

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl<sup>7</sup>

C07C317/28



# [12] 发明专利说明书

C07C323/48 C07C251/86

C07C323/60 C07D213/61

A01N 33/26 A01N 35/04

A01N 35/10 A01N 37/28

A01N 41/06 A01N 41/10

A01N 43/36 A01N 43/40

[21] ZL 专利号 96190356.2

[45] 授权公告日 2003 年 10 月 15 日

[11] 授权公告号 CN 1124259C

[22] 申请日 1996. 4. 18 [21] 申请号 96190356. 2

[30] 优先权

[32] 1995. 4. 19 [33] JP [31] 117838/1995

[86] 国际申请 PCT/JP96/01055 1996. 4. 18

[87] 国际公布 WO96/33168 英 1996. 10. 24

[85] 进入国家阶段日期 1996. 12. 17

[71] 专利权人 组合化学工业株式会社

地址 日本东京都

共同专利权人 庵原化学工业株式会社

[72] 发明人 鸟谷部启二 佐佐木秀治 益山直

永井昭英 矢野祐幸 川岛三枝子

栗原浩 嶋津朋德

[56] 参考文献

EP - A - 0355832 1990. 02. 28

EP - A - 0566534 1993. 10. 20

EP - A - 0581725 1994. 02. 02

EP - A - 0662472 1995. 07. 12

审查员 陈 矛

[74] 专利代理机构 上海专利商标事务所

代理人 林蕴和

A01N 43/653 A01N 47/02

A01N 47/24 A01N 47/34

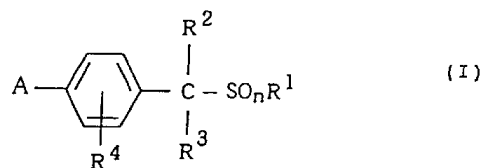
A01N 51/00

权利要求书 4 页 说明书 94 页

[54] 发明名称 苄硫化物衍生物及其制造方法和以此制造农药的方法

[57] 摘要

本发明提供了一种通式(I)的苄硫化物衍生物或其盐: 其中 R<sup>1</sup> 是 C<sub>1-6</sub> 烷基, C<sub>1-6</sub> 卤代烷基、C<sub>2-4</sub> 链烯基、氰基等, R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> 各是氢原子、卤原子、氰基、C<sub>1-4</sub> 烷基、C<sub>1-3</sub> 卤代烷基等, R<sup>4</sup> 是氢原子、卤原子、C<sub>1-4</sub> 烷基等, A 是胍芳烷基或腺芳烷基, n 是 0、1 或 2; 制备这类苄硫化物衍生物或其盐的方法; 和以苄硫化物衍生物作为活性组分的农药。本发明的苄硫化物衍生物能够防治各种害虫而对庄稼无副作用。

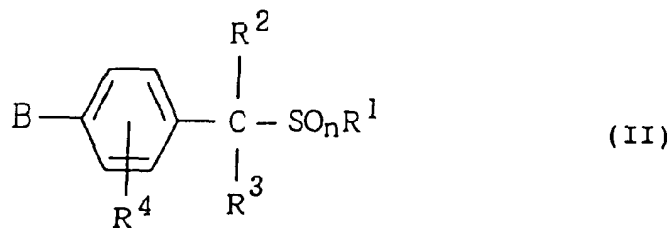


ISSN 1008-4274

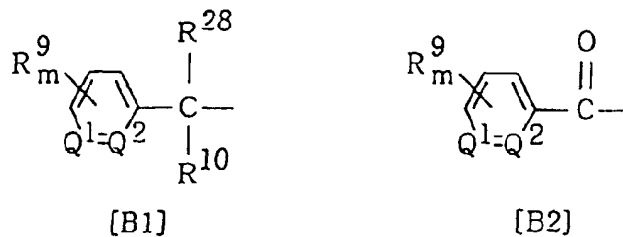


- 氧基取代的苯基、可被卤原子或 C<sub>1-4</sub> 烷基取代的萘基或一个杂原子芳环基；R<sup>15</sup> 是 C<sub>1-20</sub> 烷基、C<sub>2-8</sub> 卤代烷基、C<sub>2-12</sub> 烷氧基烷基、或可被卤原子取代的苯基；R<sup>16</sup> 是氢原子或 C<sub>1-4</sub> 烷基；R<sup>17</sup> 是氢原子、可被卤原子、C<sub>1-4</sub> 卤代烷氧基或 C<sub>1-4</sub> 烷基取代的 C<sub>1-6</sub> 烷基或苯基；R<sup>20</sup> 是一个 C<sub>1-4</sub> 烷基或 C<sub>1-4</sub> 卤代烷基；R<sup>21</sup> 是氢原子或 C<sub>1-6</sub> 烷基；R<sup>22</sup> 是 C<sub>2-4</sub> 酰基或 C<sub>2-6</sub> 烷氧羰基；R<sup>23</sup> 和 R<sup>24</sup> 彼此独立，R<sup>23</sup> 和 R<sup>24</sup> 各是氢原子、卤原子、C<sub>1-6</sub> 烷基或通式为 -N(R<sup>25</sup>)R<sup>26</sup> 的基团；R<sup>25</sup> 和 R<sup>26</sup> 彼此独立，R<sup>25</sup> 和 R<sup>26</sup> 各是氢原子、C<sub>1-4</sub> 烷基、C<sub>1-4</sub> 烷氧基；或 R<sup>25</sup> 和 R<sup>26</sup> 与氮原子形成一个 R<sup>25</sup> 和 R<sup>26</sup> 连接在氮原子上的五或六元环；Q<sup>1</sup> 和 Q<sup>2</sup> 各是氮原子或通式为 -CR<sup>9</sup> 的基团；m 是 1~3 的整数；n 为 0, 1 或 2。

- 10 2. 一种通式(II)的苄硫化物衍生物，



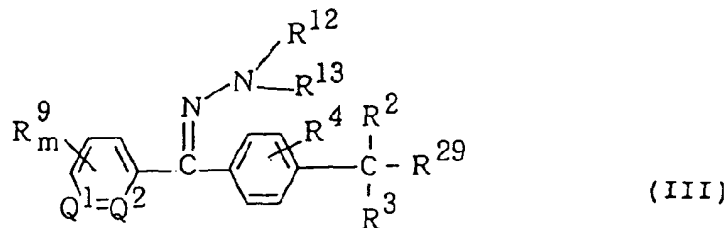
其特征在于 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 n 按权利要求 1 定义；B 是(B1)或(B2)的芳烃基或芳基羰基基团，



15

其中 R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、m、Q<sup>1</sup> 和 Q<sup>2</sup> 按权利要求 1 定义，R<sup>28</sup> 是卤原子或羟基。

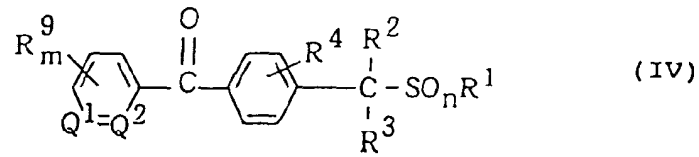
3. 一种通式(III)的二苯酮脒衍生物，



20 其特征在于 R<sup>4</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、m、Q<sup>1</sup> 和 Q<sup>2</sup> 按权利要求 1 定义；R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> 彼此独立，R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> 各是氢原子或 C<sub>1-4</sub> 烷基，R<sup>29</sup> 是卤原子、巯基或羟基。

4. 一种制备苄硫化物衍生物的方法，苄硫化物衍生物中 A 是按权利要求 1

定义的通式(A2)的基团,其特征在于该方法为将通式(IV)的一种化合物与通式(V1)的一种化合物反应,



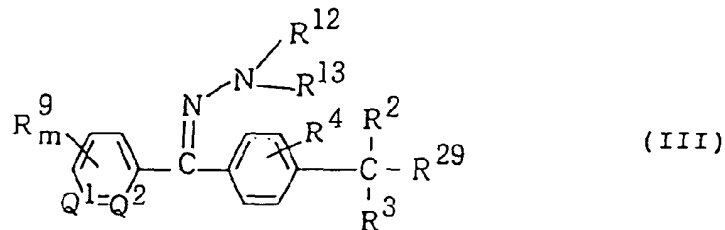
通式 IV 中  $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^9$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $\text{Q}^1$  和  $\text{Q}^2$  按权利要求 1 定义,



5

通式(V1)中  $\text{R}^{12}$  和  $\text{R}^{13}$  按权利要求 1 定义。

5. 一种制备苄硫化物衍生物的方法,苄硫化物衍生物中 A 是按权利要求 1 定义的通式(A2)的基团,其特征在于该方法为将通式(III)的化合物与通式(V2)的化合物反应,



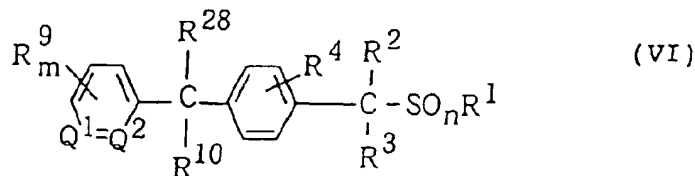
10

通式(III)中  $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^9$ 、 $\text{R}^{12}$ 、 $\text{R}^{13}$ 、 $\text{R}^{29}$ 、 $m$ 、 $\text{Q}^1$  和  $\text{Q}^2$  按权利要求 3 定义,通式(V2)中:

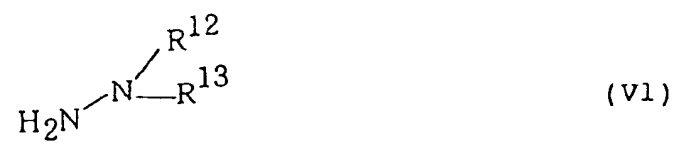


其中当  $\text{R}^{29}$  是巯基或通式 $-\text{S}(\text{O})_n\text{M}$ 的基团时,当  $\text{R}^{29}$  是卤原子或通式为 $-\text{SSR}^1$ 的基团时,当  $\text{R}^{29}$  是羟基时 Z 是卤原子、可被甲基取代的  $\text{C}_{1-4}$  烷基磺酰基或苯磺酰氧基。 $\text{R}^1$  是  $\text{C}_{1-6}$  烷基、 $\text{C}_{1-4}$  氰烷基、 $\text{C}_{3-6}$  环烷基、 $\text{C}_{1-6}$  卤代烷基、 $\text{C}_{2-4}$  链烯基或可被卤原子取代的苄基; M 是碱金属; n 是 0 或 2。

6. 一种制备苄硫化物衍生物的方法,苄硫化物衍生物中 A 是按权利要求 1 定义的通式(A1)基团,其特征在于该方法为将通式(VI)的化合物与通式(V1)的化合物反应,



通式(VI)中  $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^9$ 、 $\text{R}^{10}$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $\text{Q}^1$  和  $\text{Q}^2$  按权利要求 1 定义,  $\text{R}^{28}$  是卤原子,



通式(V1)中 R<sup>12</sup> 和 R<sup>13</sup> 按权利要求 1 定义。

7. 一种含有权利要求 1 定义的苯硫化物衍生物的农药, 其特征在于它以苯硫化物衍生物作为一种活性组分。

5

苜硫化物衍生物及其制造方法  
和以此制造农药的方法

5

技术领域

本发明涉及一种新颖的苜硫化物衍生物及其制备方法和以此作为活性组分的农药的制备方法。

## 10 发明背景

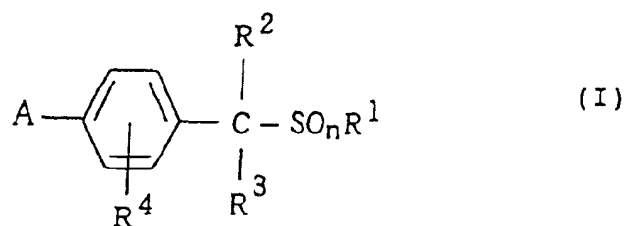
据报告，在如美国专利 3,732,307 和日本未审查专利公报 122261/1979 和 45452/1981 中，提到以苜并脞二苜硫化物衍生物作为杀虫剂。然而从未有本发明的苜硫化物衍生物的报道。

近几年，一些普通的杀虫剂由于其残效，积累或环境问题而受到限制，还有一些由于长期使用使害虫产生抗药性而无效。因此，需要研制新颖、高效、低成本和安全的杀虫剂。

本发明合成了各种苜硫化物衍生物，研究了其生理活性。由此发现本发明的化合物对各种害虫具有极好的杀虫效果，特别对农作物和园林害虫有效。这些害虫有小菜娥 (*Plutella xylostella*)，二化螟(*Chio suppressalis*) 和甜菜娥 (*Spodoptera exigua*)，代表性的半翅目害虫有：稻褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)，稻大白叶蝉(*Nephotetlix cincticeps*)以及棉蚜(*Aphis gossypii*)而代表性的鞘翅目害虫有：绿豆象(*Callosobrunchus chinensis*)。本发明已基本完成此发现。

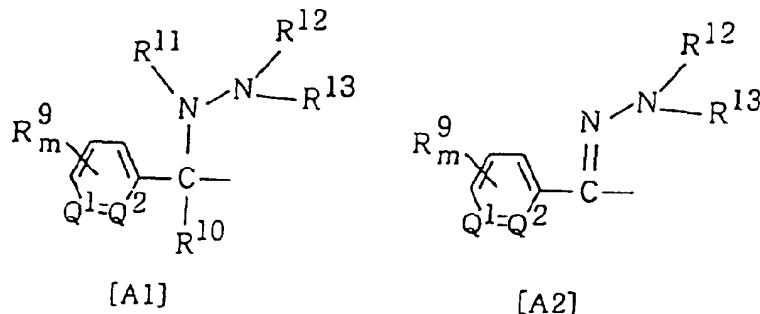
发明描述

25 本发明提供(1)一种具有式(I)的苜硫化物衍生物或其盐：



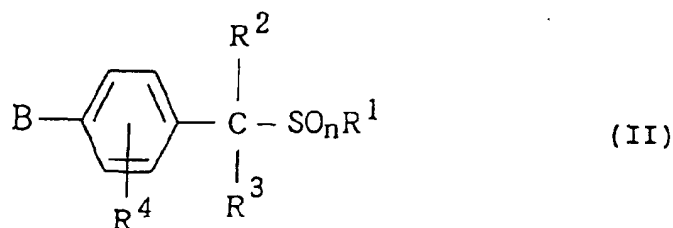
30 其中 R<sup>1</sup> 是一个 C<sub>1-6</sub> 烷基、C<sub>1-4</sub> 氰烷基、C<sub>1-4</sub> 羟烷基、C<sub>3-6</sub> 环烷基、C<sub>1-6</sub> 卤代烷基、C<sub>2-4</sub> 链烯基、C<sub>2-4</sub> 炔基、苯基（可被卤族原子或 C<sub>1-4</sub> 烷基取代）、氰基、苜基(可被卤原子取代)、噻唑基、C<sub>1-4</sub> 烷基氨基甲酰基或通式为 -N(R<sup>5</sup>)R<sup>6</sup> 的基团；R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> 彼此独立、R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> 各是氢原子、卤原子、氰基、C<sub>1-4</sub> 烷基、C<sub>1-3</sub> 卤代烷

基、 $C_{1-4}$ 硫代烷基、 $C_{1-4}$ 烷基羰基、羧基或 $C_{1-4}$ 烷氧羰基；或 $R^2$ 和 $R^3$ 与碳原子形成一个 $R^2$ 和 $R^3$ 连接碳原子上的三到六元环；或 $R^1$ 和 $R^2$ 与硫原子和碳原子形成一个 $R^1$ 和 $R^2$ 分别连接在硫原子和碳原子上的含有一个或多个杂原子的三~八元环； $R^4$ 是氢原子、卤原子、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基或 $C_{1-4}$ 卤代烷氧基； $R^5$ 和 $R^6$ 彼此独立， $R^5$ 和 $R^6$ 各是氢原子、 $C_{1-6}$ 烷基或 $C_{1-4}$ 卤代烷基；或 $R^5$ 和 $R^6$ 形成通式 $=CR^7R^8$ 的基团；或 $R^5$ 和 $R^6$ 与氮原子形成一个 $R^5$ 和 $R^6$ 连接在氮原子上的含一个或多个杂原子的四~八元环； $R^7$ 是氢原子、 $C_{1-3}$ 烷基或 $C_{1-3}$ 烷硫基， $R^8$ 是 $C_{1-3}$ 烷硫基或 $C_{1-3}$ 烷基氨基；或 $R^7$ 和 $R^8$ 与碳原子形成一个其连接在碳原子上的饱和或不饱和的四~八元环；A是通式(A1)或(A2)的胍基芳烷基或亚胍基芳烷基；

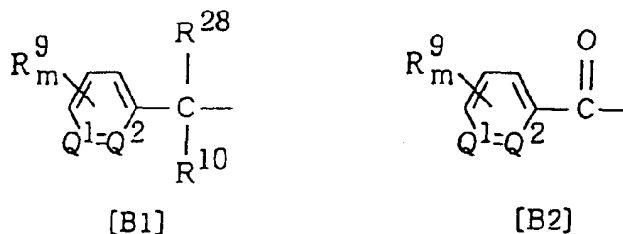


$R^9$ 是氢原子、卤原子、硝基、氰基、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-4}$ 卤代烷氧基、 $C_{1-4}$ 硫代烷基、 $C_{1-4}$ 硫代卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷基磺酰基、 $C_{2-4}$ 烷基磺酰基甲基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基磺酰氧基、苯基(可被一个卤原子取代)或苯氧基(可被一个卤原子取代)；或两个 $R^9$ 形成一个五或六元环； $R^{10}$ 是氢原子或 $C_{1-4}$ 烷基； $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 彼此独立， $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 各是氢原子、氰基、 $C_{1-6}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、 $C_{2-10}$ 烷氧基烷基、 $C_{3-8}$ 烷氧基烷氧基烷基、 $C_{2-6}$ 硫代烷基烷基、 $C_{2-6}$ 链烯基、 $C_{2-4}$ 炔基、 $C_{1-4}$ 氰烷基、苄基(可被一个卤原子、 $C_{1-4}$ 卤代烷基或 $C_{1-4}$ 烷基取代)、通式 $-COR^{14}$ 的基团、通式 $-CSR^{14}$ 的基团、通式 $-COOR^{15}$ 的基团、通式 $-COSR^{15}$ 的基团、通式 $-CON(R^{16})R^{17}$ 的基团、通式 $-CSN(R^{16})R^{17}$ 的基团、通式 $-SN(R^{18})R^{19}$ 的基团、通式 $-SO_2R^{20}$ 或 $-C(R^{21})=CHR^{22}$ 的基团；或 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 形成一个通式为 $=CR^{23}R^{24}$ 的基团；或 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 与氮原子形成一个 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 连接在氮原子上的含有一个或多个杂原子的四~八元环； $R^{14}$ 是氢原子、 $C_{1-20}$ 烷基、 $C_{1-8}$ 卤代烷基、 $C_{2-12}$ 烷氧基烷基、 $C_{2-10}$ 卤代烷氧基烷基、 $C_{3-16}$ 烷氧基烷氧基烷基、 $C_{4-22}$ 烷氧基烷氧基烷氧基烷基、 $C_{2-6}$ 烷硫基烷基、 $C_{3-6}$ 氰烷基、 $C_{1-6}$ 羟烷基、 $C_{1-6}$ 氨基烷基、 $C_{1-6}$ 酰胺基烷基、 $C_{1-8}$ 氰烷基、 $C_{3-12}$ 烷氧基羰基烷基、 $C_{2-6}$ 链烯基、 $C_{2-4}$ 炔基、苯基(可被一个卤原子、硝基、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、苯氧基或

- $C_{1-4}$  烷氧基取代), 萘基(可被卤原子或  $C_{1-4}$  烷基取代)或杂原子芳环基(可被卤原子或  $C_{1-4}$  烷基取代);  $R^{15}$  是  $C_{1-20}$  烷基、 $C_{2-8}$  卤代烷基、 $C_{2-12}$  烷氧基烷基、 $C_{2-6}$  链烯基、 $C_{2-4}$  炔基、苄基(可被卤族原子、 $C_{1-4}$  烷氧基或  $C_{1-4}$  烷基取代)或苯基(可被卤原子取代);  $R^{16}$  是氢原子或  $C_{1-4}$  烷基;  $R^{17}$  是氢原子、 $C_{1-6}$  烷基或苯基(可被一个卤原子、卤代烷氧基或  $C_{1-4}$  烷基取代);  $R^{18}$  和  $R^{19}$  彼此独立,  $R^{18}$  和  $R^{19}$  各是  $C_{1-4}$  烷基(可被  $C_{1-4}$  烷氧基取代), 或  $C_{2-5}$  烷氧基烷基; 或  $R^{18}$  和  $R^{19}$  与氮原子形成  $R^{18}$  和  $R^{19}$  连接在氮原子上的 5 或 6 元环;  $R^{20}$  是  $C_{1-4}$  烷基,  $C_{1-4}$  卤代烷基或  $C_{2-4}$  二烷基氨基;  $R^{21}$  是氢原子或  $C_{1-6}$  烷基;  $R^{22}$  是  $C_{2-4}$  酰基或  $C_{2-6}$  烷氧基羰基;  $R^{23}$  和  $R^{24}$  彼此独立,  $R^{23}$  和  $R^{24}$  各是氢原子、卤原子、 $C_{1-6}$  烷基或通式为  $-N(R^{25})R^{26}$  的基团;  $R^{25}$  和  $R^{26}$  彼此独立,  $R^{25}$  和  $R^{26}$  各是氢原子、 $C_{1-4}$  烷基、 $C_{1-4}$  烷氧基、 $C_{2-12}$  烷氧基烷基或通式  $-SO_2R^{27}$  的基团; 或  $R^{25}$  和  $R^{26}$  与氮原子形成一个  $R^{25}$  和  $R^{26}$  连接在氮原子上的五或六元环;  $R^{27}$  是  $C_{1-8}$  烷基或苯基(可被一个卤原子或一个  $C_{1-4}$  烷基取代);  $Q^1$  和  $Q^2$  各是氮原子或通式  $-CR^9$  的基团;  $m$  是 1~3 整数;  $n$  是 0, 1 或 2;
- 15 (2) 通式为(II)的苄硫化物衍生物:

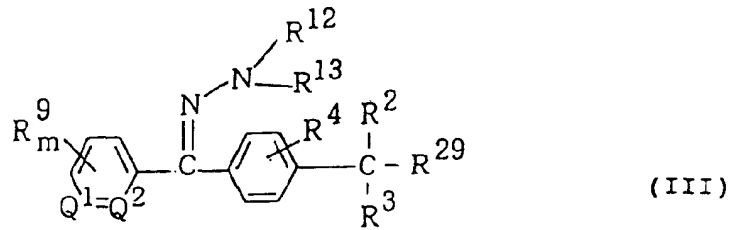


- 20 其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  和  $n$  按权利要求 1 定义;  $B$  是通式[B1]或[B2]的一种芳烷基或芳基羰基:



- 25 其中  $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $m$ 、 $Q^1$  和  $Q^2$  按权利要求 1 定义,  $R^{28}$  是卤原子或羟基;
- (3) 通式(III)的苯并苯酮亚胍基衍生物:

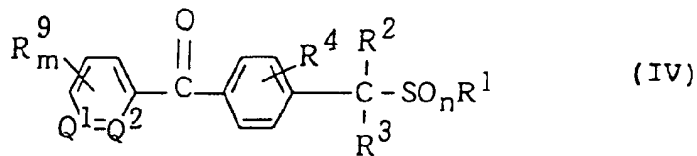




其中  $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $m$ 、 $Q^1$  和  $Q^2$  按权利要求 1 定义； $R^2$  和  $R^3$  彼此独立， $R^2$  和  $R^3$  各是氢原子或  $C_{1-4}$  烷基， $R^{29}$  是卤原子、巯基或羟基；

(4) 一种制备苄硫化物衍生物的方法，其中 A 是按权利要求 1 定义的通式(A2)

5 的基团，这一方法包括通式(IV)的化合物和通式(V1)化合物反应，



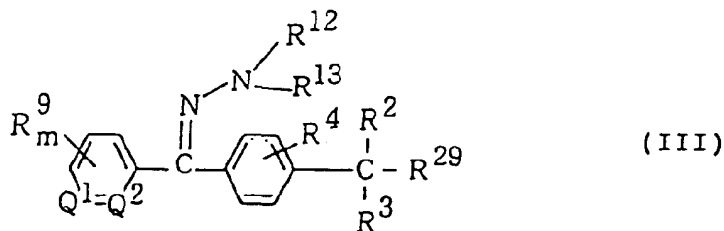
10 通式 IV 化合物的  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^9$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $Q^1$  和  $Q^2$  按权利要求定义，通式 V1 化合物：



其中  $R^{12}$  和  $R^{13}$  按权利要求 1 定义；

(5) 一种制备苄硫化物衍生物的方法，其中 A 是按权利要求 1 定义的通式(A2)

15 的基团，该方法包括通式(III)的化合物与通式(V2)的化合物反应，



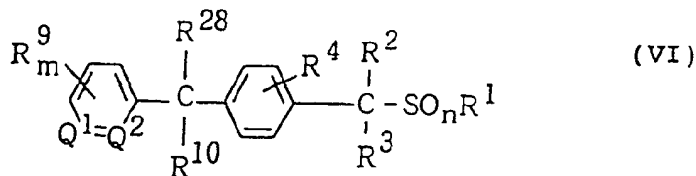
20 通式(III)的化合物的  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{29}$ 、 $m$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$  按权利要求 3 定义，通式(V2)的化合物：



当  $R^{29}$  是巯基或是通式为  $-S(O)_nM$  的基团时，当  $R^{29}$  是卤原子或通式为  $-SSR^1$  的基

团时, 当  $R^{29}$  是羟基时,  $Z$  是一个卤原子、 $C_{1-4}$  烷磺酰基或为苯磺酰氧基(可被甲基取代);  $R^1$  是  $C_{1-6}$  烷基、 $C_{1-4}$  氰烷基、 $C_{3-6}$  环烷基、 $C_{1-6}$  卤烷基、 $C_{2-4}$  链烯基或苄基(可被一个卤原子取代);  $M$  是碱金属,  $n$  是 0 或 2;

- (6) 一种制备苄硫化物衍生物的方法, 其中 A 是按权利要求 1 定义的通式(A1)的基团, 该方法包括通式(VI)的化合物与通式(VI)化合物反应, 通式(VI)化合物



- 其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$  按权利要求 1 定义,  $R^{28}$  是卤原子; 通式(VI) 的化合物,



其中  $R^{12}$  和  $R^{13}$  按权利要求 1 定义; 和

- (7) 一种以权利要求 1 定义的苄硫化物衍生物作为活性组分的农药。

在本发明中, 卤原子为氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。

- 15 烷基指一种直链或支链的  $C_{1-20}$  的烷基, 如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、正戊基、异戊基、新戊基、正己基、异己基、3,3-二甲基丁基、正庚基、正辛基、正壬基或正癸基。

环烷基指一种  $C_{3-6}$  环烷基、如环丙基、环戊基或环己基。

链烯基指直链或支链  $C_{1-6}$  链烯基, 如乙烯基或 2-丙烯基。

- 20 卤代烷基指一种直链或支链的被 1~10 个卤原子取代的  $C_{1-8}$  烷基, 卤原子可以是相同的, 也可以不同, 可以是如氯代甲基、三氟甲基或四氟乙基。

氰烷基是指一种直链或支链的被氰基取代的  $C_{1-8}$  烷基。

羟烷基指一种直链或支链的被羟基取代的  $C_{1-8}$  烷基。

- 25 烷氧基指一种烷一氧基, 其中烷基部分按上定义, 可以是如甲氧基或乙氧基。

卤代烷氧基指卤代烷基一氧一基团, 其中卤代烷基部分按上面的定义, 卤代烷氧基可以是如三氟甲氧基或 2-氯乙氧基。

烷硫基指烷基-S-基团, 其中烷基部分按上面的定义, 烷硫基可以是如甲硫基或乙硫基。

- 30 卤代烷硫基指卤代烷基-S-基团, 其中卤代烷基按上面的定义, 卤代烷硫基

可以是如三氟甲硫基或2-氯乙硫基。

烷基磺酰基指烷基-SO<sub>2</sub>-基团，其中烷基部分按上面的定义，烷基磺酰基可以是如甲磺酰基或乙磺酰基。

5 烷基磺酰基甲基是指烷基-SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-基团，其中烷基部分按上面的定义，烷基磺酰基甲基可以是如甲磺酰基甲基或乙磺酰基甲基。

亚烷基指直链的 C<sub>1-8</sub> 链烯基团，如亚甲基、乙烯基、三亚甲基或四亚甲基。

烷氧基烷基指烷基-O-亚烷基基团，其中烷基和亚烷基部分按上述定义，烷氧基烷基可以是如甲氧基甲基或乙氧基甲基。

10 烷硫基烷基是指烷基-S-亚烷基基团，其中烷基和亚烷基部分按上述定义，烷硫基烷基可以是一个甲硫基甲基或乙硫基甲基。

烷氧基烷氧基烷基指烷基-O-亚烷基-O-亚烷基基团，其中烷基和每一个亚烷基按上述定义。

烷氧基烷氧基烷氧基烷基指一个烷基-O-亚烷基-O-亚烷基-O-亚烷基基团，其中烷和每一个亚烷基按上述定义。

15 氨基烷基指直链或支链的被氨基、单烷基氨基或多烷基氨基取代的 C<sub>1-8</sub> 烷基。

酰胺烷基指一个直链或支链被一个酰胺基或一个N-甲基-N-酰胺基取代的 C<sub>1-8</sub> 烷基。

炔基是指直链 C<sub>1-4</sub> 炔基。

20 杂芳环基指含有一~四个氮、氧或硫原子的五元芳环将其与一个苯环稠合所成的稠环，或含一~三个氮原子所成的六元芳环或将其与一个苯环稠合所成的稠环。杂芳环基可以是如呋喃基、噻吩基、吡啶基、咪唑基、苯并呋喃基、苯并噻唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基、醌基、喹啉基。

25 在本发明的化合物中，盐类是通式(I)的化合物与一种酸形成的盐，或其中 R<sup>2</sup> 或 R<sup>3</sup> 是羧基的通式(I)的化合物与一种金属或一种胺形成的盐。酸可以是如一种氢卤酸如盐酸或氢溴酸，或磺酸如甲磺酸。金属可以是如碱金属类钠或钾，碱土金属类如镁或钙。胺类可以是如氨、异丙胺或三乙胺。

上述通式(I)的一组优选化合物如下，其中：

30 R<sup>1</sup> 是一个 C<sub>1-4</sub> 烷基、C<sub>1-2</sub> 氰烷基、羟乙基、环戊基、C<sub>1-2</sub> 卤代烷基、戊基(可被一个卤原子取代)、氰基、C<sub>1-4</sub> 烷基氨基甲酰基或噻唑基；

R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> 彼此独立，R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> 各是一个氢原子、甲基或 C<sub>1-2</sub> 烷氧基羰基；或 R<sup>1</sup> 和 R<sup>2</sup> 分别可与硫和碳原子相互连接而成五元环；

R<sup>4</sup> 是氢原子或氟原子。

A 是通式(A1)或(A2)的胍基烷基或亚胍基烷基；

35 R<sup>9</sup> 是氢原子、卤原子、硝基、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基、C<sub>1-2</sub> 卤代烷氧基、甲硫基、二氟甲硫基、甲磺酰基、甲磺酰基甲基、三氟甲磺酰基氧基、

苯基、可被卤原子取代的苯氧基或亚甲基二氧基;

$R^{10}$  是氢原子;

$R^{11}$  是氢原子, 通式- $COR^{14}$  的基团或通式- $COOR^{15}$  的基团;

5  $R^{12}$  和  $R^{13}$  彼此独立,  $R^{12}$  和  $R^{13}$  各是氢原子、 $C_{1-4}$  烷基、 $C_{1-4}$  卤代烷基、 $C_{2-10}$  烷氧基烷基、 $C_{3-8}$  烷氧基烷氧基烷基、 $C_{2-6}$  烷硫基烷基、氰甲基、苄基(可被卤原子或三氟甲基取代)、通式- $COR^{14}$  的基团、通式- $COOR^{15}$  的基团、通式- $CONHR^{17}$  的基团、通式- $SO_2R^{20}$  的基团或通式- $C(R^{21})=CHR^{22}$  的基团; 或  $R^{12}$  和  $R^{13}$  可与氮原子相互连接而成五元环;

10  $R^{14}$  是一个  $C_{1-10}$  烷基、 $C_{1-4}$  卤代烷基、 $C_{2-6}$  烷氧基烷基、 $C_{2-4}$  卤代烷氧基烷基、 $C_{3-10}$  烷氧基烷氧基烷基、 $C_{4-12}$  烷氧基烷氧基烷氧基烷基、环丙基、 $C_{1-4}$  烷氧基、 $C_{3-6}$  烷氧基烷基、苯基(可被卤原子、硝基、 $C_{1-4}$  烷基、三氟甲基、苯氧基或甲氧基取代)、萘基、吡啶基、噻吩基或 2-呋喃基;

$R^{15}$  是  $C_{1-10}$  烷基、 $C_{2-6}$  卤代烷基、 $C_{2-6}$  烷氧基烷基或苯基;

$R^{16}$  是氢原子或甲基;

15  $R^{17}$  是氢原子、 $C_{1-6}$  烷基或苯基(可被氯原子、甲基或三氟甲氧基取代);

$R^{20}$  是甲基或三氟甲基;

$R^{21}$  是氢原子或甲基;

$R^{22}$  是乙酰基或甲氧羰基;

20  $R^{23}$  和  $R^{24}$  彼此独立,  $R^{23}$  和  $R^{24}$  各是氢原子、氯原子、 $C_{1-4}$  烷基、1-三唑基或通式- $N(R^{25})R^{26}$  基团;

$R^{25}$  和  $R^{26}$  彼此独立,  $R^{25}$  和  $R^{26}$  各是氢原子、 $C_{1-4}$  烷基、甲氧基或  $C_{2-4}$  烷氧基烷基;

$R^{27}$  是  $C_{1-4}$  烷基或苯基(可被卤原子或甲基取代);

$Q^1$  和  $Q^2$  彼此独立,  $Q^1$  和  $Q^2$  各是氮原子或通式- $CR^9$  的基团;

25  $m$  是整数 1 - 3; 和

$n$  在  $R^1$  为氰基或  $C_{1-4}$  烷基氨基甲酰基时为 0, 在其它情况中为 0, 1 或 2.

上述通式(II)的一组优选化合物如下, 其中:

$R^1$  是一个  $C_{1-4}$  烷基、氰甲基、羟乙基、环戊基、 $C_{1-3}$  卤代烷基、苯基(可被卤原子取代)、氰基、 $C_{1-4}$  烷基氨基甲酰基或噻唑基;

30  $R^2$  和  $R^3$  彼此独立,  $R^2$  和  $R^3$  各是氢原子、甲基或  $C_{1-2}$  烷氧羰基; 或  $R^1$  和  $R^2$  分别与硫或碳原子相连而成五元环;

$R^4$  是一个氢原子或氟原子;

$B$  是通式(B1)或(B2)的芳烷基或芳羰基;

35  $R^9$  是卤原子、三氟甲基、甲氧基、 $C_{1-2}$  氟烷氧基或苯氧基(可被卤原子取代);

$R^{10}$  是氢原子;

$R^{28}$  是氯原子或羟基

$Q^1$  和  $Q^2$  各是氮原子或通式  $-CR^9$  的基团;

$m$  是整数 1 或 2; 和

当  $R^1$  是一个氰基或  $C_{1-4}$  烷基氨基甲酰基时  $n$  为 0, 在其它情况下  $n$  为 0、

5 1 或 2.

上述通式(III)的一组优选化合物如下, 其中:

$R^2$ 、 $R^3$  和  $R^4$  各是氢原子;

$R^9$  是在 4-位取代的氯原子;

$R^{12}$  和  $R^{13}$  各是氢原子, 通式  $-COR^{14}$  或  $-COOR^{15}$  的基团;

10  $R^{14}$  是  $C_{1-4}$  烷基;

$R^{15}$  是  $C_{1-4}$  烷基;

$R^{29}$  是氯原子、巯基或羟基;

$Q^1$  和  $Q^2$  各是一个次甲基; 和

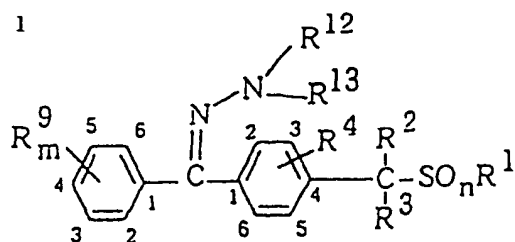
$m$  是 1.

15 现在, 将本发明的通式(I)、(II)、(III)的化合物的特选例子列于表 1 ~ 35. 在下面的描述中可找到表中所用的化合物标号.

通式(I)的化合物具有一个  $C=N$  键, 因此有两个几何异构体即反式(E)和顺式(Z). 作为本发明的化合物, 反式异构体和顺式异构体可以分别使用也可使用其混合物.

20 本发明的通式(I)的化合物在某些情况中可能还有互变异构体. 例如, 当用  $=C(R^{23})-N(R^{25})R^{26}$  代表通式  $=CR^{23}R^{24}$  基团时, 如果  $R^{25}$  是氢原子, 具有  $-N=C(R^{23})NH-R^{26}$  的部分结构会在具有  $-NH-C(R^{23})=N-R^{26}$  部分结构的互变异构体的平衡状态中出现. 因此, 在本发明的化合物中, 具有互变异构体的化合物即使不特别指出, 应理解其具有相应的互变异构体.

表 1



化合物 编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-1	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	0	1.6503
I-2	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	52- 54
I-3	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	
I-4	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	CH=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	
I-5	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	CH=NSO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	2	
I-6	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	
I-7	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1	
I-8	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	
I-9	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	CH=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	
I-10	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	214-217
I-11	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	91- 93
I-12	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.6319
I-13	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	1	141-143
I-14	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	153-156
I-15	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	159-160
I-16	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	173-175
I-17	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	2	147-149
I-18	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	0	93- 96
I-19	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.6097
I-20	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	1	93-96
I-21	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	1	1.6009
I-22	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	2	110-113
I-23	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	2	115-117
I-24	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CHOC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	1.5722
I-25	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	2	127-129
I-26	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	2	116-118

表 2








化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-27	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCF <sub>3</sub>	H	2	
I-28	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	2	
I-29	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	2	
I-30	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	2	
I-31	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	2	174-176
I-32	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	2	209-211
I-33	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	0	
I-34	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	2	180-182
I-35	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6149
I-36	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	H	2	
I-37	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> CN	H	2	
I-38	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	2	
I-39	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2	
I-40	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	0	未测定
I-41	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	1	195-197
I-42	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	2	189-191
I-43	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COO- 	H	2	94-96
I-44	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	164-166
I-45	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6148
I-46	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	41-43
I-47	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.6042
I-48	4-Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	162-165
I-49	4-Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	

表 3


化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-50	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	125-128
I-51	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5853
I-52	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	0	1.6152
I-53	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	1	43- 45
I-54	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	167-169
I-55	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	2	159-160
I-56	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	2	68- 70
I-57	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	H	0	132-134
I-58	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	H	1	89- 93
I-59	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	H	2	193-195
I-60	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	2	65- 67
I-61	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5822
I-62	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	56- 58
I-63	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	47- 49
I-64	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	0	1.6179
I-65	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	1	63- 65
I-66	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2	70- 72
I-67	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	40-4 2
I-68	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	176-177
I-69	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	197-199
I-70	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.6238
I-71	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	0	1.5888
I-72	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	1.6082
I-73	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5911
I-74	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	0	1.6187
I-75	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1	1.5949
I-76	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	61- 63
I-77	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	64- 66
I-78	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -Cl	0	1.6199
I-79	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	2	
I-80	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	2	



表 4

化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-81	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H	2	45- 47
I-82	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	0	1.6358
I-83	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	1	45- 47
I-84	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2	180-181
I-85	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	0	
I-86	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	1	
I-87	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2	
I-88	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	193-195
I-89	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6025
I-90	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	49- 51
I-91	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	122-125
I-92	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	0	43- 45
I-93	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	1	98-100
I-94	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	2	105-107
I-95	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	1.5988
I-96	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.6269
I-97	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	145-147
I-98	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	160-162
I-99	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.6113
I-100	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	1.6059
I-101	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	1.5996
I-102	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	0	1.5838
I-103	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	1	
I-104	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	2	
I-105	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	2	
I-106	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	0	1.5988
I-107	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CONH <sub>2</sub>	2	
I-108	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	
I-109	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2	
I-110	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	
I-111	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2	

表 5



化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-112	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	
I-113	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	2	
I-114	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6198
I-115	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	58-61
I-116	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	68-70
I-117	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	152-155
I-118	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	2	127-130
I-119	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	H	2	173-176
I-120	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	H	1	
I-121	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	1.5748
I-122	4-C1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2	86-88
I-123	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	
I-124	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	120-122
I-125	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	2	116-117
I-126	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-127	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-128	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	132-134
I-129	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	H	H	2	88-90
I-130	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	130-132
I-131	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-132	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	82-84
I-133	4-C1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	H	H	H	H	2	68-70
I-134	4-C1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	114-116
I-135	4-C1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	0	1.5969
I-136	4-C1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	1.5871
I-137	4-C1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2	63-65
I-138	4-C1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH=NSO <sub>2</sub> - 	H	2	74-78
I-139	4-C1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	0	

表 6



化合物 编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-140	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CHCOCH <sub>3</sub>	H	2	121-123
I-141	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CHCOOCH <sub>3</sub>	H	2	96- 98
I-142	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH=CHCOCH <sub>3</sub>	H	2	
I-143	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH=CHCOCH <sub>3</sub>	H	1	
I-144	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	0	
I-145	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	1	
I-146	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )=NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2	
I-147	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	0	
I-148	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	2	1. 5539
I-149	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	130-132
I-150	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	121-123
I-151	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	152-154
I-152	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-153	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	125-126
I-154	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	0	59- 61
I-155	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	2	153-156
I-156	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	2	122-124
I-157	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCF <sub>3</sub>	H	2	54- 56
I-158	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCF <sub>3</sub>	H	0	1. 5659
I-159	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	78- 80
I-160	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	101-103
I-161	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	126-128
I-162	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	2	120-122
I-163	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	0	1. 5972
I-164	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	1	129-130
I-165	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	112-114
I-166	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CONH- 	H	2	81- 83
I-167	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CONH- 	H	2	

表 7

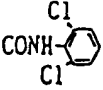
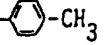
化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-168	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H		H	2	132-134
I-169	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H		H	2	193-195
I-170	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	2	
I-171	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CONHC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	2	179-181
I-172	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CONHC <sub>3</sub>	H	2	
I-173	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	75- 76
I-174	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	178-180
I-175	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	148-150
I-176	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5921
I-177	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	181-183
I-178	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	151-153
I-179	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.5802
I-180	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	1.5820
I-181	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	2	32- 34
I-182	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2	64- 65
I-183	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6203
I-184	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	158-160
I-185	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	197-199
I-186	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.5981
I-187	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.6213
I-188	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	71- 73
I-189	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	171-173
I-190	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	0	1.6273
I-191	4-Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	166-168
I-192	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5801
I-193	4-Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5649
I-194	4-Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5629

表 8



化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-195	4-Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	94-97
I-196	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	136-137
I-197	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	145-148
I-198	4-Cl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-199	4-Cl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub> -i	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-200	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-201	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-202	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-203	4-Cl	CH <sub>2</sub> - 	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-204	4-Cl	CH <sub>2</sub> Br	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-205	4-Cl	CH <sub>2</sub> Br	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-206	4-Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	未测定
I-207	4-Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	154-156
I-208	4-Cl	CHCl <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-209	4-Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6141
I-210	4-Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	75-78
I-211	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	CO- 	H	2	176-178
I-212	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	63-65
I-213	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	112-114
I-214	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	2	91-93
I-215	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COCH <sub>2</sub> Cl	H	2	180-181
I-216	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COCH <sub>2</sub> CN	H	2	68-70
I-217	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	185-187
I-218	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	166-168
I-219	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	
I-220	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2	56-58
I-221	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	60-62
I-222	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	105-107

表 9



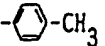
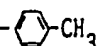






化合物 编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-223	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	160-162
I-224	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	H	H	2	1.6258
I-225	4-Cl	CH <sub>2</sub> CN	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	89-91
I-226	4-Cl	CH <sub>2</sub> CN	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	81-83
I-227	4-Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-228	4-Cl	CH <sub>2</sub> CN	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-229	4-Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-230	4-Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-231	4-Cl	CH <sub>2</sub> -  -Cl	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-232	4-Cl	CN	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6228
I-233	4-Cl	CN	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-234	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-235	4-Cl	 -CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	176-179
I-236	4-Cl	 -CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-237	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-238	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6524
I-239	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-240	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-241	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-242	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	

表 10






化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-243	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-244	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-245	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-246	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-247	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	76- 79
I-248	4-Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	2	94- 96
I-249	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	143-144
I-250	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	107-109
I-251	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	103-110
I-252	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	73- 76
I-253	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	129-130
I-254	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1. 6182
I-255	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	167-169
I-256	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	148-149
I-257	4-F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	84- 85
I-258	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	143-145
I-259	4-Br	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	158-159
I-260	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	66- 68
I-261	2-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	83- 85
I-262	3, 4, 5-Cl <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-263	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	54- 55
I-264	3-F, 4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	54- 56
I-265	4-CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	115-118
I-266	4-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	203-204

表 11

化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-267	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	164-166
I-268	4-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	1.5592
I-269	4-OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	135-138
I-270	4-CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-271	4-CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-272	4-CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-273	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	120-122
I-274	4-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	189-190
I-275	4-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-276	4-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	
I-277	4-CN	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	195-197
I-278	4-CN	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	95-96
I-279	4-CN	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-280	4-NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	193-194
I-281	4-NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2	130-133
I-282	4-NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	65-67
I-283	4-OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	121-123
I-284	4-OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	151-152
I-285	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	-COCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		2	117-120
I-286	4-Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	100-103
I-287	4-Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-288	4-Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S-		H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-289	4-Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-		H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	
I-290	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	1.5838
I-291	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	1.5835
I-292	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	2	121-123
I-293	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	2	171-173



表 12




化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-294	3-F, 4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	83-85
I-295	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.6046
I-296	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1	48-50
I-297	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	56-58
I-298	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	0	1.5889
I-299	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	2	1.5651
I-300	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	1	1.5931
I-301	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.6019
I-302	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	41-43
I-303	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	79-80
I-304	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	76-78
I-305	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5909
I-306	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	1.5869
I-307	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -Cl	2	65-67
I-308	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	0	1.6670
I-309	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	59-60
I-310	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CCOCH <sub>3</sub>	H	2	182-184
I-311	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	0	1.5714
I-312	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	2	42-43
I-313	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	3-F	COOCH <sub>3</sub>	H	2	109-110
I-314	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	3-F	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	144-146
I-315	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	2	59-61
I-316	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	0	74-75
I-317	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5791
I-318	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	38-40
I-319	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	0	1.5732
I-320	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	2	1.5702

表 13

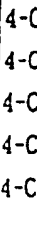



化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-321	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>	0	1.5699
I-322	4-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	193-194
I-323	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>	2	57-58
I-324	4-OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	93-95
I-325	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	152-154
I-326	4-OCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	151-153
I-327	4-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	163-164
I-328	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5831
I-329	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	1.5735
I-330	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1	1.5812
I-331	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.6025
I-332	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	2	1.5918
I-333	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5725
I-334	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	1.5659
I-335	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	2	1.5751
I-336	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	0	1.5899
I-337	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> H	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1	1.5682
I-338	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	1	1.6029
I-339	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5631
I-340	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	1.5603
I-341	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1	1.5728
I-342	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	CO-  -Cl	H	0	1.6557
I-343	2-F, 4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	172-174
I-344	3-F, 4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	165-167
I-345	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	CO-  -Cl	H	1	78-80
I-346	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	0	1.6201

表 14



化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-347	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	1	未测定
I-348	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	1	40- 42
I-349	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	0	1.5963
I-350	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	1	1.5891
I-351	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	2	53- 55
I-352	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COOCH <sub>3</sub>	0	1.5940
I-353	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COOCH <sub>3</sub>	2	50- 52
I-354	3-F, 4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.6150
I-355	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	2	未测定
I-356	3-F, 4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	54- 56
I-357	4-F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	153-155
I-358	3, 4-F <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	121-122
I-359	4-F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	134-135
I-360	3, 4-F <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	1.5923
I-361	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	149-150
I-362	3-F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	124-126
I-363	3, 4, 5-F <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	184-186
I-364	4-F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	未测定
I-365	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	2	144-146
I-366	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5601
I-367	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1	1.5628
I-368	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	1.3615
I-369	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>	2	1.5398
I-370	2-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	165-167
I-371	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -Cl	2	1.5818
I-372	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	3-F	COOCH <sub>3</sub>	H	2	85- 87

表 15

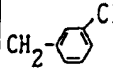
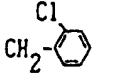
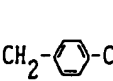
化合物 编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-373	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	1.5852
I-374	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	1.5802
I-375	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	45- 46
I-376	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	2	1.5360
I-377	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CONH <sub>2</sub>	2	40- 41
I-378	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	129-131
I-379	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5821
I-380	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	3-F	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	139-140
I-381	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	1	1.6052
I-382	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> C≡CH	H	2	121-122
I-383	3, 4-Cl <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	163-165
I-384	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5720
I-385	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	0	1.5579
I-386	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	1	127-129
I-387	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	65- 67
I-388	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	3-F	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5747
I-389	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	3-F	COOCH <sub>3</sub>	H	0	未测定
I-390	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5564
I-391	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	0	1.5793
I-392	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	0	1.5712
I-393	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H,	2	149-151
I-394	4-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5703
I-395	4-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5770
I-396	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	0	41- 42
I-397	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	38- 39
I-398	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	0	1.5930

表 16














化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-399	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COO- 	H	0	1.5992
I-400	3,4-Cl <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	68-70
I-401	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	118-120
I-402	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	0	74-76
I-403	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H		H	0	1.6058
I-404	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO-  -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	H	0	141-143
I-405	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO-  - 	H	0	1.6289
I-406	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub> - 	H	0	151-153
I-407	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO-  -CH <sub>3</sub>	H	0	136-138
I-408	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO-  -OCH <sub>3</sub>	H	0	1.6164
I-409	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO-  -NO <sub>2</sub>	H	0	153-155
I-410	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	0	136-137
I-411	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	0	63-64
I-412	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH=CHCH <sub>3</sub>	H	0	1.6004
I-413	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	0	163-165
I-414	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CO- 	H	0	125-127
I-415	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5732

表 17






化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-416	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	138-139
I-417	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	155-157
I-418	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	117-119
I-419	4- 	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	83-85
I-420	3,4-F <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	163-165
I-421	4-OCHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	130-131
I-422	4-O- 	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	66-68
I-423	3,4,5-F <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	153-154
I-424	4-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	134-135
I-425	4-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	62-64
I-426	4-O-  -Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	59-60
I-427	4-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	61-63
I-428	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	163-166
I-429	4-SCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	120-122
I-430	4-SCHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	139-140
I-431	3,5-F <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	141-142
I-432	3-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	141-143
I-433	3-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CONH-  -OCF <sub>3</sub>	H	2	108-110
I-434	3-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CONH-  -Cl	H	2	172-173
I-435	3-Cl, 4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	186-188
I-436	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5839
I-437	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5940
I-438	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5760
I-439	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5901
I-440	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	135-136

表 18









化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-441	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	169-170
I-442	4-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	52- 54
I-443	3, 4-(OCH <sub>2</sub> O)	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	182-185
I-444	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5680
I-445	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5610
I-446	4-OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5812
I-447	4-Br	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5921
I-448	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5869
I-449	4-I	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	未测定
I-450	4-I	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6060
I-451	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1.6131
I-452	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5738
I-453	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	1.5991
I-454	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1	1.5802
I-455	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -Cl	0	未测定
I-456	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -Cl	1	未测定
I-457	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>	0	1.5719
I-458	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -Cl	2	未测定
I-459	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>	2	1.5500
I-460	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	0	1.5882
I-461	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	47- 48
I-462	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	1.5318

表 19

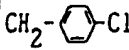
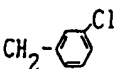
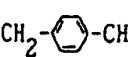



化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-463	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	未测定
I-464	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	1.5950
I-465	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> - 	2	56-57
I-466	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	1.5825
I-467	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	2	1.5659
I-468	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2	1.5775
I-469	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	2	1.5682
I-470	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	1	1.6203
I-471	3-F, 4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	111-113
I-472	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	1	135-137
I-473	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6061
I-474	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	0	1.5761
I-475	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	1	1.5742
I-476	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	189-190
I-477	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	CONH- 	H	0	124-126
I-478	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	CONH- 	H	1	102-103
I-479	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	CONH- 	H	0	90-92
I-480	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	0	1.6019
I-481	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	1.5502
I-482	3-F, 4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5981
I-483	3-F, 4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	0	1.5688
I-484	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5912



表 20

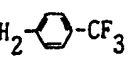

化合物 编号	R <sup>g</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-485	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	0	109-112
I-486	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	0	1.6049
I-487	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	196-198
I-488	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	112-114
I-489	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	1.5725
I-490	4-F	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.5947
I-491	4-F	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	135-137
I-492	4-F	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	148-150
I-493	4-F	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5870
I-494	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.6139
I-495	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	88-90
I-496	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6100
I-497	3,4-F <sub>2</sub>	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	133-134
I-498	3,4-F <sub>2</sub>	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	127-128
I-499	4-CF <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5662
I-500	4-CF <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	70-72
I-501	4-CF <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	64-66
I-502	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	1.6059
I-503	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-S-N <sub>2</sub> O	0	
I-504	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -  -CF <sub>3</sub>	2	1.5631
I-505	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i -SNC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0	
I-506	4-Cl		H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	134-135
I-507	4-Cl	CONHC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	47-49
I-508	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	SN(C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	0	

表 21













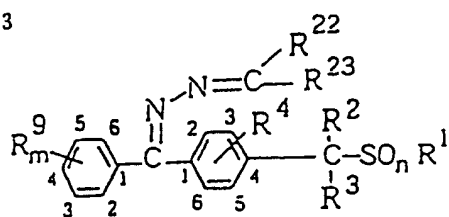
化合物 编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-509	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	CO-  -Cl	H	2	132-135
I-510	4-F	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	152-154
I-511	4-Cl	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	
I-512	4-Cl	-N 	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	
I-513	4-Cl	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-514	4-Cl	-N=C  -CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-515	4-Cl	-N 	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	
I-516	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	 -C=NSO <sub>2</sub> - 	H	0	1.6408
I-517	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	 -C=NSO <sub>2</sub> - 	H	2	48- 50
I-518	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	 -C=NSO <sub>2</sub> -  -Cl	H	0	1.6424
I-519	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	 -C=NSO <sub>2</sub> -  -Cl	H	2	75- 76
I-520	4-Cl	CF <sub>3</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5345
I-521	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	172-174
I-522	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	96- 98
I-523	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H	2	1.6258
I-524	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	202-204
I-525	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	2	105-108
I-526	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	65- 67
I-527	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H	0	1.6555
I-528	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	0	1.6415

表 22

化合物 编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
I-529	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6221
I-530	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	0	1.6396
I-531	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6463
I-532	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	1	70- 72
I-533	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	62- 64
I-534	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	60- 62
I-535	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	0	105-108
I-536	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.6328
I-537	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	1	138-139
I-538	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	135-137
I-539	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CN	2	74- 76
I-540	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CN	0	1.5689

表 23



化合物 编号	R <sup>m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>22</sup>	R <sup>23</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
II-1	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H		2	
II-2	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	N(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	1	
II-3	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	N(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	2	
II-4	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	Cl	N(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	2	
II-5	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	2	1.5951
II-6	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	50-52
II-7	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	2	
II-8	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	2	58-60
II-9	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		0	
II-10	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		2	1.5978
II-11	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	51-53
II-12	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	1.6238
II-13	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	2	55-57
II-14	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	2	108-109
II-15	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	1.6049
II-16	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	NHCH <sub>3</sub>	2	35-38
II-17	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>		2	
II-18	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	2	
II-19	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	1	
II-20	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	
II-21	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t)OCH <sub>3</sub>	2	

表 24



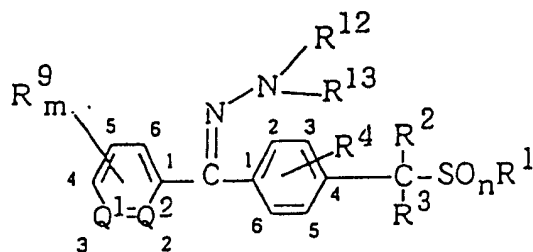
化合物 编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>22</sup>	R <sup>23</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
II-22	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	未测定
II-23	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1	53-55
II-24	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	156-158
II-25	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> )OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	2	
II-26	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	2	
II-27	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	2	
II-28	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	1	
II-29	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		0	1.6498
II-30	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		1	未测定
II-31	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	N(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	2	
II-32	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	115-118
II-33	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1	
II-34	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	
II-35	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	1.6163
II-36	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	2	1.6108
II-37	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	0	1.6089
II-38	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	1.6180
II-39	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	1.6248
II-40	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1	未测定
II-41	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	1.6171
II-42	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	3-F	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	62-68
II-43	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	109-111
II-44	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	123-124
II-45	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	2	1.6207
II-46	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	1.5619
II-47	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	2	1.5892
II-48	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	103-104

表 25

化合物编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>22</sup>	R <sup>23</sup>	n	熔点或折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
II-49	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	1.6335
II-50	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1	75- 77
II-51	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	130-132
II-52	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	1.6479

表 26



化合物编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	n	熔点或折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
III-1	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	N	CH	2	149-150
III-2	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	N	CH	2	72- 73
III-3	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	N	CH	2	103-105
III-4	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	N	CH	2	165-167
III-5	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	N	CH	2	85- 87
III-6	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	N	CH	2	67- 69
III-7	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	N	CH	2	85- 87
III-8	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	N	CH	2	176-178
III-9	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	N	CH	2	未测定
III-10	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	N	CH	0	未测定
III-11	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	N	CH	1	70- 71
III-12	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	CH	N	2	66- 67
III-13	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH	N	2	41- 42

表 27

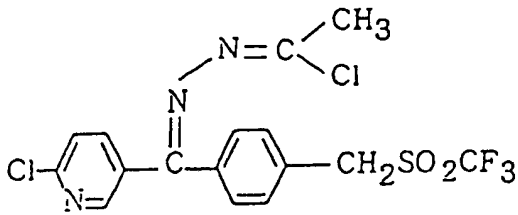
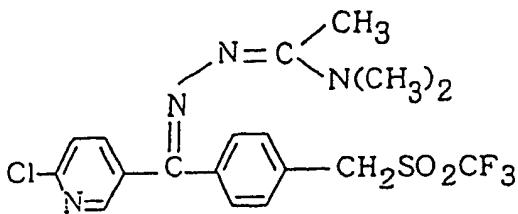
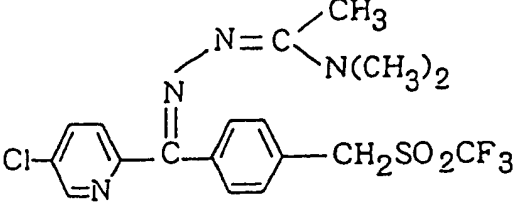
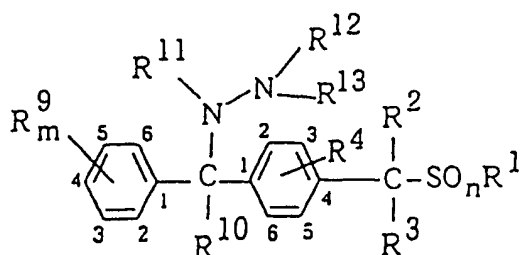
化合物 编号	结构式	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
IV - 1		1.5979
IV - 2		1.6065
IV - 3		未测定

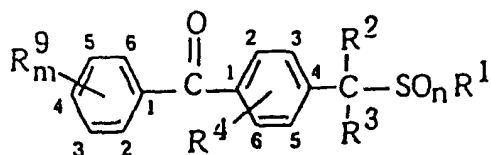
表 28



化合物 编号	R <sup>9m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )	备 注	
V-1	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	83- 85	氢氯化物	
V-2	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H	H	H	2	1.6079		
V-3	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	63- 64		
V-4	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	60- 61		
V-5	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	76- 78		
V-6	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	66- 67		
V-7	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	H	2	69- 71		
V-8	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	H	2	1.5671		
V-9	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	49- 50		
V-10	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	COCH <sub>3</sub>	H	2	49- 50		
V-11	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	47- 49		
V-12	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	1.5098		甲硫酸
V-13	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	52- 54		氢氯化物
V-14	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	未测定		
V-15	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	H	2	55- 56		
V-16	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	50- 53		
V-17	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	2	87- 88		氢氯化物
V-18	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	H	2	1.5412		
V-19	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	2	50- 52		



表 29



化合物 编号	R <sup>m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
VI-1	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	0	59-61
VI-2	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	1	116-118
VI-3	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	2	164-166
VI-4	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	0	33-34
VI-5	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	1	
VI-6	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	2	117-118
VI-7	4-Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	2	128-129
VI-8	4-Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	H	H	2	135-137
VI-9	4-Cl	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	2	118-119
VI-10	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	2	148-150
VI-11	4-Cl	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> Br	H	H	H	2	105-107
VI-12	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	0	63-65
VI-13	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	1	114-115
VI-14	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	123-125
VI-15	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	0	34-35
VI-16	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	2	154-157
VI-17	4-Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	H	0	52-53
VI-18	4-Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	H	2	94-96
VI-19	4-Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	148-150
VI-20	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	H	0	48-50
VI-21	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	H	2	68-70
VI-22	4-Cl	CF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	H	H	H	0	未测定
VI-23	4-Cl	CH <sub>2</sub> CN	H	H	H	0	54-55
VI-24	4-Cl	CH <sub>2</sub> CN	H	H	H	2	179-181

表 30




化合物 编号	R <sup>m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
VI-25	4-Cl		H	H	H	2	113-115
VI-26	4-Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	H	H	H	0	61- 62
VI-27	4-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	128-131
VI-28	4-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2	107-109
VI-29	4-Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	H	H	H	2	161-162
VI-30	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	0	1.6141
VI-31	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	2	138-139
VI-32	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	0	43- 45
VI-33	4-F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	0	1.6022
VI-34	4-F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	2	97- 98
VI-35	4-Cl	CN	H	H	H	0	129-131
VI-36	4-Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		H	H	2,	未测定
VI-37	4-Cl		H	H	H	0	80- 90
VI-38	4-Cl		H	H	H	2	101-103
VI-39	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	3-F	2	132-133
VI-40	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	144-145
VI-41	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	1	124-125
VI-42	4-Cl	CONHC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	0	115-116
VI-43	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	3-F	0	1.5684
VI-44	4-Cl	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	0	1.6191
VI-45	4-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	0	1.5698
VI-46	4-Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	2	145-147
VI-47	H	CN	H	H	H	0	138-139
VI-48	H	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	0	1.6189
VI-49	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	0	43- 44
VI-50	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	0	1.5581

表 31


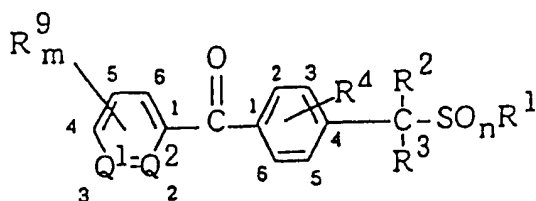
化合物 编号	R <sup>m</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	熔点或 折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
VI-51	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	0	143-145
VI-52	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	84- 85
VI-53	4-F	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	2	110-112
VI-54	4-F	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	0	1.5572
VI-55	4-F	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	2	165-167
VI-56	4-F	CN	H	H	H	0	116-117
VI-57	4-OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	2	130-131
VI-58	4-OCHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	95- 96
VI-59	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	2	110-112
VI-60	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	105-107
VI-61	3, 4, 5-F <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	83- 84
VI-62	4-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	116-117
VI-63	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	79- 81
VI-64	3-F, 4-Cl	CN	H	H	H	0	93- 95
VI-65	3-F, 4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	0	1.6129
VI-66	3-F, 4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	0	1.5922
VI-67	3-F, 4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	0	69- 70
VI-68	4-Br	CN	H	H	H	0	145-148
VI-69	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	H	H	0	74- 75
VI-70	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	0	63- 64
VI-71	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	1	118-119
VI-72	4-Br	CN	CH <sub>3</sub>	H	H	0	53- 54
VI-73	4-Br	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	0	39- 40
VI-74	3, 4-F <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	1	176-178
VI-75	4-O-  -Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	2	125-126
VI-76	4-OCH <sub>3</sub>	CN	H	H	H	0	79- 81
VI-77	4-OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H	0	57- 59

表 32

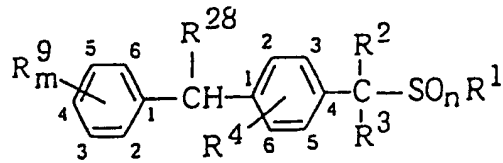
化合物编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	熔点或折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
VI-78	4-1	CN	H	H	H	0	116-118
VI-79	4-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	0	92- 94
VI-80	4-Cl	CF <sub>3</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5362
VI-81	4-Cl	CCl <sub>3</sub>	H	H	H	0	103-105
VI-82	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	2	141-142
VI-83	4-Br	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	2	113-115
VI-84	4-Br	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	0	30
VI-85	4-Cl	CH <sub>3</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	0	1.5674

表 33



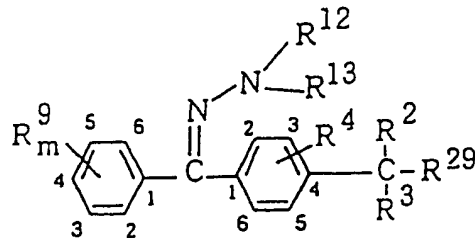
化合物编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	n	熔点或折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
VII-1	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	N	CH	2	162-164
VII-2	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	N	CH	2	97- 99
VII-3	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	N	CH	0	1.5820
VII-4	4-Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	N	CH	2	94- 96
VII-5	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	N	CH	2	155-156
VII-6	4-Cl	CN	H	H	H	N	CH	0	93- 94
VII-7	4-Cl	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH	N	2	153-155
VII-8	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH	N	2	38- 39

表 34



化合物编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>28</sup>	n	熔点或折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
VIII-1	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	OH	2	1.5950
VIII-2	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	OH	2	113-115
VIII-3	4-Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	OH	0	1.5601
VIII-4	4-Cl	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	OH	2	85-87
VIII-5	4-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Cl	2	1.6044
VIII-6	4-F	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OH	2	139-140
VIII-7	4-F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	OH	2	99-100

表 35

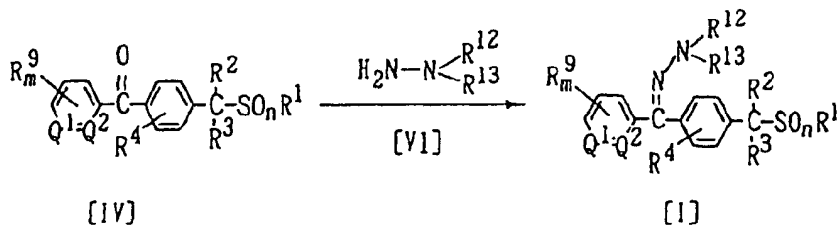


化合物编号	R <sup>9</sup> <sub>m</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>29</sup>	熔点或折射率 (n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
IX-1	4-Cl	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	OH	未测定
IX-2	4-Cl	H	H	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Cl	113-115
IX-3	4-Cl	H	H	H	COOCH <sub>3</sub>	H	SH	162-165

现在描述本发明的化合物的制备方法。

根据下面的方法 1 ~ 5 可以制备本发明的通式(I)化合物。

方法 1:



5

在上述反应通式中,  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $Q^1$  和  $Q^2$  按上面的定义。

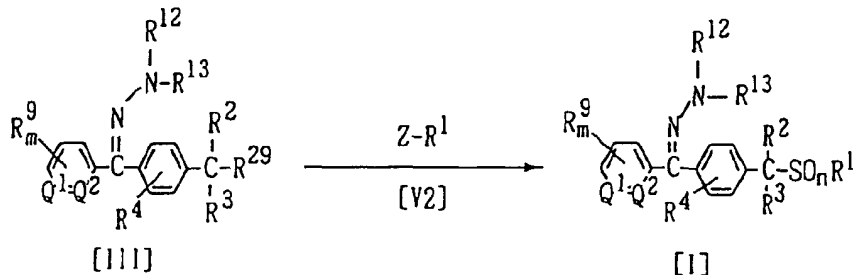
方法 1 中, 本发明的通式(I)中的 A 为(A2)化合物, 其制备可将 1 摩尔通式 (IV)的二苯酮与 1.0~10.0 摩尔的通式(VI)的脒或其水合物在 0 ~ 5 升溶剂中, 如 10 果需要还可在 0.01~1.0 摩尔的酸催化剂存在下反应可得。

可使用的溶剂如芳烃如苯、甲苯、二甲苯或氯苯, 对质子惰性的极性溶剂 15 如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砷或四氢噻吩砷, 醇如甲醇、乙醇、乙二醇或丙三醇、卤化烃如二氯甲烷或氯仿、酯如乙酸乙酯或丙酸乙酯、脂族烃如己烷、环己烷或庚烷、吡啶类如吡啶或甲 20 基吡啶, 乙酸或水, 或上述溶剂的混合物。

酸催化剂可以是如无机酸如盐酸, 硫酸或硝酸, 有机酸如甲酸、乙酸、丙 25 酸、甲磺酸、苯磺酸或对-甲苯磺酸一水化物, 胺的酸加成盐如吡啶盐酸盐或三乙基胺盐酸盐, 金属卤化物如四氯化钛、氯化锌、氯化亚铁、氯化铁、或三 氟化硼乙醚化物。

反应温度在  $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$  ~ 反应系统回流温度范围内, 最好为室温 ~  $150\text{ }^{\circ}\text{C}$ 。反应 时间依据特定的化合物而定, 但设定在 10 分 ~ 20 小时内。

方法 2:



25

在上述反应通式中,  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $Q^1$

和  $Q^2$  按上面的定义;  $R^{29}$  是卤原子;  $Z$  是通式  $MS(O)_n$  的基团;  $m$  是碱金属;  $n$  是 0 或 2.

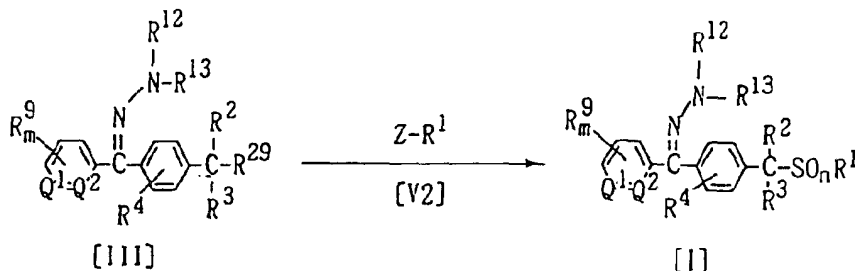
5 在方法 2 中, 本发明通式(I)中的 A 为(A2)化合物, 其制备可通过 1 摩尔通式(III)的苄基卤化物与 1.0~3.0 摩尔的通式(V2)硫碱金属盐化合物在 0 ~ 10 升溶剂中反应得到.

使用的溶剂可以是醚类如乙醚, 四氢呋喃或二噁烷, 芳烃如苯、甲苯、二甲苯或氯苯、对质子惰性的极性溶剂如  $N,N$ -二甲基甲酰胺、 $N,N$ -二甲基乙酰胺、 $N$ -甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砷或四氢噻吩砷, 醇类如甲醇、乙醇、乙二醇或丙三醇, 卤化烃如二氯甲烷或氯仿, 酯类如乙酸乙酯或丙酸乙酯, 脂族烃如戊烷、己烷、环己烷或庚烷, 吡啶类如吡啶或甲基吡啶或水, 或上面的溶剂的混合物.

在这一方法中使用硫的碱金属盐可由硫化物制备, 其中  $Z$  是  $HS(O)_n$  和碱金属、碱金属氢化物或碱金属氢氧化物.

15 反应温度在  $-10\text{ }^\circ\text{C}$ ~反应系统的回流温度范围内, 最好为室温 ~  $100\text{ }^\circ\text{C}$ . 反应时间依据特定的化合物而定, 但设定在 10 分 ~ 20 小时内.

方法 3:



20 在上述反应通式中,  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $Q^1$  和  $Q^2$  按上面的定义;  $R^{29}$  是巯基;  $Z$  是卤原子、 $C_{1-4}$  烷基磺酰氧基或苯磺酰氧基(可被甲基取代).

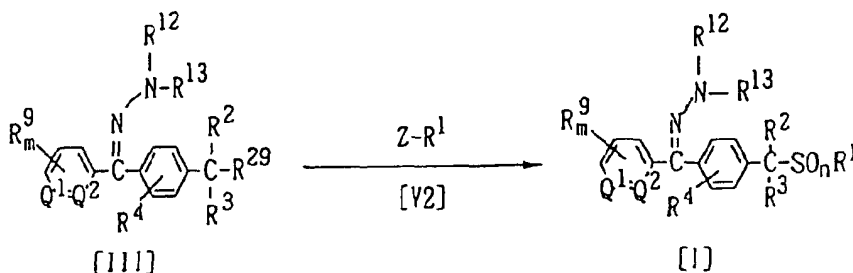
25 方法 3 中, 本发明通式(I)中的 A 为(A2)化合物, 其制备为将 1 摩尔式(III)的巯基化合物与 1.0~5.0 摩尔通式(V2)的化合物在有 1.0~3.0 摩尔一种碱的 0~5 升溶剂中反应.

所用的溶剂可以是醚类如乙醚、四氢呋喃或二噁烷、芳烃如苯、甲苯、二甲苯或氯苯, 对质子惰性的极性溶剂如  $N,N$ -二甲基甲酰胺、 $N,N$ -二甲基乙酰胺、 $N$ -甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砷或四氢噻吩砷, 卤化烃如二氯甲烷或氯仿、腈类如乙腈或丙腈, 酯类如乙酸乙酯或丙酸乙酯, 脂族烃如戊烷、己烷、环己烷或庚烷, 吡啶类如吡啶或甲基吡啶或水, 或上述溶剂的混合物.

所用的碱，可以是无机碱，如碱金属氢氧化物如氢氧化钠或氢氧化钾，碱土金属氢氧化物如氢氧化钙或氢氧化镁，碱金属碳酸盐如碳酸钠，或碳酸钾，或碱金属碳酸氢盐如碳酸氢钠或碳酸氢钾，金属氢化物如氢化钠或氢化钾，醇盐如甲醇钠、乙醇钠或叔丁醇钾，或有机碱如三乙胺、N,N-二甲苯胺、吡啶、4-N,N-二甲氨基吡啶或1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯。

反应温度在-30℃~反应系统的回流温度范围内，最好为0~150℃。反应时间依据特定化合物而定，但设定在10分~20小时内。

方法4：



10

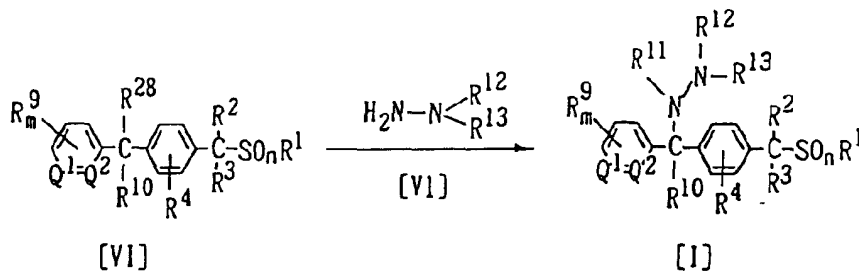
在上述反应通式中，R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、m、n、Q<sup>1</sup>和Q<sup>2</sup>按上面的定义；R<sup>29</sup>是羟基；2是通式-SSR<sup>1</sup>的基团。

方法4中，本发明通式(I)中为(A2)的化合物，其制造为将1摩尔通式(III)的苯醇与1.0~3.0摩尔的二氨基氯磷在含有1.0~3.0摩尔碱的0.1~5升溶剂中反应以得到一种亚磷酸酯，然后将其与1.0~5.0摩尔通式(V2)的二硫化物在0~5升的溶剂中反应。

在这一方法中使用的溶剂和碱与方法3中使用的相同。

反应温度在-40℃~反应系统回流温度范围内，最好为-30~50℃。反应时间依据特定的化合物而定。但设定在10分~20小时内。

方法5：



25 在上述反应通式中，R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、m、n、Q<sup>1</sup>



和  $Q^2$  按上面的定义;  $R^{11}$  是氢原子;  $R^{28}$  是卤原子。

方法 5 中, 本发明通式(I)中的 A 为(A1)化合物, 可由 1 摩尔通式(VI)的化合物与 1.0~10.0 摩尔通式(V1)的肼或其水合物, 如果需要可加入 1.0~3.0 摩尔的碱在 0 ~ 5 升溶剂中反应而制备。

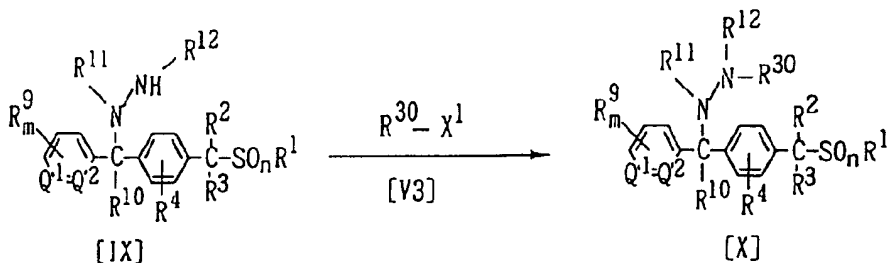
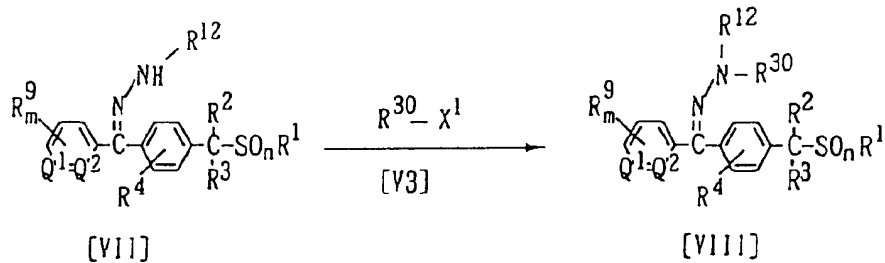
5 所用的溶剂可以是醚类如乙醚、四氢呋喃或二噁烷、芳烃如苯、甲苯、二甲苯或氯苯、对质子惰性的极性溶剂如 N,N-二甲基甲酰胺, N,N-二甲基乙酰胺, N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砷或四氢噻吩砷, 卤化烃如二氯甲烷或氯仿、腈类如乙腈或丙腈, 酯类如乙酸乙酯或丙酸乙酯、脂族烃如戊烷、己烷、环己烷或庚烷、吡啶类如吡啶或甲基吡啶, 或水, 或上述溶剂的混合物。

10 碱可以是如无机碱如碱金属氢氧化物即氢氧化钠或氢氧化钾, 碱土金属氧化物如氢氧化钙或氢氧化镁, 碱金属碳酸盐如碳酸钠或碳酸钾, 碱金属碳酸氢盐如碳酸氢钠或碳酸氢钾, 金属氢化物如氢化钠或氢化钾, 烷醇盐如甲醇钠、乙醇钠或叔丁醇钾、或有机碱如三乙胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶、4-N,N-二甲氨基吡啶或 1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳烯。

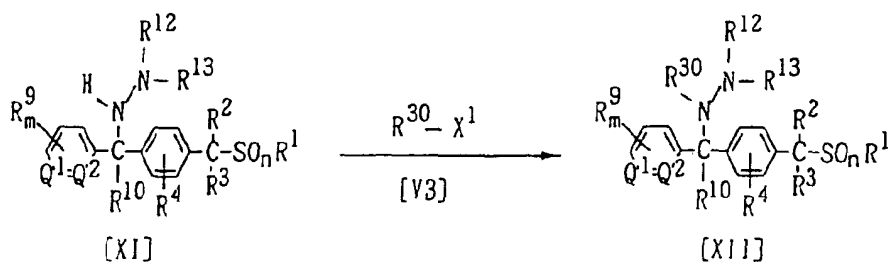
15 反应温度在  $-30\text{ }^{\circ}\text{C}$ ~反应系统的回流温度范围内, 最好为  $0\text{ }^{\circ}\text{C}$  ~  $150\text{ }^{\circ}\text{C}$ 。反应时间依据特定的化合物而定, 但设定在 10 分 ~ 20 小时内。

本发明通式(I)的化合物也可用本发明通式(I)的化合物本身作起始原料来生产。这类方法将在方法 6 ~ 11 中列出, 但这类方法不受这些说明的方法的限制。

20 方法 6:



25



在上述反应通式中， $\text{R}^{30}$  是氰基、 $\text{C}_{1-6}$  烷基、 $\text{C}_{1-4}$  卤代烷基、 $\text{C}_{2-10}$  烷氧基烷基、 $\text{C}_{3-8}$  烷氧基烷氧基烷基、 $\text{C}_{2-6}$  烷硫基烷基、 $\text{C}_{2-6}$  链烯基、 $\text{C}_{2-4}$  炔基、苄基(可被卤原子、甲基或三氟甲基取代)、通式 $-\text{COR}^{14}$  的基团、通式 $-\text{COOR}^{15}$  的基团、通式 $-\text{CON}(\text{R}^{16})\text{R}^{17}$  的基团、通式 $-\text{SN}(\text{R}^{18})\text{R}^{19}$  的基团、通式 $-\text{SO}_n\text{R}^{20}$  的基团、通式 $-\text{C}(\text{R}^{21})=\text{CHR}^{22}$  的基团或通式 $-\text{C}(\text{R}^{23})=\text{NR}^{25}$  的基团；当  $\text{R}^{30}$  是通式 $-\text{C}(\text{R}^{21})=\text{CHR}^{22}$  的基团时， $\text{X}^1$  是卤原子、羟基、 $\text{C}_{1-4}$  烷氧基、 $\text{C}_{1-4}$  烷基羰氧基、硫基、 $\text{C}_{1-4}$  烷硫基、 $\text{C}_{1-4}$  烷基磺酰氧基或苯磺酰基(可被一个甲基取代)，在其它情况时， $\text{X}$  是卤原子、 $\text{C}_{1-4}$  烷磺酰氧基或苯磺酰氧基(可被一个甲基取代)，或  $\text{R}^{30}-\text{X}^1$  形成  $\text{R}^{17}\text{NCO}$  或  $\text{ClSO}_2\text{NCO}$ ；而  $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^9$ 、 $\text{R}^{10}$ 、 $\text{R}^{11}$ 、 $\text{R}^{12}$ 、 $\text{R}^{13}$ 、 $\text{R}^{14}$ 、 $\text{R}^{15}$ 、 $\text{R}^{16}$ 、 $\text{R}^{17}$ 、 $\text{R}^{18}$ 、 $\text{R}^{19}$ 、 $\text{R}^{20}$ 、 $\text{R}^{21}$ 、 $\text{R}^{22}$ 、 $\text{R}^{23}$ 、 $\text{R}^{25}$ 、 $\text{Q}^1$ 、 $\text{Q}^2$ 、 $m$  和  $n$  按上述定义。

即，本发明的一种新的化合物(VIII)、(X)或(XII)可将 1 摩尔的本发明的化合物(VII)、(IX)或(XI)与 1.0~10.0 摩尔通式(V3)的化合物在 0 ~ 5 升溶剂中，如果需要可以 0.1~3.0 摩尔一种酸或一种碱存在下反应而制得。

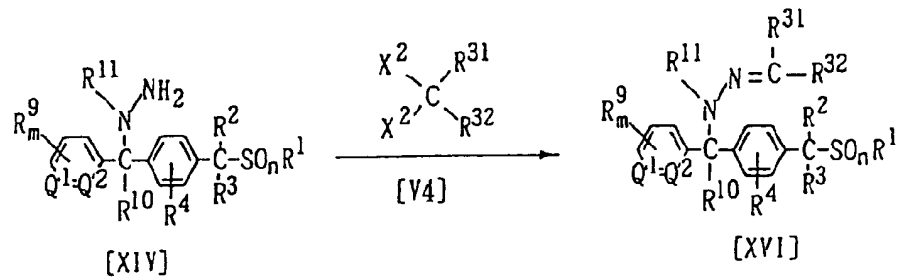
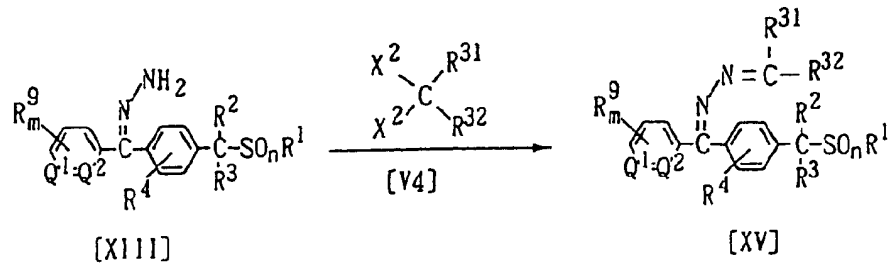
使用的溶剂和酸催化剂与方法 1 中所使用的相同。

碱可以是如无机碱，例如碱金属氢氧化物如氢氧化钠或氢氧化钾，碱土金属氧化物如氢氧化钙或氢氧化镁，碱金属碳酸盐，如碳酸钠或碳酸钾，或碱金属碳酸氢盐如碳酸氢钠或碳酸氢钾，金属氢化物如氢化钠或氢化钾，醇盐如甲醇钠、乙醇钠或叔丁醇钾，或有机碱如三乙胺、N,N-二甲苯胺、吡啶、4-N,N-二甲氨基吡啶或 1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳烯。

反应温度在 $-30\text{ }^\circ\text{C}$ ~反应系统的回流温度范围内，更好为 0 ~  $150\text{ }^\circ\text{C}$ 。反应时间依据特定的化合物而定，但设定在 10 分 ~ 20 小时内。

当异氰酸氯磺酰酯与上面的化合物(VII)、(IX)或(XI)反应时，产生的反应产物在分离后或未加分离时进行水解，可得到本发明化合物，此时  $\text{R}^{30}$  为  $\text{CONH}^2$ 。

方法 7:



5

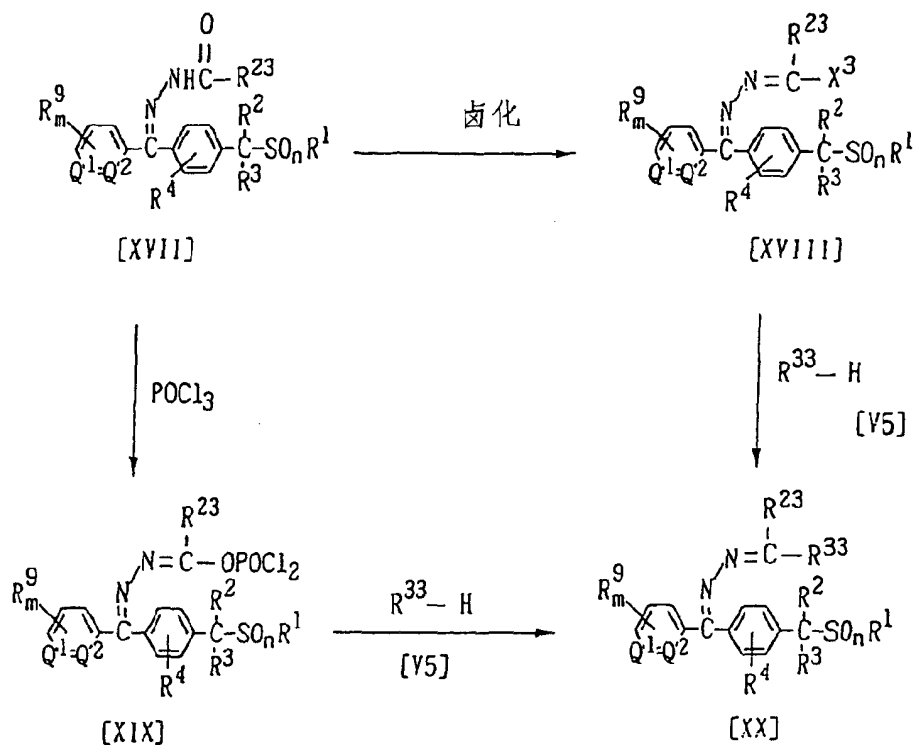
上述反应通式中， $\text{R}^{31}$  和  $\text{R}^{32}$  彼此独立， $\text{R}^{31}$  和  $\text{R}^{32}$  各是氢原子、 $\text{C}_{1-6}$  烷基或通式  $-\text{N}(\text{R}^{25})\text{R}^{26}$  的基团； $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^9$ 、 $\text{R}^{10}$ 、 $\text{R}^{11}$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $\text{Q}^1$  和  $\text{Q}^2$  按上面定义； $\text{R}^{25}$  和  $\text{R}^{26}$  彼此独立， $\text{R}^{25}$  和  $\text{R}^{26}$  各是  $\text{C}_{1-4}$  烷基； $\text{X}^2$  是  $\text{C}_{1-4}$  烷氧基；或两个  $\text{X}^2$  可与碳原子形成羰基。

10

即本发明的一种新的化合物(XV)或(XVI)可通过将 1 摩尔本发明通式(XIII)或(XIV)的化合物与通式(V4)的化合物在 0 ~ 5 升的溶剂中，如果需要可在 0.10~1.0 摩尔的酸催化剂和溶剂存在下反应获得。

反应在与方法 1 相同的条件下进行。

方法 8:



5 在上面反应通式中,  $R^{33}$  是吡咯基或通式  $-N(R^{25})R^{26}$  的基团;  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $Q^1$  和  $Q^2$  按上面定义;  $R^{23}$  是氢原子或  $C_{1-6}$  烷基;  $X^3$  是氯原子或溴原子。

10 即本发明的新化合物(XVIII)可通过将 1 摩尔通式(XVII)的化合物与 1.0~10.0 摩尔卤化剂在 0 ~ 5 升溶剂中反应。随后 1.0~5.0 摩尔通式(V5)的化合物在 0 ~ 5 升溶剂中如果需要在 1.0~3.0 摩尔碱存在下反应, 得到本发明的一种新的化合物(XX)。本发明的通式(XX)的化合物还可用分子式(XIX)的化合物代替式(XVIII)化合物而制备。

卤代剂可以是如五氯化磷、亚硫酸氯、三苯基磷/氯化碳、或三苯基磷/溴的混合物。

15 所用的溶剂可以是醚类如乙醚、四氢呋喃或二噁烷、芳烃如苯、甲苯、二甲苯或氯苯、卤化烃如二氯甲烷或氯仿、腈类如乙腈或丙腈、脂族烃如戊烷、己烷、环己烷或庚烷、或一种上面的溶剂混合物。卤代剂也可作为一种溶剂。

反应温度在  $0\text{ }^{\circ}\text{C}$  ~ 系统中回流温度范围内, 更好为  $10\text{ }^{\circ}\text{C}$  ~  $180\text{ }^{\circ}\text{C}$ 。反应时间依据特定化合物而定, 但设定在 10 分 ~ 20 小时内。

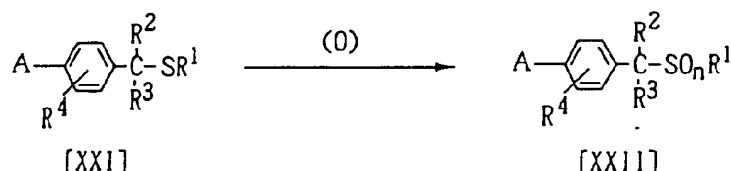
20 通式(XIX)的化合物可通过将通式(XVII)的化合物与氧氯化磷反应得到。在化学文摘 113 卷 97192b 中揭示了这种反应的一个例子。

本发明通式(XX)的化合物一般可通过将通式(XVIII)或(XIX)的化合物与通式(V5)的化合物在一种溶剂中如果需要在一种碱或一种催化剂存在下反应得

到。

使用的溶剂和碱可与方法 6 中所用的相同。可使用的催化剂为亚磺酸盐如甲基亚磺酸钠或对-甲苯亚磺酸钠，或其水合物。反应温度在 0 °C ~ 反应系统的回流温度的范围内，更好为 10 ~ 100 °C。反应时间依据特定的化合物而定，但可设定在 10 分 ~ 20 小时内。

#### 方法 9



在上面的通式中，n 是 1 或 2；A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> 和 R<sup>4</sup> 按上面的定义。

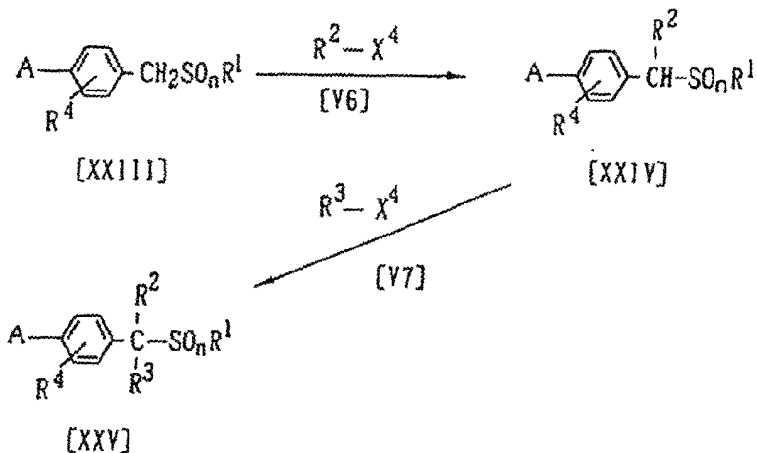
即本发明通式(XXII)的一种新化合物可通过将 1 摩尔本发明通式(XXI)的化合物与 1.0~10.0 摩尔的氧化剂在 0 ~ 5 升的溶剂，如果需要在 0.01~1.0 摩尔的催化剂存在下反应获得。

氧化剂可以是如过氧化氢，间氯过苯甲酸、高碘酸钠、OXONE (一种含过氧化硫酸氢钾的试剂的商品名，由 E.I.Dupont 生产)，N-氯代琥珀酰亚胺、N-溴代琥珀酰亚胺、次氯酸叔丁酯或次氯酸钠。催化剂可以是如钨酸钠。

使用的溶剂可以是如醚类，芳烃，质子惰性极性溶剂，醇，卤化烃或脂族烃，与方法 1 中使用的相同，还有乙酸、水或酮类如丙酮、甲基乙基酮或环己酮、或一种上面的溶剂混合物。

反应温度在 -20 °C ~ 反应系统回流温度的范围内，更好为 10 ~ 100 °C。反应时间依据特定化合物而定，但可设定在 10 分 ~ 20 小时内。

## 方法 10

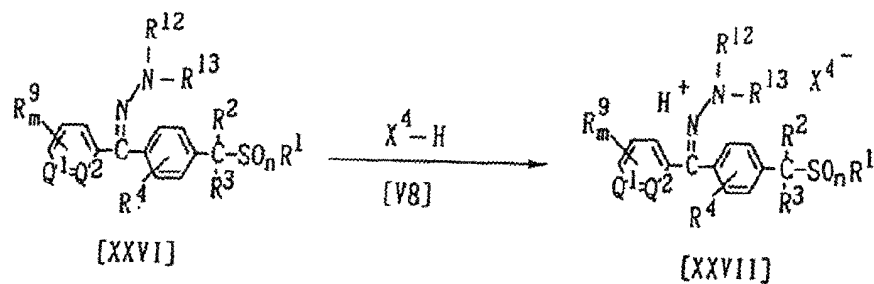


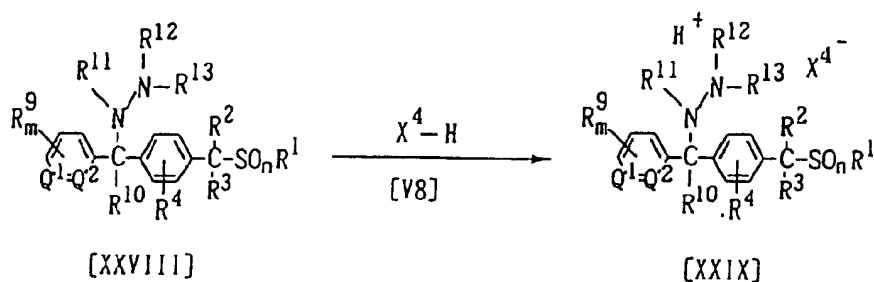
- 5 在上述以反应通式中， $\text{R}^2$ 和 $\text{R}^3$ 彼此独立， $\text{R}^2$ 和 $\text{R}^3$ 各是 $\text{C}_{1-4}$ 烷基或 $\text{C}_{1-3}$ 卤代烷基； $\text{A}$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^4$ 和 $n$ 按上面的定义； $\text{R}^4$ 是卤原子、 $\text{C}_{1-4}$ 烷基磺酰氧基或苯磺酰氧基(可被一个甲基取代)

- 10 即分子式(XXIV)的化合物可通过将 1 摩尔分子式(XXIII)的化合物与 1.0~5.0 摩尔的烷基化剂在 0 - 5 升的一种溶剂和 1.0~3.0 摩尔的碱中反应而得。随后这种化合物(XXIV)在分离后或未分离时与 1.0~5.0 摩尔分子式(V7)的烷基化试剂在 0 - 5 升的溶剂和 1.0~3.0 的碱中反应得到分子式(XXV)的化合物。

在这些反应中使用的溶剂和碱可与方法 6 中所用的相同。反应温度在 $-30\text{ }^\circ\text{C}$ ~反应系统的回流温度的范围内，更好为 $0\text{ }^\circ\text{C}$ ~ $100\text{ }^\circ\text{C}$ 。

## 15 方法 11





在上述反应通式中,  $X^4$  是卤原子、 $C_{1-4}$  烷基磺酰氧基或苯基磺酰氧基(可被甲基取代);  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $m$  和  $n$  按上面定义。

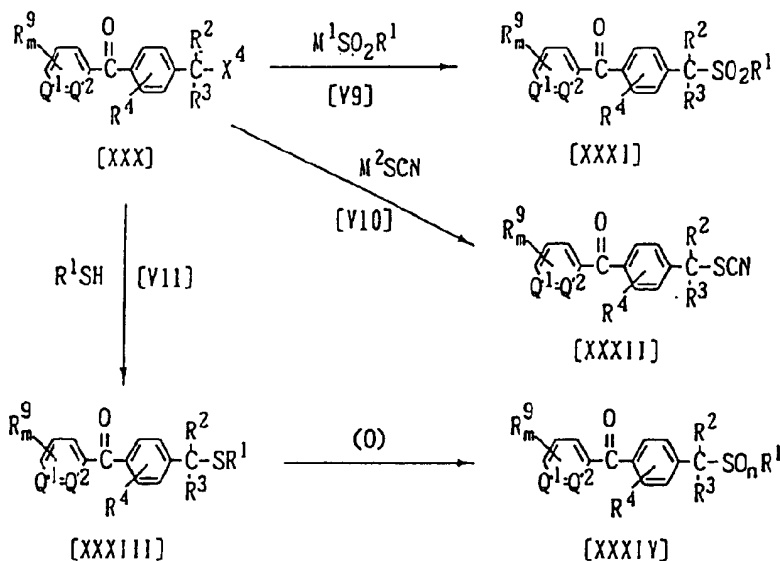
- 5 即本发明的化合物(XVII)或(XIX)的盐可通过将1摩尔本发明通式(XXVI)或(XXVIII)的化合物与1.0~3.0摩尔通式(V8)的酸在0.1~5升的溶剂中反应而得。

在这一反应中使用的溶剂可与方法1所用的相同。反应温度在 $-30\text{ }^\circ\text{C}$ ~反应系统的回流温度的范围内,更好为 $0\text{ }^\circ\text{C}$ ~ $100\text{ }^\circ\text{C}$ 。

上面通式(II)和(III)的新颖中间体可根据下面的方法12~20制备。

10

### 方法12



- 15 在上述反应通式中,  $R^1$  是  $C_{1-6}$  烷基、 $C_{1-4}$  氰烷基、 $C_{1-4}$  羟烷基、 $C_{3-6}$  环烷基、 $C_{1-6}$  卤代烷、苯基(可被卤原子或  $C_{1-4}$  烷基取代)、苄基(可被卤原子取代)或噻唑基;  $X^4$  是卤原子、 $C_{1-4}$  烷基磺酰氧基或苯磺酰氧基(可被一个甲苄取代);  $M^1$  是碱金属;  $M^2$  是碱金属或铵离子;  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $m$ 、 $Q^1$  和  $Q^2$  按上面定义;  $n$  是1或2。

即分子式(XXXI)的苄基砜衍生物可通过将 1 摩尔分子式(XXX)的苄基卤化物与 1.0~3.0 分子式(V9)的亚磺酸盐金属盐在 0 ~ 10 升的溶剂中反应得到。

在此使用的溶剂可以是如醚、芳烃、质子惰性的极性溶剂、醇、卤化烃、脂族烃或水、或上面溶剂的混合物。反应温度在 0 °C ~ 反应系统中的回流温度的范围内, 更好为 10 ~ 100 °C。

在此所用的亚磺酸盐可能是化学试剂, 或可用一般的方法制备(如在 J.Chem. Soc., Vol. 636(1945)或在 J.A.Chem. Soc. Vol. 96, No. 7 P2275(1974)中揭示的方法)。

在相似的反应条件下, 由通式(XXX)的化合物和通式(V10)的硫氰酸盐反应而得通式(XXXII)化合物。

进一步可通过将 1 摩尔通式(XXX)的化合物与 1.0~3.0 摩尔分子式(V11)的硫醇在含有 1.0~3.0 摩尔的一种碱存在下在 0 ~ 5 升溶剂中反应得到通式(XXXIII)的硫化物。

溶剂和碱与方法 6 中所用的相同。反应温度在 -10 °C ~ 反应系统中的回流温度的范围内, 更好为 0 ~ 100 °C。

本发明通式(XXXIV)的化合物可通过将 1 摩尔的通式(XXXIII)的化合物与 1.0~10.0 摩尔氧化剂在 0 ~ 5 升的溶剂, 如果需要在 0.01~1.0 摩尔的一种催化剂存在下反应而得。

氧化剂可以是如过氧化氢、间氯过苯甲酸、高碘酸钠、OXONE(一种由 E.I.DuPont 生产的含过硫酸氢钾的试剂的商品名)、N-氯代琥珀酰亚胺、N-溴代琥珀酰亚胺、次氯酸叔丁酯或次氯酸钠。

催化剂可以是如钨酸钠。

在此使用的溶剂可以是与方法 1 中相同的如醚、芳烃、质子惰性的极性溶剂、醇、卤化烃、脂族烃、还有乙酸、水或酮如丙酮、甲基乙基酮或环己酮, 或一种上面溶剂的混合物。

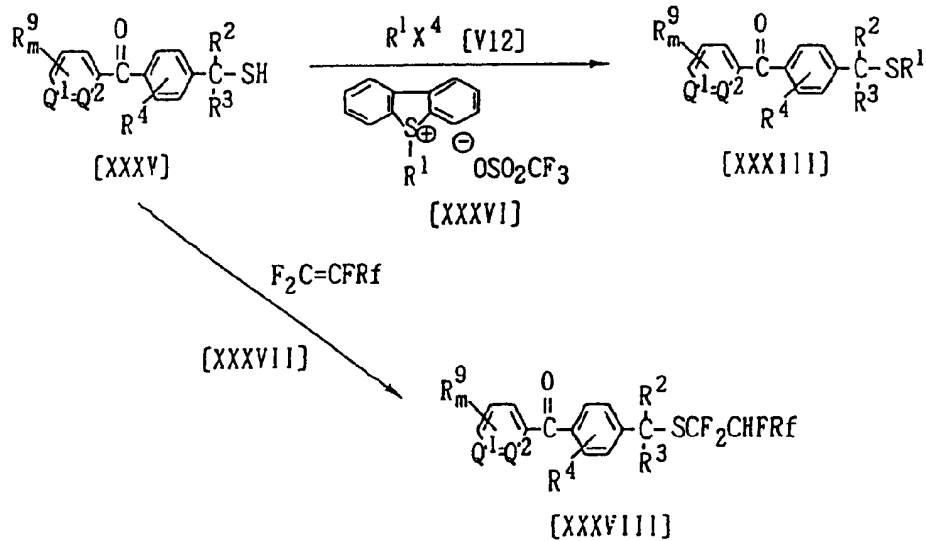
反应温度在 - 20 °C ~ 反应系统中的回流温度的范围内, 更好为 10 ~ 100。

一般已知作为原料的分子式(XXX)的苄基卤化物, 可按普通方法制备(如在 Org. Synth., Vol. 4, P. 921(1963)中揭示的一种方法), 即将芳基羰基甲苯上的甲苯用卤化剂(如氯、溴、N-氯代琥珀酰亚胺、N-溴代琥珀酰亚胺、磺酰氯或磺酰溴)卤化。

芳基羰基甲苯一般可通过将甲苯与一种芳基羧酸卤化物在路易氏酸如氯化铝存在下反应制得。



方法 13:



在上述反应通式中，R<sup>1</sup>是C<sub>1-6</sub>烷基、C<sub>3-6</sub>环烷基、C<sub>1-6</sub>卤代烷基、C<sub>1-4</sub>氰  
 5 烷基或C<sub>1-4</sub>羟烷基；R<sub>f</sub>是氟原子或全氟烷基；R<sup>4</sup>是卤原子、C<sub>1-4</sub>烷基磺酰氧基  
 或苯磺酰氧基(可被一个甲基取代)；R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、m、Q<sup>1</sup>和Q<sup>2</sup>按上面定义；  
 n是1或2。

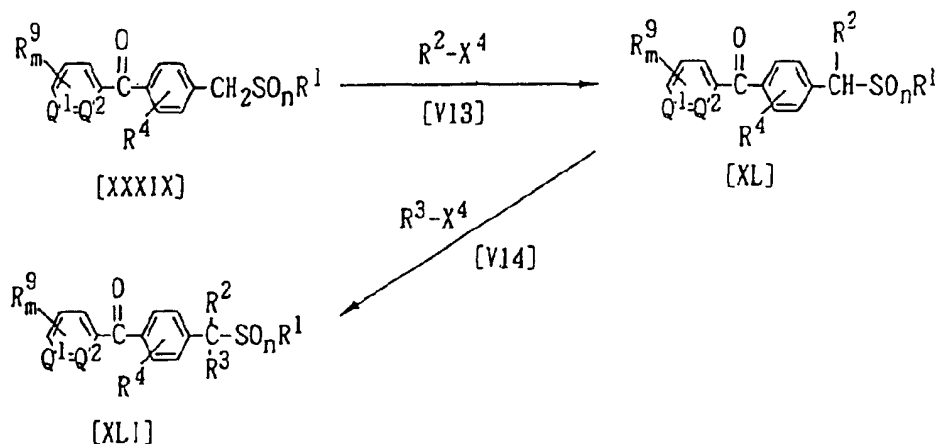
10 通式(XXXIII)或(XXXVIII)的硫化物可通过将1摩尔通式(XXXV)的苄硫醇  
 与1.0~3.0摩尔的通式(V12)的烷化剂和通式(XXXVI)的二苯噻吩三氟甲磺酸  
 盐。或通式(XXXVII)的全氟烯烃，如果有需要1.0~3.0摩尔的碱存在于0~  
 10升溶剂中反应制得。

在此使用的碱和溶剂与方法6中所用的相同。反应温度在0℃~反应系统  
 中的回流温度的范围内，更好为10~150℃。

通过氧化由与方法12相同的氧化方法得到的通式(XIII)或(XVIII)的硫化  
 物，便可得相应的亚砷或砷衍生物。

15 已知可用作原料的通式(XXXV)的苄硫醇，可根据普通的方法(如在Org. Synth.,  
 Vol. 3, P. 363(1955)中揭示的一种方法)或相似的方法制备。即可通过将在方法  
 12中作为原料的分子式(XXX)的苄基卤化物与硫化钠反应，或在硫脲和碱存在  
 下反应，随后和解。

方法 14:

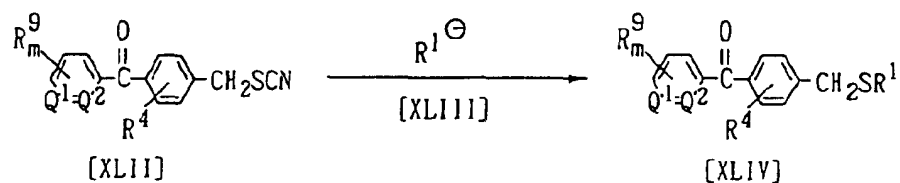


在上述反应通式中,  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $Q^1$ 和 $Q^2$ 按上面定义;  $R^2$ 和 $R^3$ 各是烷基或卤代烷基;  $X^4$ 是卤原子,  $C_{1-4}$ 烷磺酰氧基或苯磺酰氧基(可被甲基取代)。

即通式(XL)或(XVI)的化合物可通过将 1 摩尔通式(XXXIX)的化合物与 1.0~5.0 摩尔通式(V13)或(V14)的烷化剂在 0 ~ 5 升溶剂中和 1.0~3.0 摩尔的碱中反应得到。当  $X^4$ 在  $R^1$ 的侧链上存在时,  $R^1$ 和  $R^2$ 与硫和碳原子的形成一个  $R_1$ 和  $R_2$ 分别连接在其上的含有一个或多个杂原子的三~八元环。

在此所用的碱和溶剂与方法 6 中所用的相同。反应温度在 0 °C - 反应系统中回流温度的范围内, 更好为 10 ~ 150 °C。

方法 15:



在上述反应通式中,  $R^4$ 、 $R^9$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $Q^1$ 和 $Q^2$ 按上面的定义;  $R^1$ 是烷基或卤代烷基。

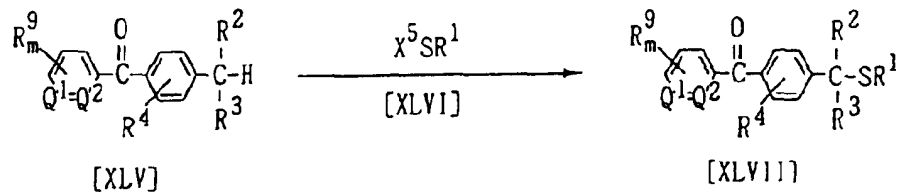
即通式(XLIV)的化合物可通过将 1 摩尔本发明式(XLII)的化合物与 1.0~5.0 摩尔通式(XLIII)的阴碳离子在 0 ~ 10 升溶剂中反应制得。制备分子式(XLIII)的阴碳离子的方法可以是如 1) 一种将 1.0~15.0 摩尔三卤代甲烷与 1.0~15.0 摩尔的碱在 0.01~1.0 摩尔相转移催化剂如四烷基铵盐、苄基三烷基铵盐、四烷基磷盐或一种冠醚存在下接触的方法, 2) 一种将 1.0~15.0 摩尔的(三烷基甲硅烷基)烷基卤化物与 1.0~15.0 摩尔氟化物如氟化钾或四丁氟化铵接触的方法, 或 3) 一种将

1.0~5.0 摩尔烷基卤化物或卤代烷基卤化物与 1.0~5.0 摩尔金属如锂、钠、铜或锌、或与有机金属化合物如二异丙基酰胺锂、苯基锂或丁基锂的接触方法。

使用的溶剂可以是如醚、芳烃、一质子惰性极性溶剂、醇、一脂族烃或水、或上述溶剂的混合物。

- 5 反应温度在 -70 °C ~ 反应系统中回流温度的范围内，更好为 -50~50 °C。

方法 16:



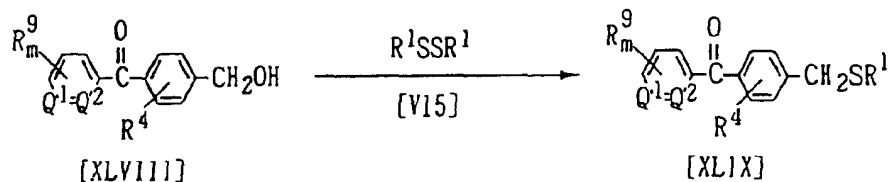
- 在上述反应通式中，R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>9</sup>、m、n、Q<sup>1</sup>和Q<sup>2</sup>按上述定义；  
10 X<sup>5</sup>是卤原子、氰基或通式SR<sup>1</sup>的基团；R<sup>1</sup>是烷基或卤代烷基。

即，通式(XLVII)的化合物可通过 1 摩尔本发明通式(XLV)的化合物与 1.0~5.0 摩尔通式(XLVI)的化合物在 0 ~ 5 升的溶剂和 1.0~5.0 摩尔的碱中反应得到。

在此使用的碱和溶剂与方法 6 中所用的相同。

- 15 反应温度在 - 70 °C ~ 反应系统回流温度的范围内，更好为 - 50 ~ 50 °C。

方法 17:



在上述反应通式中，R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>9</sup>、m、n、Q<sup>1</sup>和Q<sup>2</sup>按上面的定义。

- 20 即本发明通式(XLIV)的化合物可通过将 1 摩尔通式(XLVIII)的苄醇与 1.0~3.0 摩尔二烷基氨基氯化磷通常在一种溶剂和一种碱存在下即在 0.1~0.5 升溶剂和 1.0~3.0 摩尔的碱存在下反应制得，随后与 1.0~5.0 摩尔通式(V15)的二硫化物在 0 ~ 5 升的溶剂中反应。

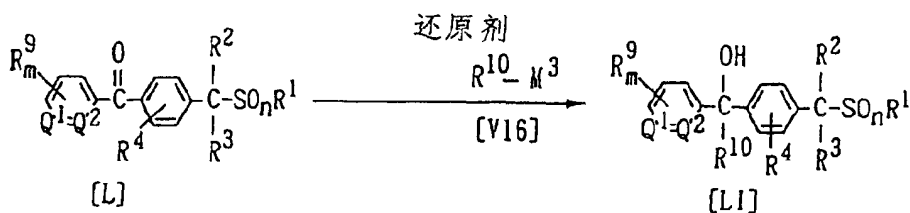
- 25 此处所用的溶剂可以是如醚如乙醚、四氢呋喃或二噁烷，芳烃如苯、甲苯、二甲苯或氯苯、质子惰性极性溶剂如 N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、二甲基亚砷或四氢噻吩砷，卤化烃如二氯甲烷或氯仿，腈如乙腈或丙腈、酯如乙酸乙酯或丙酸丙酯、脂族烃如戊烷、己烷、环己烷或庚烷、吡啶类如吡啶或甲基吡啶、或上述溶剂的混合物。

碱可以是如无机碱如碱金属氢氧化物如氢氧化钠或氢氧化钾、碱土金属氢氧化物如氢氧化钙或氢氧化镁、碱金属碳酸盐如碳酸钠或碳酸钾、碱金属碳酸氢盐如碳酸氢钠或碳酸氢钾、金属氢化物如氢化钠或氢化钾，或有机碱如三乙胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶、4-N,N-二甲基氨基吡啶或1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯。

反应温度在 $-40\text{ }^{\circ}\text{C}$ ~反应系统回流温度的范围内，更好为 $-30\text{ }^{\circ}\text{C}$ ~ $50\text{ }^{\circ}\text{C}$ 。

反应时间依据特定的化合物而定，但可设定在10分~20小时内。

方法 18:



10

在上述反应通式中， $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $M^3$ 、 $m$ 和 $n$ 按上面的定义。

即本发明通式(LI)的化合物可通过将本发明通式(L)化合物与1.0~50.0摩尔还原剂在0~5升溶剂，如果需要在0.01~0.1摩尔催化剂存在下反应。或将其与1.0~5.0摩尔分子式(V16)的烷基金属化合物反应后得到。

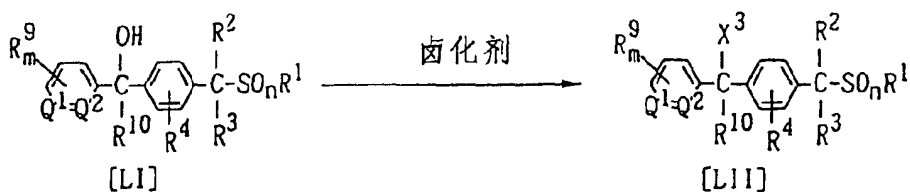
还原剂可以是如氢分子、硼氢化钠、氢化铝锂或氢化铝或氢化二异丁基铝。

在此使用的溶剂可以是如醚、芳烃、质子惰性极性溶剂、醇、脂族烃、乙酸或水、或上述溶剂的混合物。

反应温度在 $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ ~反应系统回流温度的范围内，更好为 $10\text{ }^{\circ}\text{C}$ ~ $100\text{ }^{\circ}\text{C}$ 。

20 反应时间依据特定反应物而定，但可设定在10分~20小时内。

方法 19:



25 在上述反应通式中， $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $m$ 和 $n$ 按上面的定义； $X^3$ 是氯原子或溴原子。

本发明通式(LII)的新化合物可通过将1摩尔本发明分子式(LI)的化合物与

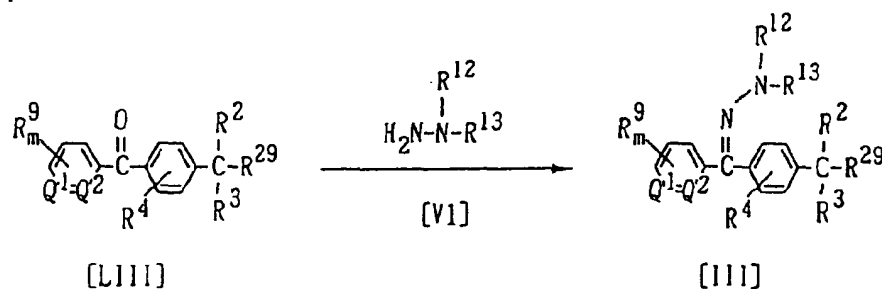
1.0~10.0 摩尔卤化剂在 0 - 5 升溶剂中反应而得。

卤化剂可以是如氯化氢、溴化氢、三氯化磷、三溴化磷、亚硫酰氯、四氯化碳与三苯基膦混合物或三苯基膦与溴的混合物。

5 在此使用的溶剂可是醚类如乙醚、四氢呋喃或二噁烷，芳烃如苯、甲苯、二甲苯或氯苯，卤化烃如二氯甲烷或氯仿，腈如乙腈、或丙腈、脂族烃如戊烷、己烷、环己烷或庚烷，或上述溶剂的混合物。

反应温度在 0 °C ~ 反应系统回流温度范围内，更好为 10 ~ 180 °C。反应时间依据特定的化合物而定，但可设定在 10 分 - 20 小时内。

10 方法 20:



在上面的分子式中， $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^9$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{29}$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$ 和 $m$ 按上面的定义。

15 即本发明通式(III)的化合物可通过将 1 摩尔通式(LIII)的二苯酮与 1.0 - 10.0 摩尔通式(VI)的脒或其水合物在 0 - 5 升溶剂，如果需要在 0.01 - 1.0 摩尔酸催化剂存在下反应得到。

在此使用的溶剂和酸催化剂与方法 1 所用的相同。

反应温度在 - 10 °C - 反应系统回流温度范围内，更好为 0 - 100 °C。

进行本发明的最好模式

20 现结合制备实施例、配方实施例和试验实施例详细描述本发明。

#### 制备实施例 1

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯酮-N'-乙氧羰基脒(化合物 No.I - 175)

25 将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯酮(0.5 克)和脒基甲酸乙酯(0.4 克)加入到乙醇(40 毫升)和乙酸(5 毫升)中，将该混合物回流搅拌 19 小时。浓缩反应混合物，余渣用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗随后用无水硫酸镁干燥。在减压蒸馏下蒸馏出乙酸乙酯。余渣用硅胶柱色层(分离)法(正己烷:乙酸乙酯 = 4:1)提纯，得到所需的产物(0.6 克，熔点: 148 - 150 °C，收率: 96 %)。

30

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

1.30	(3H, t)
4.23	(2H, q)
4.35, 4.53	(2H, s, s)
7.03-7.80	(9H, m)

#### 制备实施例 2

4-氯-4'-甲基磺酰基甲基-二苯酮-脞(化合物 No.I-2)的制备。

- 5 将 4-氯-4'-甲基磺酰基甲基二苯酮(10.0 克)和水合肼(4.9 克)加入到乙醇(200 毫升)和乙酸(10 毫升)中, 回流搅拌该混合物 6 小时, 浓缩反应混合物, 余渣用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗, 随后用无水硫酸镁干燥。在减压蒸馏下蒸出乙酸乙酯。余渣用硅胶柱色层(分离)法(正己烷:乙酸乙酯 = 2:1)提纯得到所需产物(10.0 克, 熔点: 52 - 53 °C, 产率 97 %).

10 <sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.73	(3H, s, s)
4.20, 4.30	(2H, s, s)
5.50	(2H, s, s)
7.05-7.70	(8H, m)

#### 制备实施例 3

4-氯-4'-甲基磺酰基甲基二苯酮-N'-丙酰脞(化合物 No.I-15)的制备。

- 15 4-氯-4'-甲基磺酰基甲基二苯酮-脞(1.3 克), 丙酰氯(0.4 克)和碳酸钾(0.7 克)加入到乙酸乙酯(150 毫升)和水(100 毫升)中, 将混合物在室温下搅拌 2 小时。对反应混合物进行液体层分离, 乙酸乙酯层用水清洗然后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣用硅胶色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 2 : 1)提纯, 得到所需的产物(1.3 克, 熔点 159 - 160 °C, 产率 86 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

1.23	(3H, t)
2.85-3.00	(5H, m)
4.30	(2H, s)
7.00-8.00	(8H, m)
8.25	(1H, br)

20

#### 制备实施例 4

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮-脞(化合物 No.I-136)的制备。

将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯酮(2.5 克), 水合肼(4.3 克)和对甲苯磺

酸一水化物(0.2 克)加入到乙醇(30 毫升)中, 混合物在回流条件下搅拌 3 小时。浓缩反应混合物, 余渣用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层水清洗随后用无水硫酸镁干燥。在减压蒸馏下蒸去乙酸乙酯。余渣用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 2: 1)提纯, 得到所需的产物(2.2 克,  $n_D^{20}=1.5871$ , 收率: 85 % )。

5  $^1\text{H}$  - 核磁共振数据(60MHz,  $\text{CDCl}_3$  溶剂,  $\delta$  值)

4.43, 4.53	(3H, s, s)
5.47, 5.53	(2H, s, s)
7.07-7.60	(8H, m)

#### 制备实施例 5

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮-N'-丙酰脲(化合物 No.I-149)的制备。

10 将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯酮脲(0.9 克), 丙酰氯(0.22 克)和碳酸钾(0.4 克)加入到乙酸乙酯(100 毫升)和水(100 毫升)组成的溶剂中, 分离混合物液体层, 乙酸乙酯层用水清洗随后用无水硫酸镁干燥。将乙酸乙酯在减压下蒸去。余渣固体用正己烷清洗, 得到所需产物(0.75 克, 熔点: 130 - 132 °C, 收率: 75 % )。

$^1\text{H}$  - 核磁共振数据(60MHz,  $\text{CDCl}_3$  溶剂,  $\delta$  值)

1.20	(3H, t)
2.6 - 3.00	(2H, m)
4.47	(2H, d)
7.03-7.63	(8H, m)
8.22	(1H, d)

15

#### 制备实施例 6

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮'-(1-氯亚丙基)脲(化合物 No.II-14)的制备。

20 将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基-二苯酮-丙酰脲(1.7 克), 三苯膦(1.5 克)和四氯化碳(1.2 克)加入到乙腈(80 毫升)中, 混合物在回流下搅拌 10 分钟。浓缩反应混合物, 余渣用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 10: 1)提纯, 得到所需产物(1.7 克, 熔点: 108 - 109 °C, 收率: 97 % )。

$^1\text{H}$  - 核磁共振数据(60MHz,  $\text{CDCl}_3$  溶剂,  $\delta$  值)

1.05, 1.10	(3H, t, t)
2.50, 2.55	(2H, q, q)
4.47	(2H, s)
7.00-7.85	(8H, m)

## 制备实施例 7

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮'-[1-(1-H-1,2,4-三唑-1-基)亚丙基]脞(化合物 No.II-10)的制备。

5 将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮'-(1-氯亚丙基)脞(1.0 克)、1-H-1,2,4-三唑(0.2 克)、碳酸钾(0.4 克)和甲苯磺酸钠(0.3 克)加入到 N,N-二甲基甲酰胺(70 毫升)中,混合物在 95 - 100 °C 温度下搅拌 7 小时。将反应混合物冷却至室温,再加入水。混合物用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗,随后用无水硫酸镁干燥。减压蒸馏乙酸乙酯。余渣用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷:乙酸乙酯 = 6: 1)提纯,获得所需产物(0.7 克,  $n_D^{20}=1.5978$ , 收率: 66 %)。

10  $^1\text{H}$  - 核磁共振数据(60MHz,  $\text{CDCl}_3$  溶剂,  $\delta$  值)

1.28	(3H, t)
3.28	(2H, q)
4.52	(2H, s)
7.05-7.86	(8H, m)
7.95	(1H, s)
8.40, 8.52	(1H, s, s)

## 制备实施例 8

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮'-[1-(N-甲基氨基)亚乙基]脞(化合物 No.II-8)的制备。

15 将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮'-(1-氯亚乙基)脞(0.7 克)和 40 % 甲胺水溶液(0.3 克)加入到二甲苯(50 毫升)中,混合物在回流下搅拌 1 小时。浓缩反应混合物,余渣用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗,随后用无水硫酸镁干燥。乙酸乙酯在减压下蒸馏。余渣用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷:乙酸乙酯 = 1: 1)提纯,获得所需产物(0.6 克, 熔点: 58 - 60 °C, 收率: 87 %)。

20  $^1\text{H}$  - 核磁共振数据(60MHz,  $\text{CDCl}_3$  溶剂,  $\delta$  值)

2.00, 2.20	(3H, s, s)
2.67, 2.94	(3H, d, d)
4.46	(2H, s)
6.30	(1H, br)
6.95-7.78	(8H, m)

## 制备实施例 9

4-氯-4'-乙基磺酰基-甲基二苯酮-N'-异亚丙基脞(化合物 No.II-35)的制备。

25 将 4-氯-4'-乙基磺酰基-甲基二苯酮脞(0.7 克)加入到丙酮(30 毫升)中,混合物在回流下搅拌 30 分钟。浓缩反应混合物,即获得所需产物(0.7 克,  $n_D^{20}=1.6163$ ,



收率: 88 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

1.34	(3H, t)
2.00	(6H, s)
2.90	(2H, q)
4.20	(2H, s)
7.00-7.67	(8H, m)

#### 制备实施例 10

- 5        4-氯-4'-甲硫甲基二苯酮-N'-[1-(N,N-二甲基氨基)亚乙基]胺(化合物 No.II-22)的制备。

10        将 4-氯-4'-甲硫甲基二苯酮-胺(2.0 克)和甲基乙酰胺-二甲基乙缩醛(1.4 克)加入到乙醇(100 毫升)中, 回流搅拌混合物 6 小时。浓缩反应混合物, 用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗, 随后用无水硫酸镁干燥。乙酸乙酯在减压下蒸馏。余渣用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 6: 1), 获得所需的产物, 为淡黄色透明粘稠液体(2.0 克, 收率: 81 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.00	(3H, s)
2.35	(3H, s)
2.88	(6H, s)
3.66, 3.70	(2H, s, s)
7.03-7.75	(8H, m)

#### 制备实施例 11

- 15        4-氯-4'-甲基磺酰基甲基二苯酮-缩氨基脲(化合物 No.I-42)的制备。

20        将 4-氯-4'-甲基磺酰基甲基二苯酮-胺(1.3 克)和异氰酸氯磺酰酯(0.63 克)加入到乙酸乙酯(100 毫升)中, 混合物在室温下搅拌 1 小时。随后加入水, 混合物在室温下继续搅拌 16 小时。分出反应混合物液体层, 乙酸乙酯层用水清洗, 随后用无水硫酸镁干燥。乙酸乙酯在减压下蒸馏。用乙酸乙酯: 正己烷 = 4: 1 的混合溶剂洗提余渣, 获得所需的产物, (1.2 克, 熔点: 189 - 191 °C, 收率: 80 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.87, 2.97	(3H, s,s)
4.34, 4.50	(5H, m)
7.10-7.70	(8H, m)

## 制备实施例 12

4-氯-4'-甲硫甲基二苯酮-N'-乙氧羰基-N'-甲基脲, (化合物 No.I-4)的制备.

将 4-氯-4'-甲硫甲基二苯酮-N'-乙氧羰基脲(4.3 克)溶解在 N,N-二甲基甲酰胺(100 毫升)中, 在此溶液中加入 60 % 氢氧化钠(0.6 克), 混合物在室温下搅拌 30 分钟. 随后加入甲基碘(2.5 克), 在室温下继续搅拌 16 小时. 在反应混合物中加入水, 混合物用乙酸乙酯萃取. 乙酸乙酯层用水洗清, 随后用无水硫酸镁干燥. 在减压下蒸出乙酸乙酯. 余渣用硅胶柱色层(分离)(正己烷: 乙酸乙酯 = 5: 1)提纯, 获得所需产物, (4.3 克,  $n_D^{20}=1.6042$ , 收率: 89 %).

$^1\text{H}$  - 核磁共振数据(60MHz,  $\text{CDCl}_3$  溶剂,  $\delta$  值)

1.17	(3H, t)
2.00	(3H, s)
2.79, 3.00	(3H, s, s)
3.63, 3.67	(2H, s, s)
4.04	(2H, q)
7.07-7.57	(8H, m)

10

## 制备实施例 13

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮-4-丁基缩氨基脲(化合物 No.I-171)的制备.

将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基-二苯酮脲(1.2 克)三乙胺(0.5 克)和异氰酸丁酯(0.6 克)加入到四氢呋喃(30 毫升)中, 混合物在室温下搅拌 16 小时. 浓缩反应混合物, 余渣用乙酸乙酯萃取. 乙酸乙酯层用 2N 盐酸和水洗, 随后用无水硫酸镁干燥. 在减压下蒸出乙酸乙酯. 余渣采用硅胶柱色层(分离)(正己烷: 乙酸乙酯 = 4: 1)提纯, 获得所需的产品, (0.6 克, 熔点: 169 - 181  $^{\circ}\text{C}$ , 收率: 40 %).

20

$^1\text{H}$  - 核磁共振数据(60MHz,  $\text{CDCl}_3$  溶剂,  $\delta$  值)

0.75-1.65	(7H, m)
3.15-3.50	(2H, m)
4.50	(2H, s)
6.20	(1H, br)
6.90-7.70	(9H, m)

## 制备实施例 14

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基-甲基二苯酮-N'-甲基磺酰基亚氨基甲基脲(化合物 No.I-137)的制备.

将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基-二苯酮脲(1.2 克)、三乙胺(1.6 克)和 N-甲基

25

磺酰基甲酰亚胺酸乙基(1.26 克)加入到二噁烷(30 毫升)中, 在回流下搅拌混合物 5 小时。浓缩反应混合物, 余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 1: 1)提纯, 获得所需产物, (0.8 克, 熔点: 63 - 65 °C, 收率: 52 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.95, 3.05	(3H, s, s)
4.45, 4.60	(2H, s,s)
4.95	(1H, br)
7.10-7.80	(8H, m)
8.80	(1H, br)

5

#### 制备实施例 15

4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯酮-N'-甲基磺酰基脒(化合物 No.I-182)的制备。

10 将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯酮脒(1.2 克)和三乙胺(0.4 克)溶解在乙酸乙酯(30 毫升)中, 在室温向此溶液中滴加甲磺酰氯(0.4 克), 搅拌混合物 1 小时。反应混合物用 2N 盐酸和水洗, 随后用无水硫酸镁干燥。减压下蒸出乙酸乙酯。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 4: 1)提纯, 获得所需产物, (0.5 克, 熔点: 64 - 65 °C, 收率: 36 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

3.50	(3H, s)
4.50	(2H, d)
7.10-7.70	(9H, m)

#### 15 制备实施例 16

4-氯-4'-甲基亚磺酰基甲基二苯酮-N'-丙酰脒(化合物 No.I-14)的制备。

20 将 4-氯-4'-甲硫甲基二苯酮-N'-丙酰脒(0.8 克)和高碘化钠(0.5 克)加入到甲醇(50 毫升)和水(7 毫升)中, 混合物在室温搅拌 16 小时。浓缩反应混合物, 余渣用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗, 随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸馏出乙酸乙酯。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 10: 1)提纯, 获得所需产物, (0.7 克, 熔点: 153 - 156 °C, 收率: 84 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

1.21	(3H, t)
2.43, 2.56	(3H, s,s)
2.85	(2H, q)
3.93, 4.00	(2H, s, s)
6.96-7.70	(8H, m)
8.23	(1H, br)

## 制备实施例 17

5 4-氯-4'-(2-甲基磺酰基-2-丙基)二苯酮-N'-己醇基-N'-甲基脞(化合物 No.I-128)的制备。

10 将 4-氯-4'-甲基磺酰基甲基二苯酮-N'-己醇基脞(1.4 克)、甲基碘(5.6 克)和 60 % 氢氧化钠(0.15 克)加入到 N,N-二甲基甲酰胺(80 毫升)中, 在室温搅拌混合物 16 小时。在反应混合物中加入水, 用乙酸乙酯萃取混合物。将乙酸乙酯层用水洗, 随后用无水硫酸镁干燥。减压下蒸出乙酸乙酯。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 2 : 1)提纯, 获得所需产物, (0.8 克, 熔点: 94 - 96 °C, 收率: 53 % )。

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

0.9	(3H, m)
1.10-1.93	(6H, m)
1.87	(6H, s)
2.16-2.67	(2H, m)
2.57-2.76	(3H, s)
3.09	(3H, s)
7.05-7.73	(8H, m)

## 制备实施例 18

15 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯甲基脞(化合物 No.V-8)的制备。

20 将水合脞(50 毫升)和 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯甲基氯化物加入到甲苯(80 毫升)中, 在搅拌下逐渐加热混合物。在 80 °C 搅拌 2 小时。随后冷却, 再倒入水中。加入 250 毫升乙酸乙酯进行萃取, 萃取物用水清洗, 随后用无水硫酸镁干燥。减压下蒸出溶剂, 获得的产品为淡黄色粘稠性物质(2.9 克, n<sub>D</sub><sup>20</sup>=1.5671, 收率: 82.4 % )。

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

3.83	(2H, br)
4.38	(2H, s)
4.83	(1H, s)
6.96-7.50	(8H, m)

## 制备实施例 19

25 N-(4-氯-4'-三氟甲基磺酰基二苯甲基)-N'-甲氧羰基脞盐酸盐(化合物 No.V-13)的制备。

将 N-(4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基-二苯甲基)-N'-甲氧羰基肼(1.6 克)加入到甲醇(80 毫升)中, 在室温、搅拌下加入盐酸(3 毫升), 逐渐加热混合物至回流温度, 并在回流下搅拌 2 小时, 随后冷却, 减压下蒸出溶剂, 获得的所需产物, 为淡黄色粉末(1.6 克, 熔点: 52 - 54 °C, 收率: 91.5 %).

5 <sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

3.6	(3H, s)
4.73	(2H, s)
5.23	(1H, s)
7.27-7.50	(8H, m)

#### 制备实施例 20

4-氯-4'-乙硫甲基二苯酮-N'-乙氧羰基脒(化合物 No.I-114)的制备.

10 将乙硫醇(1.2 克)和氢氧化钠(1 克)悬浮于 N,N-二甲基甲酰胺中, 随后加入 4-氯-4'-氯甲基二苯酮-N'-乙氧羰基脒(3.5 克), 将混合物在室温下搅拌 16 小时, 在反应混合物中加入水, 用乙酸乙酯萃取混合物. 乙酸乙酯层用水洗, 随后用无水硫酸镁干燥. 在减压下蒸馏出乙酸乙酯. 余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 4: 1), 获得所需产物(2.0 克, n<sub>D</sub><sup>20</sup>=1.6198, 收率: 53 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

1.34	(6H, t)
2.53	(2H, q)
3.70, 3.80	(2H, q)
7.10-7.77	(8H, m)

#### 15 制备实施例 21

4-氯-4'-二氟甲硫甲基二苯酮-N'-甲氧羰基脒(化合物 No.I-187)的制备.

20 将 4-氯-4'-硫甲基二苯酮-N'-甲氧羰基脒(1.5 克)和氢氧化钾(1.5 克)加入到由二噁烷(30 毫升)和水(30 毫升)所成的溶剂中. 在 40 °C, 向溶液吹入二氟氯甲烷直到起始原料 4-氯-4'-硫甲基二苯酮-N'-甲氧羰基脒消失. 冷却反应混合物至室温, 然后过滤. 作为滤液的有机层用无水硫酸镁干燥. 余渣采用硅胶色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 4: 1)提纯, 获得所需产物(0.3 克, n<sub>D</sub><sup>20</sup>=1.6213, 收率: 18 %).

<sup>1</sup>H - 核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

3.78	(3H, s)
3.98, 4.10	(2H, s, s)
6.7, 6.8	(1H, t)
7.07-7.67	(8H, m)
7.77	(1H, s)

## 制备实施例 22

4-氯-4'-甲硫甲基二苯酮-N'-甲氧羰基脲(化合物 No. I - 67)的制备

5 将 4-氯-4'-羟基甲基二苯酮-N'-甲氧羰基脲(1.2 克)与三乙胺 ( 0.5 克) 加入  
到四氢呋喃 ( 30 毫升)中。在-20 ℃ 向此溶液滴加氯二(二乙基氨基膦)(1.1 克)。混合物  
在室温搅拌 2 小时, 随后在减压下蒸馏出溶剂。加入冰水和乙酸乙酯进行液体分离。  
10 有机层用无水硫酸镁干燥, 浓缩后获得一种亚磷酸盐。将亚磷酸盐加入到四氢呋喃(30  
毫升)中。在 0 ℃ 向此溶液滴加二甲硫, 混合物在室温继续搅拌 12 小时。确定原料亚  
磷酸盐消失后, 在减压下蒸馏出溶剂。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸  
乙酯 = 4: 1)提纯, 获得所需的产物(0.3 克, 熔点: 40 - 42 ℃, 收率: 17 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

1.93	(3H, s, s)
3.67, 3.77	( 2H, s, s)
3.8	(3H, s)
7.1 - 7.67	(8H, m)
7.85	(1H, br)

## 制备实施例 23

4-氯-4'-甲磺酰甲基-二苯酮(化合物 No.VI-3)的制备

15 将 4-溴甲基-4'-氯二苯酮(3.1 克)和甲亚磺酸钠(1.5 克)加入到 N,N-二甲基甲酰胺  
(50 毫升)中, 混合物在室温搅拌 16 小时。将水加入反应混合物, 混合物用乙酸乙  
酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗, 随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸馏出乙酸乙酯。  
20 余渣固体用正己烷清洗, 获得所需的产物(2.8 克, 熔点: 164 - 166 ℃, 收率: 90  
%)。

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.90	(3H, s)
4.47	( 2H, s)
7.37 - 7.83	(8H, m)

## 制备实施例 24

4-氯-4'-乙磺酰甲基-二苯酮(化合物 No.VI-6)的制备

25 将亚硫酸钠(24.5 克)和碳酸氢钠(33 克)溶于水(200 毫升)中。在室温向此溶液中滴  
加到乙磺酰氯(25 克)中, 搅拌混合物 1 小时。浓缩反应混合物, 余渣在 N,N-二甲基甲  
酰胺(200 毫升)中悬浮。随后加入 4-溴甲基-4'-氯二苯酮(10.0 克), 混合物在室温搅拌  
16 小时。在反应混合物中加入水, 混合物用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗, 随  
后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸馏出乙酸乙酯。余渣固体采用正己烷清洗, 获得所

需的产物(7.5 克, 熔点: 117 - 118 °C, 收率: 72 %)

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

1.37	(3H, t)
2.93	(2H, q)
4.27	(2H, s)
7.20 - 7.83	(8H, m)

#### 制备实施例 25

##### 5 4-氯-4'-乙硫甲基二苯酮(化合物 No.VI-4)的制备

将 4-氯-4'-硫甲基二苯酮(16.0 克), 乙基溴(7.4 克)和氢氧化钾(4.3 克)加入到甲醇(250 毫升)中, 在回流下搅拌此溶液。反应混合物冷却至室温, 随后浓缩, 在余渣中加入水, 混合物用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗, 随后用无水硫酸镁干燥, 浓缩。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 4: 1)提纯, 获得所需的产物(14.0 克, 熔点: 33 - 34 °C, 收率: 79 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.23	(3H, t)
2.45	(2H, s)
3.75	(2H, s)
7.10 - 7.90	(8H, m)

#### 制备实施例 26

##### 15 4-氯-4'-二氟甲硫甲基二苯酮(化合物 No. VI-15)的制备

将 4-氯-4'-硫甲基二苯酮(14.7 克)和氢氧化钾(15 克)加入到由二噁烷(100 毫升)和水(100 毫升)所成的溶剂中。在 60 °C 向此溶液吹入二氟氯甲烷直到原料 4-氯-4'-硫甲基二苯酮消失。反应产物冷却至室温, 随后继续过滤。作为滤液的有机层用无水硫酸镁干燥, 浓缩。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 5: 1)提纯, 获得所需的产物(6.4 克, 熔点: 34 - 35 °C, 收率: 36 %).

20 <sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

4.03	(2H, s)
6.69	(1H, t)
7.15 - 7.71	(8H, m)

#### 制备实施例 27

##### 25 4-氯-4'-二氟甲磺酰基甲基二苯酮(化合物 No.VI-16)的制备

将 4-氯-4'-二氟甲硫甲基二苯酮(3.2 克)和间-过苯甲酸(5.3 克)加入到氯仿(150 毫升)中。在回流下搅拌此悬浮液 3 小时。浓缩反应混合物, 在余渣中加入水。混合物

用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗，随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣固体用正己烷洗清，获得所需的产物(2.7 克，熔点： 154 - 157 °C，收率： 78 % )。

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz， CDCl<sub>3</sub> 溶剂， δ 值)

4.57 (2H, s)  
6.41 (1H, t)  
7.27 - (8H, m)  
7.87

5

#### 制备实施例 28

4-氯-4'-三氟甲硫甲基-二苯酮(化合物 No.V I-12)的制备

10 将 4-氯-4'-硫甲基二苯酮(4.5 克)溶于四氢呋喃(150 毫升)中。在溶液中加入 60 % 的氢氧化钠 ( 0.8 克 )，混合物在室温搅拌 2 小时。随后加入 S-(三氟甲基)二苯并噻吩 -三氟甲烷硫酸盐，混合物进一步搅拌 30 分钟。浓缩反应混合物，再加入水。混合物用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水清洗，随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷： 乙酸乙酯 = 4： 1)提纯，获得所需的产物(2.0 克，熔点： 63 - 65 °C，收率： 35 % )。

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz， CDCl<sub>3</sub> 溶剂， δ 值)

4.14 (2H, s)  
7.30 - (8H, m)  
7.77

15 

#### 制备实施例 29

4-氯-4'-(1,1,2,2-四氟乙基-甲硫基二苯酮(化合物 No. VI-20)的制备

20 将 4-氯-4'-硫甲基二苯酮(5.0 克)和叔丁醇钾(0.9 克)加入到乙醇(150 毫升)中。在室温向此溶液吹入全氟乙烷(2.9 克)，随后搅拌混合物 16 小时。过滤和浓缩反应混合物。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷： 乙酸乙酯 = 4： 1)提纯，即得所需的产物(5.3 克，熔点： 48 - 50 °C，收率： 77 % )。

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz， CDCl<sub>3</sub> 溶剂， δ 值)

4.13 (2H, s)  
5.77 (1H, tt)  
7.23 - 7.73 (8H, m)

#### 制备实施例 30

4-氯-4'-甲硫甲基二苯酮(化合物 No.VI-1)的制备

25 将 4'-溴甲基-4'-氯二苯酮(3.1 克)和 15 % 甲硫醇钠水溶液(5.6 克)加入到甲醇(150 毫升)中，回流搅拌此溶液。浓缩反应混合物，用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水洗清，随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣固体用正己烷清洗，获得



所需的产物(2.3 克, 熔点: 59 - 61 °C, 收率: 83 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.00	(3H, s)
3.70	(2H, s)
7.13 - 7.74	(8H, m)

#### 制备实施例 31

##### 5 4-氯-4'-甲基亚磺酰基甲基二苯酮(化合物 No.VI-2)的制备

将 4-氯-4'-甲硫甲基二苯酮(4.2 克)加入到甲醇(150 毫升)中。将高碘酸钠(3.6 克)溶解在水(20 毫升)中, 再加入到溶液中, 在室温下搅拌此混合物 16 小时。浓缩反应混合物, 再加入水。用乙酸乙酯萃取混合物。乙酸乙酯层用水清洗, 随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸馏出乙酸乙酯。余渣固体用正己烷洗清, 获得所需的产物(4.1 克, 熔点: 116 - 118 °C, 收率: 93 %).

10

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.5	(3H, s)
4.00	(2H, s)
7.30 - 7.80	(8H, m)

#### 制备实施例 32

##### 15 4-(3-溴丙基)磺酰基甲基-4'-氯二苯酮(化合物 No.VI-11)的制备

将 4-(3-溴丙基)硫代甲基-4'-氯二苯酮(5.1 克)和 31 % 过氧化氢水溶液(6 克)加入到乙酸(200 毫升)中, 在 80 °C 搅拌此溶液 1 小时, 再在回流下继续搅拌 1 小时。浓缩反应混合物, 再加入水。混合物用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用碳酸钾水溶液洗清, 随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸馏出乙酸乙酯。余渣固体用正己烷清洗, 即得所需的产物(5.0 克, 熔点: 105 - 107 °C, 收率: 91 %).

20

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.17 - 2.60	(2H,m)
3.00 - 3.17	(2H,m)
3.53	(2H,t)
4.33	(2H,s)
7.23 - 7.87	(m,8H)

#### 制备实施例 33

##### 25 4-氯-4'-(1,1-二氧硫杂环戊烷-2-基)二苯酮(化合物 No.VI-36)的制备

将 4-(3-溴丙基)磺酰基甲基-4'-氯二苯酮(2.5 克)和 60 % 的氢化钠(0.3 克)加入到 N,N-二甲基乙酰胺(70 毫升)中, 在室温下搅拌此混合物 16 小时。在反应混合物中加

入水，混合物用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水洗，随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 1: 1)提纯，获得所需的产物为淡黄色粘稠物质(1.0 克，收率: 50 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.67 - 2.73 (4H,m)

2.87 - 3.33 (2H,m)

4.02 - 4.37 (1H,m)

7.23 - 7.97 (8H,m)

5

#### 制备实施例 34

4-氯-4'-(2-三氟甲基磺酰基丙基)二苯酮(化合物 No. VI-28)的制备

将 4-氯-4'-三氟甲基磺酰基甲基二苯酮(3.3 克)和 60 % 的氢化钠(0.8 克)加入到 N,N-二甲基乙酰胺(150 毫升)中，在室温搅拌此溶液。将甲基碘(0.8 克)加入  
10 到溶液中，在室温搅拌混合物 16 小时。在反应混合物中加入水，用乙酸乙酯萃取混合物，乙酸乙酯层用水洗，随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 4: 1)提纯，获得所需的产物(3.1 克，熔点: 107 - 109 °C，收率: 86 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

2.00 (6H,s)

7.20 - 7.70 (8H,m)

15

#### 制备实施例 35

4-氯-4'-硫氰酰甲基二苯酮(化合物 No. VI-35)的制备

将 4-溴甲基-4'-氯二苯酮(5.7 克)和硫氰酸钠(5.5 克)加入到乙醇(50 毫升)中，在 60 °C 搅拌此混合物 1 小时。浓缩反应混合物，在余渣中加入水。混合物  
20 用乙酸乙酯萃取。乙酸乙酯层用水洗，随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣固体用正己烷: 乙酸乙酯 = 10: 1 的溶剂混合物清洗，获得所需的产物(2.2 克，熔点: 129 - 131 °C，收率: 42 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

4.18 (2H,s)

7.23 - 7.87 (8H,m)

#### 25 制备实施例 36

2-{4-(4-氯苯甲酰基)苯基}-2-三氟甲硫丙二酸二乙酯(化合物 No. VI-80)的制备

将 60 % 氢化钠(0.5 克)分散在四氢呋喃(150 毫升)中，在 0 °C 搅拌下向此溶液滴  
加 2-{4-(4-氯苯甲酰基)苯基}丙二酸二乙酯(4.4 克)。氢的产生停止后，在 0 °C 吹入三

氟甲基亚磺酰氯，室温搅拌混合物 1 小时。浓缩反应混合物，在余渣中加入水，用乙酸乙酯萃取混合物。乙酸乙酯层用水洗，随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 8: 1)提纯，获得所需的产物(4.7 克,  $n_D^{20}$ :1.5362, 收率: 87 %).

5	<sup>1</sup> H-核磁共振数据(60MHz, CDCl <sub>3</sub> 溶剂, δ 值)	
	1.3	(6H, t)
	4.35	(4H, q)
	7.4	(2H, d)
	7.75	(2H, d)
	7.8	(4H, s)

#### 制备实施例 37

4-氯-4'-三氟甲磺甲基二苯酮(化合物 No.VI-81)的制备

10 将甲基二苯酮 4-氯-4'-硫氰酸酯(5.5 克)和三乙基苄基氯铵代(0.5 克)分散在氯仿(30 毫升)中，在 40 °C 加入 48 % 氢氧化钠水溶液(4 毫升)。随后混合物搅拌 3 小时。

加入冷水，进行混合物的分液。有机层用水洗，用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出氯仿。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 9: 1)提纯，获得所需的产物(1.0 克, 熔点: 103 - 105 °C, 收率: 13 %).

	<sup>1</sup> H-核磁共振数据(60MHz, CDCl <sub>3</sub> 溶剂, δ 值)	
	4.45	(2H, s)
	7.15 - 7.8	(8H, m)

15

#### 制备实施例 38

4-氯-4'-三氟甲磺酰甲基二苯基甲醇(化合物 No.VIII-2)的制备

20 将 4-氯-4'-三氟甲磺酰基甲基二苯酮(5.5 克)分散在甲醇(200 毫升)中。在室温逐渐向此溶液加入硼氢化钠，混合物在室温搅拌过夜。反应完成后，在减压下蒸出甲醇。余渣用乙酸乙酯萃取。萃取物用水洗，随后用无水硫酸镁干燥。在减压下蒸出乙酸乙酯。余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 2: 1)提纯，获得所需的产物(4.2 克, 熔点: 113 - 115 °C, 收率: 77 %).

	<sup>1</sup> H-核磁共振数据(60MHz, CDCl <sub>3</sub> 溶剂, δ 值)	
	4.7	(2H, s)
	5.77	(2H, s)
	7.3	(4H, s)
	7.47	(4H, s)

## 制备实施例 39

## 4-氯-4'-乙烷磺酰甲基二苯酮氯化物(化合物 No.VIII-5)的制备

5 将 4-氯-4'-乙烷磺酰甲基二苯基甲醇(6.0 克), 亚硫酸氯(5.4 克)甲苯(200 毫升)和催化量的 N,N-二甲基甲酰胺相混合, 并在搅拌下逐渐加热到回流温度. 混合物在回流下搅拌 4 小时, 随后放冷. 在减压下蒸出溶剂. 余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 2: 1)提纯, 获得所需的产物, 为淡黄色粘稠物质(4.6 克,  $n_D^{20}$ : 1.6044, 收率: 75 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

1.33	(3H,t)
2.88	(2H,q)
4.37	(2H,s)
6.05	(1H,s)
7.27	(4H,s)
7.35	(4H,s)

## 10 制备实施例 40

## (6-氯-3-吡啶基)(4-三氟甲基苯基)酮(化合物 No. VII-3)的制备

15 将(6-氯-3-吡啶基)(4-硫氰酸甲基苯基)酮(5.0 克)溶解在四氢呋喃(300 毫升)中, 在室温向此溶液加入三氟甲基三甲基硅烷(5.0 克). 随后将混合物冷却至 5 °C. 在冷却下逐渐滴加四丁基铵氟(1.0M 四氢呋喃溶液, 23 克), 混合物搅拌过夜. 在减压下蒸出四氢呋喃, 余渣用乙酸乙酯萃取. 萃取物用水洗, 随后用无水硫酸镁干燥. 在减压下蒸馏出碳酸乙酯. 余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 4: 1)提纯, 获得所需的产物(2.0 克,  $n_D^{20}$ =1.5820, 收率: 35 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub> 溶剂, δ 值)

4.15	(2H, s)
7.4	(3H, d d)
7.72	(2H, d d)
8.05	(2H, d d)
8.67	(2H, d)

## 20 制备实施例 41

## 4-氯-4'-羟基甲基二苯酮-N'-甲氧羰基脲(化合物 No. IX-1)的制备

25 将 4-氯-4'-羟基甲基二苯酮(0.5 克)和胼基甲酸甲酯(0.4 克)加入到乙醇(60 毫升)和乙酸(5 毫升)中, 在回流下搅拌此混合物 2 小时. 浓缩反应混合物, 余渣用乙酸乙酯萃取. 乙酸乙酯层用水洗, 随后用无水硫酸镁干燥. 在减压下蒸出乙酸乙酯. 余渣采用硅胶柱色层(分离)方法(正己烷: 乙酸乙酯 = 4: 1)提纯, 获得所需的产物(0.5 克,

收率: 83 %).

<sup>1</sup>H-核磁共振数据(60MHz, CDCl<sub>3</sub>溶剂, δ 值)

2.17	(1H, br)
3.77	(3H, s)
4.63, 4.73	(2H, s, s)
6.97 - 7.63	(8H, m)
7.73	(1H, br)

当本发明的化合物用作杀虫剂的活性组分时, 其本身也可用作杀虫剂。

- 5 当本发明的化合物用途农药的活性组分时, 其本身也可用作农药。然而它可配制成各种剂型如可乳化的浓缩剂、悬浮剂、粉剂、颗粒剂、片剂、可湿性粉剂、水溶性浓缩剂、溶液、流动性悬浮剂、水分散颗粒剂、空气溶胶、糊剂、油剂, 和与各种载体表面活性剂和其它通常用在配方中用作农用辅助药的辅助成分组合的在水中的浓缩乳化物。它们通常以活性组分为 0.1-90 份重量、农用辅助组
- 10 分为 10 ~ 99.9 份重量的比例混合。

- 在这类剂型中使用的载体分类为固体载体和液体载体。固体载体包括如: 动植物粉末如淀粉、活性炭、大豆粉、小麦粉、木粉、鱼粉和粉末化的牛乳和矿物质粉末如滑石、高岭土、膨润土、碳酸钙、沸石、硅藻土、细二氧化硅粉末、粘土和氧化铝。液体载体包括如水、醇类如异丙醇和乙二醇, 酮类如环己酮和甲
- 15 基乙基酮、醚类如二噁烷和四氢呋喃、脂族烃如石油和轻油、芳烃如二甲苯、三甲苯、四甲苯、甲基萘和溶剂石脑油、卤化烃如氯苯、酰胺类如二甲基乙酰胺、酯类如脂肪酸的甘油酯类、腈类如乙腈、含硫化合物如二甲基亚砷。

- 表面活性剂包括如烷基苯磺酸金属盐、二萘基甲烷二磺酸金属盐、硫酸醇酯、烷基芳基磺酸盐、木质素磺酸盐、聚氧乙二醇醚类、聚氧乙烯烷基芳基醚类和聚氧乙烯山梨糖醇酐单烷酯。
- 20

其它配料包括如一种粘合剂或增稠剂如羧甲基纤维素、树胶阿糖酸(阿拉伯树胶)、精氨酸钠、瓜耳胶、黄耆胶、或聚乙烯醇、一种附加发泡剂如金属皂、一种物性改进剂如脂肪酸、一种烷基磷酸盐、硅酮或石蜡、和一种着色剂。

- 当实际使用这些剂型时, 可用稀释剂如水将其稀释至预定浓度后使用。将
- 25 本发明化合物的各种剂型或其稀释溶液用普通的方法即喷洒方法(如喷淋、喷雾、雾化、撒粉、撒粒、稻田水喷洒、或播种箱处理)、土壤处理(如混合或浸润)、表面处理(如喷涂、敷涂或复盖), 浸渍或毒饵来应用。上述活性组分还可与食物混合后喂给动物, 因而可防止由排泄物引起的害虫特别是有害昆虫的传染和生长。还可采用所谓高浓度超低用量的活性组分含量可高达 100 % 的方法使用。

- 30 使用本发明的农药时, 其活性组分的浓度一般为 0.1~50,000ppm, 最好为 1 ~ 10,000ppm。

活性组分的浓度变化取决于剂型配方、方法、目的、季节或使用地点和害虫的侵扰情况。例如对水中害虫，可通过在传播区喷洒一种含有上述范围内的浓度的配方防治这种害虫。因此在水中的活性组分浓度低于上述浓度。单位面积上的剂量一般每公顷活性化合物为 0.1~5,000 克，最好为 1 ~ 1,000 克，但并不限于此范围。

当单独使用时，本发明的化合物极为有效。然而，如果需要可与肥料或其它农用化学品如杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀菌剂、抗病毒剂、诱虫剂、除草剂或植物生长调节剂组合或混合使用，通过这样的复配有时能得到进一步的增效作用。

与本发明化合物组合使用的杀虫剂、杀菌剂、除草剂和杀螨剂的典型例子如下。

有机磷化合物和氨基甲酸酯杀虫剂：倍硫磷、杀螟硫磷、二嗪磷农、毒死蜱、异丙磷、蚜灭多、稻丰散、乐果、安果、马拉硫磷、敌百虫、二甲硫吸磷、亚胺硫磷、敌敌畏、乙酰甲胺磷、伊比磷(邻-2,4-二氯苯基邻乙苯基硫代膦酸酯)、甲基对硫磷、亚砷吸磷、乙硫磷、蔬果磷、杀螟腈、噁唑磷、哒嗪硫磷、优杀硫磷、metidation、甲丙硫磷、毒虫畏、杀虫畏、甲基毒虫畏、灭克磷、异丙胺磷、乙拌磷、丙溴磷、吡啶硫磷、久效磷、保棉磷、涕灭威、灭多威、硫双灭多威、呋喃丹、丁硫克百威、丙硫克百威、呋线威、残杀威、仲丁威、速灭威、叶蝉散、甲萘威、抗蚜威、乙硫苯威、酚线磷、甲基嘧啶磷、啶硫磷、甲基毒死蜱、丙硫磷、二溴磷、噁虫威、杀线威、棉铃威、chlorothoxyfos (C<sub>6</sub>H<sub>11</sub>Cl<sub>4</sub>O<sub>3</sub>PS)等。

拟除虫菊酯杀虫剂：氯菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、戊氰菊酯、甲氰菊酯、除虫菊酯、烯丙菊酯、胺菊酯、苄呋菊酯、苄菊酯、扑虫菊、苯醚菊酯、消虫菊、氟胺氰菊酯、氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、氟氰戊菊酯、醚菊酯、乙氰菊酯、四溴菊酯、硅醚菊酯、七氟菊酯、氟氯菊酯、氟酯菊酯等。

酰基脲类及其它杀虫剂：除虫脲、定虫隆、氟铃脲、杀虫隆、伏虫隆、氟虫脲、氟螨脲、噻嗪酮、蚊蝇醚、Lufenuron (C<sub>17</sub>H<sub>8</sub>Cl<sub>2</sub>F<sub>8</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>)、灭蝇胺、烯虫酯、硫丹、齐螨隆、咪蚜胺、fipromil(C<sub>12</sub>H<sub>4</sub>Cl<sub>2</sub>F<sub>6</sub>N<sub>4</sub>OS)、烟碱硫酸盐、鱼藤酮、蜗牛敌、机油、双氧威、杀螟丹、杀虫环、杀虫磺、tebufenozide (C<sub>22</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>)、chlorphenapyr、emamectin benzoate、acetamiprid、nitenpyram(C<sub>11</sub>H<sub>15</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>)、pymetrozine (C<sub>10</sub>H<sub>11</sub>N<sub>5</sub>O)、油酸钠、菜油等。

杀线虫剂：虫胺磷(克线磷)、噁唑磷、灭线磷、异硫氰酸甲酯、1,3-二氯丙烯、DCIP等。

杀螨剂：乙酯杀螨醇、溴螨酯、三氯杀螨醇、双虫脒、克螨特、苯螨特、噻嗪酮、苯丁锡(托尔克)、杀螨霉素、灭螨猛、杀螨酯、三氯杀螨砒、双氢灭虫丁(齐墩螨素)、milbemectin(抗菌素之一)、四螨嗪(螨死净)、哒螨酮、唑螨酯、tebufenpyrad (C<sub>18</sub>H<sub>24</sub>ClN<sub>3</sub>O)、pyrimidifen(C<sub>2</sub>H<sub>28</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>)、苯硫威、遍地克、

etoxazole、halfenprox(MTI-732)等。

杀菌剂：甲基托布津、苯菌灵、多菌灵、涕必灵、灭菌丹、福美双、福美铵、代森锌、代森锰、代森锰锌、福代锌、异稻瘟净(C<sub>13</sub>H<sub>21</sub>O<sub>3</sub>PS)、克瘟散、四氯苯酞、烯丙异噻唑、稻瘟灵、百菌清、克菌丹、多氧霉素、灭瘟素、春雷霉素、链霉素、稻纹散、三环唑、咯嗉酮、叶枯净、灭锈胺、氟酰胺、戊菌隆、异菌脲、5 咪霉灵、甲霜灵、氟菌唑、噻氨灵、三唑酮、双苯三唑醇、氯苯嘧啶醇、丙环唑、霜脲氰、咪鲜安、稻瘟酯、己唑醇、腈菌唑、哒菌清、叶枯酞、丙森锌、二噻农、乙磷铝、乙烯菌核利、腐霉灵、咪霜灵、双胍辛醋酸盐、霜霉威盐酸盐、氟啶胺、啞菌酮、咪霉灵、酰胺唑、咪醚唑、啞菌胺。

10 本发明的化合物对如半翅目昆虫、鳞翅目昆虫、鞘翅目昆虫、双翅目昆虫、膜翅目昆虫、直翅目昆虫、等翅目昆虫、缨翅目昆虫、螨类以及寄生植物的线虫的害虫显示极好的杀虫活性。这些昆虫如下所述。

半翅目昆虫：半翅目如豆蝽(Riptortus clavatus)、稻绿蝽(Nezara viridula)、牧草盲蝽属(Lygus sp.)、多毛长蝽(Blissus leucopterus)和梨网蝽(Stephanitis nashi)；15 叶蝉科(Circulifer sp.)如稻大白叶蝉(Nephotettix cincticeps)和叶蝉科(Empoasca sp., Erythroneura sp., Circulifer sp.)；椿鸡科(Delphacidae)如稻褐飞虱(Nilaparvata lugens)、白背飞虱(Sogatella furcifera)和小稻褐飞虱(Laodelphax striatellus)；木虱科(Psyllidae)如木虱(Psylla sp.)；粉虱科(Aleyrodidae)如棉粉虱(Bemisia tabaci)和温室粉虱(Trialeurodes vaporariorum)；蚜科(Aphididae)如葡萄根瘤蚜(Viteus vitifolii)、桃[赤]蚜(Myzus persicae)、苹[绿]蚜(Aphis pomi)、棉蚜(Aphis gossypii)、Aphis fabae、菜缢管蚜(Rhopalosiphum psedobrassicas)、马铃薯长须蚜(Aulacorthum solani)和麦二岔蚜(Schizaphis graminum)；粉蚧科和吹绵蚧如康氏粉蚧(Pseudococcus comstocki)、红蜡蚧(Ceroplastes rubens)、梨圆蚧(Comstockaspis pernicios)和矢尖蚧(Unaspis yanonensis)。20

25 鳞翅目昆虫：卷叶蛾科如茶黄卷叶蛾(Homona magnanima)、茶小卷叶蛾(Adoxophyes orana)、葡萄长须卷叶蛾(Sparganothis pilleriana)、梨小食心虫(Grapholitha molesta)、大豆食心虫(Leguminivora glycinivorella)、苹果蠹虫(Laspeyresia pomonella)、tortricids(Eucosma sp.)和葡萄小食心虫(Lobesia botrana)；Cochylidae如grape cochylid(Eupoecillia ambiguella)；衰蛾科(Psychidae)如Bambalina sp.；谷蛾科(Tineidae)如[欧洲]谷蛾(Nemapogon granellus)和织网衣蛾(Tinea translucens)；尖潜蛾科(Lyonetiidae)如Lyonetia prunifoliella；细蛾科如梨叶肿瘿螨(Phyllonorycter rigoniella)；桔潜蛾科如桔细潜蛾(Phyllocnistis citrella)；巢蛾科如[小]菜蛾(Plutella xylostella)和巢蛾(Prays citri)；透翅蛾科(Synanthedon sp.)如葡萄透翅蛾(Parathrene regalis)和Synanthedon sp.；麦蛾科35 (Gelechiidae)如[棉]红铃虫(Pectinophora gossypiella)、马铃薯块茎蛾(Phthorimaea operculella)和Stomopteryx sp.；Carposinidae如佐佐木桃小食心虫(Carposina

niponensis); 刺蛾科如黄刺蛾(Monema flavescens); 螟蛾科如二化螟(Chilo suppressalis)、稻苞虫(Cnaphalocrocis medinalis)、玉米螟(Ostrinia nubilalis)、东方玉米螟(Ostrinia furnacalis)、菜[心]螟(Hellula undalis)、大蜡螟(Galleria mellonella)、小玉米螟(Elasmopalpus lignosellus)和甜菜网螟(Loxostege sticticalis); 蛾如[小]菜粉蛾(Pieris rapae); 尺蠖蛾科如艾尺蠖(Ascotis selenaria); 蓖麻天幕毛虫如黄褐天幕毛虫(Malacosoma neustria); 天蛾科如烟草天蛾(Manduca sexta); 毒蛾科如茶毛虫(Euproctis pseudoconspersa)和舞[毒]蛾(Lymantria dispar); 灯蛾科如美国白蛾(Hyphantria cunea); 夜蛾科如棉铃虫(Heliothis virescens)、棉铃虫(Helicoverpa zea)、甜菜夜蛾(Spodoptera exigua)、棉铃虫(Helicoverpa armigera)、斜纹夜蛾(Spodoptera litura)、甘兰夜蛾(Mamestra brassicae)、小地虎(Agrotis ipsiron)、眉纹夜蛾(Pseudaletia separata)和粉纹夜蛾(Trichoplusia ni)。

鞘翅目昆虫: 金龟科如大绿丽金龟(Anomala cuprea)、日本丽金龟(Popillia japonica)、方头绿金龟子(Anomala rufocuprea)和 Eutheola rugiceps; 黑背叩甲(Conodeus sp.)如金针虫(Agriotes sp.)和 Conodeus sp.; 瓢虫科如二十八点瓢虫(Epilachna vigintioctopunctata)和墨西哥豆瓢虫(Epilachna varivestis); 拟步甲科如赤拟谷盗(Tribolium castaneum); 天牛科如榆棺天牛(Anoplophora malasiaca)和云杉小黑天牛(Monochamus alternatus); 豆象科如到豆根直条象(Acanthoscelides obtectus)和绿豆象(Callosobruchus chinensis); 叶甲科如马铃薯甲虫(Leptinotarsa decemlineata)、南瓜十二星叶甲(Diabrotica sp.)、稻负泥虫(Oulema oryzae)、甜菜胫跳甲(Chaetocnema concinna)、辣根猿叶虫(Phaedon cochlaerias)、橙足负泥虫(Oulema melanopus)和 Dicladispa armigera; Apionidae 如 Apion godmani; 象甲科如稻象甲(Lissorhoptrus oryzophilus)和墨西哥棉铃象甲(Anthonomus grandis); 蝽象科如玉米象(Sitophilus zeamais); 棘胫小蠹科及齿小蠹科; 皮蠹科; 药材谷盗。

双翅目昆虫: 稻大蚊(Tipra ano)、稻摇蚊(Tanytarsus oryzae)、Orseolia oryzae、Ceratitis capitata、稻潜叶水蚊(Hydrellia griseola)、樱桃果蝇(Drosophila suzukii)、瑞典麦杆蝇(Oscinella frit)、稻黄潜蝇(Chlorops oryzae)、French bean miner(Ophiomyia phaseoli)、legume leafminer(Liriomyza trifolii)、甜菜潜叶花蝇(Pegomya hyoscyami)、种蝇(Hylemia platura)、sorghum fly(Atherigona soccata)、家蝇(Musca domestica)、Gastrophilus sp.、厩蝇(Stomoxys sp.)、Aedes aegypti、Culex pipiens、Anopheles slnensis 和 Culex tritaeniorhynchus。

膜翅目昆虫: 茎蜂科(Cephus sp.); 广肩小蜂科(Harmolita sp.); 甘兰叶蜂(Athalia sp.)、大胡蜂(Vespa sp.)和火蚊。

直翅目昆虫: 德国小蠊(Blatella germanica); 美洲大蠊(Periplaneta americana); 非洲蝼蛄(Gryllotalpa africana); 亚洲飞蝗(Locusta migratoria migratoriodes); 和 Melanoplus sanguinipes。

等翅目昆虫: 等翅目(Reticulitermes speratus)和家白蚁(Coptotermes



formosanus).

缨翅目昆虫: 茶黄蓟马(Scirtothrips dorsalis); 缨翅目(Thrips palmi); 温室蓟马(Heliothrips haemorrhoidalis); 苜蓿蓟马(Frankliniella occidentalis)和 rice aculeated thrips(Haplothrips aculeatus).

- 5 螨类: 普通红叶螨(Tetranychus urticae); Kanzawa spider mite(Tetranychus kanzawai); 桔全爪螨(Panonychus citri); 榆[苹]全爪螨(Panonychus ulim); 鹅耳枥东方叶螨(Eotetranychus carpini); Texas citrus mite(Eotetranychus banksi); 桔锈螨(Phyllocoptruta oleivora); 侧多食跗线螨(Polyphagotarsonemus latus); 细须螨科(Brevipalpus sp.); 刺足根螨(Rhizoglyphus robini)和腐食酪螨(Tyrophagus putrescentiae).

10 植物根线虫类: 黄麻根疣线虫(Meloidogyne incognita); root-lesion nematode(Pratylenchus sp.); 大豆异皮线虫(Heterodera glycines); rice white-tip nematode(Aphelenchoides besseyi)和 pine wood nematode(Bursaphelenchus xylophilus).

- 15 其他害虫和寄生虫: Gastropoda 如蜗牛(Pomacea canaliculata); 蛞蝓(Incilaria sp.)和褐云玛瑙螺(Achatina fulica); 鼠妇科(Isopoda)如潮虫和唇足; 书虱科(Liposcelis sp.); 东方衣鱼(oriental silverfish) (Ctenolepisma sp.); Pulex sp.; Trichodectes sp.; Cimex sp.; 动物寄生蜱螨如微小牛蜱和 aemaphysalis longicornis 和表皮螨科.

- 20 本发明的化合物对那些有机磷化合物、氨基甲酸酯化合物、合成拟除虫菊酯化合物、酰基脲化合物和普通杀虫剂具有抗药性的害虫有效。

- 因此, 本发明的化合物对广谱害虫有效, 包括: 半翅目昆虫、鳞翅目昆虫、鞘翅目昆虫、双翅目昆虫、膜翅目昆虫、直翅目昆虫、等翅目害虫、缨翅目昆虫、螨类以及寄生植物的线虫均具有极好的杀虫效果, 而且能防治对普通杀虫剂具有抗药性的害虫。

25 在一般的配方实例中详述了配制方法。然而应理解化合物和辅助物的类型及比例不受这些例子的限制, 而且可在较宽的范围内变动。在下面例子中, “%”表示重量百分比。

- 30 配方实例 1: 浓缩乳剂

将 30%(I-22)化合物、20%环己酮、11%的聚氧乙烯烷芳基醚、4%烷基苯磺酸钙和 35%甲基萘均匀溶解, 得到浓缩乳剂。

配方实例 2: 可湿性粉剂

- 35 将 10%化合物(I-22), 0.5%萘磺酸与甲醛水溶液缩合物的钠盐、0.5%聚氧乙烯烷芳基醚、24%硅藻土和 65%粘土均匀混合并磨成粉, 得到可湿性粉剂。

### 配方实例 3：颗粒剂

将 5% 化合物(I-22)， 2% 月桂醇硫酸钠、 5% 木质素磺酸钠、 2% 羧甲基纤维素和 86% 粘土均匀混合并磨成粉，将 100 份重量的此混合物与 20 份重量水捏和，用挤出型造粒机制出 14 ~ 32 目的颗粒，随后干燥得到一种颗粒剂。

在试验实施例中描述以本发明化合物作为活性组分的杀虫剂的效果。对照化合物 a 和 b 是在日本未审查专利公报 No. 122261/1979 的实施例 165 和 6 中所揭示的化合物；对照化合物 C 是在日本未审查专利公报 No.45452/1981 的实施例 88 中所揭示的化合物；对照化合物 d 是在美国专利 3,732,3067 的实施例 6 中所揭示的化合物。这些对照化合物可按本发明化合物相同的方式调配和使用。

对照化合物 a: 4-氯-4'-异丙基硫代二苯酮-N'-乙氧羰基脒。

对照化合物 b: 4-氯-4'-丙基磺酰基二苯酮-N'-丙酰脒。

对照化合物 c: 4-氯-4'-甲基亚磺酰基二苯酮-N'-乙氧羰基脒。

对照化合物 d: 4-三氟甲基二苯酮脒。

15

### 试验实例 1. 对小菜蛾的杀虫试验

根据配方实例 2 制备的可湿性粉剂用水稀释，使活性组分的浓度为 500ppm。将卷心菜叶子浸在稀释液中，在空气中干燥。随后放在聚氯乙烯杯中。将十条小菜蛾幼虫放在杯中，随后盖上盖子。将杯子放在 25 °C 的恒温箱中 6 天，统计死亡的昆虫的数量。根据计算公式(A)计算出死亡率。结果列于表 36。试验分两组进行。

$$\text{死亡率(\%)} = \frac{\text{死亡的昆虫数}}{\text{放入的昆虫数}} \times 100 \quad (\text{A})$$

表 36

化合物编号	死亡率
I-1	100
I-2	100
I-10	100
I-11	100
I-12	100
I-13	100
I-14	100
I-15	100
I-16	100
I-17	100
I-18	100
I-19	100
I-20	100
I-21	100
I-22	100
I-23	100
I-24	100
I-25	100
I-26	100
I-31	100
I-32	100
I-34	100
I-35	100
I-40	100
I-41	100
I-42	100
I-43	100
I-44	100
I-45	100
I-46	100
I-47	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-48	100
I-50	100
I-51	100
I-52	100
I-53	100
I-54	100
I-55	100
I-56	100
I-57	100
I-58	100
I-59	100
I-60	100
I-61	100
I-62	100
I-63	100
I-64	100
I-65	100
I-66	100
I-67	100
I-68	100
I-69	100
I-70	100
I-71	100
I-72	100
I-73	100
I-74	100
I-75	100
I-76	100
I-77	100
I-78	100
I-81	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-83	100
I-84	100
I-88	100
I-89	100
I-90	100
I-91	100
I-92	100
I-93	100
I-94	100
I-95	100
I-96	100
I-97	100
I-98	100
I-99	100
I-100	100
I-101	100
I-102	100
I-106	100
I-114	100
I-115	100
I-116	100
I-117	100
I-118	100
I-119	100
I-121	100
I-122	100
I-124	100
I-125	100
I-128	100
I-129	100
I-130	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-132	100
I-133	100
I-134	100
I-135	100
I-136	100
I-137	100
I-138	100
I-140	100
I-141	100
I-148	100
I-149	100
I-150	100
I-151	100
I-153	100
I-154	100
I-155	100
I-156	100
I-157	100
I-158	100
I-159	100
I-160	100
I-161	100
I-162	100
I-163	100
I-164	100
I-165	100
I-166	100
I-168	100
I-169	100
I-171	100
I-173	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-174	100
I-175	100
I-176	100
I-177	100
I-178	100
I-179	100
I-181	100
I-182	100
I-183	100
I-184	100
I-185	100
I-186	100
I-187	100
I-188	100
I-189	100
I-190	100
I-191	100
I-192	100
I-193	100
I-194	100
I-195	100
I-196	100
I-197	100
I-206	100
I-207	100
I-209	100
I-210	100
I-211	100
I-212	100
I-213	100
I-214	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-216	100
I-217	100
I-218	100
I-220	100
I-221	100
I-222	100
I-223	100
I-224	100
I-225	100
I-226	100
I-238	100
I-247	100
I-250	100
I-251	100
I-252	100
I-253	100
I-254	100
I-255	100
I-256	100
I-257	100
I-258	100
I-259	100
I-260	100
I-261	100
I-263	100
I-264	100
I-265	100
I-266	100
I-268	100
I-269	100
I-274	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-277	100
I-278	100
I-280	100
I-281	100
I-282	100
I-283	100
I-284	100
I-285	100
I-286	100
I-290	100
I-291	100
I-292	100
I-293	100
I-294	100
I-295	100
I-296	100
I-297	100
I-298	100
I-299	100
I-300	100
I-301	100
I-302	100
I-303	100
I-305	100
I-306	100
I-307	100
I-308	100
I-309	100
I-310	100
I-311	100
I-312	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-313	100
I-314	100
I-315	100
I-316	100
I-317	100
I-318	100
I-319	100
I-320	100
I-321	100
I-323	100
I-324	100
I-326	100
I-328	100
I-329	100
I-330	100
I-331	100
I-332	100
I-333	100
I-334	100
I-335	100
I-336	100
I-337	100
I-338	100
I-339	100
I-340	100
I-341	100
I-342	100
I-343	100
I-344	100
I-345	100
I-346	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-347	100
I-348	100
I-349	100
I-350	100
I-351	100
I-352	100
I-353	100
I-354	100
I-355	100
I-356	100
I-357	100
I-358	100
I-359	100
I-360	100
I-361	100
I-362	100
I-363	100
I-364	100
I-365	100
I-366	100
I-367	100
I-368	100
I-370	100
I-371	100
I-372	100
I-373	100
I-374	100
I-376	100
I-377	100
I-379	100
I-380	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-381	100
I-382	100
I-383	100
I-384	100
I-385	100
I-386	100
I-387	100
I-388	100
I-389	100
I-390	100
I-391	100
I-392	100
I-393	100
I-394	100
I-395	100
I-396	100
I-397	100
I-398	100
I-399	100
I-400	100
I-401	100
I-402	100
I-403	100
I-404	100
I-405	100
I-407	100
I-408	100
I-409	100
I-410	100
I-411	100
I-412	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-414	100
I-415	100
I-416	100
I-417	100
I-418	100
I-419	100
I-420	100
I-421	100
I-423	100
I-424	100
I-425	100
I-426	100
I-428	100
I-429	100
I-431	100
I-432	100
I-435	100
I-436	100
I-437	100
I-438	100
I-439	100
I-440	100
I-441	100
I-442	100
I-443	100
I-444	100
I-445	100
I-447	100
I-448	100
I-449	100
I-450	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-451	100
I-452	100
I-453	100
I-455	100
I-456	100
I-457	100
I-458	100
I-459	100
I-460	100
I-461	100
I-462	100
I-463	100
I-464	100
I-466	100
I-467	100
I-468	100
I-469	100
I-470	100
I-471	100
I-472	100
I-473	100
I-474	100
I-475	100
I-476	100
I-477	100
I-478	100
I-480	100
I-481	100
I-482	100
I-483	100
I-484	100



表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-485	100
I-486	100
I-487	100
I-488	100
I-489	100
I-490	100
I-491	100
I-492	100
I-494	100
I-495	100
I-496	100
I-497	100
I-498	100
I-499	100
I-500	100
I-501	100
I-502	100
I-504	100
I-509	100
I-510	100
I-516	100
I-517	100
I-518	100
I-519	100
I-520	100
I-521	100
I-522	100
I-523	100
I-524	100
I-525	100
I-526	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
I-527	100
I-528	100
I-529	100
I-530	100
I-531	100
I-532	100
I-533	100
I-534	100
I-535	100
I-536	100
I-537	100
I-538	100
I-539	100
I-540	100
II-5	100
II-6	100
II-8	100
II-10	100
II-11	100
II-12	100
II-13	100
II-14	100
II-15	100
II-16	100
II-22	100
II-23	100
II-24	100
II-29	100
II-30	100
II-32	100
II-35	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
II-36	100
II-37	100
II-38	100
II-39	100
II-40	100
II-41	100
II-42	100
II-43	100
II-44	100
II-45	100
II-46	100
II-47	100
II-48	100
II-49	100
II-50	100
II-51	100
II-52	100
III-1	100
III-2	100
III-3	100
III-4	100
III-5	100
III-6	100
III-7	100
III-8	100
III-9	100
III-10	100
III-11	100
IV-1	100

表 36(续)

化合物编号	死亡率
V-1	100
V-2	100
V-3	100
V-4	100
V-5	100
V-6	100
V-7	100
V-8	100
V-9	100
V-10	100
V-11	100
V-12	100
V-13	100
V-14	100
V-15	100
V-16	100
V-17	100
V-18	100
V-19	100
VI-2	100
VI-15	100
VI-17	100
VI-22	100
比较例 d	0

### 试验实例 2. 对稻褐飞虱的杀虫试验

根据配方实例 2 制备的可湿性粉剂用水稀释, 使活性组分的浓度为 500ppm, 将稻茎和叶浸入该稀释液, 随后在空气中干燥, 放入试管中, 在试管中放入 5 条稻褐飞虱幼虫, 试管开口端用吸收堵塞物塞住。然后将试管放入 25 ℃ 的恒温箱内 6 天。统计死亡的昆虫数, 按计算公式(A)算出死亡率(%). 试验分两组进行, 结果列于表 37.

表 37

化合物编号	死亡率
I-10	100
I-11	100
I-12	100
I-13	100
I-14	100
I-15	100
I-32	100
I-41	100
I-45	100
I-46	100
I-47	100
I-50	100
I-51	100
I-52	100
I-53	100
I-55	100
I-61	100
I-62	100
I-64	100
I-65	100
I-66	100
I-67	100
I-68	100
I-69	100
I-70	100
I-71	100
I-72	100
I-73	100
I-74	100
I-75	100
I-77	100

表 37(续)

化合物编号	死亡率
I-81	100
I-83	100
I-88	100
I-89	100
I-90	100
I-91	100
I-92	100
I-93	100
I-96	100
I-97	100
I-98	100
I-99	100
I-100	100
I-101	100
I-102	100
I-106	100
I-114	100
I-115	100
I-116	100
I-117	100
I-118	100
I-121	100
I-122	100
I-132	100
I-135	100
I-136	100
I-150	100
I-151	100
I-157	100
I-158	100
I-163	100

表 37(续)

化合物编号	死亡率
I-164	100
I-165	100
I-173	100
I-176	100
I-177	100
I-179	100
I-180	100
I-183	100
I-184	100
I-185	100
I-186	100
I-187	100
I-188	100
I-190	100
I-194	100
I-211	100
I-212	100
I-213	100
I-214	100
I-216	100
I-217	100
I-218	100
I-220	100
I-221	100
I-222	100
I-224	100
I-225	100
I-249	100
I-250	100
I-252	100
I-253	100

表 37(续)

化合物编号	死亡率
I-254	100
I-255	100
I-256	100
I-257	100
I-259	100
I-260	100
I-264	100
I-285	100
I-290	-100
I-291	100
I-293	100
I-294	100
I-295	100
I-296	100
I-297	100
I-298	100
I-299	100
I-300	100
I-301	100
I-302	100
I-304	100
I-305	100
I-306	100
I-308	100
I-313	100
I-314	100
I-317	100
I-318	100
I-319	100
I-320	100
I-328	100

表 37(续)

化合物编号	死亡率
I-329	100
I-330	100
I-333	100
I-334	100
I-335	100
I-336	100
I-337	100
I-338	100
I-339	100
I-340	100
I-341	100
I-344	100
I-346	100
I-347	100
I-348	100
I-349	100
I-350	100
I-351	100
I-352	100
I-353	100
I-354	100
I-355	100
I-356	100
I-357	100
I-358	100
I-359	100
I-360	100
I-361	100
I-362	100
I-363	100
I-364	100

表 37(续)

化合物编号	死亡率
I-366	100
I-367	100
I-368	100
I-388	100
I-390	100
I-392	100
I-394	100
I-395	100
I-399	100
I-402	100
I-403	100
I-414	100
I-415	100
I-416	100
I-418	100
I-436	100
I-437	100
I-438	100
I-439	100
I-440	100
I-444	100
I-445	100
I-446	100
I-447	100
I-450	100
I-451	100
I-452	100
I-453	100
I-454	100
I-466	100
I-467	100

表 37(续)

化合物编号	死亡率
I-468	100
I-470	100
I-472	100
I-473	100
I-474	100
I-475	100
I-480	100
I-481	100
I-482	100
I-483	100
I-484	100
I-485	100
I-486	100
I-487	100
I-488	100
I-489	100
I-490	100
I-491	100
I-494	100
I-496	100
I-497	100
I-502	100
I-510	100
I-516	100
I-517	100
I-520	100
I-521	100
I-522	100
I-524	100
I-525	100
I-526	100

表 37(续)

化合物编号	死亡率
I-527	100
I-528	100
I-529	100
I-530	100
I-531	100
I-532	100
I-533	100
I-534	100
I-535	100
I-536	100
I-537	100
I-538	100
I-539	100
I-540	100
II-10	100
II-12	100
II-13	100
II-14	100
II-23	100
II-29	100
II-30	100
II-36	100
II-37	100
II-51	100
II-52	100
III-2	100
III-4	100
III-6	100
III-7	100
III-8	100
III-9	100

表 37(续)

化合物编号	死亡率
III-10	100
III-11	100
IV-1	100
V-1	100
V-3	100
V-4	100
V-5	100
V-6	100
V-7	100
V-9	100
V-19	100
VI-22	100
VI-43	100
VI-80	100
比较例 a	10
比较例 b	20
比较例 c	20



### 试验实例 3. 对绿豆象的杀虫试验

根据配方实例 2 制备的可湿粉剂用水稀释至 100ppm. 将 0.75 毫升此稀释液滴在一直径 6 厘米的滤纸上, 将滤纸放到容积为 60 毫升的聚氯乙烯杯中. 将 5 条绿豆象的雌性成虫放入杯中, 加盖后放于 25 ℃ 的恒温箱内 4 天, 统计死亡昆虫的数量, 根据计算公式(A)算出死亡率(%)试验分两组进行, 结果列于表 38.

表 38

化合物编号	死亡率
I-11	100
I-44	100
I-45	100
I-67	100
I-69	100
I-88	100
I-89	100
I-90	100
I-94	100
I-96	100
I-97	100
I-99	100
I-102	100
I-106	100
I-114	100
I-115	100
I-116	100
I-118	100
I-140	100
I-141	100
I-149	100
I-150	100
I-151	100
I-153	100
I-155	100
I-156	100
I-157	100
I-160	100
I-161	100
I-162	100
I-165	100

表 38(续)

化合物编号	死亡率
I-173	100
I-174	100
I-175	100
I-176	100
I-177	100
I-178	100
I-179	100
I-180	100
I-183	100
I-185	100
I-186	100
I-187	100
I-188	100
I-189	100
I-191	100
I-192	100
I-194	100
I-195	100
I-196	100
I-197	100
I-206	100
I-218	100
I-222	100
I-253	100
I-254	100
I-257	100
I-258	100
I-263	100
II-5	100
II-6	100
II-10	100

表 38(续)

化合物编号	死亡率
II-11	100
II-12	100
II-13	100
II-15	100
II-16	100
比较例 b	0
比较例 d	0