



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 92101620.4

[51] Int.CI⁵
C07C271/28

[43] 公开日 1992年10月28日

[22] 申请日 92.2.7

[30] 优先权

[32] 91.2.7 [33] JP [31] 102220 / 91

[32] 91.10.23 [33] JP [31] 304176 / 91

[71] 申请人 石原产业株式会社

地址 日本大阪市

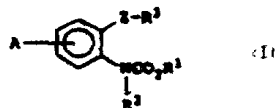
[72] 发明人 光明寺辉正 重原格 松尾宪总
下原田洋 大崎武 赤木俊夫
三谷滋[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司
代理人 汪 洋C07D307/79 C07D213/24
A01N 47/10

说明书页数: 103 附图页数:

[54] 发明名称 N-苯基氨基甲酸酯化合物、其制备方法以及控制有害生物的杀虫剂组合物

[57] 摘要

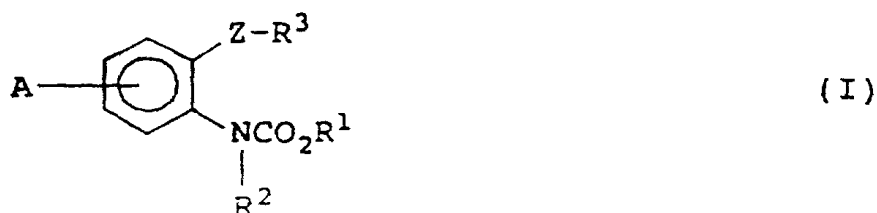
本发明涉及新型的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能的盐,其用作控制有害生物的杀生物组合物的活性成分为以下通式(I)化合物,其中, R¹、R²、R³、A、Z 如说明书中所定义。



< 20 >

权 利 要 求 书

1. 下列通式 (I) :



代表的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐, 其中 R^1 是未取代或取代的烷基; R^2 是氢原子, 未取代或取代的烷基, 未取代或取代的链烯基, 未取代或取代的炔基, 未取代或取代的环烷基, 或者 $-COX^1$ 基团, 其中 X^1 是未取代或取代的烷基, 未取代或取代的链烯基, 未取代或取代的炔基, 未取代或取代的环烷基, 或者未取代或取代的烷氧基; Z 是 $-CH_2S-$ 基团, $-SCH_2-$ 基团, $-CH_2O-$ 基团, $-OCH_2-$ 基团, $-CH_2CH_2$ 基团, $-CH=CH-$ 基团, $-C\equiv C-$ 基团, $-CH_2SO-$ 基团, $-CH_2SO_2-$ 基团, $-CH_2SCH_2-$ 基团, 或 $-CH_2O-N=C(R^4)-$ 基团, 每个基团右边的连字符表示连接 R^3 的键; R^3 是未取代或取代的苯基, 未取代或取代的吡啶基, 未取代或取代的苯并噁唑基, 未取代或取代的苯并噁唑基, 未取代或取代的苯并咪唑基, 未取代或取代的咪唑并吡啶基, 未取代或取代的萘基, 未取代或取代的嘧啶基, 未取代或取代的噻吩基, 未取代或取代的呋喃基, 未取代或取代的噻唑基, 未取代或取代的噁唑基, 未取代或取代的吡嗪基, 未取代

或取代的噻唑基，未取代或取代的噁唑基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的吡唑基，未取代或取代的噻啉基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的吡咯基，未取代或取代的苯并呋喃基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的2,3-二氢茛基，未取代或取代的四氢萘基，未取代或取代的二氢苯并呋喃基，未取代或取代的二氢苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噁嗪基，未取代或取代的苯并噻嗪基，未取代或取代的苯甲酰基； R^4 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的环烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的烷硫基，未取代或取代的苯基，氰基， $-NR^5R^6$ 基团，或 $-CO_2R^7$ 基团； R^5 和 R^6 或者各自独立地是氢原子或未取代或取代的烷基，或者彼此结合并与相邻的氮原子一起形成5-至7-元杂环基； R^7 是未取代或取代的烷基；以及A是氢原子，卤原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的苯氧基，或者未取代或取代的吡啶氧基；假定(1)当Z是 $-CH_2SO-$ 基团或 $-CH_2SO_2$ 基团时 R^2 是氢原子，(2)下面的情形除外：(i) 其中 R^1 是甲基， R^2 是氢原子，以及 $-Z-R^3$ 基团是2-硝基-3-吡啶氧甲基、苯乙炔基、苯乙烯基、或2-溴苄氧基，(ii) 其中 R^1 是乙基， R^2 是氢原子，以及 $-Z-R^3$ 是苄氧基、苯乙炔基、苯乙烯基或2-溴苄硫基。

2. 如权利要求1的N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐，其中Z是 $-CH_2O-N=C(R^4)-$ 基团；以及 R^4 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，或者未取代或取代的烷硫基。

3. 如权利要求1的N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐，其中 R^2 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的炔

基，或 $-COX^1$ 基团，其中 X^1 是未取代或取代的烷基。

4. 如权利要求 1 的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐，其中 R^3 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的 2, 3-二氢化茚基，或者未取代或取代二氢苯并呋喃基。

5. 如权利要求 1 的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐，其中 R^2 是未取代或取代的烷基；Z 是 $-CH_2O-N=C(R^4)-$ 基团； R^3 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的 2, 3-二氢化茚基，或者未取代或取代的二氢苯并呋喃基；以及 R^4 是未取代或取代的烷基。

6. 如权利要求 5 的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐，其中 R^2 是甲基、乙基或甲氧甲基；以及 R^4 是甲基。

7. 如权利要求 6 的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐，其中所述的 N-苯基氨基甲酸酯化合物是：

N-(甲氧甲基)-N-[2-[(α -甲基亚苄基)氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯，

N-(乙基)-N-[2-[(α -甲基亚苄基)氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯，

N-(甲氧甲基)-N-[2-[[α -甲基-3, 4-(亚甲基二氧基)亚苄基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯，

N-(乙基)-N-[2-[[α -甲基-3, 4-(亚甲基二氧基)亚苄基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯，

N-(甲氧甲基)-N-[2-[[α -甲基-4-(异丙氧

基)亚苄基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯,

N-(甲氧甲基)-N-[2-[[α -甲基-4-(乙氧基)-3-(甲氧基)亚苄基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯,

N-(甲氧甲基)-N-[2-[[α -甲基-4-(甲氧基)-3-(甲基)亚苄基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯,

N-(甲氧甲基)-N-[2-[[1-(2,3-二氢-5-苯并呋喃基)亚乙基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯,

N-(甲氧甲基)-N-[2-[[1-(5-2,3-二氢化茛基)]亚乙基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯,

N-(甲氧甲基)-N-[2-[[1-(5-三氟甲基-2-吡啶基)亚乙基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯,或

N-(甲氧甲基)-N-[2-[[1-(5-氯-2-吡啶基)亚乙基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯。

8. 如权利要求1的N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐,其中Z是-CH=CH-基团。

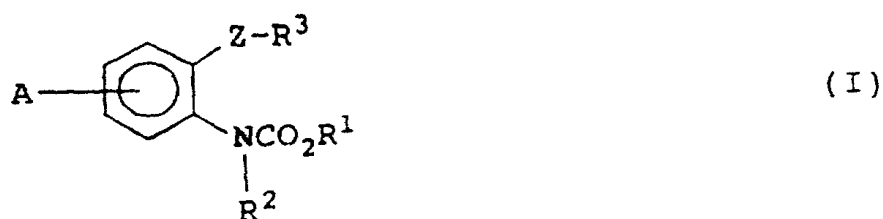
9. 如权利要求8的N-苯基氨基甲酸酯化合物,其中R²是氢原子或者未取代或取代的烷基;Z是-CH=CH-基团;以及R³是未取代或取代的苯基。

10. 如权利要求9的N-苯基氨基甲酸酯化合物,其中R²是氢原子、甲基、乙基或甲氧甲基。

11. 如权利要求10的N-苯基氨基甲酸酯化合物,该化合物是N-(甲氧甲基)-N-[2-(2-氯苯乙烯基)苯基]氨基甲酸甲酯。

12. 控制有害生物的杀生物剂组合物,包括作为活性成分的以

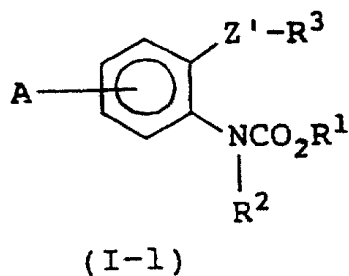
下列通式 (I) :



代表的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐，其中 R¹ 是未取代或取代的烷基；R² 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的链烯基，未取代或取代的炔基，未取代或取代的环烷基，或者 -COX¹ 基团，其中 X¹ 是未取代或取代的烷基，未取代或取代的链烯基，未取代或取代的炔基，未取代或取代的环烷基，或者未取代或取代的烷氧基；Z 是 -CH₂S- 基团，-SCH₂- 基团，-CH₂O- 基团，-OCH₂- 基团，-CH₂CH₂- 基团，-CH=CH- 基团，-C≡C- 基团，-CH₂SO- 基团，-CH₂SO₂- 基团，-CH₂SCH₂- 基团，或 -CH₂O-N=C(R⁴)- 基团，每个基团右边的连字符表示连接 R³ 的键；R³ 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并咪唑基，未取代或取代的咪唑并吡啶基，未取代或取代的萘基，未取代或取代的嘧啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的噻唑啉基，未取代或取代的噁唑啉基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噁唑基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的吡唑基，未取代或取代的喹啉基，未取代或取代的吲哚基。

噪基，未取代或取代的吡咯基，未取代或取代的苯并呋喃基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的2,3-二氢茚基，未取代或取代的四氢萘基，未取代或取代的二氢苯并呋喃基，未取代或取代的二氢苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噁嗪基，未取代或取代的苯并噻嗪基，未取代或取代的苯甲酰基； R^4 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的环烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的烷硫基，未取代或取代的苯基，氰基， $-NR^5R^6$ 基团，或 $-CO_2R^7$ 基团； R^5 和 R^6 或者各自独立地是氢原子或未取代或取代的烷基，或者彼此结合并与相邻的氮原子一起形成5-至7-元杂环基； R^7 是未取代或取代的烷基；以及A是氢原子，卤原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的苯氧基，或者未取代或取代的吡啶氧基；假定(1)当Z是 $-CH_2SO-$ 基团或 $-CH_2SO_2-$ 基团时 R^2 是氢原子，(2)下面的情形除外：(i)其中 R^1 是甲基， R^2 是氢原子，以及 $-Z-R^3$ 基团是2-硝基-3-吡啶氧甲基、苯乙炔基、苯乙烯基、或2-溴苄氧基，(ii)其中 R^1 是乙基， R^2 是氢原子，以及 $-Z-R^3$ 是苄氧基、苯乙炔基、苯乙烯基或2-溴苄硫基。

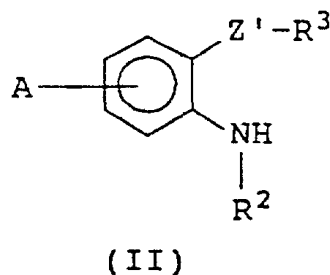
13. 一种制备下列通式(I-1)：



代表的 N - 苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性盐的方法，其中 R^1 是未取代或取代的烷基； R^2 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的链烯基，未取代或取代的炔基，未取代或取代的环烷基，或者 $-COX^1$ 基团，其中 X^1 是未取代或取代的烷基，未取代或取代的链烯基，未取代或取代的炔基，未取代或取代的环烷基，或者未取代或取代的烷氧基； Z' 是 $-CH_2S-$ 基团， $-SCH_2-$ 基团， $-CH_2O-$ 基团， $-OCH_2-$ 基团， $-CH_2CH_2-$ 基团， $-CH=CH-$ 基团， $-C\equiv C-$ 基团， $-CH_2SCH_2-$ 基团，或 $-CH_2O-N=C(R^4)-$ 基团，每个基团右边的连字符表示连接 R^3 的键； R^3 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并咪唑基，未取代或取代的咪唑并吡啶基，未取代或取代的萘基，未取代或取代的嘧啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噁唑基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噁唑基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的吡唑基，未取代或取代的喹啉基，未取代或取代的吡咯基，未取代或取代的苯并呋喃基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的 2,3-二氢化茚基，未取代或取代的四氢萘基，未取代或取代的二氢苯并呋喃基，未取代或取代的二氢苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯甲酰基； R^4 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的环烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的烷硫基，未取代或取代的苯基，氰基， $-NR^5R^6$ 基团，或 $-CO_2R^7$ 基团； R^5 和 R^6 或者各自独立地是氢原子或未取代

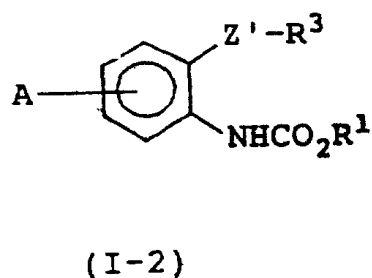
或取代的烷基，或者彼此结合并与相邻的氮原子一起形成 5 - 至 7 - 元杂环基； R^7 是未取代或取代的烷基；以及 A 是氢原子，卤原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的苯氧基，或者未取代或取代的吡啶氧基；假定下面的情形除外：(i) 其中 R^1 是甲基， R^2 是氢原子，以及 $-Z'-R^3$ 基团是 2 - 硝基 - 3 - 吡啶氧甲基、苯乙炔基、苯乙烯基、或 2 - 溴苄氧基，(ii) 其中 R^1 是乙基， R^2 是氢原子，以及 $-Z'-R^3$ 是苄氧基、苯乙炔基、苯乙烯基或 2 - 溴苄硫基；

该方法包括使下列通式 (II)



代表的化合物或其可能性的盐，其中 R^2 、 Z' 、 R^3 和 A 定义同上，与通式： $ClCO_2R^1$ (其中 R^1 定义同上) 代表的化合物反应。

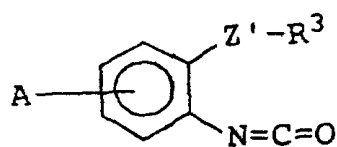
14. 一种制备下列通式 (I-2)：



代表的N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性盐的方法，其中 R^1 是未取代或取代的烷基； Z' 是 $-CH_2S-$ 基团， $-SCH_2-$ 基团， $-CH_2O-$ 基团， $-OCH_2-$ 基团， $-CH_2CH_2-$ 基团， $-CH=CH-$ 基团， $-C\equiv C-$ 基团， $-CH_2SCH_2-$ 基团，或 $-CH_2O-N=C(R^4)-$ 基团，每个基团右边的连字符表示连接 R^3 的键； R^3 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并咪唑基，未取代或取代的咪唑并吡啶基，未取代或取代的萘基，未取代或取代的嘧啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的噻唑啉基，未取代或取代的噁唑啉基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噁唑基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的吡唑基，未取代或取代的喹啉基，未取代或取代的吲哚基，未取代或取代的吡咯基，未取代或取代的苯并呋喃基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的2,3-二氢茛苳基，未取代或取代的四氢萘基，未取代或取代的二氢苯并呋喃基，未取代或取代的二氢苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯甲酰基； R^4 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的环烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的烷硫基，未取代或取代的苯基，氰基， $-NR^5R^6$ 基团，或 $-CO_2R^7$ 基团； R^5 和 R^6 或者各自独立地是氢原子或未取代或取代的烷基，或者彼此结合并与相邻的氮原子一起形成5-至7-元杂环基； R^7 是未取代或取代的烷基；以及A是氢原子，卤原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的苯氧基，或者未取代或取代的吡啶氧基；假定下

面的情形除外：(i) 其中 R^1 是甲基，以及 $-Z'-R^3$ 基团是 2-硝基-3-吡啶氧甲基、苯乙炔基、苯乙烯基、或 2-溴苄氧基，
(ii) 其中 R^1 是乙基，以及 $-Z'-R^3$ 是苄氧基、苯乙炔基、苯乙烯基或 2-溴苄硫基，

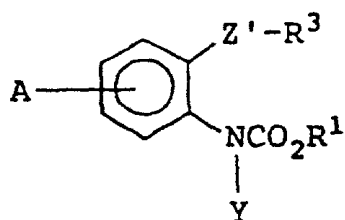
该方法包括使下列通式 (III)：



(III)

代表的化合物，其中 Z' 、 R^3 和 A 定义同上，与通式： R^1-OH (R^1 定义同上) 代表的化合物反应。

15. 一种制备下列通式 (I-3)：

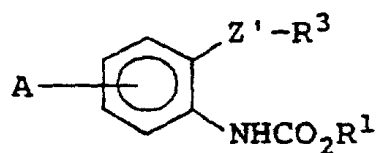


(I-3)

代表的 N-苄基氨基甲酸酯化合物或其可能性盐的方法，其中 R^1 是未取代或取代的烷基；Y 是未取代或取代的烷基，未取代或取代的链烯基，未取代或取代的炔基，未取代或取代的环烷基，或者 $-COX^1$ 基团，其中 X^1 是未取代或取代的烷基，未取代或取代的链烯基，未

取代或取代的炔基，未取代或取代的环烷基，或者未取代或取代的烷氧基； Z' 是 $-CH_2S-$ 基团， $-SCH_2-$ 基团， $-CH_2O-$ 基团， $-OCH_2-$ 基团， $-CH_2CH_2-$ 基团， $-CH=CH-$ 基团， $-C\equiv C-$ 基团， $-CH_2SCH_2-$ 基团，或 $-CH_2O-N=C(R^4)-$ 基团，每个基团右边的连字符表示连接 R^3 的键； R^3 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并咪唑基，未取代或取代的咪唑并吡啶基，未取代或取代的萘基，未取代或取代的嘧啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的噻唑啉基，未取代或取代的噁唑啉基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噁唑基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的吡唑基，未取代或取代的喹啉基，未取代或取代的吡咯基，未取代或取代的苯并呋喃基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的 2,3-二氢茛基，未取代或取代的四氢萘基，未取代或取代的二氢苯并呋喃基，未取代或取代的二氢苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯甲酰基； R^4 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的环烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的烷硫基，未取代或取代的苯基，氟基， $-NR^5R^6$ 基团，或 $-CO_2R^7$ 基团； R^5 和 R^6 或者各自独立地是氢原子或未取代或取代的烷基，或者彼此结合并与相邻的氮原子一起形成 5-至 7-元杂环基； R^7 是未取代或取代的烷基；以及 A 是氢原子，卤原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的苯氧基，或者未取代或取代的吡啶氧基；

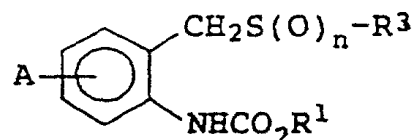
该方法包括使下列通式 (I - 2) :



(I-2)

代表的化合物或其可能性的盐，其中 R^1 、 Z' 、 R^3 和 A 定义同上，与通式： $\text{Y}-\text{W}$ （其中 Y 定义同上，并且 W 是氯原子、溴原子或碘原子）代表的化合物反应。

16. 一种制备下列通式 (I - 5) :

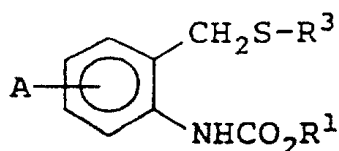


(I-5)

代表的 N - 苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性盐的方法，其中 R^1 是未取代或取代的烷基， R^3 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并咪唑基，未取代或取代的咪唑并吡啶基，未取代或取代的蔡基，未取代或取代的噻啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的噻唑啉基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噻唑啉基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的噻唑基，未取代或

取代的噻唑基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的吡唑基，未取代或取代的噻嗪基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的吡咯基，未取代或取代的苯并呋喃基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的2,3-二氢茚基，未取代或取代的四氢萘基，未取代或取代的二氢苯并呋喃基，未取代或取代的二氢苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯甲酰基；A是氢原子，卤原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的苯氧基，或者未取代或取代的吡啶氧基；以及n是1或2的整数；

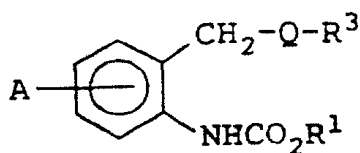
该方法包括使下列通式（I-4）：



(I-4)

代表的化合物或其可能性的盐与氧化剂反应，其中R¹、R³和A定义同上。

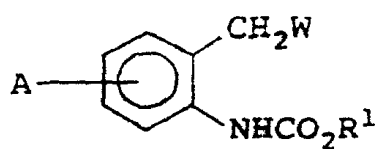
17. 一种制备下列通式（I-6）：



(I-6)

代表的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性盐的方法，其中 R^1 是未取代或取代的烷基； R^3 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并咪唑基，未取代或取代的咪唑并吡啶基，未取代或取代的萘基，未取代或取代的嘧啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的噻唑啉基，未取代或取代的噁唑啉基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噁唑基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的吡唑基，未取代或取代的噻啉基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的吡咯基，未取代或取代的苯并呋喃基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的 2,3-二氢茚基，未取代或取代的四氢萘基，未取代或取代的二氢苯并呋喃基，未取代或取代的二氢苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯甲酰基；Q 是氧原子，硫原子， $-SCH_2-$ 基团，或 $-O-N=C(R^4)-$ 基团，每个基团右边的连字符表示连接 R^3 的键； R^4 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的环烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的烷硫基，未取代或取代的苯基，氰基， $-NR^5R^6$ 基团；或 $-CO_2R^7$ 基团； R^5 和 R^6 或者各自独立地是氢原子或未取代或取代的烷基，或者彼此结合并与相邻的氮原子一起形成 5-至 7-元杂环基； R^7 是未取代或取代的烷基；以及 A 是氢原子，卤原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的苯氧基，或者未取代或取代的吡啶氧基；假定其中 R^1 是甲基并且 $-Q-R^3$ 是 2-硝基-3-吡啶氧基的情形除外；

该方法包括使下列通式 (IV)：



(IV)

代表的化合物 其中 R^1 和 A 定义同上，并且 W 是氟原子、溴原子或碘原子，与通式： $H-Q-R^3$ （其中 R^3 和 Q 定义同上）代表的化合物反应。

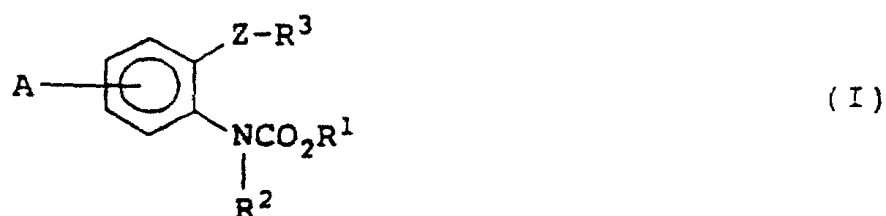
说明书

N-苯基氨基甲酸酯化合物、其制备方法以及 控制有害生物的杀虫剂组合物

本发明涉及N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐，其制备方法，以及含这些化合物的用于控制有害生物（害虫控制）的农业杀虫剂组合物（农药）。

N-苯基氨基甲酸酯化合物记载在，例如，(1)日本专利公开号146,881/1988，其与EP-A-268,989和US 4,831,041 属同族专利；(2)日本专利公开号131,175/1989，其与EP-A-270,091和US 4,996,217属同族专利；(3)Tetrahedron Letters, Vol. 29, No. 15, pp. 1799-1802,1988；(4)Journal fur Praktische Chemie., 4. Reihe., Band 12, pp. 44-49, 1960；(5) Chem. Pharm. Bull., 36(4), pp. 1305-1308(1988)；(6) INGENIERIA Y CIENCIA QUIMICA, 1979, 3(3),pp. 132-133；(7) 日本专利公开号 151,889/1975；(8) Journal of Medicinal Chemistry, 1970, Vol. 13, No.4, pp. 713-722；等等。然而，所有这些文献都没有公开如本发明下面提到的通式（I）所代表的这些N-苯基氨基甲酸酯化合物。

根据本发明的一个方面，提供了下列通式（I）代表的N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐：



其中 R^1 是未取代或取代的烷基； R_2 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的链烯基，未取代或取代的炔基，未取代或取代的环烷基，或 $-COX^1$ 基团，其中 X^1 是未取代或取代的烷基，未取代或取代的链烯基，未取代或取代的炔基，未取代或取代的环烷基，或未取代或取代的烷氧基； Z 是 $-CH_2S-$ 基， $-SCH_2-$ 基， $-CH_2O-$ 基， $-OCH_2-$ 基， $-CH_2CH_2-$ 基， $-CH=CH-$ 基， $-C\equiv C-$ 基， $-CH_2SO-$ 基， $-CH_2SO_2-$ 基， $-CH_2SCH_2-$ 基，或 $-CH_2O-N=C(R^4)-$ 基，每个基团的右边的连字符代表与 R^3 连接的键； R^3 是未取代或取代的苯基，未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并咪唑基，未取代或取代的咪唑并吡啶基，未取代或取代的萘基，未取代或取代的嘧啶基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的呋喃基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的咪唑基，未取代或取代的吡唑基，未取代或取代的噻吩基，未取代或取代的吡咯基，未取代或取代的苯并呋喃基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的 2,3-二氢茚基，未取代或取代的四氢萘基，未取代或取代的二氢苯并呋喃基，未取代或取代的

二氢苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噻吩基，未取代或取代的苯并噻嗪基，未取代或取代的苯甲酰基； R^4 是氢原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的环烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的烷硫基，未取代或取代的苯基，氰基， $-NR^5R^6$ 基团，或 $-CO_2R^7$ 基团； R^5 和 R^6 或者各自独立地是氢原子或未取代或取代的烷基，或者彼此结合并与相邻的氮原子一起形成 5-至 7-元杂环基团； R^7 是未取代或取代的烷基；以及 A 是氢原子，卤原子，未取代或取代的烷基，未取代或取代的烷氧基，未取代或取代的苯氧基，未取代或取代的吡啶氧基；假定(1)当 Z 是 $-CH_2SO-$ 基团或 $-CH_2SO_2-$ 基团时 R^2 是氢原子，(2)下面的情形除外：(i) 其中 R^1 是甲基， R^2 是氢原子，以及 $-Z-R^3$ 基团是 2-硝基-3-吡啶氧甲基、苯乙炔基、苯乙烯基或 2-溴苄氧基，(ii) 其中 R^1 是乙基， R^2 是氢原子，以及 $-Z-R^3$ 是苄氧基、苯乙炔基、苯乙烯基或 2-溴苄硫基。

根据本发明的另一方面，提供了制备上述通式 (I) 所代表的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性盐的方法，该方法在下文有详细的叙述。

根据本发明的又一方面，提供了含有通式 (I) 代表的 N-苯基氨基甲酸酯化合物或其可能性的盐作为活性成分的杀虫剂组合物，该组合物在下文有详细的叙述。

取代烷基、烯基、炔基、环烷基、烷氧基或烷硫基（包括在通式 (I) 中的至少一个 R^1 、 R^2 、 X^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 或 A 的符号之中）的取代基包括卤原子；氰基；被至少一个卤原子和或至少一个烷氧基取代或未取代的烷氧基；烷硫基；烷氧羰基；烷

基巯基；或环烷基；硝基；以及苯基。其中这些取代基的数目是2或更多，取代基彼此可以相同或不同。

取代苯基、吡啶基、苯并噻唑基、苯并噁唑基、苯并咪唑基、咪唑并吡啶基、苯氧基、吡啶氧基、萘基、嘧啶基、噻吩基、呋喃基、噻唑啉基、噁唑啉基、吡嗪基、噻唑基、噁唑基、咪唑基、吡唑基、噻啉基、吡啶基、吡咯基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、2,3-二氢化茛基、四氢萘基、二氢苯并呋喃基、二氢苯并噻吩基、苯并噁嗪基、苯并噻嗪基或苯甲酰基（包括在至少一个 R^3 、 R^4 和A的符号之中）的取代基包括，例如，卤原子；被至少一个卤原子和/或至少一个烷氧基和/或至少一个烷氧亚氨基取代或未取代的烷基；硝基；氰基；烷氧羰基；被至少一个卤原子取代或未取代的烷氧基；被至少一个卤原子和/或至少一个烷氧基和/或至少一个烷基取代或未取代的亚烷二氧基；被至少一个卤原子取代或未取代的烷基磺酰氧基；烷硫基；烷基磺酰基；烷基亚磺酰基；芳基如苯基和萘基；被至少一个烷基取代或未取代的吡咯基；（2-四氢吡喃基）氧基；被至少一个烷基取代或未取代的氨基甲酰基；被至少一个卤原子和/或至少一个三氟甲基取代或未取代的吡啶氧基；二烷基氨基；以及烷基羧基。其中这些取代基的数目是2或更多，取代基彼此可以相同或不同。

至于烷基或还可以包括在通式（I）中的烷基部分，可以举出，例如，那些具有1-6个碳原子的基团，如甲基、乙基、丙基、丁基、戊基和己基。至于链烯基或可以包括在通式（I）中的链烯基部分，可以举出，例如，那些具有2-6个碳原子的基团，如乙烯基、丙烯基、丁烯基、戊烯基和己烯基。至于炔基或可以包括在通式（I）中的炔基部分，可以举出，例如，那些具有2-6个碳原子的

基团，如乙炔基、丙炔基、丁炔基、戊炔基或己炔基。上述的这些基团或基团部分包括具有线性或分枝脂族链的结构同分异构体。至于环烷基或可以包括在通式 (I) 中的环烷基部分，例如以 R^2 表示的，可以举出，例如，那些具有 3 - 6 个碳原子的基团，如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

至于可以包括在通式 (I) 中的卤原子，可以举出，例如，氟原子、氯原子、溴原子和碘原子。

R^5 和 R^6 可彼此结合并与相邻的氮原子一起形成 5 - 至 7 - 元杂环基。这些 5 - 至 7 - 元杂环基的例子包括饱和杂环基，如吗啉代基、1 - 吡咯烷基和哌啶子基；以及不饱和杂环基，如三唑基和咪唑基。

基中 R^3 是未取代或取代的吡啶基，未取代或取代的苯并噻唑基，未取代或取代的苯并噁唑基，未取代或取代的苯并咪唑基，未取代或取代的咪唑并吡啶基，未取代或取代的嘧啶基，未取代或取代的吡嗪基，未取代或取代的噻唑基，未取代或取代的噁唑基，未取代或取代的咪唑基，或未取代或取代的喹啉基。结构式 (I) 的化合物可用酸性物质转变成盐的形式。这些盐的例子包括无机酸盐，如盐酸盐和硫酸盐。

其中 Z 是 $-CH=CH-$ 基团或 $-CH_2O-N-(R^4)-$ 基团，结构式 (I) 的化合物由于其中含有双键而涉及到 E 型和 Z 型几何异构体。因此，本发明的化合物包括 E 型异构体、Z 型异构体和其混合物。

在本发明通式 (I) 所代表的那些化合物中，下列化合物是优选的。

(1) 结构式 (I) 的化合物或其可能性的盐, 其中 Z 是 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 或 $-\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^4)-$ 基团, 以及 R^4 是氢原子, 未取代或取代的烷基, 未取代或取代的烷氧基, 未取代或取代的烷硫基;

(2) 结构式 (I) 中 R^2 是氢原子、未取代或取代的烷基、未取代或取代的炔基或 $-\text{COX}^1$ 基团, 以及 X^1 是未取代或取代的烷基的化合物或其可能性的盐; 以及

(3) 结构式 (I) 中 R^3 是未取代或取代的苯基、未取代或取代的吡啶基、未取代或取代的噻吩基、未取代或取代的呋喃基、未取代或取代的 2, 3-二氢茛基、或未取代或取代的二氢苯并呋喃基的化合物, 或其可能性的盐。

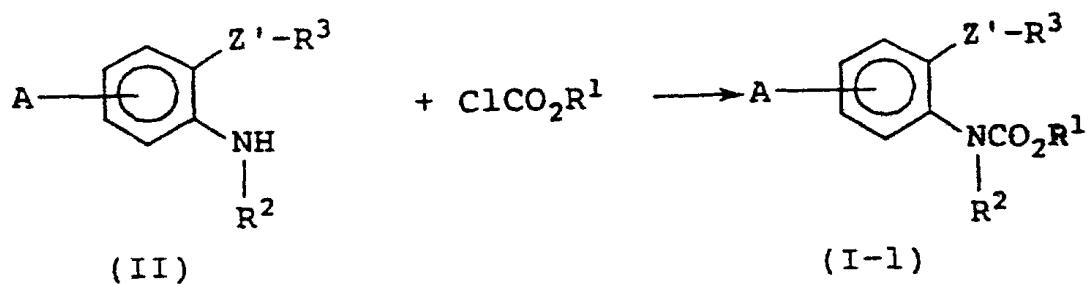
最优选的化合物是结构式 (I) 中 R^2 是未取代或取代的烷基, Z 是 $-\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^4)-$ 基团, R^3 是未取代或取代的苯基、未取代或取代的吡啶基、未取代或取代的噻吩基、未取代或取代的呋喃基、未取代或取代的 2, 3-二氢茛基、或未取代或取代的二氢苯并呋喃基, 以及 R^4 是未取代或取代烷基的化合物; 和结构式 (I) 中 R^2 是氢原子或未取代或取代的烷基, Z 是 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 基团, 以及 R^3 是未取代或取代苯基的化合物。作为 R^2 表示的未取代或取代的烷基, 更优选甲基、乙基和甲氧甲基。作为 R^4 表示的未取代或取代的烷基, 更优选甲基。

通式 (I) 的化合物可根据, 例如, 下列反应方法 1 - 6 的其中一个来制备。

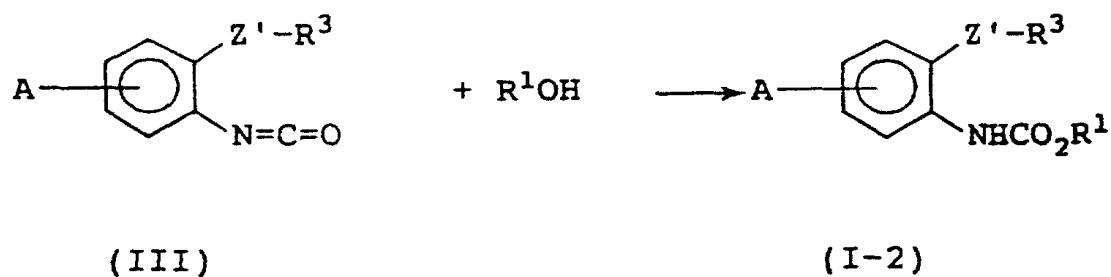
(i) 其中 Z 是 Z' , Z' 表示 $-\text{CH}_2\text{S}-$ 基团、 $-\text{SCH}_2-$ 基团、 $-\text{CH}_2\text{O}-$ 基团、 $-\text{OCH}_2-$ 基团、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基团、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 基团、 $-\text{C}\equiv\text{C}-$ 基团、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 基

团或 $-\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^4)-$ 基团, 以及 R^4 如上述定义, 结构式 (I) 的化合物可根据, 例如, 下列反应方法 1-3 的其中一个来制备;

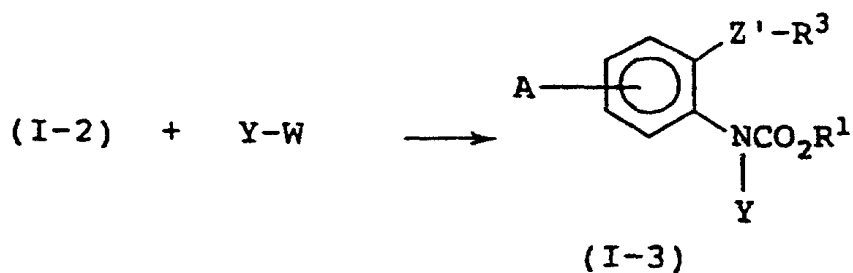
反应方法 1



反应方法 2



反应方法 3

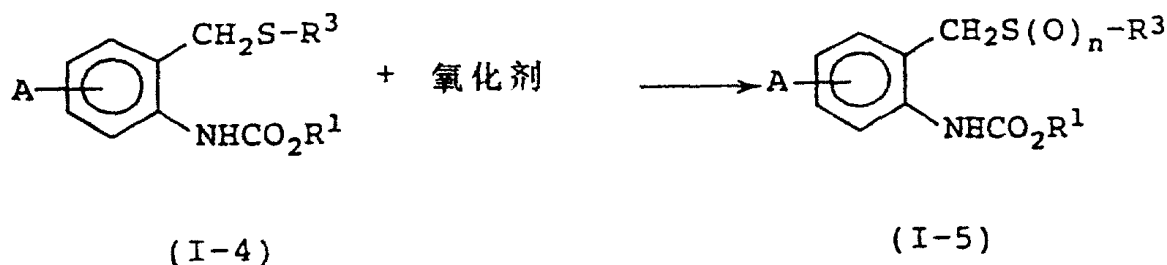


在上述反应方法 1 - 3 的结构式中, R^1 、 R^2 、 Z' 、 R^3 和 A 同上面定义; Y 是未取代或取代的烷基, 未取代或取代的链烯基, 未取代或取代的炔基, 未取代或取代的环烷基, 或 $-COX^1$ 基团, 其中 X^1 是未取代或取代的烷基、未取代或取代的链烯基、未取代或取代的炔基、未取代或取代的环烷基、或未取代或取代的烷氧基; 以及 W 是氯原子、溴原子或碘原子。

在反应方法 3 中, $(X^2 CO)_2 O$, 其中 X^2 是未取代或取代的烷基、未取代或取代的链烯基、未取代或取代的炔基、或者未取代或取代的环烷基, 可用来代替 $Y-W$ (当 Y 是 $-COX^2$ 时, 其中 X^2 定义同上)。

(ii) 其中 Z 是 $-CH_2 SO-$ 基团或 $-CH_2 SO_2-$ 基团, 结构式 (I) 的化合物可根据, 例如, 下列反应方法 4 来制备:

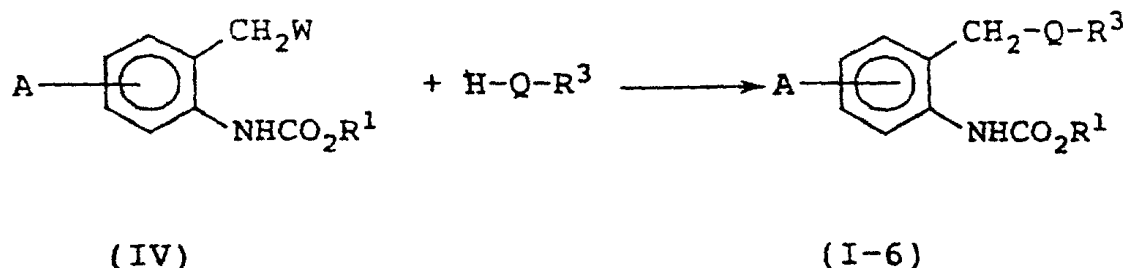
反应方法 4



在反应方法 4 的结构式中, R^1 、 R^3 和 A 定义同上, 并且 n 是 1 或 2 的整数。

(iii) 其中 R^2 是氢原子, 以及 Z 是 $-CH_2 O-$ 基团、 $-CH_2 S-$ 基团、 $-CH_2 SCH_2-$ 基团或 $-CH_2 O-N=C(R^4)$ 基团, 结构式 (I) 的化合物可根据, 例如, 下列反应方法 5 来制备:

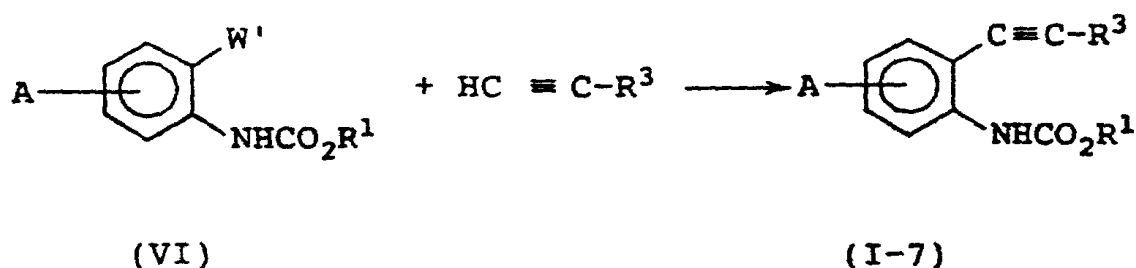
反应方法 5



在反应方法 5 的结构式中， R^1 、 R^3 、A 和 W 定义同上，Q 是氧原子、硫原子、 $-\text{SCH}_2-$ 基团或 $-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^4)-$ 基团，Q 右边的连字符代表连接 R^3 的键，假定其中 R^1 是甲基并且 $-\text{Q}-\text{R}^3$ 基团是 2-硝基-3-吡啶氧基的情况除外。

(iv) 其中 R^2 是氢原子并且 Z 是 $-\text{C}\equiv\text{C}-$ 基团，结构式 (I) 的化合物可根据，例如，下列反应方法 6 制备，该方法类似于例如 Chem. Pharm. Bull., 36(4), pp. 1305-1308(1988) 中描述的方法。

反应方法 6



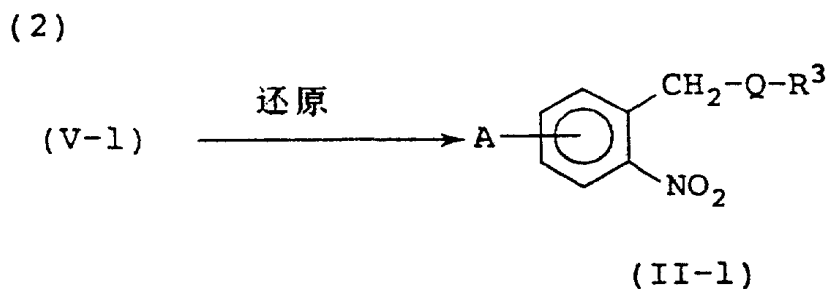
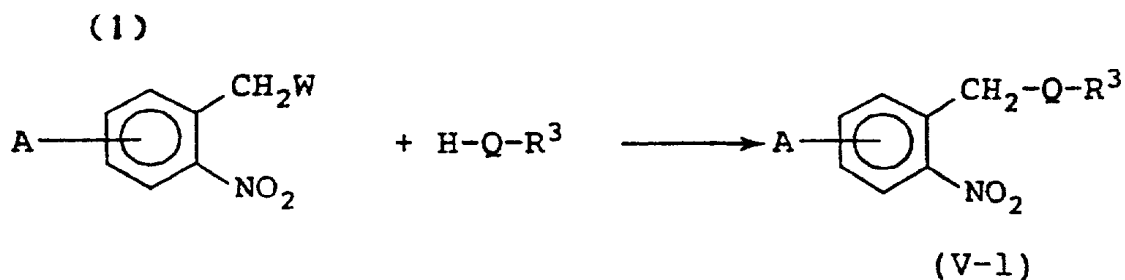
在反应方法 6 的结构式中， R^1 、 R^3 和 A 定义同上，并且 W' 是溴原子或碘原子。

用于反应方法 1 中的通式 (II) 代表的化合物，在结构式 (II) 中 R^2 是氢原子的情况下，可根据 (例如) 下列反应方法 7-12 制

备。

(i) 其中 Z 是 $-\text{CH}_2\text{O}-$ 基团、 $-\text{CH}_2\text{S}-$ 基团、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 基团或 $-\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^4)-$ 基团，结构式 (II) 的化合物可根据，例如，下列反应方法 7 制备：

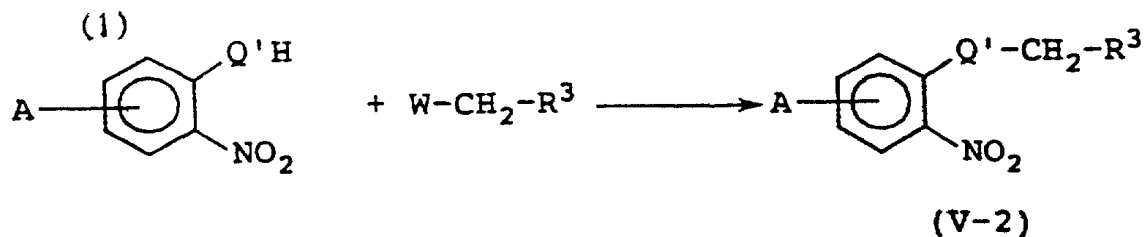
反应方法 7



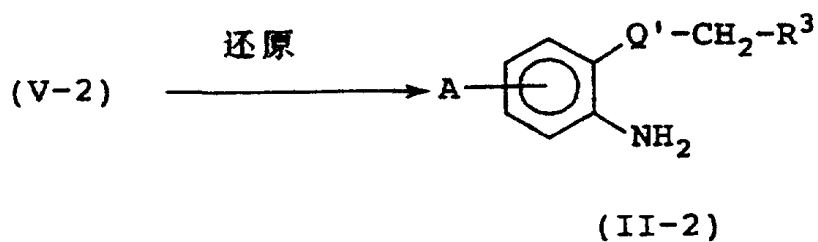
在反应方法 7 的结构式中，A、W、Q 和 R^3 定义同上。

(ii) 其中 Z 是 $-\text{OCH}_2-$ 基团或 $-\text{SCH}_2-$ 基团，结构式 (II) 的化合物可根据，例如，下列反应方法 8 制备：

反应方法 8



(2)

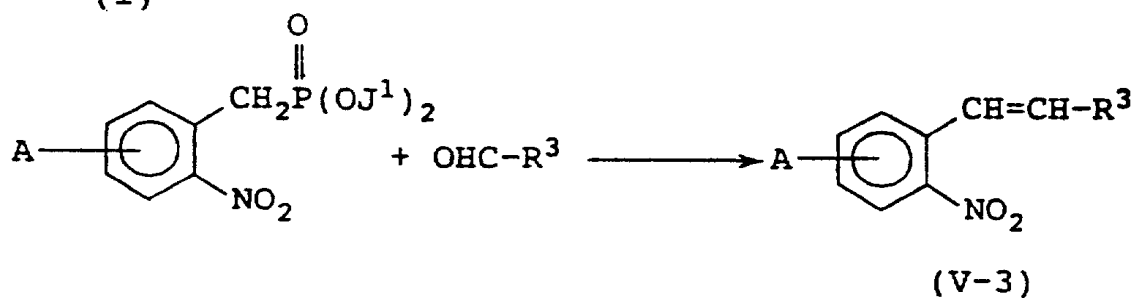


在反应方法 8 的结构式中, A、W 和 R^3 定义同上, 并且 Q' 是氧原子或硫原子。

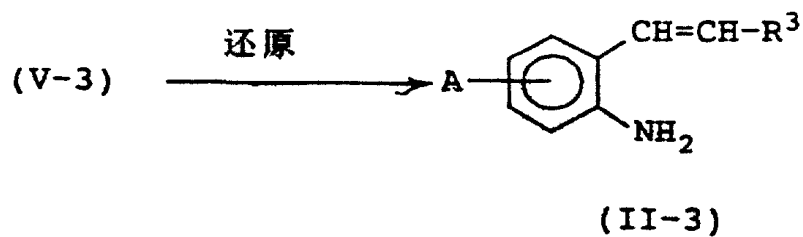
(iii) 其中 Z 是 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 基团, 结构式 (II) 的化合物可根据, 例如, 反应方法 9 制备:

反应方法 9

(1)



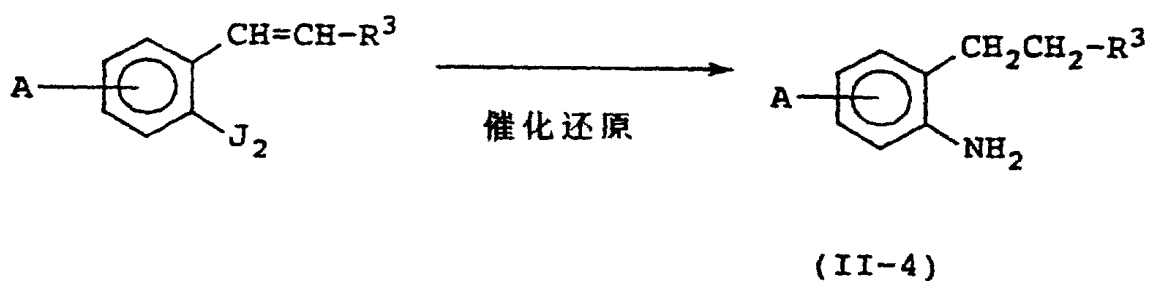
(2)



在反应方法 9 的结构式中, R^3 和 A 定义同上, 并且 J^1 是甲基或乙基。

(iv) 其中 Z 是 $-CH_2CH_2-$ 基团, 结构式 (II) 的化合物可按照, 例如, 反应方法 10 制备:

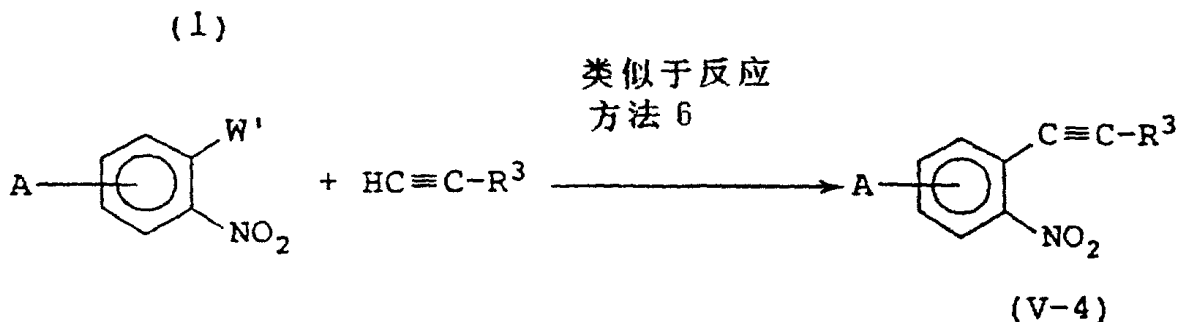
反应方法 10



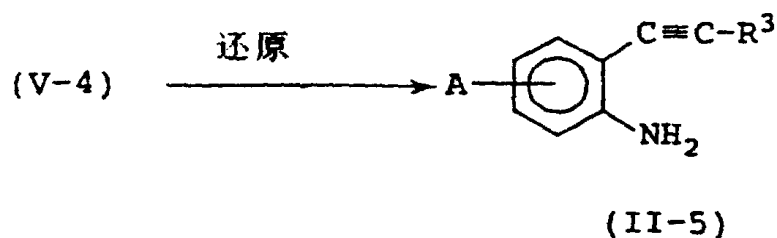
在反应方法 10 的结构式中, R^3 和 A 定义同上, 并且 J^2 是硝基或氨基。

(v) 其中 Z 是 $-C\equiv C-$ 基团, 结构式 (II) 的化合物可按照, 例如, 反应方法 11 制备:

反应方法 11



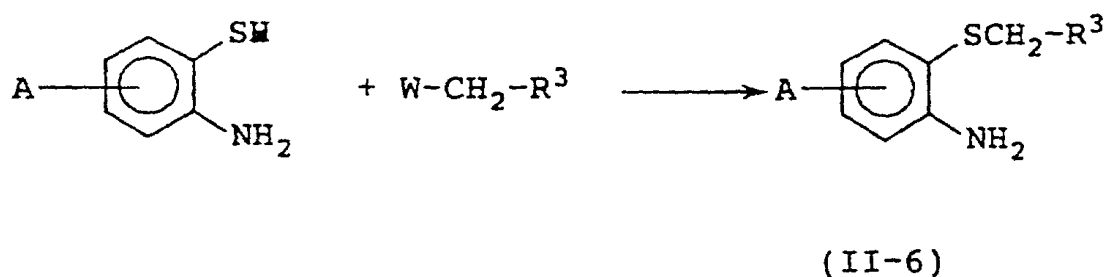
(2)



在反应方法 1 1 的结构式中，A、W' 和 R³ 定义同上。

(vi) 其中 Z 是 -SCH₂- 基团，结构式 (II) 的化合物可按照，例如下列反应方法 1 2 制备：

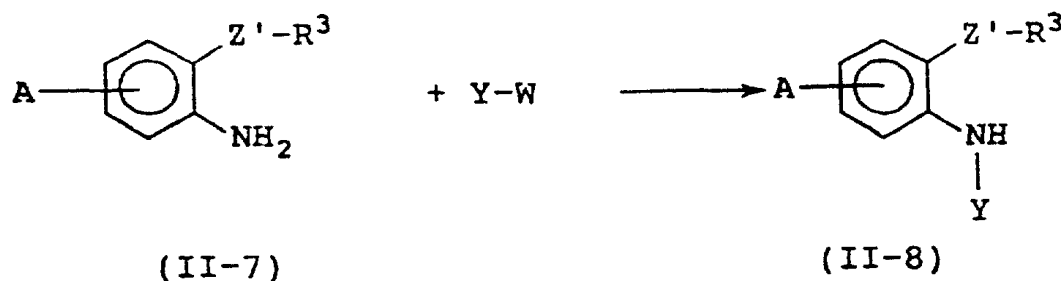
反应方法 1 2



在反应方法 1 2 的结构式中，A、W 和 R³ 定义同上。

用于反应方法 1 的通式 (II) 的化合物，在结构式 (II) 中的 R² 是前文所定义的 Y 的情况下，可按照 (例如) 下列反应方法 1 3 制备：

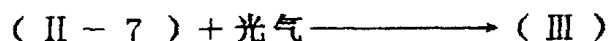
反应方法 1 3



在反应方法 1 3 的结构式中，A、Z'、R³、Y 和 W 定义同上。

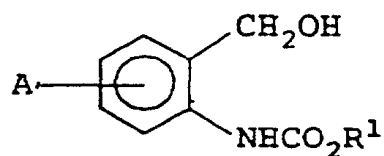
用于反应方法 2 的通式 (III) 所代表的化合物可按照，例如，下列反应方法 1 4 制备：

反应方法 1 4



用于反应方法 5 的通式 (IV) 所代表的化合物可制备 (例如) 如下。

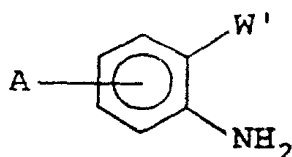
(i) 结构式 (IV) 的化合物，其中 W 是氯原子或溴原子，可通过使 2-氨基苄醇的衍生物与 ClCO_2R^1 (其中 R¹ 定义同上) 按类似于反应方法 1 的方式反应得到下列通式表示的化合物：



(其中 R¹ 和 A 定义同上)，并使所得的化合物进行常规的氯化，例如使用 SOCl_2 ，或进行常规的溴化，例如使用 SOBr_2 来制备。

(ii) 其中W是碘原子的结构式(IV)的化合物, 可通过使上述(i)制得的化合物, 即其中W是氯原子或溴原子的结构式(IV)化合物, 与碱金属碘化物如碘化钠反应来制备。

用于反应方法6的通式(VI)代表的化合物, 可通过下列通式:



(其中A和W'定义同上)代表的化合物以类似于反应方法1的方式与 $\text{C}_1\text{CO}_2\text{R}^1$ (R^1 定义同上)反应来制备。

通式(II)的化合物在某些情况下类似于通式(I)的化合物, 可包括其盐和几何异构体。

反应方法1、3、5、7(I)、8(I)、9(I)、12和13通常在溶剂和碱存在下进行。这些溶剂的例子包括未取代或取代的芳香烃, 如苯、甲苯、二甲苯和氯苯; 卤代脂族烃, 如氯仿、四氯化碳、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷; 非环状或环状脂族烃, 如正己烷和环己烷; 醚, 如二乙醚、二噁烷和四氢呋喃; 酮, 如丙酮、甲基乙基酮和甲基异丁基酮; 腈, 如乙腈和丙腈; 以及非质子极性溶剂, 如二甲基甲酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砷和四氢噻吩砷。至于碱, 可用无机碱或有机碱。这些无机碱的例子包括: 碱金属氢氧化物, 如氢氧化钠和氢氧化钾; 碱金属或碱土金属碳酸盐, 如无水碳酸钾和无水碳酸钙; 碱金属氢化物, 如氢化钠; 以及碱金属, 如金属钠。这些有机碱的例子包括吡啶和三乙胺。特别是在其中 $-\text{Z}-\text{R}^3$ 基团是未取代或取代的吡啶基硫代甲基、以及在反应方法9(I)的情况

下，氢化钠是优选使用的碱。反应温度通常在 -10°C — $+150^{\circ}\text{C}$ 范围，而反应时间通常在0.5—24小时范围。

另外要指出的是，在反应方法3和13的情况，如果必要可使用催化剂，如溴化四丁基铵。

如果必要，反应方法2可在溶剂和/或催化剂存在下进行。至于溶剂，可举出那些关于反应方法1、3、5、7(1)、8(1)、9(1)、12和13举出的溶剂。至于催化剂，可举出三乙胺、二乙基苯胺、1,4-二氮杂双环[2.2.2]辛烷等。反应温度通常在 $0-50^{\circ}\text{C}$ 范围，而反应时间通常在瞬时—10小时范围。

举出间氯过苯甲酸及其类似物作为用于反应方法4的氧化剂。通式(I-4)代表的化合物与等摩尔量的氧化剂反应制得 $n=1$ 的通式(I-5)化合物。通式(I-4)代表的化合物与两倍摩尔量的氧化剂反应制得 $n=2$ 的通式(I-5)化合物。反应方法4通常可在惰性溶剂如甲苯、氯仿或二氯甲烷存在下反应，反应温度 $0-130^{\circ}\text{C}$ ，反应时间0.1—24小时。

反应方法7(2)和8(2)中涉及到的还原反应的手段包括：使用催化剂如氧化铂或钨—碳的催化还原；使用金属如锡、铁或锌与酸如盐酸或硫酸一起还原；以及使用无机化合物如氯化亚锡、硫酸亚铁、氢氧化亚铁或硫化钠还原，所有这些方法都是常用的成熟方法。在使用无机化合物还原的情况下，如果必要，还原可在无机酸如盐酸和醇如乙醇存在下进行。

反应方法9(2)和11(2)中涉及到的还原反应的手段包括上述的使用金属和酸一起还原，以及上述的使用无机化合物还原，但不包括催化还原。反应方法10可通过上述的催化还原进行。

反应方法 1 4 可在溶剂存在下进行，这些溶剂的例子包括有机溶剂如苯、甲苯、二甲苯和乙酸乙酯。反应温度可在 50 °C - 回流温度范围，而反应时间在瞬时 - 10 小时范围。

本发明通式 (I) 的化合物可用作控制有害生物的杀生物剂组合物的活性成分。例如，结构式 (I) 的化合物可用作农业和园艺杀真菌剂的活性成分，对控制植物病害如水稻枯萎病，水稻叶鞘枯萎病，水稻长蠕孢属叶斑病，黄瓜炭疽病，黄瓜白粉病，黄瓜霜霉病，番茄晚疫病，番茄早疫病，柑桔树脂病，柑桔常见绿霉病，苹果和梨黑星病，苹果斑点病，葡萄霜霉病，以及各种作物的灰霉病、菌核腐烂病和锈病；和由致植物病的真菌如镰孢霉属、腐霉属、丝核菌属、轮枝孢菌属、以及甘蓝根菌属引起的土壤病害，显示出良好的效果。结构式 (I) 的化合物对控制水稻枯萎病，黄瓜炭疽病，各种作物的霜霉病，各种作物的灰霉病，各种作物的菌核腐烂病，各种作物的锈病，黄瓜和葡萄霜霉病，以及番茄和土豆晚疫病显示出特别好的效果。本发明的化合物不仅显示出长效作用和良好的预防效果，而且通过处理发病作物具有控制病害的治疗作用。而且，通过用本发明的化合物处理土壤也可以控制病害。本发明的化合物不仅对敏感菌种有效，而且对各种抗药菌种如抗苯菌灵的白粉病、抗氮丙灵的霜霉病、以及抗苯菌灵和 / 或二巯酰亚胺的灰霉病也有效。

本发明的化合物具有杀虫剂、杀螨剂以及杀线虫剂的活性，因此对上述各类害虫均有灭杀作用。

象在普通农用化学制剂中的情况一样，本发明的化合物可与助剂相结合制备各种制剂，如乳油、粉剂、可湿性粉末、水溶液、粒剂、悬浮浓缩物等等。这些制剂在实际应用中，或者直接使用，或者用稀

稀释剂如水稀释到预定的浓度后使用，至于助剂，可以举出载体、乳化剂、悬浮剂、分散剂、铺展剂、渗透剂、湿润剂、增稠剂以及稳定剂，这些助剂适于按照需要加到本发明的化合物中。

载体分为固体载体和液体载体。固体载体的例子包括：动物或植物粉末，如淀粉、糖、纤维素粉、环糊精、活性炭、大豆粉、小麦粉、粗糠末、木屑、鱼粉和奶粉；以及矿物粉末，如滑石、高岭土、膨润土、膨润土-烷基胺配合物、碳酸钙、硫酸钙、碳酸氢钠、沸石、硅藻土、白炭、粘土、氧化铝、氧化硅和硫磺粉末。液体载体的例子包括：水；动物或植物油，如大豆油、棉籽油和玉米油；醇，如乙醇和乙二醇；酮，如丙酮和甲乙酮；醚，如二噁烷和四氢呋喃；脂族烃，如煤油、灯油和液体石蜡；芳香烃，如二甲苯、三甲苯、四甲苯、环己烷和溶剂石脑油；卤代烃，如氯仿和氯苯；酰胺，如二甲基甲酰胺；酯，如乙酸乙酯和脂肪酸甘油酯；腈，如乙腈；含硫化合物，如二甲亚砷；以及N-甲基吡咯烷酮。

本发明化合物与助剂的适宜混合重量比通常在0.05：99.95-90：10范围，优选在0.2：99.8-80：20范围。

本发明化合物使用时的浓度取决于处理的农作物对象、使用方式、制剂种类、剂量等，因此不能一概而论。然而，在对叶用药的情况下，作为活性成分的本发明化合物的浓度通常在0.1-10,000 ppm范围，优选在1-2,000 ppm范围。在对土壤用药的情况下，剂量通常在10-100,000 g/ha（公顷）范围，优选在200-20,000 g/ha范围。

说明书将给出用于控制有害生物的本发明杀生物剂组合物的制剂实施例，制剂中包括作为活性成分的本发明化合物。在下列制剂实施

例中，化合物编号列在稍后给出的表 2 中。

制剂实施例 1

- | | |
|-------------------|-----------|
| (1) 化合物 No. 1 3 2 | 5 0 份 (重) |
| (2) 高岭土 | 4 0 份 (重) |
| (3) 木素磺酸钠 | 7 份 (重) |
| (4) 聚氧乙烯烷基苯基醚 | 3 份 (重) |

上述的组分均匀地混合在一起，得到一种可湿性粉剂。

制剂实施例 2

- | | |
|-----------------|-----------|
| (1) 化合物 No. 1 9 | 2 0 份 (重) |
| (2) 白碳 | 1 0 份 (重) |
| (3) 高岭土 | 6 2 份 (重) |
| (4) 木素磺酸钠 | 4 份 (重) |
| (5) 聚氧乙烯烷基芳基醚 | 4 份 (重) |

上述的组分均匀地混合在一起，得到一种可湿性粉剂。

制剂实施例 3

- | | |
|-------------------------|-----------|
| (1) 化合物 No. 2 1 6 | 1 0 份 (重) |
| (2) 硅藻土 | 1 5 份 (重) |
| (3) 碳酸钙粉末 | 6 9 份 (重) |
| (4) 二烷基硫代琥珀酸酯 | 1 份 (重) |
| (5) 聚氧乙烯烷基苯基醚硫酸盐 | 3 份 (重) |
| (6) β -萘磺酸钠甲醛水缩合物 | 2 份 (重) |

上述的组分均匀地混合在一起，得到一种可湿性粉剂。

制剂实施例 4

- | | |
|-----------------|---------|
| (1) 化合物 No. 5 2 | 6 份 (重) |
|-----------------|---------|

- | | |
|------------------|--------|
| (2) 硅藻土 | 88份(重) |
| (3) 三烷基硫代琥珀酸酯 | 2份(重) |
| (4) 聚氧乙烯烷基苯基醚硫酸酯 | 4份(重) |

上述的组分均匀地混合在一起，得到一种可湿性粉剂。

制剂实施例 5

- | | |
|-----------------|----------|
| (1) 化合物 No. 240 | 0.5份(重) |
| (2) 滑石 | 99.0份(重) |
| (3) 低级醇的磷酸酯 | 0.5份(重) |

上述的组分均匀地混合在一起，得到一种粉剂。

制剂实施例 6

- | | |
|-----------------|----------|
| (1) 化合物 No. 193 | 0.2份(重) |
| (2) 碳酸钙粉末 | 98.8份(重) |
| (3) 低级醇的磷酸酯 | 1份(重) |

上述的组分均匀地混合在一起，得到一种粉剂。

制剂实施例 7

- | | |
|-----------------|--------|
| (1) 化合物 No. 224 | 20份(重) |
| (2) 二甲苯 | 60份(重) |
| (3) 聚氧乙烯烷基芳基醚 | 20份(重) |

上述的组分均匀地混合成溶液，得到一种乳油。

制剂实施例 8

- | | |
|----------------|--------|
| (1) 化合物 No. 57 | 1份(重) |
| (2) 膨润土 | 33份(重) |
| (3) 高岭土 | 61份(重) |
| (4) 木素磺酸钠 | 5份(重) |

上述的组分与便于造粒的适量水混合，并造粒，得到颗粒剂。

制剂实施例 9

- | | |
|-----------------|-----------|
| (1) 化合物 No. 1 | 1 0 份 (重) |
| (2) 玉米油 | 7 7 份 (重) |
| (3) 聚氧乙烯氢化的蓖麻油醚 | 1 2 份 (重) |
| (4) 膨润土-烷基胺配合物 | 1 份 (重) |

上述的组分混合在一起，并磨成粉，得到一种悬浮浓缩物。

制剂实施例 1 0

- | | |
|---|-----------|
| (1) 化合物 No. 1 9 | 1 0 份 (重) |
| (2) 异构烷烃饱和烃 (馏分 210-265°C) | 7 9 份 (重) |
| (3) 聚氧乙烯苯基酚衍生物和
聚氧乙烯脱水山梨糖醇烷基化物的
混合物 | 1 0 份 (重) |
| (4) 膨润土-烷基胺配合物 | 1 份 (重) |

上述的组分混合在一起，并磨成细粉，得到一种悬浮浓缩物。

制剂实施例 1 1

- | | |
|------------------------------|---------------|
| (1) 化合物 No. 1 5 9 | 4 0 份 (重) |
| (2) 用三乙醇胺中和的氧乙基化
的多芳基酚磷酸酯 | 2 份 (重) |
| (3) 聚硅氧烷 | 0 . 2 份 (重) |
| (4) 黄原胶 | 0 . 1 份 (重) |
| (5) 乙二醇 | 5 份 (重) |
| (6) 水 | 5 2 . 7 份 (重) |

上述的组分均匀的混合在一起，并磨成粉，得到一种水悬浮浓缩物。

制剂实施例 1 2

- | | |
|-------------------|---------------|
| (1) 化合物 No. 1 3 8 | 7 5 份 (重) |
| (2) 聚羧酸钠 | 1 3 . 5 份 (重) |
| (3) 无水硫酸钠 | 1 0 份 (重) |
| (4) 糊精 | 0 . 5 份 (重) |
| (5) 烷基磺酸钠 | 1 份 (重) |

把上述组分放在一个高速混合制粒机中，与 2 0 % 水混合，造粒，干燥，得到水溶的颗粒剂。

如果需要的话，本发明的化合物可以与其他农用化学品混合或结合在一起使用，这些农用化学品的例子包括杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀菌剂、抗病毒剂、引诱剂、除草剂和植物生长调节剂。在这种情况下，本发明的化合物或杀生物组合物的作用有时可被提高。

这样的杀虫剂、杀螨剂或杀线虫剂的活性组分的具体例子包括下面的化合物：

有机磷酸酯化合物

O - (4 - 溴 - 2 - 氯苯基) O - 乙基 S - 丙基硫代磷酸酯 (通用名 : Profenofos) ,

O - (2 , 2 - 二氯乙烯基) O , O - 二甲基磷酸酯 (通用名 : Dichlorvos) ,

O - 乙基 O - [3 - 甲基 - 4 - (甲硫基) 苯基] N - 异丙基氨基磷酸酯 (通用名 : Fenamiphos) ,

O , O - 二甲基 O - (4 - 硝基 - m - 甲苯基) 硫代磷酸酯 (通

用名：Fenitrothion），

O-乙基O-（4-硝基苯基）苯基硫代磷酸酯（通用名：EPN）

O，O-二乙基O-（2-异丙基-6-甲基嘧啶-4-基）硫代磷酸酯（通用名：Diazinon），

O，O-二甲基O-（3，5，6-三氯-2-吡啶基）硫代磷酸酯（通用名：Chlorpyrifos-methyl），

O，S-二甲基N-乙酰基硫代氨基磷酸酯（通用名：Acephate

O-（2，4-二氯苯基）O-乙基S-丙基二硫代磷酸酯（通用名：Prothiofos）和

（RS）-S-仲丁基O-乙基2-氧代-1，3-噻唑烷-3-基硫代磷酸酯（公开在U. S. P. 4，590，182中）；

氨基甲酸酯化合物

1-萘基 N-甲基氨基甲酸酯（通用名：Carbaryl）；

2-异丙氧基苯基N-氨基甲酸酯（通用名：Propoxur），

2-甲基-2-（甲硫基）丙醛O-甲基-氨甲酰肼（通用名：Aldicarb），

2，3-二氢-2，2-二甲基苯并呋喃-7-基N-甲基氨基甲酸酯（通用名：Carbofuran），

二甲基N，N'-[硫代双[（甲基亚氨基）羰基氧代]]双硫代乙亚胺酯（通用名：Thiodicarb），

S-甲基 N-（甲基氨甲酰氧代）硫代乙酰亚胺酯（通用名：Methomyl），

N，N-二甲基-2-甲基氨甲酰氧代亚氨基-2-（甲硫基）乙酰胺（通用名：Oxamyl），

2 - (乙硫基甲基) 苯基 N - 甲基氨基甲酸酯 (通用名: Ethiofencarb),

2 - 二甲基氨基 - 5, 6 - 二甲基嘧啶 - 4 - 基 N, N - 二甲基氨基甲酸酯 (通用名: Pirimicarb), 和

2 - 仲丁基苯基 N - 甲基氨基甲酸酯 (通用名: Fenobucarb);

Nereistoxin 衍生物

S, S' - 2 - 二甲基氨基三亚甲基双 (硫代氨基甲酸酯) (通用名: Carlap), 和

N, N - 二甲基 - 1, 2, 3 - 三噻烷 - 5 - 基胺 (通用名: Thiocyclam);

有机氟化合物

2, 2, 2 - 三氟 - 1, 1 - 双 (4 - 氟苯基) 乙醇 (通用名: Dicofol), 和

4 - 氟苯基 - 2, 4, 5 - 三氟苯基砒 (通用名: Tetradifon)

有机金属化合物

双 [三 (2 - 甲基 - 2 - 苯基丙基) 锡] 氧化物 (通用名: Fenbutatin Oxide);

拟除虫菊酯化合物

(RS) - α - 氰基 - 3 - 苯氧基苄基 (RS) - 2 - (4 - 氟苯基) - 3 - 甲基丁酯 (通用名: Fenvalerate),

3 - 苯氧基苄基 (1RS) - 顺, 反 - 3 - (2, 2 - 二氟乙烯基) - 2, 2 - 二甲基环丙烷羧酸酯 (通用名: Permethrin),

(RS) - α - 氰基 - 3 - 苯氧基苄基 (1RS) - 顺, 反 - 3 - (2, 2 - 二氟乙烯基) - 2, 2 - 二甲基环丙烷羧酸酯 (通用

名：Cypermethrin），

（S）-α-氰基-3-苯氧基苄基（1R）-顺-3-（2，2-二溴乙烯基）-2，2-二甲基环丙烷羧酸酯（通用名：Deltamethrin），

（RS）-α-氰基-3-苯氧基苄基（1RS）-顺，反-3-（2-氯-3，3，3-三氟丙烯基）-2，2-二甲基环丙烷羧酸酯（通用名：Cyhalothrin），

4-甲基-2，3，5，6-四氟苄基-3-（2-氯-3，3，3-三氟-1-丙烯基）-2，2-二甲基环丙烷羧酸酯（通用名：Tefluthrin），和

2-（4-乙氧基苯基）-2-甲基丙基3-苯氧基苄基醚（通用名：Ethofenprox）；

苯甲酰脲化合物

1-（4-氯苯基）-3-（2，6-二氟苯甲酰基）脲（通用名：Diflubenzuron），

1-〔3，5-二氯-4-（3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基氧代）苯基〕-3-（2，6-二氟苯甲酰基）脲（通用名：Chlorfluazuron），和

1-（3，5-二氯-2，4-二氟苯基）-3-（2，6-二氟苯甲酰基）脲（通用名：Teflubenzuron）；

类保幼激素化合物

异丙基（2E，4E）-11-甲氧基-3，7，11-三甲基-2，4-十二碳二烯酸酯（通用名：Methoprene）；

吡嗪酮化合物

2-叔丁基-5-(4-叔丁基苄基硫代)-4-氯-3(2H)吡嗪酮(通用名:Pyridaben);

吡唑化合物

4-[(1,3-二甲基-5-苯氧基吡唑-4-基)-亚甲基氨基-氧甲基]苯甲酸叔丁酯(通用名:Fenpyroximate);

硝基化合物

1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-N-硝基-咪唑烷基-2-叉胺(通用名:Imidacloprid),

1-[N-(6-氯-3-吡啶基甲基)-N-乙基氨基]-1-甲基氨基-2-硝基乙烯(欧洲专利公开No. 3 02, 389),

2-甲基氨基-2-[N-甲基-N-(6-氯-3-吡啶基甲基)氨基]-1-硝基乙烯(欧洲专利公开No. 3 02, 389),

1-(6-氯-3-吡啶基甲基)氨基-1-二甲基氨基-2-硝基乙烯(欧洲专利公开No. 3 02, 389),

1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-2-(1-硝基-2-烯丙基-硫代亚乙基)咪唑烷(欧洲专利公开No. 4 37, 784),

1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-2-(1-硝基-2-乙基-硫代亚乙基)咪唑烷(欧洲专利公开No. 4 37, 784),

1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-2-(1-硝基-2-β-甲基烯丙基硫代亚乙基)咪唑烷(欧洲专利公开No. 437,784),

1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-3-甲基-2-硝基胍(欧洲专利公开No. 3 83, 091),

1-(6-氯-3-吡啶基甲基)-3,3-二甲基-2-硝基胍(欧洲专利公开No. 3 83, 091),

3 - (6 - 氯 - 3 - 吡啶基甲基) - 2 - 硝基亚甲基 - 噻唑烷
(欧洲专利公开 No. 1 9 2 , 0 6 0) ,

1 - (6 - 氯 - 3 - 吡啶基甲基) - 2 - (硝基亚甲基咪唑烷
(欧洲专利公开 No. 1 6 3 , 8 5 5) ,

6 - (6 - 氯 - 3 - 吡啶基甲基氨基) - 1 , 3 - 二甲基 - 5 -
硝基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氢嘧啶 (欧洲专利公开 No. 366,085) ,
和

1 - (6 - 氯 - 3 - 吡啶基甲基) - 5 - 硝基 - 3 - 甲基 - 6 -
甲基氨基 - 1 , 2 , 3 , 4 - 四氢嘧啶 (欧洲专利公开 No. 366,085)

二硝基化合物

有机硫化合物

脲化合物

三嗪化合物

胍化合物

其他化合物

2 - 叔丁基亚氨基 - 3 - 异丙基 - 5 - 苯基 - 3 , 4 , 5 , 6 -
四氢 - 2 H - 1 , 3 , 5 - 噻二嗪 - 4 - 酮 (通用名 Buprofezin) ,

反 - (4 - 氯苯基) - N - 环己基 - 4 - 甲基 - 2 - 氧代噻唑烷
酮 - 3 - 羧基酰胺 (通用名 : Hexythiazox) ,

N - 甲基双 (2 , 4 - 二甲苯基亚氨基甲基) 胺 (通用名 :
Amitraz) ,

N' - (4 - 氯 - O - 甲基苯) - N , N - 二甲基甲脒 (通用
名 : Chlordimeform) 和

(4 - 乙氧基苯基) - [3 - (4 - 氯 - 3 - 苯氧基苯基) 丙

基] (二甲基) 硅烷 (通用名: Silafluofen)。

本发明的化合物也可以与微生物的农业化学品如 B. T. 和昆虫病毒及抗生素如 avermectin 和 milbemycin 的混合物或混合的形式使用。

上述杀菌剂的活性组分的具体例子包括下面的化合物:

嘧啶胺化合物

2-苯胺基-4-甲基-6-(1-丙炔基)嘧啶 (在日本专利公开 No. 208, 581/1988 中公开),

吡咯化合物

1-(4-氯苯氧基)-3, 3-二甲基-1-(1H-1, 2, 4-三唑-1-基)丁酮 (通用名: Triadimefon),

1-(联苯-4-基氧代)-3, 3-二甲基-1-(1H-1, 2, 4-三唑-1-基)丁-2-醇 (通用名: Bitertanol),

1-[N-(4-氯-2-三氟甲基苯基)-2-丙氧基亚氨代乙酰基]咪唑 (通用名: Triflumizole),

1-[2-(2, 4-二氯苯基)-4-乙基-1, 3-二氧戊环-2-基-甲基]-1H-1, 2, 4-三唑 (通用名: Etaconazole),

1-[2-[2, 4-二氯苯基)-4-丙基-1, 3-二氧戊环-2-基-甲基]-1H-1, 2, 4-三唑 (通用名: Propiconazole),

1-[2-[2, 4-二氯苯基)戊基]-1H-1, 2, 4-三唑 (通用名: Penconazole),

双(4-氟苯基)(甲基)(1H-1, 2, 4-三唑-1-基

—甲基)硅烷(通用名: Flusilazole),

2-(4-氯苯基)-2-(1H-1, 2, 4-三唑-1-基)-
—甲基己 腈(通用名: Myclobutanil),

(2RS, 3RS)-2-(4-氯苯基)-3-环丙基-1-
(1H-1, 2, 4-三唑-1-基) 丁-2-醇(通用名:
Cyproconazole),

(RS)-1-(4-氯苯基)-4, 4-二甲基-3-(1H-
-1, 2, 4-三唑-1-基甲基) 戊-3-醇(通用名:
Terbuconazole),

(RS)-2-(2, 4-二氯苯基)-1-(1H-1, 2, 4-
-三唑-1-基)己-2-醇(通用名: Hexaconazole),

(2RS, 5RS)-5-(2, 4-二氯苯基)四氢-5-
(1H-1, 2, 4-三唑-1-基甲基)-2-呋喃基 2, 2, 2-
—三氟乙醚(通用名: Furconazole-顺), 和

N-丙基-N-[2(2, 4, 6-三氯苯氧基)乙基]咪唑-
1-羧基酰胺(通用名: Prochloraz);

噻嘧啉化合物

6-甲基-1, 3-二硫戊环并[4, 5-b] 噻嘧啉-2-酮
(通用名: Quinomethionate);

二硫代氨基甲酸盐化合物

亚乙基双(二硫代氨基甲酸)锰聚合物(通用名: Maneb),

亚乙基双(二硫代氨基甲酸)锌聚合物(通用名: Zineb),

亚乙基双(二硫代氨基甲酸)锰(Maneb)与锌的配合物(通用
名: Mancozeb),

双（二甲基二硫代氨基甲酸）亚乙基双（二硫代氨基甲酸二锌（通用名：Polycarbamate），和

亚丙基双（二硫代氨基甲酸）锌聚合物（通用名：Propineb）；

有机氯化物

4，5，6，7-四氯-2-苯并[c]呋喃酮（通用名：Fthalide），

四氯异邻苯二甲腈（通用名：Chlorothalonil）和

五氯硝基苯（通用名：Quintozene）；

苯并咪唑化合物

1-（丁基氨基甲酰基）苯并咪唑-2-基-氨基甲酸甲酯（通用名：Benomyl），

4，4'-（O-亚苯基）双（3-硫代脲基甲酸）二甲酯（通用名：Thiophanate-Methyl）和

苯并咪唑-2-基氨基甲酸甲酯（通用名：Carbendazim）；

吡啶胺化合物

3-氯-N-（3-氯-2，6-二硝基-4- α ， α ， α -三氟甲基苯基）-5-三氟甲基-2-吡啶胺（通用名：Fluazinam）；

氰基乙酰胺化合物

1-（2-氰基-2-甲氧基亚氨基乙酰基）-3-乙基脲（通用名：Cymoxanil）；

苯酰胺化合物

N-（2-甲氧基乙酰基）-N-（2，6-二甲苯基）-DL-丙氨酸甲酯（通用名：Metalaxyl），

2-甲氧基-N-（2-氧代-1，3-噁唑烷-3-基）乙酰

- 2, 6-二甲苯酰胺 (通用名: Oxadixyl),

(±)-α-2-氯-N-(2, 6-二甲苯基乙酰胺基)-γ-丁内酯 (通用名: Ofurace),

N-苯基乙酰基-N-(2, 6-二甲苯基)-DL-苯胺甲酯 (通用名: Benalaxyl),

N-(2-糠酰)-N-(2, 6-二甲苯基)-DL-苯胺甲酯 (通用名: Furalaxyl) 和

(±)-α-[N-(3-氯苯基)环丙烷羧酰胺]-γ-丁内酯 (通用名: Cyprofuram);

次磺酸化合物

N-二氯氟甲硫基-N', N'-二甲基-N-苯基硫酰胺 (通用名: Dichlofluanid);

铜化合物

氢氧化铜 (通用名: Cupric hydroxide) 和

8-羟基喹啉铜 (通用名: Oxine-Copper);

异噁唑化合物

5-甲基异噁唑-3-醇 (通用名: Hydroxy-isoxazole)

有机磷化合物

三(乙基膦酸)铝 (通用名: Fosetyl-Al),

O-2, 6-二氯-对甲苯基-O, O-二甲基硫代磷酸酯 (通用名: Tolcofos-Methyl),

S-苄基O, O-二异丙基硫代磷酸酯,

O-乙基S, S-二苯基二硫代磷酸酯和

乙基磷酸氢铝;

N-卤代硫代烷基化合物

N-(三氯甲基)环己-4-烯-1,2-二羧酰亚胺(通用名: Captan),

N-(1,1,2,2-四氯乙硫基)环己-4-烯-1,2-二羧酰亚胺(通用名: Captafol)和

N-(三氯甲基)邻苯二甲酰亚胺(通用名: Folpet);

二羧酰亚胺化合物

N-(3,5-二氯苯基)-1,2-二甲基环丙烷-1,2-二羧酰亚胺(通用名: Procymidone),

3-(3,5-二氯苯基)-N-异丙基-2,4-二氧咪唑烷-1-羧酰胺(通用名: Iprodione)和

(RS)-3-(3,5-二氯苯基)-5-甲基-5-乙烯基-1,3-噁唑烷-2,4-二酮(通用名: Vinclozolin);

苯甲酰苯胺化合物

α, α, α -三氟-3'-异丙氧基-O-N-对甲苯甲酰苯胺(通用名: Flutolanil)和

3'-异丙氧基-O-N-对甲苯甲酰苯胺(通用名: Mepronil);

苯甲酰胺化合物

2-(1,3-二甲基吡唑-4-基羧基氨基)-4-甲基-3-戊烯腈(公开在英国专利 No. 2,190,375)和

α -(烟酰氨基)-(3-氟苯基)乙腈(公开在日本专利公开 No. 135,364/1988);

嘧啶化合物

N,N'-[嘧啶-1,4-二基双[(三氯甲基)亚甲基]]

二甲酰胺（通用名：Triforine）；

吡啶化合物

2', 4' - 二氯 - 2 - (3 - 吡啶基) 苯乙酮 O - 甲胍（通用名：PyrifenoX）；

甲醇化合物

(±) - 2, 4' - 二氯 - α - (嘧啶 - 5 - 基) 二苯甲基醇（通用名：Fenarimol）和

(±) - 2, 4' - 二氟 - α - (1H - 1, 2, 4 - 三唑 - 1 - 基 - 甲基) 二苯甲基醇（通用名：Flutriafol）；

哌啶化合物

(RS) - 1 - [3 - (4 - 叔丁基苯基) - 2 - 甲基丙基] 哌啶（通用名：Fenpropidine）；

吗啉化合物

(±) - 顺 - 4 - [3 - (4 - 叔丁基苯基) - 2 - 甲基丙基] - 2, 6 - 二甲基吗啉（通用名：Fenpropimorph）；

有机锡化合物

氢氧化三苯锡（通用名：Fentin Hydroxide）和

乙酸三苯锡（通用名：Fentin Acetate）；

脲化合物

1 - (4 - 氯苄基) - 1 - 环戊基 - 3 - 苯基脲（通用名：Pencycuron）；

肉桂酸化合物

(E, Z) - 4 - [3 - (4 - 氯苄基) - 3 - (3, 4 - 二甲氧基苄基) 丙烯酰] 吗啉（通用名：Dimethomorph）；

苯基氨基甲酸酯化合物

3, 4-二乙氧基苯氨基甲酸异丙酯 (通用名: Diethofencarb);

氟基吡咯化合物

3-氟基-4-(2, 2-二氟-1, 3-苯并二氧戊环-4-基)-吡咯 (商品名: Sapphire) 和

3-(2', 3'-二氟苯基)-4-氟基吡咯 (通用名: Fenpiclonil)。

杀菌剂的其他活性组分包括蒽醌化合物、巴豆酸化合物和抗菌素。

通式 (I) 表示的本发明的 N-苯基氨基甲酸酯化合物与其他农用化学品当以混合物或混合形式使用时, 它们的合适的混合重量比一般可以为 1 : 300 - 300 : 1, 优选 1 : 100 - 100 : 1。

实施例

下面要介绍制备本发明化合物的具体合成实施例。

合成实施例 1 [合成 N-[2-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基硫甲基)苯基]氨基甲酸甲酯 (化合物 No. 1)]

[1] 在室温和搅拌下, 把 2 g 60 wt% 氢氧化钠加到 45 ml 四氢呋喃中, 接着滴加 9.9 g 3-氯-2-巯基-5-三氟甲基吡啶在 40 ml 四氢呋喃中的溶液, 滴加完后, 把反应混合物在回流下加热 30 分钟, 并冷却到室温, 接着滴加 10 g 2-硝基苄基溴在 60 ml 四氢呋喃中的溶液。滴加完后, 在室温继续搅拌 15 小时。把反应混合物倒入水中, 用乙酸乙酯萃取, 水洗, 并用无水硫酸钠干燥。在减压下蒸出溶剂, 用硅胶柱色谱 (展开溶剂: 二氯甲烷: 己烷 = 4 : 1) 提纯得到的残余物, 得到 12 g 2-(3-氯-5-三氟甲基-

2-吡啶基硫甲基)硝基苯。

[2] 把 19.5 g 二水氯化亚锡和 28.5 ml 浓盐酸的混合物冷却到 5℃。把步骤 [1] 得到的 10 g 2-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基硫甲基)硝基苯一次加到该冷却的混合物中,接着加入 52.5 ml 乙醇。将得到的混合物逐渐加热到 80℃,然后在 80℃继续加热 1 小时。冷却该反应混合物,倒入水中,用 40 wt% 的氢氧化钾水溶液碱化。过滤出沉淀的固体,并干燥,得到 8.3 g 熔点为 98-102℃的 2-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基硫甲基)苯胺(中间体 No. 1)。

[3] 在 10-15℃和搅拌的情况下,把 2.23 g 2-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基硫甲基)苯胺和 0.83 g 吡啶在 10 ml 甲苯中的溶液滴加到 1.1 g 氯甲酸甲酯在 10 ml 甲苯中的溶液中。滴加完后,在室温继续反应 2 小时。反应完后,把反应混合物倒入水中,用乙酸乙酯萃取,用水洗涤,并用无水硫酸钠干燥。减压下蒸出溶剂,用己烷洗涤得到的残余物。过滤出沉淀的固体,得到 1.9 g 熔点为 111-113℃的所需产物(化合物 No. 1)。

合成实施例 2 [合成 N-[2-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基硫甲基)苯基]-N-(甲氧基甲基)氨基甲酸甲酯(化合物 No. 3)]

把 0.22 g 氢氧化钾粉末慢慢加到 1 g 上述合成实施例 1 中得到的化合物(化合物 No. 1)在 12 ml 四氢呋喃中的溶液中,接着加 0.19 g 溴化四正丁铵。在室温,把 0.43 g 氯甲基甲醚加到得到的混合物中,然后,在此温度下继续搅拌 15 小时。将反应混合物倒入水中,用二氯甲烷萃取,用水洗涤,无水硫酸钠干燥。减压下

蒸出溶剂，用硅胶柱色谱（展开溶剂：二氯甲烷：己烷=1：1）提纯得到残余物，得到0.52g所需产物（化合物No. 3），其折光指数 $n_D^{25.4}$ 为1.5077。

合成实施例3 [合成N- [2- [(α-甲基-3- (三氟甲基) 亚苄基] 氨基氧甲基] 苯基] 氨基甲酸甲酯(化合物No. 56)]

[1] 在回流下，把7.5g 3'-三氟甲基苯乙酮、6.25g 盐酸羟胺和8.8g 三水乙酸钠在125ml 甲醇中加热1小时，反应完后，减压蒸出甲醇，加190ml 水到得到的残余物中，接着用乙酸乙酯萃取。用无水硫酸钠干燥乙酸乙酯层，在减压下蒸馏解吸溶剂，得到7.3g 熔点63-65℃的3'-三氟甲基苯乙酮肟。

[2] 在室温搅拌下，把0.66g 60wt%的氢化钠加入到18ml 四氢呋喃中，接着滴加3g 在步骤[1]中得到的3'-三氟甲基苯乙酮肟在18ml 四氢呋喃中的溶液。滴加完后，在室温下搅拌反应混合物1小时，接着滴加3g N- [2- (氯甲基) 苯基] 氨基甲酸甲酯在20ml 四氢呋喃中的溶液。滴加完后，在室温继续搅拌3小时。将反应混合物倒入水中，用乙酸乙酯萃取，水洗涤，并用无水硫酸钠干燥。减压下蒸出溶剂。用硅胶柱色谱（展开溶剂：二氯甲烷：己烷=4：1）提纯得到的残余物，得到1.8g 熔点77-80℃的所需产物（化合物No. 56）。

合成实施例4 [合成N- (甲氧基甲基) -N- [2- [[α-甲基-3- (三氟甲基) 亚苄基] 氨基氧甲基] 苯基] 氨基甲酸甲酯(化合物No. 57)]

把0.29g 氢氧化钾粉末慢慢地加到上述合成实施例3得到的1.3g 化合物（化合物No. 56）在25ml 四氢呋喃中的溶液中，

接着加 0.25 g 溴化四正丁基铵。在室温下，把 0.57 g 氯甲基甲醚加到生成的混合物中，然后，在室温下继续搅拌 1 小时。将反应混合物倒入水中，用乙醚萃取，水洗，并用无水硫酸钠干燥。减压下蒸出溶剂。用硅胶柱色谱（展开溶剂：二氯甲烷：己烷 = 3 : 1）提纯得到的残余物，得到 0.81g 所需产物（化合物 No. 57），它的折光指数 $n_D^{19.3}$ 为 1.4761。

合成实施例 5 [合成 N - [2 - (2 - 氯苯乙烯基) 苯基] 氨基甲酸甲酯（化合物 No. 52）]

[1] 在室温搅拌下，把 1.63 g 60 wt% 的氯化钠加到 20 ml 四氢呋喃中，接着冷却其到 0℃，并滴加 8 g 2-硝基苄基磷酸二甲酯在 20 ml 四氢呋喃中的溶液。滴加完成后，在 0℃ 搅拌反应混合物 30 分钟，接着滴加 6.2 g 2-氯苯甲醛。滴加完后，将得到的混合物逐渐加热到室温，然后在此温度继续搅拌 17 小时。将反应混合物倒入水中，用乙酸乙酯萃取，水洗，并用无水硫酸钠干燥。减压下蒸出溶剂。用硅胶柱色谱提纯得到的残余物两次（第一次展开溶剂：二氯甲烷：己烷 = 7 : 3，第二次展开溶剂：二氯甲烷：己烷 = 3 : 1）得到 5.8 g 2-氯-2'-硝基芪。

[2] 将 23 ml 浓盐酸加到 15.1 g 二水氯化亚锡中，形成一种混合物，在搅拌下的该混合物中加 5.8 g 步骤 [1] 得到的 2-氯-2'-硝基芪和 4.1 ml 乙醇。然后，将形成的混合物逐渐加热到回流温度，再在此温度下继续加热 25 分钟。冷却反应混合物，倒入水中，并用氢氧化钾水溶液碱化。过滤出沉淀的半固体，将乙酸乙酯加到该半固体中，接着过滤除去不溶物。减压下蒸馏滤液，得到 5 g 油状 2-氨基-2'-氯芪（中间体 No. 13）。

[3] 将 5 g 步骤 [2] 中得到的 2 - 氨基 - 2' - 氯芪和 2.6 g 吡啶在 30 ml 甲苯中的溶液, 在室温搅拌下, 滴加到 3.4 g 氯甲酸甲酯在 39 ml 甲苯中的溶液中。滴加完后, 在室温继续反应 2 小时, 反应完后, 将反应混合物倒入水中, 用乙酸乙酯萃取, 水洗, 并用无水硫酸钠干燥。在减压下蒸出溶剂。用硅胶柱色谱提纯得到的残余物两次 (第一次展开溶剂: 二氯甲烷: 己烷 = 3 : 1, 第二次展开溶剂: 乙酸乙酯: 己烷 = 1 : 4), 得到 1.85 g 熔点 135 - 137 °C 的所需产物 (化合物 No. 52)。

合成实施例 6 [合成 N - [2 - (2 - 氯苯乙烯基) 苯基] - N - (甲氧基甲基) 氨基甲酸甲酯 (化合物 No. 53)]

将 0.29 g 氢氧化钾粉末慢慢加到 1 g 上述合成实施例 5 中得到的化合物 (化合物 No. 52) 在 20 ml 四氢呋喃中的溶液中, 接着加 0.25 g 溴化四正丁基铵。在室温下, 将 0.56 g 氯甲基甲醚加到生成的混合物中, 然后, 在此温度继续搅拌 1.5 小时。将反应混合物倒入水中, 用乙酸乙酯萃取, 用水洗, 并用无水硫酸钠干燥。减压下蒸出溶剂。用硅胶柱色谱 (展开溶剂: 二氯甲烷: 己烷 = 2 : 1) 提纯得到的残余物, 得到 0.54 g 粘状液体形式的所需产物 (化合物 No. 53), 它的 NMR 数据列在表 2 后面的说明中, 表 2 将在后面给出。

合成实施例 7 [合成 N - [2 - (3 - 氯 - 5 - 三氟甲基 - 2 - 吡啶基亚硫酰基甲基) 苯基] 氨基甲酸甲酯 (化合物 No. 60)]

在室温搅拌下, 将 0.41 g m-氯过苯甲酸慢慢加到按合成实施例 1 (化合物 No. 1) 的同样方法得到的 0.75 g N - [2 - (3 - 氯 - 5 - 三氟甲基 - 2 - 吡啶基硫甲基) 苯基] 氨基甲酸酯在

20 ml 二氯甲烷中的溶液中，加完后，在室温继续反应 20 小时。将反应混合物倒入水中，用乙酸乙酯萃取，水洗，并用无水硫酸钠干燥。减压下蒸出溶剂，用己烷洗涤形成的残余物。过滤出沉淀的固体，得到 0.66 g 熔点为 160 – 162 °C 的所需产物（化合物 No. 60）。

合成实施例 8 [合成 N – [2 – [[甲硫基) (5 – 三氟甲基 – 2 – 吡啶基) 亚甲基] 氨基氧甲基] 苯基] 氨基甲酸甲酯 (化合物 No. 201)]

[1] 在室温搅拌下，将 180 ml 乙醇加到 22 g 2 – 氟基 – 5 – 三氟甲基吡啶在 180 ml 1, 2 – 二氯乙烷中的溶液中，接着滴加 9.8 g 盐酸羟胺在 17 ml 水中的溶液。将 56 g 氢氧化钠在 17 ml 水中的水溶液滴加到形成的混合物中。滴加完后，在 80 °C 加热反应混合物 2 小时。冷却反应混合物，过滤除去不溶物。减压蒸馏滤液，除去其中的溶剂。用己烷洗涤形成的残余物，过滤出沉淀的固体，得到 25 g 熔点 130 – 133 °C 的 5 – 三氟甲基 – 2 – 吡啶羧酰胺肟。

[2] 在搅拌下，将 10.25 g 上述步骤 [1] 得到的 5 – 三氟甲基 – 2 – 吡啶羧酰胺肟加到 175 ml 4N 盐酸中。将形成的混合物冷却到 0 – 5 °C，接着滴加 4.15 g 亚硝酸钠在 25 ml 水中的水溶液。滴加完后，在 0 – 5 °C 继续搅拌 3 小时。反应完后，过滤出沉淀的固体，得到 8.8 g α – 氯 – 5 – 三氟甲基吡啶甲醛肟。

[3] 在室温搅拌下，把 10 ml 15 wt% 甲硫醇钠水溶液滴加到 4.49 g 上述步骤 [2] 得到的 α – 氯 – 5 – 三氟甲基吡啶甲醛肟在 10 ml 四氢呋喃中的溶液中。滴加完后，在室温继续搅拌 1 小时。反应完后，将反应混合物倒入水中，用乙醚萃取，水洗，并用无

水硫酸钠干燥。减压蒸出溶剂。用硅胶柱色谱（展开溶剂：二氯甲烷）提纯形成的残余物，得到 3.5 g α -甲硫基-5-三氟甲基吡啶甲醛肟。

[4] 在室温搅拌下，将 0.62 g 的 60 wt% 氢化钠加到 20 ml 四氢呋喃中，接着滴加 3.3 g 上述步骤 [3] 中得到的 α -甲硫基-5-三氟甲基吡啶甲醛肟在 30 ml 四氢呋喃中的溶液。滴加完后，在室温搅拌反应混合物 30 分钟，接着滴加 3.35 g N-[2-(氟甲基)苯基]氨基甲酸甲酯在 30 ml 四氢呋喃中的溶液。滴加完后，在室温继续搅拌 3 小时。将反应混合物倒入水中，用二氯甲烷萃取，水洗，无水硫酸钠干燥。减压蒸出溶剂。用硅胶柱色谱（展开溶剂：二氯甲烷：己烷 = 1 : 2）提纯形成的残余物，得到 3.1 g 熔点 120 - 122 °C 的所需产物（化合物 No. 201）。

合成实施例 9 [合成 N-(甲氧基甲基)-N-[2-[[[甲硫基](5-三氟甲基-2-吡啶基)亚甲基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯（化合物 No. 202）]

把 0.28 g 氢氧化钾粉末慢慢加到 1.32 g 合成实施例 8 得到的化合物（化合物 No. 201）在 25 ml 四氢呋喃中的溶液中，接着加 0.25 g 溴化四正丁基铵。在室温下，将 0.53 g 氟甲基甲醚加到得到的混合物中，然后在此温度继续搅拌 1 小时。将反应混合物倒入水中，用二氯甲烷萃取，用水洗，无水硫酸钠干燥。减压蒸出溶剂，用硅胶柱色谱（展开溶剂：二氯甲烷：己烷 = 1 : 2）提纯形成的残余物，得到 1.0 g 半固体状所需产物（化合物 No. 202）。

合成实施例 10 [合成 N-[2-[α -甲基亚苄基]氨基氧甲基]苯基]氨基甲酸甲酯（化合物 No. 131）]

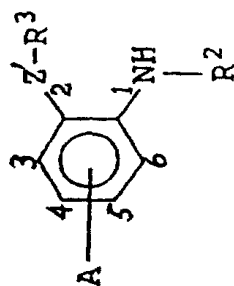
把 2.0 g 氢氧化钾粉末慢慢加到 30 ml 四氢呋喃中，接着在室温搅拌下滴加 4.06 g 苯乙酮肟在 25 ml 四氢呋喃中的溶液，滴加完后，在室温搅拌反应混合物 30 分钟，接着滴加 6.0 g N - [2 - (氯甲基) 苯基] 氨基甲酸甲酯在 30 ml 四氢呋喃中的溶液。滴加完后，在室温继续搅拌 1 小时 20 分钟。将反应混合物倒入水中，用乙酸乙酯萃取，水洗，并用无水硫酸钠干燥。减压下蒸出溶剂。用硅胶柱色谱（展开溶剂：二氯甲烷：己烷 = 3 : 1）提纯形成的残余物，得到 5.7 g 熔点 84 - 88 °C 的所需产物（化合物 No. 131）。

合成实施例 11 [合成 N - (甲氧基甲基) - N - [2 - [[α - 甲基亚苄基) 氨基氧甲基] 苯基] 氨基甲酸甲酯（化合物 No. 132）]

把 0.82 g 氢氧化钾粉末慢慢加到 3.0 g 上述合成实施例 10 得到的化合物（化合物 No. 131）在 50 ml 四氢呋喃中的溶液中，接着加 0.72 g 溴化四正丁基铵。在室温将 1.61 g 氯甲基甲醚加到得到的混合物中，然后在此温度下继续搅拌 30 分钟。将反应混合物倒入水中，用乙酸乙酯萃取，水洗，并用无水硫酸钠干燥，减压下蒸出溶剂。用硅胶柱色谱（展开溶剂：己烷：乙酸乙酯 = 5 : 1）提纯形成的残余物，得到 2.2 g 熔点 61 - 63 °C 的所需产物（化合物 No. 132），它的 NMR 数据列在表 2 后面的说明中，表 2 将在下面给出。

本发明通式 (I I) 的中间体和通式 (I) 的化合物的有代表性的例子分别列于下列表 1 和 2。

表 1



(II)

中间体编号	R ²	Z'	R ³	A	物理性质
1	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 98-102°C
2	H	-CH ₂ S-	2-苯并噻唑基	H	见后面提到的NMR数据
3	H	-CH ₂ S-	2-吡啶基	H	见后面提到的NMR数据
4	H	-CH ₂ SCH ₂ -	苯基	H	见后面提到的NMR数据
5	H	-CH ₂ S-	3-三氟甲基-2-吡啶基	H	见后面提到的NMR数据
6	H	-CH ₂ S-	5-三氟甲基-2-吡啶基	H	见后面提到的NMR数据
7	H	-CH ₂ S-	3,5-双(三氟甲基)-2-吡啶基	H	
8	H	-CH ₂ S-	2-三氟甲基苯基	H	浅黄色固体
9	H	-CH ₂ S-	2-氯苯基	H	

表 1 (续)

中间体编号	R ²	Z'	R ³	A	物理性质
10	H	-CH ₂ S-	3,5-二氯-2-吡啶基	H	-
11	H	-SCH ₂ -	2-氯苯基	H	见后面提到的NMR数据
12	H	-SCH ₂ -	3,5-二氯-2-吡啶基	H	-
13	H	-CH=CH-	2-氯苯基	H	油状物质
14	H	-CH ₂ S-	5-氯-1-甲基-2-苯并咪唑基和/或5-氯-3-甲基-2-苯并咪唑基	H	油状物质
15	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	6-CH ₃	m.p. 80-83°C
16	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	5-Cl	m.p. 104-106°C
17	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-CH ₃	-
18	H	-CH ₂ S-	3-苯基-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 129-131°C
19	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-OCH ₃	m.p. 93-95°C

表1 (续)

中间体编号	R ²	Z'	R ³	A	物理性质
20	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	4-(3-氯 -5-三氟 甲基-2- 吡啶基) 氧 6-OCH ₃	m.p. 180-181°C
21	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基		
22	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	5-F	m.p. 130-133°C
23	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	3-F	油状物质

在表 1 中，Z' 的右边的连字号代表向着 R³ 的一个键。

中间体 No. 3 的 ¹H-NMR 数据 (在 CDCl₃ 中) : 3.90-4.67 (br. s, 2H) , 4.43 (s, 2H) , 6.55-7.55 (m, 7H) , 8.33-8.47 (dd, 1H)

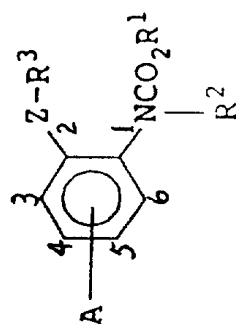
中间体 No. 4 的 ¹H-NMR 数据 (在 CDCl₃ 中) : 3.50-4.00 (br. s, 2H) , 3.60 (s, 4H) , 6.60-7.30 (m, 9H) 中间体

中间体 No. 5 的 ¹H-NMR 数据 (在 CDCl₃ 中) : 3.97-4.40 (br. s, 2H) , 4.50 (s, 2H) , 6.57-7.27 (m, 5H) , 7.80 (dd, 1H) , 8.57 (dd, 1H)

中间体 No. 6 的 ¹H-NMR 数据 (在 CDCl₃ 中) : 3.92-4.08 (br. s, 2H) , 4.42 (s, 2H) , 6.57-7.25 (m, 5H) , 7.58 (dd, 1H) , 8.67 (dd, 1H)

中间体 No. 11 的 ¹H-NMR 数据 (在 CDCl₃ 中) : 3.97 (s, 2H) , 4.07-4.43 (br. s, 2H) , 6.40-7.37 (m, 8H)

表 2



(I)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
1	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 111-113°C
2	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ^{26.9} 1.4886
3	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ^{26.4} 1.5077
4	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
5	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ^{24.2} 1.4708
6	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ²⁵ 1.5318
7	-CH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ^{25.1} 1.4826
8	-CH ₃	-CO ₂ CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 128-133°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
9	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ^{24.6} 1.4839
10	-C ₂ H ₅	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 110-114°C
11	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
12	-n-C ₃ H ₇	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 89-92°C
13	-i-C ₃ H ₇	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 99-102°C
14	-C ₂ H ₅	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ^{22.1} 1.4771
15	-CH ₂ $\begin{smallmatrix} \text{CH}_2 \\ \\ \text{Cl} \end{smallmatrix}$	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 79-81°C
16	-n-C ₄ H ₉	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	-
17	-CH ₃	-COCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 87-88°C
18	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
19	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3,5-双(三氟甲基)-2-吡啶基	H	m.p. 109-113°C
20	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3,5-双(三氟甲基)-2-吡啶基	H	粘性液体
21	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ S-	3,5-双(三氟甲基)-2-吡啶基	H	粘性液体
22	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 97-105°C
23	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ^{20.5} 1.4850
24	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 113-115°C
25	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	5-三氟甲基-2-吡啶基	H	n _D ^{20.5} 1.4856
26	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3,5-二氯-2-吡啶基	H	m.p. 112-115°C
27	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3,5-二氯-2-吡啶基	H	粘性液体
28	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	2-吡啶基	H	m.p. 65-67°C
29	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	2-吡啶基	H	n _D ^{22.3} 1.4632
30	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	2-氯-4-三氟甲基苯基	H	m.p. 147-149°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
31	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	2-氯-4-三氟甲基 苯基	H	m.p. 84-86°C
32	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	2-氯苯基	H	m.p. 92-95°C
33	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	2-氯苯基	H	n _D ¹⁶ 1.4699
34	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	2-三氟甲基苯基	H	m.p. 106-108°C
35	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	2-三氟甲基苯基	H	n _D ²⁰ 1.4631
36	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	苯基	H	n _D ²³ 1.5391
37	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	苯基	H	m.p. 70-72°C
38	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	2-苯并噻唑基	H	m.p. 138-141°C
39	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ S-	2-苯并噻唑基	H	m.p. 70-72°C
40	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	2-苯并噻唑基	H	粘性液体
41	-CH ₃	H	-SCH ₂ -	3-5-二氯-2-吡 啶基	H	m.p. 47-49°C
42	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-SCH ₂ -	3-5-二氯-2-吡 啶基	H	n _D ¹⁷ 1.4882
43	-CH ₃	H	-SCH ₂ -	2-氯苯基	H	n _D ²⁰ 1.4892
44	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-SCH ₂ -	2-氯苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
45	-CH ₃	H	-SCH ₂ -	苯基	H	n _D ²² . ¹¹ 1.4856
46	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-SCH ₂ -	苯基	H	m.p. 77-78°C
47	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	苯基	H	n _D ²⁵ 1.5244
48	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-	苯基	H	m.p. 78-81°C
49	-CH ₃	H	-OCH ₂ -	苯基	H	n _D ²⁵ . ⁰¹ 1.5466
50	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-OCH ₂ -	苯基	H	n _D ²⁵ . ⁰¹ 1.5364
51	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH=CH-	苯基	H	m.p. 85-88°C
52	-CH ₃	H	-CH=CH-	2-氯苯基	H	m.p. 135-137°C
53	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH=CH-	2-氯苯基	H	粘性液体
54	-CH ₃	H	-CH ₂ SCH ₂ -	苯基	H	m.p. 52-55°C
55	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -	苯基	H	n _D ²² . ⁰¹ 1.4768
56	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	m.p. 77-80°C
57	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	n _D ¹⁹ . ³¹ 1.4761

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
58	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=CH-	3-三氟甲基苯基	H	m.p. 57-61°C
59	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=CH-	3-三氟甲基苯基	H	n _D ^{17.3} 1.4939
60	-CH ₃	H	-CH ₂ SO-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 160-162°C
61	-CH ₃	H	-CH ₂ SO ₂ -	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 182-184°C
62	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	5-氯-1-甲基-2-苯并咪唑基和/或5-氯-3-甲基-2-苯并咪唑基	H	m.p. 170-175°C
63	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	5-氯-1-甲基-2-苯并咪唑基和/或5-氯-3-甲基-2-苯并咪唑基	H	粘性液体
64	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	2,4-二氯苯基	H	m.p. 111-112°C
65	-CH ₃	H	-CH=CH-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	
66	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH=CH-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
67	-CH ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
68	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	H	-
69	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	H	-
70	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=CH-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	H	-
71	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=CH-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	H	-
72	-CH ₃	H	-SCH ₂ -	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	H	-
73	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-SCH ₂ -	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	H	-
74	-CH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ -	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	H	-
75	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ -	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	H	-
76	-CH ₃	H	-C≡C-	4-氯苯基	H	-

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
77	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-C≡C-	4-氟苯基	H	-
78	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	2-苯并噁唑基	H	-
79	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	2-苯并噁唑基	H	-
80	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	1-甲基-5-三氟甲基咪唑并[5,4-a]吡啶-2-基	H	-
81	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	1-甲基-5-三氟甲基咪唑并[5,4-a]吡啶-2-基	H	-
82	-CH ₃	H	-CH=CH-	吡啶-2-基	H	m.p. 106-108°C
83	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH=CH-	2-吡啶基	H	m.p. 68-72°C
84	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	2-吡啶基	H	-
85	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-	5-氟-2-苯并噁唑基	H	-
86	-CH ₃	-CH ₂ 	-CH ₂ S-	5-氟-2-苯并噁唑基	H	-
87	-CH ₃	-CH ₂ C≡C-I	-CH ₂ S-	3-氟-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	-

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
88	-CH ₂ CF ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	-
89	-CH ₂ CF ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	-
90	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3,5,6-三氯-2-三氟甲基-4-吡啶基	H	-
91	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3,5,6-三氯-2-三氟甲基-4-吡啶基	H	-
92	-CH ₃	-CH ₂ S(CH ₃)	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
93	-CH ₃	-CH(CO ₂ CH ₃) CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
94	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	o-CH ₃	m.p. 134-135°C
95	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-CH ₃	m.p. 115-116°C
96	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	5-Cl	m.p. 117-118°C
97	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-苯基-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 117-118°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
98	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	2,3-(二氟亚甲基 二氧)苯基	H	m.p. 100-102°C
99	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	2,3-(二氟亚甲基 二氧)苯基	H	粘性液体
100	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	5-氯-2-噻啶基	H	m.p. 98-100°C
101	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	5-氯-2-噻啶基	H	粘性液体
102	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	1-吡啶基	H	m.p. 89-92°C
103	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体
104	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	4-cl	m.p. 134-136°C
105	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	4-cl	m.p. 106-108°C
106	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二氯苯基	H	m.p. 128-132°C
107	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二氯苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
108	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二氯苯基	H	粘性液体
109	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-氯苯基	H	m.p. 127-130°C
110	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-氯苯基	H	粘性液体
111	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-氯苯基	H	粘性液体
112	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	5-氯-3-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 111-112°C
113	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	5-氯-3-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
114	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ S-	5-氯-3-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
115	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	4-甲基-5-苯基-2-噻唑啉-2-基	H	粘性液体
116	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	4-甲基-5-苯基-2-噻唑啉-2-基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
117	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	4-甲基-5-苯基-2-恶唑啉-2-基	H	粘性液体
118	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	4-甲基-5-苯基-2-恶唑啉-2-基	H	粘性液体
119	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C(CH ₃)	3-三氟甲基苯基	4-CH ₃	m.p. 87-89°C
120	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C(CH ₃)	3-三氟甲基苯基	4-CH ₃	粘性液体
121	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C(CH ₃)	3-三氟甲基苯基	4-CH ₃	粘性液体
122	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-CH ₃	粘性液体
123	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-CH ₃	粘性液体
124	-CH ₃	-COCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-CH ₃	m.p. 79-82°C
125	-CH ₃	-COCH ₃	-CH ₂ S-	2-苯并噻唑基	H	m.p. 98-100°C
126	-CH ₃	-COCH ₂ Cl	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 112-115°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
127	-CH ₃	-CO- 	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 107-108°C
128	-CH ₃	-COCH ₂ CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 96-99°C
129	-CH ₃	-COCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	m.p. 90-91°C
130	-CH ₃	-COCH(CH ₃ CH ₃)	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 94-97°C
131	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	H	m.p. 84-88°C
132	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	H	m.p. 61-63°C
133	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
134	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氯苯基	H	m.p. 120-122°C
135	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氯苯基	H	粘性液体
136	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氯苯基	H	粘性液体
137	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,5-双(三氟甲基)苯基	H	m.p. 117-120°C
138	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,5-双(三氟甲基)苯基	H	粘性液体
139	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,5-双(三氟甲基)苯基	H	粘性液体
140	-CH ₃	-CH ₂ C≡C-CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 96-97°C
141	-CH ₃	-CH ₂ C≡C-CH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体

表 2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
142	-CH ₃	-CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
143	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CF ₃	苯基	H	m.p. 55-62°C
144	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CF ₃	苯基	H	粘性液体
145	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	7-三氟甲基-4-喹啉基	H	m.p. 147-149°C
146	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	7-三氟甲基-4-喹啉基	H	m.p. 104-106°C
147	-CH ₃	-COCH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 92-94°C
148	-CH ₃	H	-CH ₂ O	3-甲氧基苯基	H	m.p. 85-87°C
149	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-溴苯基	H	m.p. 125-127°C
150	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-溴苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
151	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-溴苯基	H	粘性液体
152	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-三氟甲基苯基	H	m.p. 133-136°C
153	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-三氟甲基苯基	H	m.p. 63-65°C
154	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-三氟甲基苯基	H	m.p. 66-69°C
155	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-(3-氯-5-三氟 甲基-2-吡啶基氧) 苯基	H	m.p. 92-94°C
156	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-氯苯基	H	m.p. 101-103°C
157	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-氯苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
158	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-氯-2-吡啶基	H	m.p. 85-88°C
159	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-氯-2-吡啶基	H	粘性液体
160	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-氯-2-吡啶基	H	粘性液体
161	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-氯-2-噻吩基	H	m.p. 125-127°C
162	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-氯-2-噻吩基	H	粘性液体
163	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-氯-2-噻吩基	H	m.p. 102-105°C
164	-CH ₃	-CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氯甲基苯基	H	粘性液体

表2 (续)

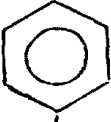
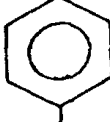
化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
165	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₂ CH ₃	3-氯苯基	H	m.p. 58-62°C
166	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₂ CH ₃	3-氯苯基	H	粘性液体
167	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₂ CH ₃	3-氯苯基	H	粘性液体
168	-CH ₃	-CH ₂ - 	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
169	-CH ₃	-CH ₂ - 	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
170	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-三氟甲基苯基	H	m.p. 38-40°C
171	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-三氟甲基苯基	H	粘性液体
172	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲基苯基	H	m.p. 79-81°C
173	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-硝基苯基	H	m.p. 170-172°C
174	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-硝基苯基	H	m.p. 72-74°C
175	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-二氯苯基	H	m.p. 140-142°C
176	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-二氯苯基	H	粘性液体
177	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-二氯苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
178	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CO ₂ CH ₃	苯基	H	m.p. 98-100°C
179	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CO ₂ CH ₃	4-氟苯基	H	m.p. 116-118°C
180	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- 	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体
181	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- 	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体
182	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- 	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
183	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	4-二甲氨基氨基-3-甲基苯基	H	粘性液体
184	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	6-OCH ₃	m.p. 123-125°C
185	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	6-OCH ₃	m.p. 104-107°C
186	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基)氧基	m.p. 161-164°C
187	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ F	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体
188	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ F	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	H	粘性液体
189	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-氟苯基	H	m.p. 133-135°C
190	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-氟苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
191	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-氟苯基	H	粘性液体
192	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲基苯基	H	m.p. 76-78°C
193	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲基苯基	H	粘性液体
194	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲基苯基	H	粘性液体
195	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,5-二氟苯基	H	m.p. 152-155°C
196	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,5-二氟苯基	H	粘性液体
197	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,5-二氟苯基	H	粘性液体
198	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-萘基	H	m.p. 95-98°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
199	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-萘基	H	粘性液体
200	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,3-(二氟亚甲基二氧)苯基	H	m.p. 83-86°C
201	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- SCH ₃	5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 120-122°C
202	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- SCH ₃	5-三氟甲基-2-吡啶基	H	半固体
203	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- SCH ₃	5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 100-102°C
204	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-OCH ₃	m.p. 129-130°C
205	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-OCH ₃	粘性液体
206	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-OCH ₃	粘性液体
207	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	3-F	m.p. 115-117°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
208	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	3-F	m.p. 90-91°C
209	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	3-F	粘性液体
210	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	5-F	m.p. 124-127°C
211	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	5-F	粘性液体
212	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	5-F	粘性液体
213	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基	4-(3-氯-5-三氟甲基-2-吡啶基)氧基	粘性液体
214	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基磺酰氧基	H	m.p. 68-70°C
215	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基磺酰氧基	H	粘性液体

表 2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
216	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲氧苯基	H	m.p. 80-85°C
217	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲氧苯基	H	粘性液体
218	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-氯-3-三氟甲基 苯基	H	m.p. 86-90°C
219	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	3-甲氧基亚氨基 甲基苯基	H	m.p. 103-104°C
220	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-	3-甲氧基亚氨基 甲基苯基	H	粘性液体
221	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	3-(1-甲氧基亚氨基) 乙基苯基	H	m.p. 90-91°C
222	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-	3-(1-甲氧基亚氨基) 乙基苯基	H	粘性液体
223	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-亚甲基二氧基 苯基	H	m.p. 117-119°C
224	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-亚甲基二氧基 苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
225	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,3-(二氟亚甲基 二氧基)苯基	H	粘性液体
226	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-亚乙基二氧 基苯基	H	m.p. 97-101°C
227	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-亚乙基二氧 基苯基	H	粘性液体
228	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲基苯基	4-CH ₃	m.p. 83-85°C
229	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲基苯基	4-CH ₃	粘性液体
230	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲基苯基	4-CH ₃	粘性液体
231	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CN	3-三氟甲基苯基	H	m.p. 137-139°C
232	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CN	3-三氟甲基苯基	H	m.p. 79-81°C

表 2 (续)

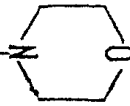
化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
233	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- NH ₂	5-三氟甲基-2-吡啶基	H	m.p. 116-118°C
234	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- 	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体
235	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- 	4-氯苯基	H	m.p. 69-74°C
236	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- 	4-氯苯基	H	粘性液体
237	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-溴苯基	H	m.p. 124-126°C

表 4 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
238	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-溴苯基	H	粘性液体
239	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-吡啶基	H	m.p. 93-95°C
240	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-吡啶基	H	粘性液体
241	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-吡啶基	H	m.p. 88-90°C
242	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-吡啶基	H	粘性液体
243	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(二氟甲氧基) 苯基	H	m.p. 89-91°C
244	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(二氟甲氧基) 苯基	H	粘性液体
245	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-噻吩基	H	m.p. 106-108°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
246	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-噻吩基	H	粘性液体
247	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	4-CH ₃	m.p. 89-91°C
248	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	4-CH ₃	粘性液体
249	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氟苯基	H	m.p. 115-118°C
250	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氟苯基	H	粘性液体
251	-CH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体
252	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-三氟甲基苯基	H	粘性液体
253	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- H	苯基	H	m.p. 55-57°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
254	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- H	苯基	H	粘性液体
255	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₂ CH ₃	苯基	H	粘性液体
256	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₂ CH ₃	苯基	H	粘性液体
257	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-呋喃基	H	m.p. 78-80°C
258	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-呋喃基	H	粘性液体
259	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- SCH ₃	2-吡啶基	H	m.p. 118-119°C
260	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- SCH ₃	2-吡啶基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
261	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	1-甲基-3-吡啶基	H	m.p. 150-152°C
262	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲基苯基	H	-
263	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	1-甲基-3-吡咯基	H	m.p. 128-130°C
264	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	1-甲基-3-吡咯基	H	粘性液体
265	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-(甲基硫代)苯基	H	m.p. 88-92°C
266	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-(甲基硫代)苯基	H	粘性液体
267	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- SCH ₃	苯基	H	-
268	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- SCH ₃	苯基	H	-

表 2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
269	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-乙酰氧基苯基	H	-
270	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-乙酰氧基苯基	H	-
271	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(2-四氢吡喃基) 氧基苯基	H	-
272	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(2-四氢吡喃基) 氧基苯基	H	-
273	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(二甲基氨基甲 酰基)氧基苯基	H	粘性液体
274	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(二甲基氨基甲 酰基)氧基苯基	H	粘性液体
275	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氟基苯基	H	m.p. 148-150°C
276	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氟基苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
277	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-二甲氨基苯基	H	m.p. 109-111°C
278	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-二甲氨基苯基	H	粘性液体
279	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-联苯基	H	粘性液体
280	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-联苯基	H	粘性液体
281	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲氧基苯基	H	m.p. 109-111°C
282	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲氧基苯基	H	粘性液体
283	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-二甲氧基苯基	H	m.p. 159-161°C
284	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-二甲氧基苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
285	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二甲氧基苯基	H	m.p. 120-122°C
286	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二甲氧基苯基	H	粘性液体
287	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,5-二甲氧基苯基	H	m.p. 45-47°C
288	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,5-二甲氧基苯基	H	粘性液体
289	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-乙氧基苯基	H	m.p. 96-98°C
290	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-乙氧基苯基	H	粘性液体
291	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(甲氧甲基)苯基	H	-
292	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(甲氧甲基)苯基	H	-

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
293	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-吡嗪基	H	-
294	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-吡嗪基	H	-
295	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二甲基-5-噁 唑基	H	-
296	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二甲基-5-噁 唑基	H	-
297	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二甲基-5-噁 唑基	H	-
298	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,4-二甲基-5-噁 唑基	H	-
299	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	1-甲基-2-咪唑基	H	-
300	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	1-甲基-2-咪唑基	H	-

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
301	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-苯并呋喃基	H	-
302	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-苯并呋喃基	H	-
303	-CH ₃	H	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	4-(2-氯 -4-三氟 甲基)苯 氧基	-
304	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ S-	3-氯-5-三氟甲基 -2-吡啶基	4-(2-氯 -4-三氟 甲基)苯 氧基	-
305	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- OCH ₃	苯基	H	m.p. 69-72°C
306	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- OCH ₃	苯基	H	粘性液体
307	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- N(CH ₃) ₂	苯基	H	-

表 2 (续)

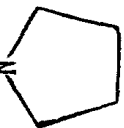
化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
308	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-
309	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-
310	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-
311	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-

表2 (续)

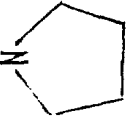
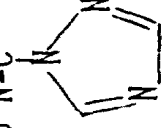
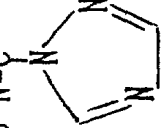
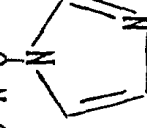
化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
312	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-
313	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-
314	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-
315	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-

表 2 (续)

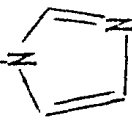
化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
316	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- 	苯基	H	-
317	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-苯并噻吩基	H	-
318	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2-苯并噻吩基	H	-
319	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	H	m.p. 59-61°C
320	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	H	m.p. 47-48°C
321	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
322	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	H	m.p. 68-70°C
323	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-亚甲基二氧基 苯基	H	粘性液体
324	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-亚甲基二氧基 苯基	H	m.p. 90-92°C
325	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-异丙氧基苯基	H	m.p. 88-90°C
326	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-异丙氧基苯基	H	粘性液体
327	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-三氟甲基-2-吡 啶基	H	m.p. 126-128°C
328	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-三氟甲基-2-吡 啶基	H	m.p. 77-79°C
329	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	1,2,3,4-四氢-6- 萘基	H	m.p. 109-111°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
330	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	1,2,3,4-四氢-6-萘基	H	m.p. 72-74°C
331	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-(2,3-二氢化茚基)	H	m.p. 119-121°C
332	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-(2,3-二氢化茚基)	H	m.p. 40-47°C
333	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯基	H	粘性液体
334	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,3-二氢-5-苯并呋喃基	H	m.p. 111-114°C
335	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,3-二氢-5-苯并呋喃基	H	粘性液体
336	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲氧基-3-甲基苯基	H	m.p. 110-112°C
337	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲氧基-3-甲基苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
338	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(1-吡咯基)苯基	H	m.p. 109-110°C
339	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-(1-吡咯基)苯基	H	粘性液体
340	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-乙氧基苯基	H	m.p. 134-135°C
341	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-乙氧基苯基	H	粘性液体
342	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-乙氧基-3-甲氧基 苯基	H	m.p. 140-141°C
343	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-乙氧基-3-甲氧基 苯基	H	粘性液体
344	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-异丙氧基苯基	H	m.p. 83-85°C
345	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-异丙氧基苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
346	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-(二氟亚甲基 二氧基)苯基	H	-
347	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-(二氟亚甲基 二氧基)苯基	H	-
348	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	3-(3-氯-5-三氟甲 基-2-吡啶氧基)苯基	H	m.p. 121-123°C
349	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-	3-(3-氯-5'-三氟甲 基-2-吡啶氧基)苯基	H	粘性液体
350	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,3-二氢-5-苯并噻 吩基	H	-
351	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	2,3-二氢-5-苯并噻 吩基	H	-
352	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氯-4-甲氧基苯基	H	m.p. 170-173°C
353	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-氯-4-甲氧基苯基	H	粘性液体

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
354	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-(二氯亚甲基 二氧基)苯基	H	-
355	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-(二氯亚甲基 二氧基)苯基	H	-
356	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-(二甲基亚甲 基二氧基)苯基	H	m.p. 119-121°C
357	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-(二甲基亚甲 基二氧基)苯基	H	粘性液体
358	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-(甲氧基亚甲 基二氧基)苯基	H	-
359	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-(甲氧基亚甲 基二氧基)苯基	H	-
360	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲基-2-氯代-2, 3-二氢[1,3]苯 并噁唑-5-基	H	-
361	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3-甲基-2-氧代-2, 3-二氢[1,3]苯 并噁唑-5-基	H	-

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
362	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲基-3-氧代-2,3-二氢[1,4]苯并噁唞-6-基	H	-
363	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲基-3-氧代-2,3-二氢[1,4]苯并噁唞-6-基	H	-
364	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲基-3-氧代-2,3-二氢[1,4]苯并噁唞-6-基	H	-
365	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲基-3-氧代-2,3-二氢[1,4]苯并噁唞-6-基	H	-
366	-CH ₃	-CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-甲基-3-氧代-2,3-二氢[1,4]苯并噁唞-6-基	H	粘性液体
367	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯甲酰基	H	粘性液体
368	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	苯甲酰基	H	粘性液体
369	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-(甲基亚硫酸基)苯基	H	m.p. 120-122°C

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
370	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-(甲基亚硫酸基)苯基	H	粘性液体
371	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-(甲基硫酸基)苯基	H	m.p. 138-141°C
372	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	4-(甲基硫酸基)苯基	H	粘性液体
373	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4,5-三甲氧基苯基	H	粘性液体
374	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4,5-三甲氧基苯基	H	粘性液体
375	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	5-(2,3-二氢化茚基)	H	粘性液体
376	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-	2,4-二氯苯基	H	粘性液体
377	-CH ₃	H	-CH ₂ O-	2,4-二甲苯基	H	-
378	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-	2,4-二甲苯基	H	-

表2 (续)

化合物编号	R ¹	R ²	Z	R ³	A	物理性质
379	-CH ₃	H	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-二甲苯基	II	m.p. 112-114°C
380	-CH ₃	-CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ O-N=C- CH ₃	3,4-二甲苯基	II	粘性液体

在表 2 中, Z 右边的连字号代表向着 R^3 的键。

化合物 No. 4 的 ^1H-NMR 数据 (在 $CDCl_3$ 中): 3.27 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 7.13-7.62 (m, 4H), 7.73 (d, 1H), 8.60 (d, 1H)

化合物 No. 11 的 ^1H-NMR 数据 (在 $CDCl_3$ 中): 2.25 (t, 1H), 3.67 (s, 3H), 4.28 (d, 2H), 4.45 (s, 2H), 7.13-7.60 (m, 4H), 7.68 (d, 1H), 8.58 (d, 1H)

化合物 No. 20 的 ^1H-NMR 数据 (在 $CDCl_3$ 中): 3.40 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 4.58 (dd, 2H), 7.17-7.57 (m, 4H), 7.93 (d, 1H), 8.73 (d, 1H)

化合物 No. 21 的 ^1H-NMR 数据 (在 $CDCl_3$ 中): 2.23 (t, 1H), 3.70 (s, 3H), 4.38 (ddd, 2H), 4.53 (s, 2H), 7.18-7.63 (m, 4H), 8.00 (d, 1H), 8.80 (d, 1H)

化合物 No. 27 的 ^1H-NMR 数据 (在 $CDCl_3$ 中): 3.42 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.33 (s, 2H), 4.90 (dd, 2H), 7.10-7.50 (m, 4H), 7.43 (d, 1H), 8.20 (d, 1H)

化合物 No. 40 的 ^1H-NMR 数据 (在 $CDCl_3$ 中): 3.43 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 4.58 (s, 2H), 4.95 (dd, 2H), 7.07-7.88 (m, 8H)

化合物No. 44的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):

3.37 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 4.12 (s, 2H), 4.80 (dd, 2H), 6.97-7.37 (m, 8H)

化合物No. 53的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):

3.40 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 4.93 (dd, 2H), 6.85-7.77 (m, 10H)

化合物No. 63的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):

3.42 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.57 (s, 2H), 4.98 (dd, 2H), 7.07-7.62 (m, 7H)

化合物No. 67的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):

3.75 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 4.52 (dd, 2H), 7.23-7.67 (m, 4H), 7.75 (d, 1H), 8.60 (d, 1H)

化合物No. 92的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):

2.18 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 4.80 (dd, 2H), 7.17-7.67 (m, 4H), 7.75 (dd, 1H), 8.60 (dd, 1H)

化合物No. 132的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):

2.20 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 4.93 (dd, 2H), 5.16 (s, 2H), 7.20-7.67 (m, 9H)

化合物No. 159的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):

2.33 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.70 (s, 3H)

H), 4.98 (dd, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.26
- 7.90 (m, 6H), 8.50 (d, 2H)

化合物No. 193的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):
2.23 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 5.00 (dd, 2H), 5.17
(s, 2H), 7.10-7.50 (m, 8H)

化合物No. 202的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):
2.27 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 5.00 (dd, 2H), 5.27 (s, 2H), 7.16
- 8.07 (m, 6H), 8.90 (d, 1H)

化合物No. 217的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):
2.23 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.03 (dd, 2H), 5.20
(s, 2H), 6.77-7.63 (m, 8H)

化合物No. 224的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):
2.20 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 5.00 (dd, 2H), 5.17 (s, 2H), 5.97
(s, 2H), 6.73-7.60 (m, 7H)

化合物No. 227的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):
2.17 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 4.17 (s, 4H), 4.93 (dd, 2H), 5.10
(s, 2H), 6.67-7.53 (m, 7H)

化合物No. 240的 ^1H -NMR数据(在 CDCl_3 中):
2.33 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.67 (s, 3

H), 5.00 (dd, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.23
- 7.90 (m, 7H), 8.50 (d, 1H)

化合物No. 321的 ^1H -NMR数据 (在 CDCl_3 中):
1.13 (t, 3H), 2.20 (s, 3H), 3.05-3.88
(5H), 5.10 (s, 2H), 7.00-7.73 (m, 9H)

化合物No. 323的 ^1H -NMR数据 (在 CDCl_3 中):
1.18 (t, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.50-3.90
(5H), 5.13 (s, 2H), 5.93 (s, 2H), 6.68
- 7.62 (m, 7H)

化合物No. 328的 ^1H -NMR数据 (在 CDCl_3 中):
2.36 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 3.73 (s, 3
H), 5.05 (dd, 2H), 5.30 (s, 2H), 7.27
- 8.13 (m, 6H), 8.80-8.87 (m, 1H)

化合物No. 332的 ^1H -NMR数据 (在 CDCl_3 中):
1.90-2.23 (5H), 2.80-3.03 (t, 4H),
3.46 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 5.00 (dd,
2H), 5.18 (s, 2H), 7.10-7.60 (m, 7H)

化合物No. 335的 ^1H -NMR数据 (在 CDCl_3 中):
2.20 (s, 3H), 3.17 (t, 2H), 3.43 (s, 3
H), 3.67 (s, 3H), 4.53 (t, 3H), 5.00
(dd, 2H), 5.10 (s, 2H), 6.65 (d, 1H),
7.20-7.50 (m, 6H)

化合物No. 337的 ^1H -NMR数据 (在 CDCl_3 中):
2.20 (s, 6H), 3.43 (s, 3H), 3.67 (s, 3

H), 3.80 (s, 3H), 5.00 (dd, 2H), 5.13 (s, 2H), 6.73 (d, 2H), 7.23-7.53 (m, 6H)

化合物 No. 343 的 $^1\text{H-NMR}$ 数据 (在 CDCl_3 中):
1.44 (t, 3H), 2.24 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 4.10 (q, 2H), 5.50 (dd, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.70-7.60 (m, 6H)

化合物 No. 345 的 $^1\text{H-NMR}$ 数据 (在 CDCl_3 中):
1.30 (d, 6H), 2.19 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.20-5.00 (m, 3H), 5.12 (s, 2H), 6.73-7.60 (m, 8H)

现在要介绍测试本发明的化合物作为农业和园艺杀菌剂的试验实施例。除非另有规定,性能的评价按照下面的等级。

[评价标准]

依据观测的日子里在试验植物上疾病突然蔓延的程度,给出下面五个等级作为防治指数,来目测防治效果:

等级

疾病突然蔓延的程度

- 5 完全没有见到损害。
- 4 该地区损害的数目或持续时间小于未处置地块的 10%。
- 3 该地区损害的数目或持续时间小于未处置地块的 40%。
- 2 该地区损害的数目或持续时间小于未处置地块的 70%。
- 1 该地区损害的数目或持续时间是未处置地块的 70%或更大。

试验实施例 1 [试验对黄瓜白粉病的预防效果]

在直径 7.5 cm 的聚乙烯盆中栽培黄瓜（栽培者：Suyo）。当黄瓜生长到单叶阶段，用一个喷雾器，用 10 ml 有预定活性组分浓度的溶液喷洒黄瓜。把盆保持在 22 - 24 °C 的恒温室约 24 小时之后，用粉菌（*Sphaerotheca fuliginea*）的霉菌分生孢子给黄瓜散粉接种。接种之后的第七天 - 第十三天，按照上述的评价标准，观测第一片叶子上损害的区域，找出防治指数的等级。试验结果如下：

等级 化合物 No. (活性组分：500 ppm)

5	1, 11, 19, 26, 32, 46, 52, 56, 57, 94, 95, 103, 107, 109, 110, 111, 114, 116, 119, 120, 121, 122, 123, 128, 129, 131, 133, 134, 137, 138, 139, 141, 142, 143, 147, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 156, 158, 160, 163, 165, 172, 177, 187, 188, 189, 190, 191, 192, 194, 198, 200, 201, 203, 204, 206, 208, 212, 215, 216, 217, 219, 225, 228, 230, 235, 237, 239, 240, 243, 244, 245, 247, 248, 250, 251, 252, 261, 282, 320, 322, 327, 328, 330, 344, 345
4	2, 5, 41, 45, 99, 105, 108, 130, 132, 140, 148, 157, 159, 168, 169, 193, 197, 199, 202, 205, 207, 226, 229, 236, 249, 264, 281, 289, 290, 323, 325, 326, 329, 341

当溶液的活性组分的浓度是 250 ppm 时，化合物 No. 214 和 218 的防治指数的等级都是 5，化合物 No. 343 的防治指数的等级是 4。

试验实施例 2 [试验对黄瓜炭疽病的预防效果]

在直径 7 . 5 cm 的聚乙烯盆中栽培黄瓜 (栽培者: Suyo)。当黄瓜生长到二片叶阶段, 用喷雾器, 用 1 0 ml 有预定活性组分浓度的溶液喷洒黄瓜。盆保持在 2 2 - 2 4 °C 的恒温室中约 2 4 小时, 之后, 用炭疽病 (Collectotrichum lagenarium) 菌的孢子悬浮液喷洒接种。接种之后的第 5 - 第 9 天, 按照上述的评价标准, 测定第一片叶子上损害的区域, 找出防治指数的等级。试验结果如下:

等级	化合物 No. (活性组分: 5 0 0 p p m)
5	4, 5, 7, 9, 27, 52, 53, 56, 109
4	3, 8, 11, 145, 289

当溶液的活性组分的浓度是 2 5 0 p p m 时, 化合物 No. 5 7 的防治指数的等级是 5。

试验实施例 3 [试验对黄瓜霜霉病的预防效果]

在直径为 7 . 5 cm 的聚乙烯盆中栽培黄瓜 (栽培者: Suyo)。当黄瓜长到两片叶阶段, 用喷雾器将 1 0 ml 有预定活性组分浓度的溶液喷洒黄瓜。把盆保持在 2 2 - 2 4 °C 的恒温室中约 2 4 - 4 8 小时, 之后, 用霜霉病菌 (Pseudoperonospora cubensis) 的孢子悬浮液喷洒接种到黄瓜上。接种后第 4 - 第 8 天, 按照上述的评价标准, 观测第一片叶上损害的区域, 找出防治指数的等级, 结果如下:

等级	化合物 No. (活性组分: 5 0 0 p p m)
5	1, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 26, 27, 33, 34, 35, 37, 39, 40, 41, 42, 43, 46, 47, 49, 50, 51, 93, 95, 98, 101, 113, 124, 131, 134, 137, 161, 162, 170, 198, 201, 209, 220, 221, 226, 234, 247, 258, 327

4 2, 24, 32, 44, 45, 48, 54, 97, 99, 102, 104, 171, 193,
224

当溶液的活性组分的浓度是 2 5 0 p p m 时，化合物 No. 200 的防治指数的等级是 4。

试验实施例 4 [试验对稻瘟病的预防效果]

在直径 7 . 5 cm 的聚乙烯盆中栽培稻植物 (栽培者: Koshihikari)。当稻苗长到 4 个叶阶段，用喷雾器将 2 0 ml 有预定活性组分浓度的溶液喷洒稻苗。将盆保持在 2 2 - 2 4 °C 的恒温室中约 8 - 2 4 小时，之后，用稻瘟菌 (*Pyricularia oryzae*) 的孢子悬浮液喷洒接种稻苗。接种后第 4 - 第 8 天，按照上述的评价标准，观测损害的数目，找出防治指数的等级，其结果如下：

等级	化合物 No. (活性组分: 5 0 0 p p m)
5	2, 3, 11, 14, 15, 20, 23, 48, 49, 57, 58, 92, 120, 139, 162, 166, 196, 205, 224, 225, 227, 230, 257, 261, 276, 282, 284, 290, 321, 322, 329, 338, 339, 352
4	1, 5, 6, 9, 21, 25, 28, 29, 36, 45, 46, 50, 51, 54, 67, 132, 135, 136, 138, 141, 142, 143, 153, 159, 164, 167, 170, 171, 172, 176, 177, 192, 211, 212, 217, 221, 228, 229, 235, 236, 238, 244, 248, 274, 332, 333, 335, 337

当溶液的活性组分的浓度是 2 5 0 p p m 时，化合物 No. 4 0 和 7 的防治指数等级分别为 5 和 4。

试验实施例 5 [试验对稻瘟病的防治效果]

在直径为 7.5 cm 的聚乙烯盆中栽培稻植物（栽培者：Koshihikari）。当稻苗长到 4 片叶阶段，用稻瘟病菌（*Pyricularia oryzae*）的孢子悬浮液喷洒接种稻苗。将盆保持在 22 – 24 °C 的恒温室中约 24 小时，之后，用喷雾器将 20 ml 含有化合物 No. 3（活性组分）浓度为 500 ppm 的溶液喷洒稻苗。接种后的第 5 天，按照上述的评价标准，观测损害的数目，找出防治指数的等级为 4。

试验实施例 6 [试验对燕麦冠锈病的预防效果]

在直径为 7.5 cm 的聚乙烯盆中栽培燕麦（栽培者：Zenshin）。当燕麦长到 2 片叶阶段，用喷雾器，用 20 ml 有预定活性组分浓度的溶液喷洒燕麦苗。将盆保持在 22 – 24 °C 的恒温室中约 8 – 24 小时，之后，将燕麦用冠锈病（*Puccinia coronata*）菌的分生孢子散粉接种。接种后的第 9 – 第 15 天，按照上述的评价标准，观测第二片叶上的损害区域，找出防治指数的等级，结果如下：

等级	化合物 No. (活性组分: 500 ppm)
5	2, 3, 4, 5, 7, 11, 28, 44, 51, 53, 57, 67, 94, 101, 103, 105, 107, 108, 111, 114, 116, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 132, 133, 136, 138, 150, 151, 153, 154, 159, 160, 166, 167, 187, 188, 190, 194, 196, 197, 204, 206, 215, 217, 219, 220, 223, 224, 251, 252, 276, 290, 321, 323, 326, 339
4	27, 29, 37, 40, 52, 56, 110, 115, 117, 124, 129, 135, 148, 157, 163, 165, 176, 199, 205, 208, 211, 216, 218, 238, 240, 244, 248, 250, 320,

328, 330, 341, 343, 345

当溶液的活性组分的浓度是 2 5 0 p p m 时, 化合物 No. 113 和 2 1 4 的防治指数的等级都是 5。

试验实施例 7 [试验对番茄晚疫病的预防效果]

在直径为 7.5 cm 的聚乙烯盆中栽培番茄(栽培者: Ponderosa)。当番茄长到 4 片叶阶段, 用喷雾器, 用 1 0 ml 有预定活性组分浓度的溶液喷洒番茄苗。将盆保持在 2 2 - 2 4 °C 的恒温室中约 8 - 2 4 小时, 之后, 用晚疫病菌 (*Phytophthora infestans*) 的游动孢子囊悬浮液喷洒接种。接种后的第 3 - 第 5 天, 按照上述的评价标准, 观测损害的区域, 找出防治指数等级, 结果如下:

等级	化合物 No. (活性组分: 5 0 0 p p m)
5	1, 4, 11, 37, 39, 52, 53, 57, 63, 168, 191, 193, 246, 284
4	3, 5, 7, 8, 14, 40, 45, 61, 67, 152, 203, 352

当溶液的活性组分的浓度为 1 2 5 p p m 时, 化合物 No. 5 1 的防治指数等级为 4。

试验实施例 8 [试验对黄瓜花腐病的预防效果]

在直径为 7.5 cm 的聚乙烯盆中栽培黄瓜(栽培者: Suyo)。当黄瓜长到 2 片叶阶段, 用喷雾器, 用 1 0 ml 有预定活性组分浓度的溶液喷洒黄瓜。将盆保持在 2 2 - 2 4 °C 的恒温室中约 2 4 小时, 之后, 用苯菌灵和二羧酰亚胺敏感的花腐病 (*Botrytis cinerea*) 菌在土豆葡萄制剂中的孢子悬浮液接种第一个叶片。接种后第 3 天, 按照上述的评价标准, 观测损害的持续时间, 找出防治指数等级, 结果如

下：

等级	化合物 No. (活性组分：500 ppm)
4	1, 57, 103, 132

试验实施例 9 [试验对稻叶鞘枯萎病的预防效果]

在直径为 7.5 cm 的聚乙烯盆中栽培稻植物 (栽培者：Koshihikari)。当稻苗长到 5 片叶阶段，用喷雾器，用 20 ml 含有浓度为 500 ppm 化合物 349 (活性组分) 的溶液喷洒稻苗。将盆保持在 22 - 24 °C 的恒温室中约 24 小时，之后，通过把其中已预先培育叶鞘枯萎病 (*Rhizoctonia solani*) 菌的稻草放在稻苗的叶鞘中的方法接种稻苗。把盆保持在 28 °C，湿度 100 % 的培育室中 5 天，然后，按照上述的评价标准，观测损害的持续时间，找出防治指数等级为 4。

虽然已经详细地介绍了本发明及其有关特定的实施方案，但是很显然，本专业的熟练技术人员可以做出各种变化和改进而不脱离本发明的精神和范围。