(CH ₃) ₂
4-N(CH ₃) ₂
2-SCH ₃
3-SCH ₃
4-SCH ₃
2-SO ₂ CH ₃
3-SO ₂ CH ₃
4-SO ₂ CH ₃
2-COCH ₃
3-COCH ₃
4-COCH ₃
2-CO ₂ H
3-CO ₂ H
4-CO ₂ H
2-CONH ₂
3-CONH ₂
4-CONH ₂
2-COOCH ₃
3-COOCH ₃
4-COOCH ₃
2-COOCH ₂ CH ₃

3-COOCH ₂ CH ₃
4-COOCH ₂ CH ₃
2-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
3-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
4-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
2-COOCH(CH ₃) ₃
3-COOCH(CH ₃) ₃
4-COOCH(CH ₃) ₃
3-COOC(CH ₃) ₃
4-COOC(CH ₃) ₃
2,3-[OCH ₂ O]
3,4-[OCH ₂ O]
2,3-[OC(CH ₃) ₂ O]
3,4-[OC(CH ₃) ₂ O]
2,3-[OCH ₂ CH ₂ O]
3,4-[OCH ₂ CH ₂ O]
2,3-[OCF ₂ O]
3,4-[OCF ₂ O]
2,3-[CH ₂] ₄
3,4-[CH ₂] ₄
2,3-[CH=CH-CH=CH]
3,4-[CH=CH-CH=CH]

表 A (续):

$R^1 = V_x$ 
V_x
H
2-Cl
3-Cl
4-Cl
2,3-Cl ₂
2,4-Cl ₂
2,5-Cl ₂
2,6-Cl ₂
3,5-Cl ₂
2-CH ₃
3-CH ₃
4-CH ₃
2,3-(CH ₃) ₂
2,4-(CH ₃) ₂
2,5-(CH ₃) ₂
2,6-(CH ₃) ₂
3,4-(CH ₃) ₂
3,5-(CH ₃) ₂
2-NO ₂
3-NO ₂
4-NO ₂
2-CN
3-CN
4-CN
2-OCH ₃
3-OCH ₃

4-OCH ₃
2-CF ₃
3-CF ₃
4-CF ₃
2-F
3-F
4-F
2,3-F ₂
2,4-F ₂
2,5-F ₂
2,6-F ₂
3,4-F ₂
3,5-F ₂
3,4-Cl ₂
2,3,4-Cl ₃
2,3,5-Cl ₃
2,3,6-Cl ₃
2,4,5-Cl ₃
2,4,6-Cl ₃
3,4,5-Cl ₃
2-Br
3-Br
4-Br
2,3-Br ₂
2,4-Br ₂
2,5-Br ₂
2,6-Br ₂
3,4-Br ₂
3,5-Br ₂
2-I
3-I
4-I
2,4-I ₂

2-F, 3-Cl
2-F, 4-Cl
2-F, 5-Cl
2-F, 6-Cl
3-F, 2-Cl
3-F, 4-Cl
3-F, 5-Cl
3-F, 6-Cl
4-F, 2-Cl
4-F, 3-Cl
2-F, 3-Br
2-F, 4-Br
2-F, 5-Br
2-F, 6-Br
3-F, 2-Br
3-F, 4-Br
3-F, 5-Br
3-F, 6-Br
4-F, 2-Br
4-F, 3-Br
2-Br, 3-Cl
2-Br, 4-Cl
2-Br, 5-Cl
2-Br, 6-Cl
3-Br, 2-Cl
3-Br, 4-Cl
3-Br, 5-Cl
3-Br, 6-Cl
4-Br, 2-Cl
4-Br, 3-Cl
2-Cl, 3-CN
2-Cl, 4-CN
2-Cl, 5-CN

2-Cl, 6-CN
3-Cl, 2-CN
3-Cl, 4-CN
3-Cl, 5-CN
3-Cl, 6-CN
4-Cl, 2-CN
4-Cl, 3-CN
2-F, 3-CN
2-F, 4-CN
2-F, 5-CN
2-F, 6-CN
3-F, 2-CN
3-F, 4-CN
3-F, 5-CN
3-F, 6-CN
4-F, 2-CN
4-F, 3-CN
2-Cl, 3-CH ₃
2-Cl, 4-CH ₃
2-Cl, 5-CH ₃
2-Cl, 6-CH ₃
3-Cl, 2-CH ₃
3-Cl, 4-CH ₃
3-Cl, 5-CH ₃
3-Cl, 6-CH ₃
4-Cl, 2-CH ₃
4-Cl, 3-CH ₃
2-F, 3-CH ₃
2-F, 4-CH ₃
2-F, 5-CH ₃
2-F, 6-CH ₃
3-F, 2-CH ₃
3-F, 4-CH ₃

3-F, 5-CH ₃
3-F, 6-CH ₃
4-F, 2-CH ₃
4-F, 3-CH ₃
2-CN, 3-CH ₃
2-CN, 4-CH ₃
2-CN, 5-CH ₃
2-CN, 6-CH ₃
3-CN, 2-CH ₃
3-CN, 4-CH ₃
3-CN, 5-CH ₃
3-CN, 6-CH ₃
4-CN, 2-CH ₃
4-CN, 3-CH ₃
2-Cl, 3-CF ₃
2-Cl, 4-CF ₃
2-Cl, 5-CF ₃
2-Cl, 6-CF ₃
3-Cl, 2-CF ₃
3-Cl, 4-CF ₃
3-Cl, 5-CF ₃
3-Cl, 6-CF ₃
4-Cl, 2-CF ₃
4-Cl, 3-CF ₃
2-F, 3-CF ₃
2-F, 4-CF ₃
2-F, 5-CF ₃
2-F, 6-CF ₃
3-F, 2-CF ₃
3-F, 4-CF ₃
3-F, 5-CF ₃
3-F, 6-CF ₃
4-F, 2-CF ₃

4-F, 3-CF ₃
2-Cl, 3-OCH ₃
2-Cl, 4-OCH ₃
2-Cl, 5-OCH ₃
2-Cl, 6-OCH ₃
3-Cl, 2-OCH ₃
3-Cl, 4-OCH ₃
3-Cl, 5-OCH ₃
3-Cl, 6-OCH ₃
4-Cl, 2-OCH ₃
4-Cl, 3-OCH ₃
2-F, 3-OCH ₃
2-F, 4-OCH ₃
2-F, 5-OCH ₃
2-F, 6-OCH ₃
3-F, 2-OCH ₃
3-F, 4-OCH ₃
3-F, 5-OCH ₃
3-F, 6-OCH ₃
4-F, 2-OCH ₃
4-F, 3-OCH ₃
2-CN, 3-OCH ₃
2-CN, 4-OCH ₃
2-CN, 5-OCH ₃
2-CN, 6-OCH ₃
3-CN, 2-OCH ₃
3-CN, 4-OCH ₃
3-CN, 5-OCH ₃
3-CN, 6-OCH ₃
4-CN, 2-OCH ₃
4-CN, 3-OCH ₃
2-CH ₃ , 3-OCH ₃
2-CH ₃ , 4-OCH ₃

2-CH ₃ , 5-OCH ₃
2-CH ₃ , 6-OCH ₃
3-CH ₃ , 2-OCH ₃
3-CH ₃ , 4-OCH ₃
3-CH ₃ , 5-OCH ₃
3-CH ₃ , 6-OCH ₃
4-CH ₃ , 2-OCH ₃
4-CH ₃ , 3-OCH ₃
2-CF ₃ , 3-OCH ₃
2-CF ₃ , 4-OCH ₃
2-CF ₃ , 5-OCH ₃
2-CF ₃ , 6-OCH ₃
3-CF ₃ , 2-OCH ₃
3-CF ₃ , 4-OCH ₃
3-CF ₃ , 5-OCH ₃
3-CF ₃ , 6-OCH ₃
4-CF ₃ , 2-OCH ₃
4-CF ₃ , 3-OCH ₃
2-Cl, 3-OCF ₃
2-Cl, 4-OCF ₃
2-Cl, 5-OCF ₃
2-Cl, 6-OCF ₃
3-Cl, 2-OCF ₃
3-Cl, 4-OCF ₃
3-Cl, 5-OCF ₃
3-Cl, 6-OCF ₃
4-Cl, 2-OCF ₃
4-Cl, 3-OCF ₃
2-F, 3-OCF ₃
2-F, 4-OCF ₃
2-F, 5-OCF ₃
2-F, 6-OCF ₃
3-F, 2-OCF ₃

3-F, 4-OCF ₃
3-F, 5-OCF ₃
3-F, 6-OCF ₃
4-F, 2-OCF ₃
4-F, 3-OCF ₃
2-CN, 3-OCF ₃
2-CN, 4-OCF ₃
2-CN, 5-OCF ₃
2-CN, 6-OCF ₃
3-CN, 2-OCF ₃
3-CN, 4-OCF ₃
3-CN, 5-OCF ₃
3-CN, 6-OCF ₃
4-CN, 2-OCF ₃
4-CN, 3-OCF ₃
2-CH ₃ , 3-OCF ₃
2-CH ₃ , 4-OCF ₃
2-CH ₃ , 5-OCF ₃
2-CH ₃ , 6-OCF ₃
3-CH ₃ , 2-OCF ₃
3-CH ₃ , 4-OCF ₃
3-CH ₃ , 5-OCF ₃
3-CH ₃ , 6-OCF ₃
4-CH ₃ , 2-OCF ₃
4-CH ₃ , 3-OCF ₃
2-CF ₃ , 3-OCF ₃
2-CF ₃ , 4-OCF ₃
2-CF ₃ , 5-OCF ₃
2-CF ₃ , 6-OCF ₃
3-CF ₃ , 2-OCF ₃
3-CF ₃ , 4-OCF ₃
3-CF ₃ , 5-OCF ₃
3-CF ₃ , 6-OCF ₃

4-CF ₃ , 2-OCHF ₂
4-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-Cl, 3-OCHF ₂
2-Cl, 4-OCHF ₂
2-Cl, 5-OCHF ₂
2-Cl, 6-OCHF ₂
3-Cl, 2-OCHF ₂
3-Cl, 4-OCHF ₂
3-Cl, 5-OCHF ₂
3-Cl, 6-OCHF ₂
4-Cl, 2-OCHF ₂
4-Cl, 3-OCHF ₂
2-F, 3-OCHF ₂
2-F, 4-OCHF ₂
2-F, 5-OCHF ₂
2-F, 6-OCHF ₂
3-F, 2-OCHF ₂
3-F, 4-OCHF ₂
3-F, 5-OCHF ₂
3-F, 6-OCHF ₂
4-F, 2-OCHF ₂
4-F, 3-OCHF ₂
2-CN, 3-OCHF ₂
2-CN, 4-OCHF ₂
2-CN, 5-OCHF ₂
2-CN, 6-OCHF ₂
3-CN, 2-OCHF ₂
3-CN, 4-OCHF ₂
3-CN, 5-OCHF ₂
3-CN, 6-OCHF ₂
4-CN, 2-OCHF ₂
4-CN, 3-OCHF ₂
2-CH ₃ , 3-OCHF ₂

2-CH ₃ , 4-OCHF ₂
2-CH ₃ , 5-OCHF ₂
2-CH ₃ , 6-OCHF ₂
3-CH ₃ , 2-OCHF ₂
3-CH ₃ , 4-OCHF ₂
3-CH ₃ , 5-OCHF ₂
3-CH ₃ , 6-OCHF ₂
4-CH ₃ , 2-OCHF ₂
4-CH ₃ , 3-OCHF ₂
2-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-CF ₃ , 4-OCHF ₂
2-CF ₃ , 5-OCHF ₂
2-CF ₃ , 6-OCHF ₂
3-CF ₃ , 2-OCHF ₂
3-CF ₃ , 4-OCHF ₂
3-CF ₃ , 5-OCHF ₂
3-CF ₃ , 6-OCHF ₂
4-CF ₃ , 2-OCHF ₂
4-CF ₃ , 3-OCHF ₂
2-CSNH ₂
3-CSNH ₂
4-CSNH ₂
2,4,6-(CH ₃) ₃
3,4,5-(CH ₃) ₃
2-CH ₂ CH ₃
3-CH ₂ CH ₃
4-CH ₂ CH ₃
2-CH ₂ CH ₂ CH ₃
3-CH ₂ CH ₂ CH ₃
4-CH ₂ CH ₂ CH ₃
2-CH(CH ₃) ₃
3-CH(CH ₃) ₃
4-CH(CH ₃) ₃

3-C(CH ₃) ₃
4-C(CH ₃) ₃
3-C ₆ H ₅
4-C ₆ H ₅
3,5-(CF ₃) ₂
2,3-(OCH ₃) ₂
2,4-(OCH ₃) ₂
2,5-(OCH ₃) ₂
2,6-(OCH ₃) ₂
3,4-(OCH ₃) ₂
3,5-(OCH ₃) ₂
3,4,5-(OCH ₃) ₃
2-OCH ₃
3-OCH ₃
4-OCH ₃
2-OCH ₂ CH ₃
3-OCH ₂ CH ₃
4-OCH ₂ CH ₃
2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
3-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
4-OCH ₂ CH ₂ CH ₃
2-OCH(CH ₃) ₃
3-OCH(CH ₃) ₃
4-OCH(CH ₃) ₃
3-OC(CH ₃) ₃
4-OC(CH ₃) ₃
2-OCF ₃
3-OCF ₃
4-OCF ₃
2-OCHF ₂
3-OCHF ₂
4-OCHF ₂
2-OCF ₂ CHF ₂

3-OCF ₂ CHF ₂
4-OCF ₂ CHF ₂
2-OH
3-OH
4-OH
2-NH ₂
3-NH ₂
4-NH ₂
2-NH(CH ₃)
3-NH(CH ₃)
4-NH(CH ₃)
2-N(CH ₃) ₂
3-N(CH ₃) ₂
4-N(CH ₃) ₂
2-SCH ₃
3-SCH ₃
4-SCH ₃
2-SO ₂ CH ₃
3-SO ₂ CH ₃
4-SO ₂ CH ₃
2-COCH ₃
3-COCH ₃
4-COCH ₃
2-CO ₂ H
3-CO ₂ H
4-CO ₂ H
2-CONH ₂
3-CONH ₂
4-CONH ₂
2-COOCH ₃
3-COOCH ₃
4-COOCH ₃
2-COOCH ₂ CH ₃

3-COOCH ₂ CH ₃
4-COOCH ₂ CH ₃
2-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
3-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
4-COOCH ₂ CH ₂ CH ₃
2-COOCH(CH ₃) ₃
3-COOCH(CH ₃) ₃
4-COOCH(CH ₃) ₃
3-COOC(CH ₃) ₃
4-COOC(CH ₃) ₃
2,3-[OCH ₂ O]
3,4-[OCH ₂ O]
2,3-[OC(CH ₃) ₂ O]
3,4-[OC(CH ₃) ₂ O]
2,3-[OCH ₂ CH ₂ O]
3,4-[OCH ₂ CH ₂ O]
2,3-[OCF ₂ O]
3,4-[OCF ₂ O]
2,3-[CH ₂] ₄
3,4-[CH ₂] ₄
2,3-[CH=CH-CH=CH]
3,4-[CH=CH-CH=CH]

表 A (续):

$R^1 = H_3C-CR^C=NO-$
R^C
1-萘基
2-萘基
2-吡啶基
3-吡啶基
4-吡啶基
4-Cl-吡啶-2-基
5-Cl-吡啶-2-基
6-Cl-吡啶-2-基
嘧啶-5-基
6-CH ₃ -吡啶-3-基
噻吩-2-基
哒嗪-4-基
3-CH ₃ -嘧啶-4-基
1, 2, 4-三嗪-5-基
5-CH ₃ -吡嗪-2-基
6-CF ₃ -嘧啶-4-基
5-Cl-噻吩-2-基
5-CH ₃ -噻唑-2-基
COCH ₃
COC ₆ H ₅
6-CF ₃ -吡嗪-2-基

表 A (续):

$R^1 = R''ON=CR'-C(CH_3)=NO-$	
R'	R''
CH ₃	H
CH ₃	CH ₃
CH ₃	C ₂ H ₅
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
CH ₃	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	环丙基
CH ₃	(CH ₂) ₃ CH ₃
CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CH ₃	C(CH ₃) ₃
CH ₃	(CH ₂) ₄ CH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₃
CH ₃	环戊基
CH ₃	(CH ₂) ₅ CH ₃
CH ₃	环己基
CH ₃	(CH ₂) ₇ CH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃)OCH ₃
CH ₃	(CH ₂) ₃ OCH ₃
CH ₃	CH ₂ CN
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH=CHCl
CH ₃	CH ₂ C≡CH

CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₃
CH ₃	CH ₂ CO ₂ H
CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃
CH ₃	CH ₂ CONH ₂
CH ₃	CH ₂ CONHCH ₃
CH ₃	CH ₂ CON(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ H
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CONH ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CONHCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CON(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ NHCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₂ CSNH ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CSNH ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CSNH ₂
CH ₃	CH ₂ COCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ COCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCF ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCF ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCHF ₂
CH ₃	CH ₂ NO ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ NO ₂
CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NO ₂
CH ₃	C(CH ₃)=NOCH ₃
CH ₃	C(CH ₃)=NOCH ₂ CH ₃

CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=NOCH ₃
CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=NOCH ₂ CH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CH ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
C ₆ H ₅	H
C ₆ H ₅	CH ₃
C ₆ H ₅	C ₂ H ₅
C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
C ₆ H ₅	CH(CH ₃) ₂
C ₆ H ₅	cyclopropyl
C ₆ H ₅	(CH ₂) ₃ CH ₃
C ₆ H ₅	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
C ₆ H ₅	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃
C ₆ H ₅	(CH ₂) ₄ CH ₃
C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
C ₆ H ₅	CH ₂ C(CH ₃) ₃
C ₆ H ₅	环戊基
C ₆ H ₅	(CH ₂) ₅ CH ₃
C ₆ H ₅	环己基
C ₆ H ₅	(CH ₂) ₇ CH ₃
C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
C ₆ H ₅	CH ₂ CH(CH ₃)OCH ₃
C ₆ H ₅	(CH ₂) ₃ OCH ₃
C ₆ H ₅	CH ₂ CN
C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₂ CN
C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
C ₆ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
C ₆ H ₅	CH ₂ CH=CHCH ₃
C ₆ H ₅	CH ₂ CH=CHCl
C ₆ H ₅	CH ₂ C≡CH
C ₆ H ₅	CH ₂ C≡CCH ₃

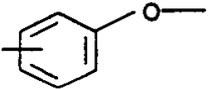
C_6H_5	CH_2CO_2H
C_6H_5	$CH_2CO_2CH_3$
C_6H_5	CH_2CONH_2
C_6H_5	$CH_2CONHCH_3$
C_6H_5	$CH_2CON(CH_3)_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2CO_2H$
C_6H_5	$CH_2CH_2CO_2CH_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2CONH_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2CONHCH_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2CON(CH_3)_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2NH_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2NH_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2CH_2NH_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2NHCH_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2NHCH_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2CH_2NHCH_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2N(CH_3)_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2N(CH_3)_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2CH_2N(CH_3)_2$
C_6H_5	CH_2CSNH_2
C_6H_5	$CH_2CH_2CSNH_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2CSNH_2$
C_6H_5	CH_2COCH_3
C_6H_5	$CH_2CH_2COCH_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2OCF_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2OCF_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2CH_2OCHF_2$
C_6H_5	CH_2NO_2
C_6H_5	$CH_2CH_2NO_2$
C_6H_5	$CH_2CH_2CH_2NO_2$
C_6H_5	$C(CH_3)=NOCH_3$
C_6H_5	$C(CH_3)=NOCH_2CH_3$
C_6H_5	$C(CH_2CH_3)=NOCH_3$

C_6H_5	$C(CH_2CH_3)=NOCH_2CH_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2SCH_3$
C_6H_5	$CH_2CH_2SO_2CH_3$
4-Cl- C_6H_4	H
4-Cl- C_6H_4	CH_3
4-Cl- C_6H_4	C_2H_5
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH_2CH_3$
4-Cl- C_6H_4	$CH(CH_3)_2$
4-Cl- C_6H_4	cyclopropyl
4-Cl- C_6H_4	$(CH_2)_3CH_3$
4-Cl- C_6H_4	$CH(CH_3)CH_2CH_3$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH(CH_3)_2$
4-Cl- C_6H_4	$C(CH_3)_3$
4-Cl- C_6H_4	$(CH_2)_4CH_3$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2C(CH_3)_3$
4-Cl- C_6H_4	环戊基
4-Cl- C_6H_4	$(CH_2)_5CH_3$
4-Cl- C_6H_4	环己基
4-Cl- C_6H_4	$(CH_2)_7CH_3$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH_2OCH_3$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH_2OCH_2CH_3$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH(CH_3)OCH_3$
4-Cl- C_6H_4	$(CH_2)_3OCH_3$
4-Cl- C_6H_4	CH_2CN
4-Cl- C_6H_4	CH_2CH_2CN
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH_2CH_2CN$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH=CH_2$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH=CHCH_3$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2CH=CHCl$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2C\equiv CH$
4-Cl- C_6H_4	$CH_2C\equiv CCH_3$
4-Cl- C_6H_4	CH_2CO_2H

4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CO ₂ CH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CONH ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CONHCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CON(CH ₃) ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CO ₂ H
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CONH ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CONHCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CON(CH ₃) ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ NH ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ NHCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CSNH ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CSNH ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CSNH ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ COCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ COCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ OCF ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCF ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCHF ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ NO ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ NO ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NO ₂
4-Cl-C ₆ H ₄	C(CH ₃)=NOCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	C(CH ₃)=NOCH ₂ CH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	C(CH ₂ CH ₃)=NOCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	C(CH ₂ CH ₃)=NOCH ₂ CH ₃

4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃

表 A (续):

$R^1 = V_x$ 
V_x
2-F
3-F
4-F
2,3-F ₂
2,4-F ₂
2,5-F ₂
2,6-F ₂
3,4-F ₂
3,5-F ₂
2-F, 5-CH ₃
5-F, 2-CH ₃
2-Cl
3-Cl
4-Cl
2,3-Cl ₂
2,4-Cl ₂
2,5-Cl ₂
2,6-Cl ₂
3,4-Cl ₂
3,5-Cl ₂
2-CH ₃
3-CH ₃
4-CH ₃
2,3-(CH ₃) ₂
2,4-(CH ₃) ₂
2,5-(CH ₃) ₂
2,6-(CH ₃) ₂

3,4-(CH ₃) ₂
3,5-(CH ₃) ₂
2-NO ₂
3-NO ₂
4-NO ₂
2-CN
3-CN
4-CN
2-OCH ₃
3-OCH ₃
4-OCH ₃
2-CF ₃
3-CF ₃
4-CF ₃
2-Cl, 4-CH ₃
2-Cl, 5-CH ₃
4-Cl, 2-CH ₃
5-Cl, 2-CH ₃
2-COCH ₃
3-COCH ₃
4-COCH ₃
2-COC ₂ H ₅
3-COC ₂ H ₅
4-COC ₂ H ₅
2-CO(CH ₂) ₂ CH ₃
3-CO(CH ₂) ₂ CH ₃
4-CO(CH ₂) ₂ CH ₃
2-COCH(CH ₃) ₂
3-COCH(CH ₃) ₂
4-COCH(CH ₃) ₂
2-CH ₃ , 4-COCH ₃
2-CH ₃ , 4-COC ₂ H ₅
2-CH ₃ , 4-CO(CH ₂) ₂ CH ₃

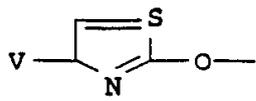
2-CH ₃ , 4-COCH(CH ₃) ₂
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-COCH ₃
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-COC ₂ H ₅
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-CO(CH ₂) ₂ CH ₃
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-COCH(CH ₃) ₂
2-CH ₃ , 4-C(CH ₃)=NOH
2-CH ₃ , 4-C(CH ₃)=NOCH ₃
2-CH ₃ , 4-C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅
2-CH ₃ , 4-C(CH ₃)=NO(CH ₂) ₂ CH ₃
2-CH ₃ , 4-C(CH ₃)=NOCH(CH ₃) ₂
2-CH ₃ , 4-C(CH ₃)=NO(CH ₂) ₃ CH ₃
2-CH ₃ , 4-C(CH ₃)=NO(CH ₂) ₄ CH ₃
2-CH ₃ , 4-C(CH ₃)=NO(CH ₂) ₅ CH ₃
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(CH ₃)=NOH
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(CH ₃)=NOCH ₃
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(CH ₃)=NO(CH ₂) ₂ CH ₃
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(CH ₃)=NOCH(CH ₃) ₂
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(CH ₃)=NO(CH ₂) ₃ CH ₃
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(CH ₃)=NO(CH ₂) ₄ CH ₃
2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(CH ₃)=NO(CH ₂) ₅ CH ₃

表 A (续)

$R^1 = V - \begin{array}{c} \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{N} \end{array} - \text{O} -$
V
2-吡啶基
3-吡啶基
4-吡啶基
5-Cl-2-吡啶基
6-Cl-2-吡啶基
3,5-Cl ₂ -2-吡啶基
3-Cl, 5-CF ₃ -2-吡啶基
5-CF ₃ -2-吡啶基
6-CF ₃ -2-吡啶基
5-CH ₃ -2-吡啶基
6-CH ₃ -2-吡啶基
5-OCH ₃ -2-吡啶基
6-OCH ₃ -2-吡啶基
5-Cl-3-吡啶基
6-Cl-3-吡啶基
3,5-Cl ₂ -3-吡啶基
3-Cl, 5-CF ₃ -3-吡啶基
5-CF ₃ -3-吡啶基
6-CF ₃ -3-吡啶基
5-CH ₃ -3-吡啶基
6-CH ₃ -3-吡啶基
5-OCH ₃ -3-吡啶基
6-OCH ₃ -3-吡啶基
2-嘧啶基
4-嘧啶基
5-嘧啶基
5-Cl-2-嘧啶基

6-Cl-2-嘧啶基
4,6-Cl ₂ -2-嘧啶基
4-Cl, 6-CF ₃ -2-嘧啶基
4-CF ₃ -2-嘧啶基
6-CF ₃ -2-嘧啶基
4-CH ₃ -2-嘧啶基
6-CH ₃ -2-嘧啶基
4-OCH ₃ -2-嘧啶基
6-OCH ₃ -2-嘧啶基
3-哒嗪基
2-Cl-3-哒嗪基
6-Cl-3-哒嗪基
2,6-Cl ₂ -3-哒嗪基
2-Cl, 6-CF ₃ -3-哒嗪基
2-CF ₃ -3-哒嗪基
6-CF ₃ -3-哒嗪基
2-CH ₃ -3-哒嗪基
6-CH ₃ -3-哒嗪基
2-OCH ₃ -3-哒嗪基
6-OCH ₃ -3-哒嗪基
2-吡嗪基
2-噁唑基
2-Cl-4-噁唑基
5-环丙基-3-异噁唑基
2-CN-4-噻唑基

表 A (续)

$R^1 =$ 
V
2-吡啶基
3-吡啶基
4-吡啶基
5-Cl-2-吡啶基
6-Cl-2-吡啶基
3,5-Cl ₂ -2-吡啶基
3-Cl, 5-CF ₃ -2-吡啶基
5-CF ₃ -2-吡啶基
6-CF ₃ -2-吡啶基
5-CH ₃ -2-吡啶基
6-CH ₃ -2-吡啶基
5-OCH ₃ -2-吡啶基
6-OCH ₃ -2-吡啶基
5-Cl-3-吡啶基
6-Cl-3-吡啶基
3,5-Cl ₂ -3-吡啶基
3-Cl, 5-CF ₃ -3-吡啶基
5-CF ₃ -3-吡啶基
6-CF ₃ -3-吡啶基
5-CH ₃ -3-吡啶基
6-CH ₃ -3-吡啶基
5-OCH ₃ -3-吡啶基
6-OCH ₃ -3-吡啶基
2-噻啶基
4-噻啶基
5-噻啶基
5-Cl-2-噻啶基

6-Cl-2-嘧啶基
4,6-Cl ₂ -2-嘧啶基
4-Cl, 6-CF ₃ -2-嘧啶基
4-CF ₃ -2-嘧啶基
6-CF ₃ -2-嘧啶基
4-CH ₃ -2-嘧啶基
6-CH ₃ -2-嘧啶基
4-OCH ₃ -2-嘧啶基
6-OCH ₃ -2-嘧啶基
3-哒嗪基
2-Cl-3-哒嗪基
6-Cl-3-哒嗪基
2,6-Cl ₂ -3-哒嗪基
2-Cl, 6-CF ₃ -3-哒嗪基
2-CF ₃ -3-哒嗪基
6-CF ₃ -3-哒嗪基
2-CH ₃ -3-哒嗪基
6-CH ₃ -3-哒嗪基
2-OCH ₃ -3-哒嗪基
6-OCH ₃ -3-哒嗪基
2-吡嗪基
2-噁唑基
2-Cl-4-噁唑基
5-环丙基-3-异噁唑基
2-CN-4-噻唑基

表 A (续)

$R^1 = \text{V} - \text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{O} \\ \diagdown \end{array} \text{N}$
V
2-吡啶基
3-吡啶基
4-吡啶基
5-Cl-2-吡啶基
6-Cl-2-吡啶基
3,5-Cl ₂ -2-吡啶基
3-Cl, 5-CF ₃ -2-吡啶基
5-CF ₃ -2-吡啶基
6-CF ₃ -2-吡啶基
5-CH ₃ -2-吡啶基
6-CH ₃ -2-吡啶基
5-OCH ₃ -2-吡啶基
6-OCH ₃ -2-吡啶基
5-Cl-3-吡啶基
6-Cl-3-吡啶基
3,5-Cl ₂ -3-吡啶基
3-Cl, 5-CF ₃ -3-吡啶基
5-CF ₃ -3-吡啶基
6-CF ₃ -3-吡啶基
5-CH ₃ -3-吡啶基
6-CH ₃ -3-吡啶基
5-OCH ₃ -3-吡啶基
6-OCH ₃ -3-吡啶基
2-嘧啶基
4-嘧啶基
5-嘧啶基
5-Cl-2-嘧啶基

6-Cl-2-嘧啶基
4,6-Cl ₂ -2-嘧啶基
4-Cl, 6-CF ₃ -2-嘧啶基
4-CF ₃ -2-嘧啶基
6-CF ₃ -2-嘧啶基
4-CH ₃ -2-嘧啶基
6-CH ₃ -2-嘧啶基
4-OCH ₃ -2-嘧啶基
6-OCH ₃ -2-嘧啶基
3-哒嗪基
2-Cl-3-哒嗪基
6-Cl-3-哒嗪基
2,6-Cl ₂ -3-哒嗪基
2-Cl, 6-CF ₃ -3-哒嗪基
2-CF ₃ -3-哒嗪基
6-CF ₃ -3-哒嗪基
2-CH ₃ -3-哒嗪基
6-CH ₃ -3-哒嗪基
2-OCH ₃ -3-哒嗪基
6-OCH ₃ -3-哒嗪基
2-吡嗪基
2-噁唑基
2-Cl-4-噁唑基
5-环丙基-3-异噁唑基
2-CN-4-噻唑基

表 A (续)

$R^1 = \text{V} - \text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{N} \\ \diagdown \text{N} \end{array} - \text{O} -$
V
2-吡啶基
3-吡啶基
4-吡啶基
5-Cl-2-吡啶基
6-Cl-2-吡啶基
3,5-Cl ₂ -2-吡啶基
3-Cl, 5-CF ₃ -2-吡啶基
5-CF ₃ -2-吡啶基
6-CF ₃ -2-吡啶基
5-CH ₃ -2-吡啶基
6-CH ₃ -2-吡啶基
5-OCH ₃ -2-吡啶基
6-OCH ₃ -2-吡啶基
5-Cl-3-吡啶基
6-Cl-3-吡啶基
3,5-Cl ₂ -3-吡啶基
3-Cl, 5-CF ₃ -3-吡啶基
5-CF ₃ -3-吡啶基
6-CF ₃ -3-吡啶基
5-CH ₃ -3-吡啶基
6-CH ₃ -3-吡啶基
5-OCH ₃ -3-吡啶基
6-OCH ₃ -3-吡啶基
2-嘧啶基
4-嘧啶基
5-嘧啶基
5-Cl-2-嘧啶基

6-Cl-2-嘧啶基
4,6-Cl ₂ -2-嘧啶基
4-Cl, 6-CF ₃ -2-嘧啶基
4-CF ₃ -2-嘧啶基
6-CF ₃ -2-嘧啶基
4-CH ₃ -2-嘧啶基
6-CH ₃ -2-嘧啶基
4-OCH ₃ -2-嘧啶基
6-OCH ₃ -2-嘧啶基
3-哒嗪基
2-Cl-3-哒嗪基
6-Cl-3-哒嗪基
2,6-Cl ₂ -3-哒嗪基
2-Cl, 6-CF ₃ -3-哒嗪基
2-CF ₃ -3-哒嗪基
6-CF ₃ -3-哒嗪基
2-CH ₃ -3-哒嗪基
6-CH ₃ -3-哒嗪基
2-OCH ₃ -3-哒嗪基
6-OCH ₃ -3-哒嗪基
2-吡嗪基
2-噁唑基
2-Cl-4-噁唑基
5-环丙基-3-异噁唑基
2-CN-4-噻唑基

表 A (续)

$R^1 = R''ON=CR'-C(R''')=NO-$		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-F-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2,3-F ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,5-F ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,6-F ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,4-F ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,5-F ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2,3-Cl ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂
CH ₃	CH ₃	2,3,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂
CH ₃	CH ₃	2,3,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
CH ₃	CH ₃	2,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂
CH ₃	CH ₃	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
CH ₃	CH ₃	3,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂
CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-Br-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2,3-Br ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,4-Br ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,5-Br ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,6-Br ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,4-Br ₂ -C ₆ H ₃

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	3,5-Br ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-F, 3-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-F, 4-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-F, 5-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-F, 3-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-F, 4-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-F, 5-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-Cl, 3-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-Cl, 4-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-F, 4-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-F, 5-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-F, 6-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-F, 4-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-F, 5-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-F, 6-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-Cl, 4-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-Cl, 6-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	4-F, 5-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	4-F, 6-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	4-F, 5-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	4-F, 6-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	4-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	5-F, 6-Cl-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	5-F, 6-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	5-Cl, 6-Br-C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3-Br, 4-Cl, 5-Br-C ₆ H ₂
CH ₃	CH ₃	2-CN-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CN-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-CN-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-NO ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-NO ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-NO ₂ -C ₆ H ₄

$R^1 = R''ON=CR'-C(R''')=NO-$		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2,3-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-tert.-C ₆ H ₄ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-tert.-C ₆ H ₄ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-Vinyl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-Vinyl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-Vinyl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-Allyl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-Allyl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-Allyl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-OH-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-OH-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-OH-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2,3-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,5-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	3,4,5-(OCH ₃) ₃ -C ₆ H ₂
CH ₃	CH ₃	2-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-O-(n-C ₄ H ₉)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-O-(t-C ₄ H ₉)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-O-(t-C ₄ H ₉)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-O-烯丙基-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-O-烯丙基-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-O-烯丙基-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-乙酰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-乙酰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-乙酰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2- 甲氧羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3- 甲氧羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4- 甲氧羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2- 氨基羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3- 氨基羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4- 氨基羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-二甲基氨基羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-二甲基氨基羰基 -C ₆ H ₄

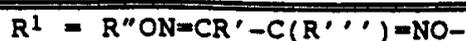
R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	4- 二甲氨基羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-(N - 甲基氨基羰基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-(N - 甲基氨基羰基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-(N - 甲基氨基羰基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-H ₂ N-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-H ₂ N-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-H ₂ N-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-氨基硫代羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-氨基硫代羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-氨基硫代羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-甲氧基亚氨基甲基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-甲氧基亚氨基甲基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-甲氧基亚氨基甲基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-甲酰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-甲酰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-Formyl-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-(1'-甲氧基亚氨基乙-1'-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-(1'-甲氧基亚氨基乙-1'-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-(1'-甲氧基亚氨基乙-1'-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-SCH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-SCH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-OCF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-OCF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-OCHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-OCHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ , 4-OCF ₃ -C ₆ H ₃
CH ₃	CH ₃	2-NHCH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-NHCH ₃ -C ₆ H ₄

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	4-NHCH ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-乙氧羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-乙氧羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-乙氧羰基 -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-CHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-CHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-CHF ₂ -C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-(1'-氧代-正丙-1-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-(1'-氧代-正丙-1-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-(1'-氧代-正丙-1-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	2-(1'-氧代-异丙-1-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	3-(1'-氧代-异丙-1-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	4-(1'-氧代-异丙-1-基)-C ₆ H ₄
CH ₃	CH ₃	环丙基
CH ₃	CH ₃	环戊基
CH ₃	CH ₃	环己基
CH ₃	CH ₃	1-萘基
CH ₃	CH ₃	2-萘基
CH ₃	CH ₃	2-吡啶基
CH ₃	CH ₃	3-吡啶基
CH ₃	CH ₃	4-吡啶基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -吡啶-2-基



R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	5-Cl-吡啶-2-基
CH ₃	CH ₃	6-Cl-吡啶-2-基
CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -吡啶-2-基
CH ₃	CH ₃	6-OCH ₃ -吡啶-2-基
CH ₃	CH ₃	6-CH ₃ -吡啶-2-基
CH ₃	CH ₃	6-Cl-吡啶-3-基
CH ₃	CH ₃	6-CH ₃ -吡啶-3-基
CH ₃	CH ₃	6-OCH ₃ -吡啶-3-基
CH ₃	CH ₃	2-嘧啶基
CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -嘧啶-2-基
CH ₃	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -嘧啶-2-基
CH ₃	CH ₃	4-Cl-嘧啶-2-基
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -嘧啶-2-基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -嘧啶-2-基
CH ₃	CH ₃	5-Cl-嘧啶-2-基
CH ₃	CH ₃	5-OCH ₃ -嘧啶-2-基
CH ₃	CH ₃	5-OC ₂ H ₅ -嘧啶-2-基
CH ₃	CH ₃	4-嘧啶基
CH ₃	CH ₃	2-Cl-嘧啶-4-基
CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -嘧啶-4-基
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -嘧啶-4-基
CH ₃	CH ₃	6-Cl-嘧啶-4-基
CH ₃	CH ₃	6-CH ₃ -嘧啶-4-基
CH ₃	CH ₃	6-OCH ₃ -嘧啶-4-基
CH ₃	CH ₃	5-嘧啶基
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -嘧啶-5-基
CH ₃	CH ₃	2-Cl-嘧啶-5-基
CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -嘧啶-5-基
CH ₃	CH ₃	2-OC ₂ H ₅ -嘧啶-5-基
CH ₃	CH ₃	2-咪喃基
CH ₃	CH ₃	4-C ₂ H ₅ -咪喃-2-基
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -咪喃-2-基
CH ₃	CH ₃	4-Cl-咪喃-2-基
CH ₃	CH ₃	4-CN-咪喃-2-基

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	5 - CH ₃ - 咪喃 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5 - Cl - 咪喃 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5 - CN - 咪喃 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	3-咪喃基
CH ₃	CH ₃	5 - CH ₃ - 咪喃 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5 - Cl - 咪喃 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5 - CN - 咪喃 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	2 - 噻吩基
CH ₃	CH ₃	4 - CH ₃ - 噻吩 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4 - Cl - 噻吩 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4 - CN - 噻吩 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -噻吩 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-Cl-噻吩 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CN-噻吩 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	3-噻吩基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -噻吩 - 3-基
CH ₃	CH ₃	5-Cl-噻吩 - 3-基
CH ₃	CH ₃	5-CN-噻吩 - 3-基
CH ₃	CH ₃	1- 甲基丙 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	1-甲基丙 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	2 - 噁唑基
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -噁唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4-Cl-噁唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4-CN-噁唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -噁唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-Cl-噁唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CN-噁唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4 - 噁唑基
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -噁唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	2-Cl-噁唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	2-CN-噁唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	5 - 噁唑基
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -噁唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	2-Cl-噁唑 - 5 - 基



R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	2 - CN - 噁唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	3 - 异噁唑基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ - 异噁唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5-Cl - 异噁唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CN - 异噁唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5 - 异噁唑基
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ - 异噁唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	3-Cl - 异噁唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	3-CN - 异噁唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	2-噻唑基
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -噻唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4-Cl-噻唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4-CN-噻唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -噻唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-Cl-噻唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CN-噻唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4 - 噻唑基
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -噻唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	2-Cl-噻唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	2-CN-噻唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	2-SCH ₃ -噻唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	5 - 噻唑基
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -噻唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	2-Cl-噻唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	2-CN-噻唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	3 - 异噻唑基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -异噻唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5-Cl-异噻唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CN- 异噻唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5 - 异噻唑基
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ - 异噻唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	3-Cl-异噻唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	3-CN-异噻唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	2 - 咪唑基

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -咪唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4-Cl-咪唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4-CN-咪唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -咪唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 4-Cl-咪唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	1,4-(CH ₃) ₂ -咪唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 5-Cl-咪唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	1,5-(CH ₃) ₂ -咪唑 - 2 - 基
CH ₃	CH ₃	4 - 咪唑基
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -咪唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	2-Cl-咪唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -咪唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	1,2-(CH ₃) ₂ -咪唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 2-Cl-咪唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -咪唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 3-Cl-咪唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	1,2-(CH ₃) ₂ -咪唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	3 - 吡唑基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -吡唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5-Cl-吡唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	5-CN-吡唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -吡唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 4-Cl-吡唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 5-Cl-吡唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	1,5-(CH ₃) ₂ -吡唑 - 3 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -吡唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 3-Cl-吡唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	1,3-(CH ₃) ₂ -吡唑 - 5 - 基
CH ₃	CH ₃	4 - 吡唑基
CH ₃	CH ₃	3-Cl-吡唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -吡唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -吡唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 3-Cl-吡唑 - 4 - 基
CH ₃	CH ₃	1,3-(CH ₃) ₂ -吡唑 - 4 - 基

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	1,3,4-噁二唑-5-基
CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3,4-噁二唑-5-基
CH ₃	CH ₃	2-Cl-1,3,4-噁二唑-5-基
CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -1,3,4-噁二唑-5-基
CH ₃	CH ₃	2-i-C ₃ H ₇ -1,3,4-噁二唑-5-基
CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -1,3,4-噁二唑-5-基
CH ₃	CH ₃	1,2,4-噁二唑-3-基
CH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -1,2,4-噁二唑-3-基
CH ₃	CH ₃	5-i-C ₃ H ₇ -1,2,4-噁二唑-3-基
CH ₃	CH ₃	5-Cl-1,2,4-噁二唑-3-基
CH ₃	CH ₃	5-CF ₃ -1,2,4-噁二唑-3-基
CH ₃	CH ₃	1,2,4-三唑-3-基
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -1,2,4-三唑-3-基
CH ₃	CH ₃	1-吡咯基
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -吡咯-1-基
CH ₃	CH ₃	1-吡唑基
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -吡唑-1-基
CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -吡唑-1-基
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -吡唑-1-基
CH ₃	CH ₃	4-Cl-吡唑-1-基
CH ₃	CH ₃	4-乙氧羰基-吡唑-1-基
CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 4-Br-吡唑-1-基
CH ₃	CH ₃	1-咪唑基
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -咪唑-1-基
CH ₃	CH ₃	4,5-Cl ₂ -咪唑-1-基
CH ₃	CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂ -咪唑-1-基
CH ₃	CH ₃	1,2,4-三唑-1-基
CH ₃	CH ₃	1,3,4-三唑-1-基
CH ₃	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂ -1,2,4-三唑-1-基
CH ₃	CH ₃	1-吡啶基
CH ₃	CH ₃	1-吡咯烷基
CH ₃	CH ₃	1-吗啉基
H	CH ₃	CH ₃
F	CH ₃	CH ₃

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
Cl	CH ₃	CH ₃
Br	CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
CN	CH ₃	CH ₃
NO ₂	CH ₃	CH ₃
OCH ₃	CH ₃	CH ₃
SCH ₃	CH ₃	CH ₃
NH ₂	CH ₃	CH ₃
NH(CH ₃)	CH ₃	CH ₃
N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃
OH	CH ₃	CH ₃
CF ₃	CH ₃	CH ₃
OCF ₃	CH ₃	CH ₃
H	CH ₃	C ₆ H ₅
F	CH ₃	C ₆ H ₅
Cl	CH ₃	C ₆ H ₅
Br	CH ₃	C ₆ H ₅
C ₂ H ₅	CH ₃	C ₆ H ₅
CN	CH ₃	C ₆ H ₅
NO ₂	CH ₃	C ₆ H ₅
OCH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
SCH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
NH ₂	CH ₃	C ₆ H ₅
NH(CH ₃)	CH ₃	C ₆ H ₅
NH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₆ H ₅
OH	CH ₃	C ₆ H ₅
CF ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
OCF ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
CH ₃	CH ₃	n-C ₃ H ₇
CH ₃	CH ₃	iso-C ₃ H ₇
CH ₃	CH ₃	tert-C ₄ H ₉
CH ₃	CH ₃	CN

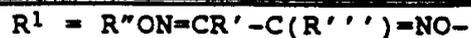
$R^1 = R''ON=CR'-C(R''')=NO-$		
R'''	R''	R'
CH ₃	CH ₃	NO ₂
CH ₃	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅
CH ₃	CH ₃	O-n-C ₃ H ₇
CH ₃	CH ₃	O-iso-C ₃ H ₇
CH ₃	CH ₃	O-Benzyl
CH ₃	CH ₃	SCH ₃
CH ₃	CH ₃	SC ₂ H ₅
CH ₃	CH ₃	S-n-C ₃ H ₇
CH ₃	CH ₃	S-iso-C ₃ H ₇
CH ₃	CH ₃	NH ₂
CH ₃	CH ₃	NH(CH ₃)
CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	OH
CH ₃	CH ₃	CF ₃
CH ₃	CH ₃	OCF ₃
OCH ₃	CH ₃	OCH ₃
CF ₃	CH ₃	CF ₃
SCH ₃	CH ₃	CN
OH	CH ₃	OH
OCH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
OCH ₃	n-C ₃ H ₇	CH ₃
OCH ₃	iso-C ₃ H ₇	CH ₃
OCH ₃	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
OCH ₃	n-C ₃ H ₇	C ₆ H ₅
OCH ₃	iso-C ₃ H ₇	C ₆ H ₅
CH ₃	CH ₃	F
CH ₃	CH ₃	Cl
CH ₃	CH ₃	Br
CH ₃	CH ₃	S(C ₆ H ₅)
CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
CH ₃	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇
CH ₃	C ₂ H ₅	iso-C ₃ H ₇
CH ₃	C ₂ H ₅	tert-C ₄ H ₉

R ¹ = R ^{''} ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-F-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2,3-F ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,5-F ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,6-F ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,4-F ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,5-F ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2,3-Cl ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂
OCH ₃	CH ₃	2,3,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂
OCH ₃	CH ₃	2,3,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
OCH ₃	CH ₃	2,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂
OCH ₃	CH ₃	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
OCH ₃	CH ₃	3,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂
OCH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-Br-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2,3-Br ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,4-Br ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,5-Br ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,6-Br ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,4-Br ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,5-Br ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-F, 3-Cl-C ₆ H ₃

$R^1 = R''ON=CR'-C(R''')=NO-$		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	2-F, 4-Cl-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-F, 5-Cl-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-F, 3-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-F, 4-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-F, 5-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-Cl, 3-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-Cl, 4-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-F, 4-Cl-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-F, 5-Cl-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-F, 6-Cl-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-F, 4-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-F, 5-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-F, 6-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-Cl, 4-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-Cl, 6-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	4-F, 5-Cl-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	4-F, 6-Cl-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	4-F, 5-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	4-F, 6-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	4-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	5-F, 6-Cl-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	5-F, 6-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	5-Cl, 6-Br-C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3-Br, 4-Cl, 5-Br-C ₆ H ₂
OCH ₃	CH ₃	2-CN-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CN-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-CN-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-NO ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-NO ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-NO ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2,3-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-tert.-C ₆ H ₄ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-tert.-C ₆ H ₄ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-Vinyl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-Vinyl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-Vinyl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-Allyl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-Allyl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-Allyl-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-OH-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-OH-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-OH-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2,3-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃

$R^1 = R''ON=CR'-C(R''')=NO-$		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	3,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,5-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	3,4,5-(OCH ₃) ₃ -C ₆ H ₂
OCH ₃	CH ₃	2-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-O-(n-C ₄ H ₉)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-O-(t-C ₄ H ₉)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-O-(n-C ₆ H ₁₃)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-O-烯丙基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-O-烯丙基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-O-烯丙基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-乙酰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-乙酰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-乙酰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-甲氧羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-甲氧羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-甲氧羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-氨基羰基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-氨基羰基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-氨基羰基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-二甲氨基羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-二甲氨基羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-二甲氨基羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-(N-甲基氨基羰基)-C ₆ H ₄



R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	3-(N-甲基氨基羰基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-(N-甲基氨基羰基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-H ₂ N-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-H ₂ N-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-H ₂ N-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-氨基硫代羰基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-氨基硫代羰基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-氨基硫代羰基-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-甲氧基亚氨基甲基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-甲氧基亚氨基甲基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-甲氧基亚氨基甲基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-甲酰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-甲酰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-甲酰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-(1'-甲氧基亚氨基乙-1'-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-(1'-甲氧基亚氨基乙-1'-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-(1'-甲氧基亚氨基乙-1'-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-SCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-SCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-OCF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-OCF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-OCHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-OCHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CF ₃ , 4-OCF ₃ -C ₆ H ₃
OCH ₃	CH ₃	2-NHCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-NHCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-NHCH ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄

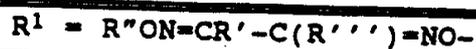
R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	3-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-乙氧羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-乙氧羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-乙氧羰基 -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-CHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-CHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-CHF ₂ -C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-(1'-氧代-正丙-1-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-(1'-氧代-正丙-1-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-(1'-氧代-正丙-1-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	2-(1'-氧代-异丙-1-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	3-(1'-氧代-异丙-1-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	4-(1'-氧代-异丙-1-基)-C ₆ H ₄
OCH ₃	CH ₃	环丙基
OCH ₃	CH ₃	环戊基
OCH ₃	CH ₃	环己基
OCH ₃	CH ₃	1-萘基
OCH ₃	CH ₃	2-萘基
OCH ₃	CH ₃	2-吡啶基
OCH ₃	CH ₃	3-吡啶基
OCH ₃	CH ₃	4-吡啶基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -吡啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-吡啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	6-Cl-吡啶-2-基

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -吡啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	6-OCH ₃ -吡啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	6-CH ₃ -吡啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	6-Cl-吡啶-3-基
OCH ₃	CH ₃	6-CH ₃ -吡啶-3-基
OCH ₃	CH ₃	6-OCH ₃ -吡啶-3-基
OCH ₃	CH ₃	2-嘧啶基
OCH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -嘧啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-OC ₂ H ₅ -嘧啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-Cl-嘧啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -嘧啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -嘧啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-嘧啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-OCH ₃ -嘧啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-OC ₂ H ₅ -嘧啶-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-嘧啶基
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-嘧啶-4-基
OCH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -嘧啶-4-基
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -嘧啶-4-基
OCH ₃	CH ₃	6-Cl-嘧啶-4-基
OCH ₃	CH ₃	6-CH ₃ -嘧啶-4-基
OCH ₃	CH ₃	6-OCH ₃ -嘧啶-4-基
OCH ₃	CH ₃	5-嘧啶基
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -嘧啶-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-嘧啶-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -嘧啶-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-OC ₂ H ₅ -嘧啶-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-咪喃基
OCH ₃	CH ₃	4-C ₂ H ₅ -咪喃-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -咪喃-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-Cl-咪喃-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-CN-咪喃-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -咪喃-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-咪喃-2-基

R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	5-CN- 咪喃 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	3 - 咪喃基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -咪喃 - 3 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-咪喃 - 3 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-CN-咪喃 - 3 - 基
OCH ₃	CH ₃	2-噻吩基
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -噻吩 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	4-Cl-噻吩 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	4-CN-噻吩 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -噻吩 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-噻吩 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-CN-噻吩 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	3 - 噻吩基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -噻吩 - 3 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-噻吩 - 3 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-CN-噻吩 - 3 - 基
OCH ₃	CH ₃	1 - 甲基丙基 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	1 - 甲基丙基 - 3 - 基
OCH ₃	CH ₃	2 - 噁唑基
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -噁唑 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	4-Cl-噁唑 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	4-CN-噁唑 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -噁唑 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-噁唑 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	5-CN-噁唑 - 2 - 基
OCH ₃	CH ₃	4 - 噁唑基
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -噁唑 - 4 - 基
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-噁唑 - 4 - 基
OCH ₃	CH ₃	2-CN-噁唑 - 4 - 基
OCH ₃	CH ₃	5 - 噁唑基
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -噁唑 - 5 - 基
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-噁唑 - 5 - 基
OCH ₃	CH ₃	2-CN-噁唑 - 5 - 基
OCH ₃	CH ₃	3 - 异噁唑基

R ¹ = R ^{''} ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -异噁唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-异噁唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-CN-异噁唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-异噁唑基
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -异噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	3-Cl-异噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	3-CN-异噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-噁唑基
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -噁唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-Cl-噁唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-CN-噁唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -噁唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-噁唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	5-CN-噁唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-噁唑基
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -噁唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-噁唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	2-CN-噁唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	2-SCH ₃ -噁唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	5-噁唑基
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-CN-噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	3-异噁唑基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -异噁唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-异噁唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-CN-异噁唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-异噁唑基
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -异噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	3-Cl-异噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	3-CN-异噁唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-咪唑基
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -咪唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-Cl-咪唑-2-基

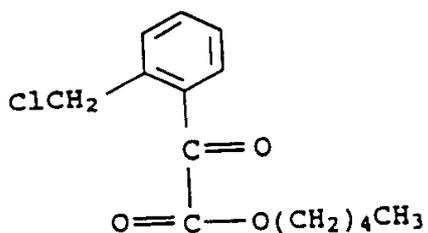
R ¹ = R''ON=CR'-C(R''')=NO-		
R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	4-CN-咪唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -咪唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 4-Cl-咪唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	1,4-(CH ₃) ₂ -咪唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 5-Cl-咪唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	1,5-(CH ₃) ₂ -咪唑-2-基
OCH ₃	CH ₃	4-咪唑基
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -咪唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-咪唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -咪唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	1,2-(CH ₃) ₂ -咪唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 2-Cl-咪唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -咪唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 3-Cl-咪唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	1,2-(CH ₃) ₂ -咪唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	3-吡唑基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -吡唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-吡唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-CN-吡唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -吡唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 4-Cl-吡唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 5-Cl-吡唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	1,5-(CH ₃) ₂ -吡唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -吡唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 3-Cl-吡唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	1,3-(CH ₃) ₂ -吡唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	4-吡唑基
OCH ₃	CH ₃	3-Cl-吡唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -吡唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -吡唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ , 3-Cl-吡唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	1,3-(CH ₃) ₂ -吡唑-4-基
OCH ₃	CH ₃	1,3,4-噁二唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3,4-噁二唑-5-基



R'''	R''	R'
OCH ₃	CH ₃	2-Cl-1,3,4-噁二唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -1,3,4-噁二唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-i-C ₃ H ₇ -1,3,4-噁二唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -1,3,4-噁二唑-5-基
OCH ₃	CH ₃	1,2,4-噁二唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-CH ₃ -1,2,4-噁二唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-i-C ₃ H ₇ -1,2,4-噁二唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-Cl-1,2,4-噁二唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	5-CF ₃ -1,2,4-噁二唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	1,2,4-三唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -1,2,4-三唑-3-基
OCH ₃	CH ₃	1-吡咯基
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -吡咯-1-基
OCH ₃	CH ₃	1-吡唑基
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -吡唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -吡唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -吡唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	4-Cl-吡唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	4-乙氧羰基-吡唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 4-Br-吡唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	1-咪唑基
OCH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -咪唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	4,5-Cl ₂ -咪唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂ -咪唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	1,2,4-三唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	1,3,4-三唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂ -1,2,4-三唑-1-基
OCH ₃	CH ₃	1-1-吡啶基
OCH ₃	CH ₃	1-1-吡咯烷基
OCH ₃	CH ₃	1-吗啉基

实施例 1

2-(氯甲基)苯乙醛酸正戊酯



在 80g 甲苯中用 1.8g 水将 18g 1-戊醇 (0.2mol) 溶解。然后导入 14.6g (0.4mol) 氯化氢气体 (-0°C)。随后滴加入 16.2g (0.09mol) 2-(氯甲基)苯甲酰氯。混合物于室温搅拌 2 小时并在 60°C 加热 8 小时。

冷却反应混合物，并用 50ml 15% 浓度盐酸提取一次及 50ml 水提取三次，并浓缩至干。

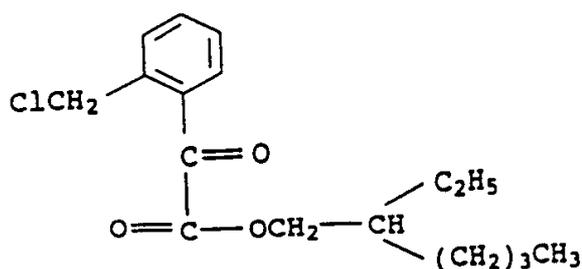
产率: 23g (95%, 含 4.9% 2-(氯甲基)苯甲酸戊酯)

取少量用色谱纯化，如用硅胶 60 快速色谱纯化，环己烷: 甲苯 = 2: 1。大量部分采用蒸馏方式纯化。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 0.92$ (t, 3H); 1.28–1.48 (m, 4H); 1.67–1.84 (m, 2H); 4.39 (t, 2H); 5.03 (s, 2H); 7.45–7.78 (m, 4H) ppm.

实施例 2

2-(氯甲基)苯乙醛酸 (2-乙基) 己酯



利用 2.0g 水使 30g 2-乙基己醇 (0.23mol) 溶于 80g 甲苯中。0-5℃ 下, 导入 14.6g (0.4mol) 氯化氢气体, 然后在 0℃ 滴加入溶在 25g 甲苯中的 18g 2-(氯甲基)苯甲酰氯。

反应混合物在 2 小时内搅拌加热至 60℃。在此温度下搅拌 8 小时后, 冷却至室温, 并用 50ml 15% 浓度盐酸洗涤一次及用 50ml 水洗涤 3x。

粗产物: 33g (约 88%)

采用环己烷 (3): 甲苯 (1) 在硅胶 60 上快速层析。

产率: 23g (75%, 纯度 > 99%)

实施例 3

2-甲氧基亚氨基-2-[(2'-氯甲基)苯基]乙酸正戊酯

将 33g (0.4mol) O-甲基羟胺盐酸化物和 10g 干燥分子筛珠 (3Å) 加到 27g (0.1mol) 2-(氯甲基)苯乙醛酸正戊酯的 50ml 甲醇溶液中并将混合物室温放置 16 小时。滤出分子筛后, 浓缩溶液, 残留物分配在甲基叔丁基醚和水之间, 有机相用水洗涤, 硫酸钠干燥并浓缩。得到 30g (100%) 标题化合物, 为浅黄色油, 该产物以 1:1 E/Z 异构体混合物形式存在。利用硅胶柱色谱能够分离各异构体 (甲基叔丁基醚/正己烷)。

E 异构体: (无色油)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 0.87$ (t, 3H); 1.20-1.37 (m, 4H); 1.62-1.74 (m, 2H); 4.05 (s, 3H); 4.27 (t, 2H); 4.44 (s, 2H); 7.16 (dd, 1H); 7.32-7.51 (m, 3H) ppm.

Z 异构体: (无色油)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 0.89$ (t, 3H); 1.24-1.41 (m, 4H); 1.66-1.77 (m, 2H); 4.04 (s, 3H); 4.30 (t, 2H); 4.88 (s, 2H); 7.32-7.47 (m, 3H); 7.58 (d, 1H) ppm.

实施例 4

(E)-2-甲氧基亚氨基-2-[(2'-氯甲基)苯基]乙酸正戊酯

冰冷却下, 用氯化氢气体饱和 30g (0.1 mol) 2-甲氧基亚氨基-2-[(2'-氯甲基)苯基]乙酸正戊酯 (E: Z=1: 1) 的 500ml 乙醚溶液。冷却混合物至室温并室温搅拌混合物 16 小时。浓缩和硅胶柱色谱纯化之后(甲基叔丁基醚/正己烷), 得 24.3g (81% 产率) 所要标题化合物, 为无色油。

¹H-NMR: 见实施例 1 (E 异构体)

实施例 5

(E,E)-2-甲氧基亚氨基-2-[[2'-(1''-(4'''-氯苯基)-1''-甲基)亚氨基氧基甲基]苯基]乙酸正戊酯

先将 0.27g (11mmol) 氯化钠放入 50ml 二甲基甲酰胺内。分批加入 1.7g 4-氯苯乙酮脞并将混合物室温搅拌 30 分钟。然后滴加入 3.0g (10mmol) (E)-2-甲氧基亚氨基-2-[(2'-氯甲基)苯基]乙酸正戊酯的 10ml 二甲基甲酰胺溶液。混合物在室温搅拌 2 小时, 倒入到冷的 2M 盐酸中并用甲基叔丁基醚提取。合并的有机相用水洗涤, 硫酸钠干燥并浓缩。硅胶柱色谱(甲基叔丁基醚/正己烷)纯化之后, 得 3.5g (80%) 标题化合物, 为无色油。

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 0.84 (t, 3H); 1.16–1.36 (m, 4H); 1.53–1.72 (m, 2H); 2.18 (s, 3H); 4.02 (s, 3H); 4.19 (t, 2H); 5.12 (s, 2H); 7.17–7.59 (m, 8H) ppm.

实施例 6

N-甲基-(E,E)-2-甲氧基亚氨基-2-[[2'-(1''-(4'''-氯苯基)-1''-甲基)亚氨基氧基甲基]苯基]乙酰胺

将 2.0g (4.6mmol) (E,E)-2-甲氧基亚氨基-2-[[2'-(1''-(4'''-

氯苯基)-1''-甲基)亚氨基氧基甲基]苯基}乙酸正戊酯溶于50ml四氢呋喃中,用20ml40%浓度一甲胺水溶液处理并在室温下搅拌3小时。然后用水处理混合物并用甲基叔丁基醚提取。合并得有机相用水洗涤,硫酸钠干燥并浓缩。得1.6g(92%)标题化合物,为白色粉末,熔点117-119℃。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 2.17$ (s, 3H); 2.86 (d, 3H); 3.94 (s, 3H); 5.11 (s, 2H); 6.72 (s, br, 1H); 7.19-7.55 (m, 8H) ppm.

实施例 7

N-甲基-(Z)-2-甲氧基亚氨基-2-{{2'-(E)-(1''-(4'''-氯苯基)-1''-甲基)亚氨基氧基甲基]苯基}乙酰胺

先将0.09g(3.7mmol)氯化钠放入10ml二甲基甲酰胺内。分批加入0.58g4-氯苯乙酮肟并将混合物室温搅拌30分钟。然后滴加入1.0g(3.4mmol)(Z)-2-甲氧基亚氨基-2-[(2'-氯甲基)苯基]乙酸正戊酯的10ml二甲基甲酰胺溶液。混合物在室温搅拌30分钟,用10ml四氢呋喃和10ml40%浓度一甲胺水溶液处理并在室温下搅拌16小时。然后用水处理混合物并用甲基叔丁基醚提取。合并得有机相用水洗涤,硫酸钠干燥并浓缩。硅胶柱色谱(甲基叔丁基醚/n-己烷)纯化后,得1.0g(79%产率)标题化合物,为米色粉末,熔点111-113℃。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 2.23$ (s, 3H); 2.80 (d, 3H); 4.04 (s, 3H); 5.39 (s, 2H); 6.68 (s, br, 1H); 7.30-7.55 (m, 8H) ppm.

实施例 8

N-甲基-(E,E)-2-甲氧基亚氨基-2-{{2'-(1''-(4'''-氯苯基)-1''-甲基)亚氨基氧基甲基]苯基}乙酰胺

将50ml饱和氢氯酸乙醚溶液加到8.4g(0.022mol)N-甲基-(Z)-2-甲氧基亚氨基-2-{{2'-(E)-(1''-(4'''-氯苯基)-1''-甲基)亚氨基氧基甲基]苯基}乙酰胺的300ml甲苯溶液内,并将混合物室温放置4小时。加入甲基叔丁基醚后,先用饱和碳酸氢钠溶液洗涤,然后用水洗涤至中性,分出有机相,硫酸钠干燥并浓缩。硅胶柱色谱(甲基叔丁基醚/n-己烷)纯化后,得5.4g(65%产率)标题化合物,为无色晶体,熔点117-119℃。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 2.17$ (s, 3H); 2.86 (d, 3H); 3.94 (s, 3H); 5.11 (s, 2H); 6.71 (sbr, 1H); 7.19-7.55 (m, 8H) ppm.

实施例 9

2-(氯甲基)苯乙酰胺

将 16.5g (92mmol) 2-(氯甲基)苯甲酰氯, 150ml 浓盐酸和 150ml 饱和氢氟酸乙醚溶液一同混合并于室温下搅拌 5 小时。然后将混合物倒入水中, 分出有机相并将水相用甲基叔丁基醚提取。合并的有机相用水洗涤, 硫酸钠干燥并浓缩。硅胶柱色谱(甲基叔丁基醚/n-己烷)纯化后, 得 13.4g (74%产率) 标题化合物, 为米色粉末, 熔点 105-107 °C。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 4.90$ (s, 2H); 5.79 (s, br, 1H); 7.03 (s, br, 1H); 7.46-7.69 (m, 3H); 8.02 (d, 1H) ppm.

实施例 10

2-(氯甲基)苯乙酰胺正戊酯

开始先将 1.5g (7.6mmol) 2-(氯甲基)苯乙酰胺加到 200ml 正戊醇内。然后将氯化氢气体通入混合物内至其饱和, 温度升至 80 °C。然后再搅拌混合物 3 小时并浓缩, 残留物用水处理并将混合物用甲基叔丁基醚提取。水洗合并的有机相, 硫酸钠干燥并浓缩。硅胶柱色谱(甲基叔丁基醚/n-己烷)纯化后, 得 1.1g (54%产率) 标题化合物, 为无色油。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 0.92$ (t, 3H); 1.28-1.48 (m, 4H); 1.67-1.84 (m, 2H); 4.39 (t, 2H); 5.03 (s, 2H); 7.45-7.78 (m, 4H) ppm.

实施例 11

N-甲基-(E,E,E)-2-[[[2-(甲氧基亚氨基)-1, 2-(二甲基)亚乙基]氧基]氧基]甲基]- α -甲氧基亚氨基苯乙酰胺

先将 1.4g (10mmol) 碳酸钾和 0.7g (5.4mmol) (E,E)-2-羟基亚氨基-3-甲氧基亚氨基丁烷全部加到 15ml 二甲基甲酰胺内并将混合物于 50 °C 搅拌 1 小时。然后加入溶在 5ml 二甲基甲酰胺内的 1.5g (5.0mmol) (E)-2-甲氧基亚氨基-2-[2-(氯甲基)苯基]乙酸正戊酯,

并在室温搅拌混合物共 48 小时。然后加入 20ml40%浓度一甲胺水溶液并将混合物室温搅拌 1 小时。水处理后，用甲基叔丁基醚提取。水洗合并的有机相，硫酸钠干燥并浓缩。硅胶柱色谱（甲基叔丁基醚/n-己烷）纯化后，得 1. 5g（91%产率）标题化合物，为无白色粉末，熔点 67-69 °C。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 1.95$ (s, 3H); 1.98 (s, 3H); 2.90 (d, 3H); 3.92 (s, 3H); 3.94 (s, 3H); 5.05 (s, 2H); 6.70 (s, br, 1H); 7.13-7.45 (m, 4H) ppm.

实施例 12

N-甲基-(E,E,E)-2[[[2-(甲氧基亚氨基)-1-(甲基)-2-(苯基)亚乙基]氧基]甲基]- α -甲氧基亚氨基苯乙酰胺

先将 2. 2g (16mmol) 碳酸钾和 0. 65g (3. 4mmol) (E,E)-1-苯基-1-甲氧基亚氨基-丙-2-酮-2-脞全部加到 30ml 二甲基甲酰胺内并将混合物于 60 °C 搅拌 1 小时。然后加入溶在 20ml 二甲基甲酰胺内的 1. 0g (3. 4mmol) (E)-2-甲氧基亚氨基-2-[(2-氯甲基)苯基]乙酸正戊酯，并在室温搅拌混合物 28 小时及在 60 °C 搅拌 17 小时。冷却后，加入 50ml 四氢呋喃和 15ml40%浓度一甲胺水溶液并将混合物室温搅拌 24 小时。水处理后，用甲基叔丁基醚提取。水洗合并的有机相，硫酸钠干燥并浓缩。硅胶柱色谱（甲基叔丁基醚/n-己烷）纯化后，得 1. 0g (75%产率) 标题化合物，为无白色粉末，熔点 127-130 °C。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 2.10$ (s, 3H); 2.84 (d, 3H); 3.87 (s, 3H); 3.89 (s, 3H); 4.91 (s, 2H); 6.62 (s, br, 1H); 7.12-7.33 (m, 9H) ppm.

实施例 13

(E)-2-[[[1-苯基-1, 2, 4-三唑-3-基]氧基]甲基]- α -甲氧基亚氨基苯乙酰胺正戊酯

先将 0. 80g (5. 0mmol)3-羟基-1-苯基-1, 2, 4-三唑和 3. 5g

(25mmol) 碳酸钾加到 40ml 二甲基甲酰胺内并将混合物于室温搅拌 10 分钟。然后加入 1.5g (5.0mmol) 溶在 10ml 二甲基甲酰胺内的(E)-2-甲氧基亚氨基-2-[(2-氯甲基)苯基]乙酸正戊酯和平勺尖量碘化钾, 将混合物在 100 ℃ 搅拌 6 小时。水处理后, 用甲基叔丁基醚提取。水洗合并的有机相, 硫酸钠干燥并浓缩。硅胶柱色谱(甲基叔丁基醚/n-己烷)纯化后, 得 1.7g (80% 产率) 标题化合物, 为黄色油。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 0.83$ (t, 3H); 1.21–1.32 (m, 4H); 1.60–1.71 (m, 2H); 4.04 (s, 3H); 4.23 (t, 2H), 5.26 (s, 2H); 7.17–7.70 (m, 9H); 8.25 (s, 1H) ppm.

实施例 14

N-甲基-(E)-2-[[[1-苯基-1, 2, 4-三唑-3-基]氧基]甲基]- α -甲氧基亚氨基苯乙酰胺

将 1.5g (3.6mmol) 实施例 13 的戊酯溶于 50ml 四氢呋喃中, 混合物用 10ml 40% 浓度一甲胺水溶液处理并室温搅拌 16 小时。然后用水处理, 甲基叔丁基醚提取。水洗有机相, 硫酸钠干燥并用旋转蒸发器浓缩。残留物为重 1.1g (86% 产率) 的标题化合物, 为黄色油。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 2.90$ (d, 3H); 3.96 (s, 3H); 5.30 (s, 2H); 6.87 (s, br, 1H); 7.25–7.68 (m, 9H); 8.21 (s, 1H) ppm.