

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

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



# [12] 发明专利说明书

专利号 ZL 01808126.6

C07C233/76

C07C317/40

C07C317/44

C07C321/28

A01N 37/20

A01N 43/56

A01N 43/40

[45] 授权公告日 2005 年 11 月 9 日

[11] 授权公告号 CN 1226277C

[22] 申请日 2001.2.9 [21] 申请号 01808126.6

[30] 优先权

[32] 2000. 2. 16 [33] JP [31] 38586/00

[86] 国际申请 PCT/JP2001/000957 2001. 2. 9

[87] 国际公布 WO2001/060783 日 2001. 8. 23

[85] 进入国家阶段日期 2002. 10. 15

[71] 专利权人 石原产业株式会社

地址 日本大阪府

[72] 发明人 中村裕治 森田雅之 井樱贤二

审查员 任晓兰

[74] 专利代理机构 上海专利商标事务所有限公司

代理人 胡 焯

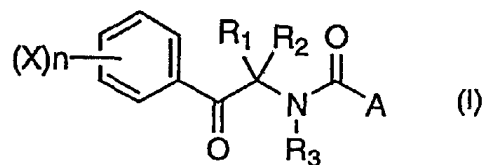
C07D213/64 C07D213/82 C07D231/14 C07D231/16

权利要求书 4 页 说明书 26 页

[54] 发明名称 苯甲酰甲胺衍生物及其制法和含这些衍生物的有害生物防治剂

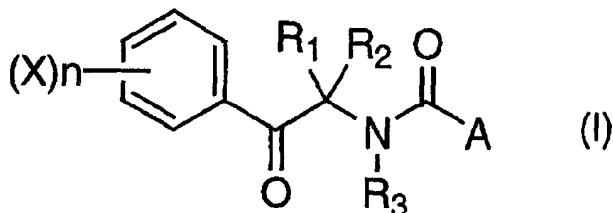
[57] 摘要

本发明涉及式(I)表示的苯甲酰甲胺衍生物或其盐, 式中, A 为烷基、环烷基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的吡啶基或可被 Y 取代的吡唑基, R<sub>1</sub>及 R<sub>2</sub>分别为烷基或 R<sub>1</sub>与 R<sub>2</sub>一起形成 3~6 元饱和碳环, R<sub>3</sub>为氢原子、烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基或 COR<sub>4</sub>基, X 为卤素、烷基、卤代烷基、链烯基、卤代链烯基、炔基、卤代炔基、烷氧基、卤代烷氧基、链烯氧基、卤代链烯氧基、炔氧基、卤代炔氧基、炔硫基、卤代炔硫基、烷基亚硫酰基、卤代烷基亚硫酰基、烷基硫酰基、卤代烷基硫酰基、二烷基氨基硫酰基、硝基、氰基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的苯氧基、可被 Y 取代的苄氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基, n 为 0~5 的整数。



ISSN 1008-4274

## 1. 式(I)



- 5 表示的苯甲酰胺衍生物或其盐，式中，A 为 C1-C6 烷基、C3-C6 环烷基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的吡啶基或可被 Y 取代的吡唑基，R<sub>1</sub> 及 R<sub>2</sub> 分别表示 C1-C6 烷基或 R<sub>1</sub> 与 R<sub>2</sub> 一起形成 3~6 元饱和碳环，R<sub>3</sub> 为氢原子、C1-C6 烷基、C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基、C1-C6 烷硫基 C1-C6 烷基或 COR<sub>4</sub> 基，R<sub>4</sub> 为 C1-C6 烷基或 C1-C6 烷氧基，X 为卤素、C1-C6 烷基、C1-C6 卤代烷基、C2-C7
- 10 链烯基、C2-C7 卤代链烯基、C2-C7 炔基、C2-C7 卤代炔基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 卤代烷氧基、C2-C7 链烯氧基、C2-C7 卤代链烯氧基、C2-C7 炔氧基、C2-C7 卤代炔氧基、C1-C6 烷硫基、C1-C6 卤代烷硫基、C2-C7 链烯硫基、C2-C7 卤代链烯硫基、C2-C7 炔硫基、C2-C7 卤代炔硫基、C1-C6 烷基亚硫酰基、C1-C6 卤代烷基亚硫酰基、C1-C6 烷基硫酰基、C1-C6 卤代烷基硫酰基、二 C1-C6 烷
- 15 基氨基硫酰基、硝基、氰基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的苯氧基、可被 Y 取代的苄氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基，Y 为卤素、C1-C6 烷基、C1-C6 卤代烷基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 卤代烷氧基、C1-C6 烷硫基、C1-C6 卤代烷硫基、C1-C6 烷基亚硫酰基、C1-C6 卤代烷基亚硫酰基、C1-C6 烷基硫酰基、C1-C6 卤代烷基硫酰基、二 C1-C6 烷基氨基硫酰基、硝基或氰基，n 为 0~5
- 20 的整数，n 在 2 以上时，X 可相同也可不同，但 A 为甲基、叔丁基、苯基、R<sub>1</sub> 及 R<sub>2</sub> 分别为甲基或一起形成 6 元饱和碳环、R<sub>3</sub> 为氢原子、且 n 为 0 的情况除外。

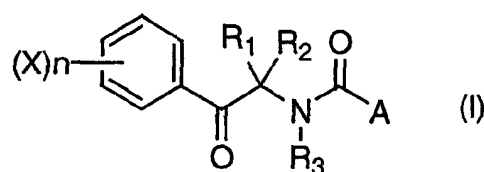
2. 如权利要求 1 所述的苯甲酰胺衍生物或其盐，其中，X 为卤素、C1-C6 烷基、C1-C6 卤代烷基、C2-C7 卤代链烯基、C2-C7 卤代炔基、C1-C6 烷
- 25 氧基、C1-C6 卤代烷氧基、C2-C7 卤代链烯氧基、C2-C7 卤代炔氧基、C1-C6 烷硫基、C1-C6 卤代烷硫基、C2-C7 卤代链烯硫基、C2-C7 卤代炔硫基、C1-C6 烷基亚硫酰基、C1-C6 卤代烷基亚硫酰基、C1-C6 烷基硫酰基、C1-C6 卤代烷

基硫酸基、二 C1-C6 烷基氨基硫酸基、硝基、氰基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的苯氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基。

3. 如权利要求 1 所述的苯甲酰甲胺衍生物或其盐，其中，X 为卤素、C1-C6 烷基、C1-C6 卤代烷基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 卤代烷氧基、C1-C6 烷硫基、C1-C6 卤代烷硫基、C1-C6 烷基亚硫酸基、C1-C6 卤代烷基亚硫酸基、C1-C6 烷基硫酸基、C1-C6 卤代烷基硫酸基、二 C1-C6 烷基氨基硫酸基、硝基、氰基、可被 Y 取代苯氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基。

4. 如权利要求 1 所述的苯甲酰甲胺衍生物或其盐，其中，A 为可被 Y 取代的苯基，R<sub>1</sub> 及 R<sub>2</sub> 都为 C1-C6 烷基，R<sub>3</sub> 为氢原子，X 为卤素、C1-C6 卤代烷基、C1-C6 卤代烷氧基、C1-C6 卤代烷硫基、C1-C6 卤代烷基亚硫酸基、C1-C6 卤代烷基硫酸基、可被 Y 取代的苯氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基，Y 为卤素、C1-C6 烷基、C1-C6 卤代烷基、C1-C6 卤代烷氧基或 C1-C6 卤代烷硫基，n 为 1~3 的整数。

5. 式(I)



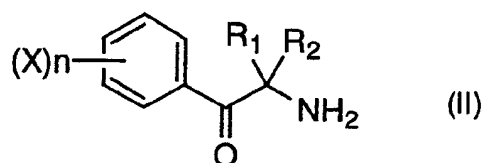
15

表示的苯甲酰甲胺衍生物或其盐的制法，式中，A 为 C1-C6 烷基、C3-C6 环烷基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的吡啶基或可被 Y 取代的吡啶基，R<sub>1</sub> 及 R<sub>2</sub> 分别表示 C1-C6 烷基或 R<sub>1</sub> 与 R<sub>2</sub> 一起形成 3~6 元饱和碳环，R<sub>3</sub> 为氢原子、C1-C6 烷基、C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基、C1-C6 烷硫基 C1-C6 烷基或 COR<sub>4</sub> 基，R<sub>4</sub> 为 C1-C6 烷基或 C1-C6 烷氧基，X 为卤素、C1-C6 烷基、C1-C6 卤代烷基、C2-C7 链烯基、C2-C7 卤代链烯基、C2-C7 炔基、C2-C7 卤代炔基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 卤代烷氧基、C2-C7 链烯氧基、C2-C7 卤代链烯氧基、C2-C7 炔氧基、C2-C7 卤代炔氧基、C1-C6 烷硫基、C1-C6 卤代烷硫基、C2-C7 链烯硫基、C2-C7 卤代链烯硫基、C2-C7 炔硫基、C2-C7 卤代炔硫基、C1-C6 烷基亚硫酸基、C1-C6 卤代烷基亚硫酸基、C1-C6 烷基硫酸基、C1-C6 卤代烷基硫酸基、二 C1-C6 烷基氨基硫酸基、硝基、氰基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的苯氧基、可被 Y 取代的苯氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基，Y 为卤素、C1-C6 烷基、C1-C6 卤代烷基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 卤代烷氧基、C1-C6 烷硫

20

25

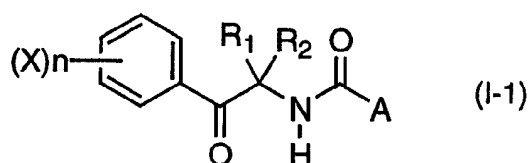
- 基、C1-C6 卤代烷基硫基、C1-C6 烷基亚硫酸基、C1-C6 卤代烷基亚硫酸基、C1-C6 烷基硫酸基、C1-C6 卤代烷基硫酸基、二 C1-C6 烷基氨基硫酸基、硝基或氰基，n 为 0~5 的整数，n 在 2 以上时，X 可相同也可不同，但 A 为苯基、R<sub>1</sub> 及 R<sub>2</sub> 分别为甲基或一起形成 6 元饱和碳环、R<sub>3</sub> 为氢原子、且 n 为 0 的情况除  
5 外，其特征在于，(A)使式(II)



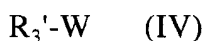
表示的化合物与式(III)



- 表示的化合物反应，式(II)中的 R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、X 及 n 如前所述，式(III)中的 A 如前  
10 所述，Z 为羟基、C1-C6 烷氧基或卤素，或(B)使式(I-1)



表示的化合物与式(IV)



- 表示的化合物反应，式(I-1)中的 A、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、X 及 n 如前所述，式(IV)中的 R<sub>3</sub>'  
15 为 C1-C6 烷基、C1-C6 烷氧基 C1-C6 烷基、C1-C6 烷基硫基 C1-C6 烷基或 COR<sub>4</sub> 基，R<sub>4</sub> 如前所述，W 为卤素。

6. 有害生物防治剂，其特征在于，含有作为有效成分的权利要求 1 所述的苯甲酰甲胺衍生物或其盐。

7. 如权利要求 6 所述的有害生物防治剂，其特征在于，所述有害生物防  
20 治剂是农业园艺业用有害生物防治剂。

8. 如权利要求 6 所述的有害生物防治剂，其特征在于，所述有害生物防  
治剂是杀虫、杀螨或杀线虫剂。

9. 如权利要求 6 所述的有害生物防治剂，其特征在于，所述有害生物防  
治剂是杀线虫剂。

- 25 10. 如权利要求 6 所述的有害生物防治剂，其特征在于，所述有害生物防  
治剂是动物寄生生物防治剂。

---

11. 如权利要求 6 所述的有害生物防治剂，其特征在于，所述有害生物防治剂是动物体内寄生性生物防治剂。

12. 如权利要求 6 所述的有害生物防治剂，其特征在于，所述有害生物防治剂是寄生生物引起的动物疾病防治剂。

5        13. 农业园艺上的有害生物的防治方法，其特征在于，使用了有效量的权利要求 1 所述的苯甲酰甲胺衍生物或其盐。

苯甲酰胺衍生物及其制法和含这些  
衍生物的有害生物防治剂

5

技术领域

本发明涉及作为有害生物防治剂的有效成分的新颖的苯甲酰胺衍生物。

背景技术

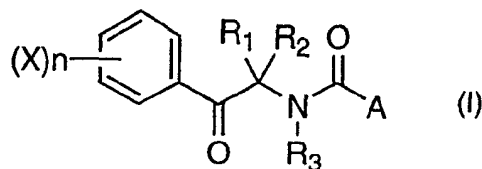
10 日本专利公报昭 48-18222 号揭示了酰氨基酮衍生物的制法，但未见有关对后述式(I)所示的苯甲酰胺衍生物的具体记载。此外，该公报也完全未揭示后述的其作为有害生物防治剂的有效性。

长期以来，人们使用了许多有害生物防治剂，但因效果不理想、有害生物产生抗性而使用受到限制，并出现对人畜鱼类等毒性强或因残留而扰乱生态等问题，  
15 从而引出不少课题。人们希望开发出缺陷较少、安全性较高的有害生物防治剂。

此外，由于动物寄生性生物寄生于家畜、宠物等的体表、胃、肠道、肺、心、肝、血管、皮下、淋巴组织等处，引起各种动物疾患，如贫血、营养失调、衰弱、体重减轻、肠道壁、各种器官及其他组织的障碍等，所以希望能得到防治。

20 发明的揭示

本发明者为了找到更优良的有害生物防治剂，对苯甲酰胺衍生物作了各种研究。结果表明新颖的苯甲酰胺衍生物及其盐以低剂量即对有害生物有极高的防治效果，且对哺乳动物、鱼类等几乎没有不良影响，从而完成了本发明。即，本发明为式(I)：



25

表示的苯甲酰胺衍生物及其盐、其制法，以及含这些化合物的有害生物防治剂，式中，A 为烷基、环烷基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的吡啶基或可被 Y 取代的吡唑基，R<sub>1</sub> 及 R<sub>2</sub> 分别表示烷基、或 R<sub>1</sub> 与 R<sub>2</sub> 一起形成 3~6 元饱和碳环，R<sub>3</sub> 为

氢原子、烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基或  $\text{COR}_4$  基,  $\text{R}_4$  为烷基或烷氧基, X 为卤素、烷基、卤代烷基、链烯基、卤代链烯基、炔基、卤代炔基、烷氧基、卤代烷氧基、链烯氧基、卤代链烯氧基、炔氧基、卤代炔氧基、烷硫基、卤代烷硫基、链烯硫基、卤代链烯硫基、炔硫基、卤代炔硫基、烷基亚硫酸基、卤代烷基亚硫酸基、烷基硫酸基、卤代烷基硫酸基、二烷基氨基硫酸基、硝基、氰基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的苯氧基、可被 Y 取代的苄氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基, Y 为卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、烷基亚硫酸基、卤代烷基亚硫酸基、烷基硫酸基、卤代烷基硫酸基、二烷基氨基硫酸基、硝基或氰基, n 为 0~5 的整数, n 在 2 以上时, X 可相同也可不同, 但 A 为无取代的苯基、 $\text{R}_1$  及  $\text{R}_2$  分别为甲基或一起形成 6 元饱和碳环、 $\text{R}_3$  为氢原子、且 n 为 0 的情况除外。

A、 $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_2$ 、 $\text{R}_3$ 、 $\text{R}_4$ 、X 及 Y 中的烷基或烷基部分为具有 1~6 个碳原子的直链或支链基团, 例如甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、叔丁基、戊基、己基等。

A 中的环烷基是具有 3~6 个碳原子的基团, 例如环丙基、环戊基、环己基等。

X 中的链烯基或链烯基部分为具有 2~7 个碳原子的直链或支链基团, 例如乙烯基、1-丙烯基、烯丙基、异丙基、1-丁烯基、1,3-戊二烯基、1-己烯基、1-庚烯基等。X 中的炔基或炔基部分为具有 2~7 个碳原子的直链或支链基团, 例如乙炔基、2-丁炔基、2-戊炔基、3-己炔基、4-二甲基-2-戊炔基等。

A 中的可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的吡啶基和可被 Y 取代的吡啶基, 以及 X 中的可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的苯氧基、可被 Y 取代的苄氧基和可被 Y 取代的吡啶氧基中的取代基 Y 的数目可以是 1 或 2 以上, 为 2 个以上时, 这些取代基可以相同也可以不同。

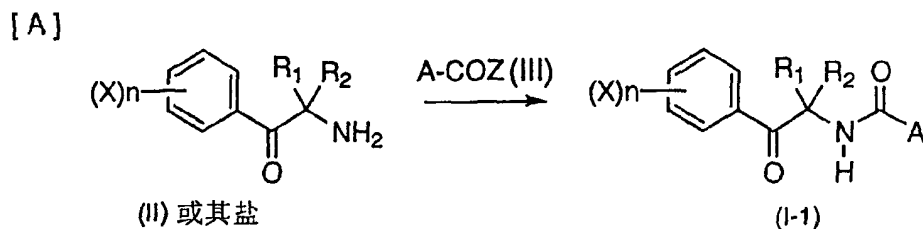
X 及 Y 中的卤素或作为取代基的卤素为氟、氯、溴或碘。作为取代基的卤素的数目可以是 1 或 2 以上, 为 2 以上时, 各个卤素可以相同也可以不同。此外, 卤素的取代位置是任意的。

前述式(I)表示的苯甲酰胺甲胺衍生物的盐只要是农业上允许的盐即可, 例如钠盐、钾盐等碱金属盐, 镁盐、钙盐等碱土金属盐, 二甲胺盐、三乙胺盐等胺盐, 盐酸盐、高氯酸盐、硫酸盐、硝酸盐等无机酸盐, 乙酸盐、甲磺酸盐等有机酸盐。

上述式(I)表示的苯甲酰胺甲胺衍生物存在光学异构体。本发明包括各种异构体及不同异构体的混合物。

上述式(I)表示的苯甲酰胺甲胺衍生物盐(以下略称为本发明化合物)可按以下

反应式[A]和[B]或通常的盐的制法制得。



反应(A)中, A、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、Y及n如前所述, Z为羟基、烷氧基或卤素, 卤素包括氟、氯、溴或碘各原子。

5 反应[A]通常在碱及溶剂存在下进行。

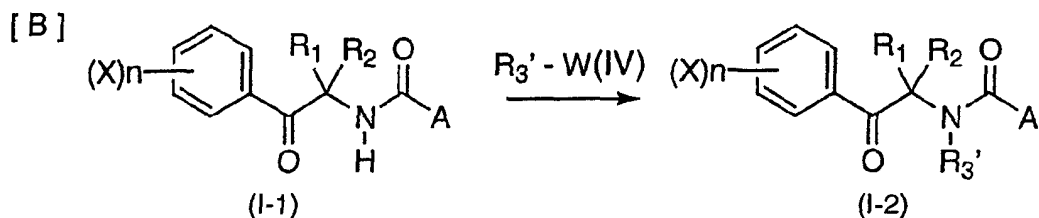
所用碱包括选自钠、钾等碱金属, 甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等碱金属醇盐, 碳酸钠、碳酸钾等碳酸盐, 碳酸氢钠、碳酸氢钾等碳酸氢盐, 氢氧化钠、氢氧化钾等金属氢氧化物, 氢化钠、氢化钾等金属氢化物, 甲胺、二甲胺、三乙胺等胺类, 吡啶、4-二甲基氨基吡啶等吡啶类等的1种或2种以上, 碱的用量为式(II)

10 表示的化合物的1~3倍摩尔, 最好是1~3倍摩尔。

所用溶剂只要是对反应显惰性的溶剂即可, 可使用选自苯、甲苯、二甲苯、氯苯等芳香族烃类, 四氯化碳、一氯甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、环己烷等脂肪族烃类, 二噁烷、四氢呋喃、乙醚等醚类, 乙酸甲酯、乙酸乙酯等酯类, 二甲亚砜、环丁砜、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶等极性非质子性溶剂, 乙腈、丙腈、丙烯腈等腈类, 丙酮、丁酮等酮类等的1种或2种以上。

15 反应[A]按需可在脱水缩合剂存在下进行, 该脱水缩合剂可用N,N'-二环己基碳二亚胺等。

20 反应[A]的反应温度通常为0~100℃, 最好为0~50℃, 反应时间通常为0.5~48小时, 最好为1~24小时。



反应[B]中的A、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、X及n如前所述, R<sub>3</sub>'为烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基或COR<sub>4</sub>基(R<sub>4</sub>如前所述), W为卤素, 卤素包括氟、氯、溴、碘各原子。

反应[B]通常在碱及溶剂存在下进行。

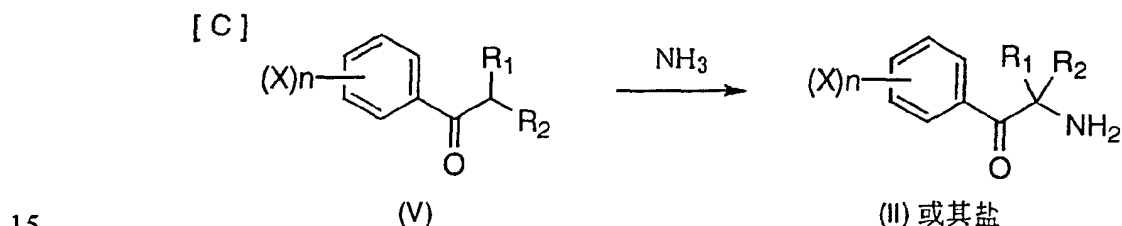


所用碱可使用选自钠、钾等碱金属，甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等碱金属醇盐，碳酸钠、碳酸钾等碳酸盐，碳酸氢钠、碳酸氢钾等碳酸氢盐，氢氧化钠、氢氧化钾等金属氢氧化物，氢化钠、氢化钾等金属氢化物，甲胺、二甲胺、三乙胺等胺类，吡啶、4-二甲基氨基吡啶等吡啶类等的1种或2种以上。碱的用量为式(I-1)化合物的1~3倍摩尔，最好是1~1.5倍摩尔。

所用溶剂只要对反应显惰性即可，可使用选自苯、甲苯、二甲苯、氯苯等芳香族烃类，四氯化碳、一氯甲烷、氯仿、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷、己烷、环己烷等脂肪族烃类，二噁烷、四氢呋喃、乙醚等醚类，乙酸甲酯、乙酸乙酯等酯类，二甲亚砜、环丁砜、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶等极性非质子性溶剂，乙腈、丙腈、丙烯腈等腈类，丙酮、丁酮等酮类的1种或2种以上。

反应[B]的反应温度一般为0~100℃，最好为0~50℃，反应时间一般为1~300小时，最好为1~150小时。

上述反应[A]所用的式(II)化合物是新的，可按以下反应[C]或[D]制得。



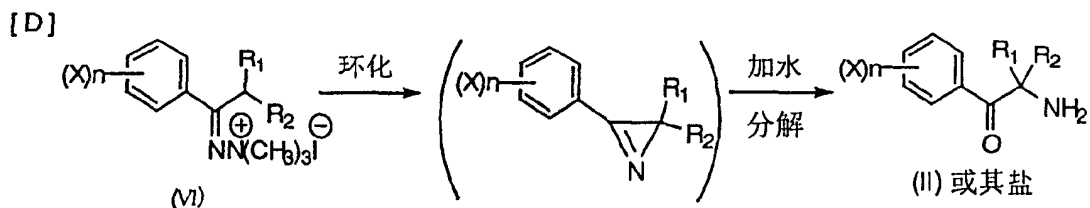
反应[C]中， $R_1$ 、 $R_2$ 、 $X$ 及 $n$ 如前所述。反应[C]可经反应后处理及一般成盐反应制得化合物(II)的盐。

反应[C]一般在氧化剂及溶剂存在下进行。

所用氧化剂为铁氰化钾等，所用氧化剂为式(V)化合物的1~10倍摩尔，最好为1~5倍摩尔。

所用溶剂只要对反应显惰性即可，可使用选自二噁烷、四氢呋喃、乙醚等醚类，乙酸甲酯、乙酸乙酯等酯类，二甲亚砜、环丁砜、二甲基乙酰胺、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、吡啶等极性非质子性溶剂，乙腈、丙腈、丙烯腈等腈类，丙酮、丁酮等酮类及水等的1种或2种以上。

反应[C]的反应温度一般为20~150℃，最好为50~100℃，反应时间一般为0.5~30小时，最好为1~20小时。



反应[D]中， $R_1$ 、 $R_2$ 、 $X$ 及 $n$ 如前所述。反应[D]可经反应后处理及一般的成盐反应制得化合物(II)的盐。

反应[D]的环化反应一般在碱及溶剂存在下进行。

- 5 所用碱为选自钠、钾等碱金属，甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等碱金属醇盐，氢化钠、氢化钾等金属氢化物等的1种或2种以上。所用碱为式(VI)化合物的1~3倍摩尔，最好为1~1.5倍摩尔。

- 10 所用的溶剂只要对反应显惰性即可，可使用选自苯、甲苯、二甲苯、氯苯等芳香族烃类，二噁烷、四氢呋喃、乙醚等醚类，甲醇、乙醇、丙醇、叔丁醇等醇类，乙腈、丙腈、丙烯腈等腈类等的1种或2种以上。

反应[D]的环化反应的反应温度一般为 $0\sim 150^\circ\text{C}$ ，最好为 $30\sim 100^\circ\text{C}$ ，反应时间一般为 $0.5\sim 24$ 小时，最好为 $1\sim 12$ 小时。

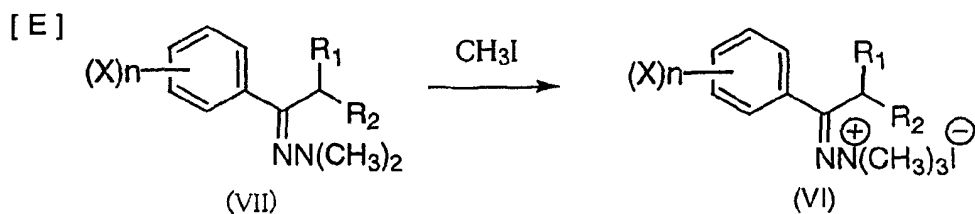
反应[D]的水解反应按一般的水解反应进行即可，一般在酸、碱及溶剂存在下进行。

- 15 所用酸包括氯化氢、硫酸等，所用碱包括氢氧化钠、氢氧化钾等金属氢氧化物。

所用溶剂只要对反应显惰性即可，可使用选自甲醇、乙醇、丙醇、叔丁醇等醇类，乙腈、丙腈、丙烯腈等腈类，丙酮、丁酮等酮类及水等的1种或2种以上。

- 20 反应[D]的水解反应的反应温度一般为 $0\sim 100^\circ\text{C}$ ，最好为 $20\sim 80^\circ\text{C}$ ，反应时间一般为 $0.1\sim 12$ 小时，最好为 $0.1\sim 1$ 小时。

上述反应[D]中所用的式(VI)化合物是新的，可按下列反应[E]制得。



反应[E]中， $R_1$ 、 $R_2$ 、 $X$ 及 $n$ 如前所述。

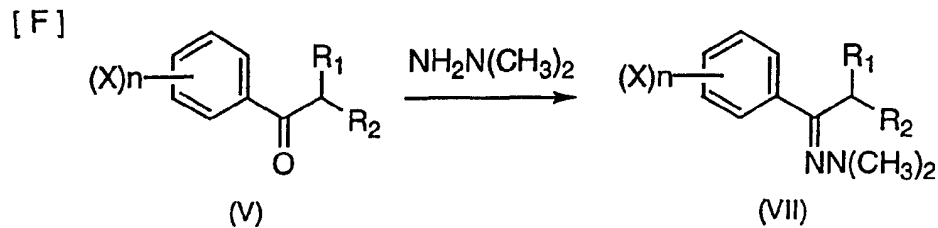
- 25 反应[E]可按需在溶剂存在下进行，该溶剂只要对反应显惰性即可，可使用选自苯、甲苯、二甲苯、氯苯等芳香族烃类，四氯化碳、氯仿、二氯甲烷、二氯

乙烷、三氯乙烷、己烷、环己烷等脂肪族烃类，二噁烷、四氢呋喃、乙醚等醚类，乙酸甲酯、乙酸乙酯等酯类，甲醇、乙醇、丙醇、叔丁醇等醇类，乙腈、丙腈、丙烯腈等腈类，丙酮、丁酮等酮类等的1种或2种以上。

5 反应[E]的碘甲烷用量为式(VII)化合物的1~10倍摩尔，最好为1~3倍摩尔。碘代甲烷如过量使用，则可兼作溶剂。

反应[E]的反应温度一般为0~100℃，最好为10~50℃，反应时间一般为0.5~48小时，最好为1~24小时。

上述反应[E]所用的(VII)化合物是新的，可按下述反应[F]制得。



10 反应[F]中， $R_1$ 、 $R_2$ 、 $X$ 及 $n$ 如前所述。

反应[F]可按一般的腈的合成反应来进行，按需在脱水剂及/或催化剂存在下进行。

脱水剂可使用分子筛等。脱水剂的用量一般为式(V)化合物重量的1~30倍，最好为5~10倍。

15 催化剂可使用四氯化钛等。

反应[F]中的二甲基胍的用量为式(V)化合物用量的1~30倍摩尔、最好为5~10倍摩尔。

反应[F]的反应温度通常为20~150℃，最好为50~120℃，反应时间通常为5~200小时，最好为24~120小时。

20 含本发明化合物的有害生物防治剂的较好例子如下所述。

含本发明化合物的有害生物防治剂可用作杀虫、杀螨、杀线虫、杀土壤害虫剂。可有效防治棉叶螨、红叶螨、神泽叶螨、桔全爪螨、苹果全爪螨、茶半跗线螨、桔锈螨、刺足根螨等植物寄生性螨类，桃蚜、棉蚜等蚜科、菜蛾、甘蓝夜蛾、夜纹夜蛾、棉黑叶甲、棉铃虫、烟草夜蛾、舞毒蛾、稻纵卷叶蛾、茶小卷叶蛾、  
25 马铃薯甲虫、黄守瓜、棉铃象虫、飞虱科、叶蝉科、介壳虫科、椿象科、粉虱科、蓟马科、蝗虫科、花蝇科、金龟子科、小地老虎、黄地老虎、蚊科等农业害虫，甘薯根瘤线虫科、异皮线虫科、根腐线虫、稻白顶线虫、草莓不正茎线虫、松木

线虫等植物寄生性线虫，蛭螭、大蜗牛科等腹足纲，鼠妇科、潮虫亚目同足亚纲等土壤害虫，扁虱、蜚蠊、家蝇、库蚊等卫生害虫，麦蛾、绿豆象、赤拟谷盗、大点拟粉虫科等粮库害虫，袋谷蛾、黑毛皮蠹、白蚁科等衣物家舍害虫类，腐食酪螨、粉飘螨、ミナミツメダニ等室内粉尘螨等。其中，含本发明化合物的有害生物防治剂对农业害虫、植物寄生性线虫等的防治特别有效。此外，对有机磷、氨基甲酸酯、合成拟除虫菊酯等药剂产生各种抗性的害虫，使用含本发明化合物的有害生物防治剂进行防治也很有效。由于本发明化合物具有优良的渗透转移性，所以用含本发明化合物的有害生物防治剂处理土壤，就能在防治土壤有害昆虫、螨类、线虫类、腹足纲、同足亚纲害虫的同时，对茎叶部的害虫进行防治。

除上所述之外，含本发明化合物的有害生物防治剂还可用作上述植物寄生性螨类、农业害虫类、植物寄生性线虫类、腹足纲、土壤害虫等的综合性的农业园艺用有害生物防治剂。

通常将含本发明化合物的有害生物防治剂与各种农业助剂相混合，制成粉剂、颗粒剂、颗粒水和剂，水和剂、水溶性悬浮剂、油性悬浮剂、水溶液剂、乳剂、溶液剂、糊剂、气雾剂、低剂量喷洒剂等各种制剂后使用，只要达到本发明的目的，可用于一般该领域可使用的所有制剂。所用助剂包括硅藻土、消石灰、碳酸钙、滑石粉、白炭、高岭土、膨润土、高岭石与丝云母的混合物、粘土、碳酸钠、碳酸氢钠、硫酸钠、沸石、淀粉等固形载体，水、甲苯、二甲苯、溶剂石脑油、二噁烷、丙酮、异佛尔酮、甲基异丁基酮、氯苯、环己烷、二甲亚砷、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮、乙醇等溶剂，脂肪酸盐、苯甲酸盐、烷基磺基琥珀酸盐、二烷基磺基琥珀酸盐、聚羧酸盐、烷基硫酸酯盐、烷基硫酸盐、烷基芳基硫酸盐、烷基二甘醇醚硫酸盐、硫酸醇酯盐、烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、芳基磺酸盐、木质素磺酸盐、烷基二苯醚二磺酸盐、聚苯乙烯磺酸盐、烷基磷酸酯盐、烷基芳基磷酸盐、苯乙烯基芳基磷酸盐、聚氧乙烯烷基醚硫酸酯盐、聚氧乙烯烷基芳基醚硫酸盐、聚氧乙烯烷基芳基醚硫酸酯盐、聚氧乙烯烷基醚磷酸盐、聚氧乙烯烷基芳基磷酸酯盐、萘磺酸甲醛缩合物的盐等阴离子性表面活性剂及展开剂，脱水山梨醇脂肪酸酯、甘油脂肪酸酯、脂肪酸聚甘油酯、脂肪酸醇聚甘油醚、乙炔二醇、乙炔醇、氧化烯炔嵌段聚合物、聚氧乙烯烷基醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯苯乙烯基芳基醚、聚氧乙烯脱水山梨糖醇脂肪酸酯、聚氧乙烯甘油脂肪酸酯、聚氧乙烯硬化蓖麻籽油、聚氧丙烯脂肪酸酯等非离子性表面活性剂及展开剂，橄榄油、木棉油、蓖麻籽油、棕榈油、山茶油、

椰子油、芝麻油、玉米油、米糠油、花生油、棉籽油、豆油、菜油、亚麻籽油、桐油、液体石蜡等植物油和矿物油。这些助剂只要不影响本发明的目的，可在该领域已知的助剂中选用，此外还可使用增量剂、增粘剂、防沉降剂、防冻剂、分散稳定剂、减轻药害剂、防霉剂等常用助剂。本发明化合物与各种助剂的配比为  
5 0.001:99.999~95:5、最好是 0.005:99.995~90:10。这些制剂在实际使用时，可直接使用也可用水等稀释剂稀释至所需浓度再使用，必要时可添加相应的各种展开剂。

含本发明化合物的有害生物防治剂的使用应按气象条件、制剂形式、施用时间、施用场所、病虫害种类及临场状况等差异而定，不能统一规定，一般有效成分浓度为 0.05~800000ppm、最好为 0.5~500000ppm，其单位面积的使用量是每公顷使用本发明化合物 0.05~50000g，最好为 1~30000g。含本发明化合物的有害生物防治剂以其他方式用于农业园艺业用防治有害生物时，其用法可以上述有害生物防治剂的使用方法为基准。本发明还包括通过上述施用方法对有害生物进行防治的方法，特别是对农业害虫、植物寄生性线虫的防治方法。  
10

含本发明化合物的有害生物防治剂的各种制剂及其稀释剂在使用时可按一般常法施行。即，采用撒布(例如撒布、喷雾、混入、喷雾气流、撒粒、水面施用等)、土壤使用(掺入、灌注等)、表面施用(涂布、覆盖等)、浸渍毒饵等方法。此外，对于家畜，可将上述有效成分混入饲料中，可阻碍其排泄物中的害虫、特别是有害昆虫的产生及发育。也可用所谓超低容量喷洒法，对于此法活性成分的含量可  
15 20 达到 100%。

含本发明化合物的有害生物防治剂可与其他农药、肥料、药害减轻剂等混用或并用，有时可显示更好的效果及作用。其他农药包括除草剂、杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀土壤害虫剂、杀菌剂、抗病毒剂、引诱剂、抗生素、植物激素、植物生长调节剂等。特别是本发明化合物与其他农药的有效成分化合物的 1 种或 2  
25 种以上混用或并用的混合有害生物防治组合物可在适用范围、药剂处理时间、防治活性等方面得到改进。将本发明化合物与其他农药的有效成分化合物分别制剂，在撒布时混合使用，或者将两者一起制剂使用都是可以的。本发明也包含这种混合有害生物防治组合物。

本发明化合物与其他农药的有效成分化合物的混合比按气象条件、制剂形式、施用时间、施用场所、病虫害的种类与临场状况等而定，不能笼统规定，但  
30 一般为 1:300~300:1，最好是 1:100~100:1。合适的施用量为每公顷使用有效成

分化合物 0.1~50000g, 最好是 1~30000g。本发明也包括通过使用这种混合有害生物防治组合物对有害生物进行防治的方法。

上述可混有或并用的其他农药中的杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂或杀土壤害虫剂, 即虫害防治剂的有效成分化合物(通用名, 包括部分正在申请中)包括丙溴磷、敌敌畏、虫胺磷(Fenamiphos)、杀螟松、苯硫磷、二嗪农、甲基毒死蜱、乙酰甲胺磷、丙硫磷、噻唑硫磷、phosphocarb、硫线磷、乙拌磷等有机磷酸酯类化合物, 甲萘威、猛杀威、涕灭威、呋喃丹、硫双威、灭多威、杀线威、乙硫苯威、抗蚜威、仲丁威、丁硫克百威、丙硫克百威等氨基甲酸酯类化合物, 杀螟丹、杀虫环等沙蚕毒素衍生物, 三氯杀螨醇、三氯杀螨砒等有机氯系化合物, 苯丁锡等有机金属类化合物, 氰戊菊酯、氯菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、氯氟氰菊酯、七氟菊酯、醚菊酯等拟除虫菊酯类化合物, 除虫脲、定虫隆、伏虫隆、氟虫脲等苯甲酰脲类化合物, 烯虫酯等保幼激素样化合物, 哒螨酮等哒螨酮类化合物, 唑螨酯、氟虫腈、吡螨胺、Ethiprole、唑虫酰胺等吡唑类化合物, 吡虫啉、烯啶虫胺、啶虫咪、噻虫啉、噻虫嗪、噻虫胺、呋虫胺等新烟碱类, 虫酰肼、甲氧虫酰肼、环虫酰肼等肼类化合物, 二硝基类化合物, 有机硫化合物、脲类化合物, 三嗪类化合物, 脲类化合物; 以及作为其他化合物的噻嗪酮、噻螨酮、双甲脒、杀虫脒、氟硅菊酯、啶蚜威、吡啶酮、啉啉醚、溴虫腈、茚虫威、Acequinocyl、乙螨唑、灭蝇胺、1,3-二氯丙烯等化合物; 还有苏云金杆菌、昆虫病原病毒剂等微生物农药, 阿维菌素、弥拜菌素、多杀菌素等抗生素等。

上述其他农药中的杀菌剂的有效成分化合物(通用名, 包括部分正在申请中)包括啞菌胺、啞霉胺、啞菌环胺等啞啞胺类化合物, 三唑酮、双苯三唑醇、氟菌唑、乙环唑、丙环唑、戊菌唑、氟硅唑、腈菌唑、环唑醇、戊唑醇、己唑醇、呋醚唑、咪鲜胺、叶菌唑、氟环唑、氟醚唑、恶咪唑、灭螨猛等啞啞啞啞类化合物, 代森锰、代森锌、代森锰锌、福代锌、丙森锌等二硫代氨基甲酸盐类化合物, 四氯苯酞、百菌清、五氯硝基苯等有机氯类化合物, 苯菌灵、甲基托布津、多菌灵、4-氯-2-氰基-1-二甲基氨磺酰-5-(4-甲基)咪唑等咪唑类化合物, 氟啶胺等吡啶胺类化合物, 霜脲氰等氰乙酰胺类化合物, 甲霜灵、啞霜灵、甲呋酰胺、苯霜灵、呋霜灵、酯菌胺等苯酰胺类化合物, 苯氟磺胺等磺酸类化合物, 氢氧化铜、有机铜(啞啞铜)等铜类化合物, 土菌消等异啞啞啞类化合物, 乙磷铝、甲基立枯磷、S-苄基-0、0-二异丙基硫代磷酸酯、0-乙基-S、S-二苯基二硫代磷酸酯、乙基卤代磷酸铝等有机磷类化合物, 克菌丹、敌菌丹、灭菌丹等 N-卤代硫烷基类化合物,

腐霉利、异菌脲、乙烯菌核利等二羧酰亚胺类化合物，氟酰胺、灭锈胺、苯酰菌胺等苯甲酰苯胺类化合物，嘧啶灵等嘧啶类化合物，啉斑肟等吡啶类化合物，氟苯嘧啶醇、粉唑醇等甲醇类化合物，苯锈啉等嘧啶类化合物，丁苯吗啉等吗啉类化合物，毒菌锡、薯瘟锡等有机锡类化合物，戊菌隆等脲类化合物，烯酰吗啉等肉桂酸类化合物，乙霉威等苯基氨基甲酸酯类化合物，咯菌腈、拌种咯等氰基吡咯类化合物，嘧菌酯、醚菌酯、Metominofen、肟菌酯、Picoxystrobin 等 Strobillin 类化合物，噁唑菌酮等唑啉二酮类化合物，噁唑菌胺等噁唑酰胺类化合物，硅噁菌胺等甲硅烷酰胺类化合物，异丙菌胺等氨基酸酰胺氨基甲酸酯类化合物，咪唑菌酮等咪唑酮类化合物，环酰菌胺等羟基酰替苯胺类化合物，磺菌胺等苯碘酰胺类化合物，葱醌类化合物，巴豆酸类化合物，抗生素及作为其他化合物的稻瘟灵、三环唑、咯嗪酮、吡菌清、烯丙异噁唑、苯氧唑啉、霜霉威盐酸盐、螺环菌胺、氯化苦、棉隆、威百亩等。

可与本发明化合物混用或并用的农药还包括 Farm Chemicals Handbook (1998 年版)所记载的除草剂的有效成分化合物，特别是土壤处理型农药等。

含本发明化合物的有害生物防治剂可用作动物寄生生物防治剂，特别是动物体内寄生性生物的防治剂或由寄生生物引起的动物疾病的防治剂，例如对(1)疥癣螨、メソスチグマチド、疥癣、恙螨、フタトビチマダニ、オウシマダニ等螨类，猫蚤、犬蚤、鼠蚤、ケオプト鼠蚤、人蚤等蚤类，牛虱、马虱、羊虱、牛细虱、头虱等虱类，犬羽虱等羽虱类，牛虻、ウアイヌカカ、ツメトグブエ等的吸血性双翅目害虫等寄生动物体内的寄生性寄生生物；(2)后圆线虫、鞭虫、结节虫、胃内寄生虫、蛔虫、丝虫等线虫纲，绦虫、吸虫、球虫、疟原虫、肠内肉孢子虫、弓浆虫、隐孢子虫等原生动物在宿主体内的寄生生物的防治有效。

本发明化合物通常与载体制成制剂而使用，剂型有粉剂、粒剂、颗粒剂、片剂、散剂、胶囊剂、溶液剂、乳剂等。作为载体可用适合饲料用药剂等的载体，例如乳糖、蔗糖、葡萄糖、淀粉、麦粉、玉米粉、大豆饼、脱脂米糖、碳酸钙、其他市售的饲料原料等。此外，本发明化合物可与载体一起配用各种维生素、矿物质、氨基酸、酶制剂、退热剂、镇静剂、消炎剂、杀菌剂、着色剂、芳香剂、保存剂等。本发明化合物的给药浓度应按所防治的寄生生物、给药方法、给药目的、病症等决定，配入饲料中给药时，一般以 0.1ppm 以上浓度给药为宜。

按特开平 5-70350 号、特表平 11-500439 号记载的试验方法进行试验，本发明化合物对动物寄生生物，例如蚤类、球虫类、丝虫均显示出防治效果。

本发明的其他较好的例子如下所述：

[1] 上式(I)中的 X 为卤素、烷基、卤代烷基、卤代链烯基、卤代炔基、烷氧基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、卤代炔氧基、烷硫基、卤代烷硫基、卤代链烯硫基、卤代炔硫基、烷基亚硫酸基、卤代烷基亚硫酸基、烷基硫酸基、卤代烷基硫酸基、二烷基氨基硫酸基、硝基、氰基、可被 Y 取代的苯基、可被 Y 取代的苯氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基的苯甲酰胺衍生物或其盐。

[2] 上式(I)中的 X 为卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、烷基亚硫酸基、卤代烷基亚硫酸基、烷基硫酸基、卤代烷基硫酸基、二烷基氨基硫酸基、硝基、氰基、可被 Y 取代的苯氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基的苯甲酰胺衍生物或其盐。

[3] 上式(I)中的 A 为可被 Y 取代的苯基， $R_1$  及  $R_2$  都为烷基， $R_3$  为氢原子，X 为卤素、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代烷硫基、卤代烷基亚硫酸基、卤代烷基硫酸基、可被 Y 取代的苯氧基或可被 Y 取代的吡啶氧基，Y 为卤素、烷基、卤代烷基、卤代烷氧基或卤代烷硫基，n 为 1~3 的整数的苯甲酰胺衍生物或其盐。

下面所述为本发明的实施例，但本发明并不限于此。首先记载的是本发明化合物的合成实例。

#### 合成例 1

3,5-二氯-N-[(4'-乙基-1,1-二甲基)-苯甲酰胺甲基]苯甲酰胺(化合物No. 1-84)的合成

(1) 在加热至 80℃ 的 360ml 水中加入铁氰化钾 41g，然后加入 4-乙基异丁酰苯 5.5g，再耗时 30 分钟滴入 28% 的氨水 50ml，于 85~90℃ 反应 16 小时。用乙酸乙酯萃取反应混合物后，减压浓缩。用水稀释残渣，以盐酸调节成酸性后，用乙酸乙酯洗净。用 NaOH 水中和水层，再用乙酸乙酯萃取后，用无水硫酸镁干燥，减压浓缩，得油状  $\alpha$ -氨基-4-乙基-异丁酰苯 0.54g，该化合物的核磁谱数据如下：

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  ppm (溶剂:  $\text{CDCl}_3/400\text{MHz}$ )

1.24(t, 3H), 1.53(s, 6H), 2.66(q, 2H), 7.22(d, 2H), 7.87(d, 2H)。

(2) 在  $\alpha$ -氨基-4-乙基-异丁酰苯 0.16g 及二氯乙烷 4ml 的混合物中加入三乙胺 0.13g，在冰冷却下加入 3,5-二氯苯酰氯 0.18g，室温反应 6 小时。将反应混合物投入水中，用二氯甲烷萃取后水洗。用无水硫酸钠干燥有机层，减压浓缩，将残渣用硅胶柱色谱法精制(展开剂为乙酸乙酯/正己烷=15/85)。获得熔点 176~



177°C的目的产物 0.12g。该化合物的核磁谱数据如下：

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  ppm (溶剂:  $\text{CDCl}_3/400\text{MHz}$ )

1. 23(t, 3H), 1.86(s, 6H), 2.67(q, 2H), 7.24(dd, 2H), 7.38(s, 1H), 7.46(d, 2H),  
7.59(d, 2H), 7.89(dd, 2H)。

5

### 合成例 2

2-氯-N-[(4'-氯-1,1-二甲基)-苯甲酰甲基]苯甲酰胺(化合物 No. 1-54)的合成

(1) 将 4-氯异丁酰苯 5.92g, N,N-二甲基胍 19.5g 及分子筛(3A)29.6g 的混  
10 合物, 于高压釜中 100°C反应 110 小时。将反应混合物用二氯甲烷稀释后过滤。  
用无水硫酸镁干燥后减压浓缩, 得油状 4-氯异丁酰苯二甲基胍 5.82g, 该化合物的  
NMR 谱数据如下:

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  ppm (溶剂:  $\text{CDCl}_3/400\text{MHz}$ )

1.05(d, 6H), 2.31(bs, 6H), 2.85(m, 1H), 7.14(d, 2H), 7.32(d, 2H)。

15

(2) 将 7.82g 碘甲烷加至 4-氯异丁酰苯二甲基胍 5.82g 与无水乙醇 3.5ml 的  
混合物中, 室温反应 15 小时, 减压浓缩反应混合物, 将所得残渣加乙醚搅拌, 过  
滤析出固体, 用乙醚洗涤后干燥, 得熔点为 107~112°C的 4-氯异丁酰苯二甲基胍  
碘甲烷盐 10.19g, 该化合物的核磁谱数据如下:

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  ppm (溶剂:  $\text{CDCl}_3/400\text{MHz}$ )

20

1.13(d, 6H), 2.83(m, 1H), 3.58(s, 9H), 7.28(d, 2H), 7.53(d, 2H)。

(3) 室温下, 在 4-氯异丁酰苯二甲基胍碘甲烷盐与无水乙醇 35ml 的混合物中  
滴入由钠 0.70g 及无水甲醇 15ml 所配制的甲醇钠溶液, 回流反应 3 小时。减压浓  
缩, 先加水再加盐酸至残渣中以调节成弱酸性, 搅拌 30 分钟。过滤生成的固体,  
干燥得 $\alpha$ -氨基-4-氯异丁酰苯盐酸盐(熔点 275°C/分解)2.46g。另将滤液用二氯甲  
25 烷洗净后, 用 NaOH 水中和。用二氯甲烷萃取后, 用无水硫酸钠干燥, 减压浓缩,  
得油状 $\alpha$ -氨基 4-氯异丁酰苯 0.77g。该化合物的 NMR 谱数据如下:

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  ppm (溶剂:  $\text{CDCl}_3/400\text{MHz}$ )

1.58(s, 6H), 7.41(d, 2H), 7.96(d, 2H)。

(4) 在 $\alpha$ -氨基 4-氯异丁酰苯 0.77g 及二氯乙烷 22ml 的混合物中加入 0.47g  
30 的三乙胺。然后, 在室温下在其中滴入 2-氯苯甲酰氯 0.68g 及二氯乙烷 3ml 的混  
合物。滴加结束后, 在相同温度下反应 15 小时。对反应混合物进行水洗; 用无水

硫酸钠干燥后，减压浓缩。所得残渣用硅胶柱色谱法(展开剂为乙酸乙酯/正己烷=3/7)精制，获得熔点为 99~102℃的目的产物 1.05g。该化合物的 NMR 谱数据如下：

- <sup>1</sup>H-NMR δ ppm (溶剂: CDCl<sub>3</sub>/400MHz)
- 5 1.76 (s, 6H), 6.98 (s, 1H), 7.26 (dd, 1H), 7.30~7.42 (m, 5H), 7.97 (dd, 2H)。

### 合成例 3

3,5-二氯-N-[(4'-氯-1,1-二甲基)-苯甲酰基]苯甲酰胺(化合物 No. 1-63)的合成

- 10 室温下，在α-氨基-4-氯异丁酰苯盐酸盐 0.49g 及二氯乙烷 14ml 的混合物中，加入三乙胺 0.47g，再加入 3,5-二氯苯甲酰氯 0.44g，于室温反应 15 小时。水洗反应混合物，用无水硫酸钠干燥后，减压浓缩，在所得残渣中加入正己烷，过滤固体，干燥，得熔点 169~171℃的目的产物 0.46g。该化合物的核磁谱数据如下：

- <sup>1</sup>H-NMR δ ppm (溶剂: CDCl<sub>3</sub>/400MHz)
- 15 1.79 (s, 6H), 7.04 (s, 1H), 7.36 (dd, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.54 (d, 2H),  
7.91 (dd, 2H)。

### 合成例 4

- 20 2-氯-N-[(3',4'-二氯-1,1-二甲基)-苯甲酰甲基]苯甲酰胺(化合物 No. 1-78)的合成

- 25 室温下，在α-氨基-3,4-二氯异丁酰苯 0.22g、2-氯苯甲酸 0.148g 及二氯甲烷 8ml 的混合物中滴加 N,N'-二环己基碳二亚胺 0.215g 及二氯甲烷 7ml 的混合物，在此温度反应 20 小时。水洗反应混合物，用无水硫酸钠干燥后，减压浓缩，所得残渣用硅胶柱色谱法精制(展开剂为乙酸乙酯/正己烷=3/7)，得熔点为 116~120℃的目的产物 0.26g。该化合物的 NMR 光谱数据如下：

- <sup>1</sup>H-NMR δ ppm (溶剂: CDCl<sub>3</sub>/400MHz)
- 1.76 (s, 6H), 6.89 (s, 1H), 7.25~7.29 (m, 1H), 7.33~7.37 (m, 2H), 7.42~7.46 (m, 2H), 7.87 (dd, 2H), 8.15 (d, 2H)。

### 30 合成例 5

N-甲基-N[(1,1-二甲基)-苯甲酰甲基]-2-三氟甲基苯甲酰胺(化合物 No. 1-27)

的合成

室温下, 在 N-[(1, 1-二甲基)苯甲酰甲基]-2-三氟甲基苯甲酰胺 0.33g 与四氢呋喃 5ml 反应混合物中加入 60%氢化钠 38mg, 仍于此温搅拌 1 小时后, 加碘甲烷 0.28g, 室温反应 20 小时。将反应混合物投入水中水洗, 用无水硫酸钠干燥, 减压浓缩得残渣。用硅胶柱色谱法(展开剂为乙酸乙酯/正己烷=3/7)精制, 得熔点 149~150°C 的目的产物 0.30g。该化合物的核磁谱数据如下:

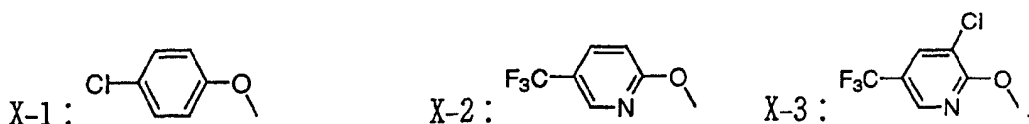
$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  ppm (溶剂:  $\text{CDCl}_3/400\text{MHz}$ )

1.64(s, 3H), 1.67(s, 3H), 2.92(s, 3H), 6.65(dd, 1H), 7.40~7.44(m, 4H), 7.47~7.49(m, 1H), 7.59(dd, 1H), 7.92(dd, 2H)。

10 上述式(I)所示的本发明化合物列于表 1~4, 这些化合物可根据上述合成例或上述本发明化合物的各种制法合成。

而表中所用的略称如下所示。

Me: 甲基、Et: 乙基、Pr: 丙基、Bu: 丁基、Ph: 苯基、allyl: 烯丙基、



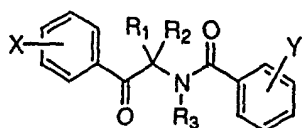
X-4:  $\text{F}_2\text{C}=\text{CH}-$ , X-5:  $\text{F}_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ , X-6:  $\text{Cl}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}-$ ,

X-7:  $\text{F}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{CH}_2-$ , X-8:  $\text{F}_2\text{BrC}(\text{CH}_2)_3-$ , X-9:  $\text{IC}\equiv\text{CCH}_2-$ ,

X-10:  $(\text{CH}_3)_3\text{CC}\equiv\text{CCH}_2-$ , X-11:  $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2-$ , X-12:  $\text{IC}\equiv\text{CCH}_2-$

15 表中的 4-[X-1]表示 4 位上有 X-1 取代, 其余记述也是如此。

表 1



化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y	物性(熔点℃)
1-1	Me	Me	H	H	2-F	110~111
1-2	Me	Et	H	H	2-F	
1-3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	2-F	
1-4	Me	Me	H	H	2,6-F <sub>2</sub>	109~113
1-5	Me	Me	H	H	2-Cl	128~131
1-6	Me	Et	H	H	2-Cl	
1-7	Me	Me	COMe	H	2-Cl	205~209
1-8	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	2-Cl	
1-9	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		H	H	2-Cl	
1-10	Me	Me	H	H	3-Cl	159~161
1-11	Me	Me	H	H	4-Cl	155~160
1-12	Me	Me	H	H	2,3-Cl <sub>2</sub>	122~126
1-13	Me	Me	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	144~147
1-14	Me	Me	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	190~191
1-15	Me	Me	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub>	160~163
1-16	Me	Me	H	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	160~161
1-17	Me	Me	H	H	2-Br	149~150
1-18	Me	Me	H	H	2-Me	171~172
1-19	Me	Me	H	H	4-Me	182~185
1-20	Me	Me	H	H	3,5-Me <sub>2</sub>	157~159
1-21	Me	Me	H	H	2-Et	
1-22	Me	Me	H	H	4-Et	194~195
1-23	Me	Me	H	H	4-tert-Bu	180~181
1-24	Me	Me	H	H	2-CF <sub>3</sub>	158~161
1-25	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	2-CF <sub>3</sub>	
1-26	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	2-CF <sub>3</sub>	178~180
1-27	Me	Me	Me	H	2-CF <sub>3</sub>	149~150
1-28	Me	Me	H	H	4-CF <sub>3</sub>	184~186
1-29	Me	Me	H	H	2-OMe	118~121
1-30	Me	Me	H	H	4-OMe	171~175
1-31	Me	Me	H	H	2-SMe	127~132
1-32	Me	Me	H	H	4-SMe	185~187
1-33	Me	Me	H	H	4-SOMe	

表 1 (续)

化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y	物性(熔点℃)
1-34	Me	Me	H	H	2-SO <sub>2</sub> Me	177~180
1-35	Me	Me	H	H	4-SO <sub>2</sub> Me	189~191
1-36	Me	Me	H	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-37	Me	Me	H	H	4-SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	
1-38	Me	Me	H	H	2-NO <sub>2</sub>	184~187
1-39	Me	Me	H	H	4-NO <sub>2</sub>	
1-40	Me	Me	H	H	4-CN	
1-41	Me	Me	H	4-F	H	150~152
1-42	Me	Me	H	4-F	2-F	78~81
1-43	Me	Me	H	4-F	2-Cl	152~155
1-44	Me	Me	H	4-F	2-CF <sub>3</sub>	151~154
1-45	Me	Me	H	2-Cl	H	油状
1-46	Me	Me	H	2-Cl	2-Cl	85~87
1-47	Me	Me	H	3-Cl	H	136~138
1-48	Me	Me	H	3-Cl	2-Cl	168~169
1-49	Me	Me	H	4-Cl	H	161~162
1-50	Me	Me	H	4-Cl	2-F	164~167
1-51	Me	Et	H	4-Cl	2-F	93~95
1-52	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	4-Cl	2-F	
1-53	Me	Me	H	4-Cl	2,6-F <sub>2</sub>	146~148
1-54	Me	Me	H	4-Cl	2-Cl	99~102
1-55	Me	Me	Na	4-Cl	2-Cl	270/分解
1-56	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		H	4-Cl	2-Cl	
1-57	Me	Me	H	4-Cl	3-Cl	145~147
1-58	Me	Me	H	4-Cl	4-Cl	191~195
1-59	Me	Me	H	4-Cl	2,3-Cl <sub>2</sub>	129~131
1-60	Me	Me	H	4-Cl	2,4-Cl <sub>2</sub>	152~153
1-61	Me	Me	H	4-Cl	2,5-Cl <sub>2</sub>	
1-62	Me	Me	H	4-Cl	2,6-Cl <sub>2</sub>	
1-63	Me	Me	H	4-Cl	3,5-Cl <sub>2</sub>	169~171
1-64	Me	Me	H	4-Cl	2-Br	149~151
1-65	Me	Me	H	4-Cl	2-Me	160~163
1-66	Me	Me	H	4-Cl	3-Me	
1-67	Me	Me	H	4-Cl	4-Me	
1-68	Me	Me	H	4-Cl	3,5-Me <sub>2</sub>	
1-69	Me	Me	H	4-Cl	2-Et	
1-70	Me	Me	H	4-Cl	2-CF <sub>3</sub>	95~97

表 1 (续)

化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y	物性(熔点°C)
1-71	Me	Et	H	4-Cl	2-CF <sub>3</sub>	147~149
1-72	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	4-Cl	2-CF <sub>3</sub>	
1-73	Me	Me	H	4-Cl	4-CF <sub>3</sub>	
1-74	Me	Me	H	4-Cl	2-OMe	
1-75	Me	Me	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	171~173
1-76	Me	Me	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
1-77	Me	Me	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-F	114~116
1-78	Me	Me	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-Cl	116~120
1-79	Me	Me	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	2-Cl	146~149
1-80	Me	Me	H	4-Me	H	181~182
1-81	Me	Me	H	4-Me	2-Cl	141~143
1-82	Me	Me	H	4-Et	H	172~174
1-83	Me	Me	H	4-Et	2-Cl	116~118
1-84	Me	Me	H	4-Et	3,5-Cl <sub>2</sub>	176~177
1-85	Me	Me	H	4-Et	3,5-Me <sub>2</sub>	179~181
1-86	Me	Me	H	4-tert-Bu	H	
1-87	Me	Me	H	4-tert-Bu	2-F	136~139
1-88	Me	Me	H	4-tert-Bu	2-Cl	172~176
1-89	Me	Me	H	4-tert-Bu	2-CF <sub>3</sub>	150~153
1-90	Me	Me	H	4-CF <sub>3</sub>	H	178~179
1-91	Me	Me	H	4-CF <sub>3</sub>	2-Cl	127~129
1-92	Me	Me	H	4-OMe	H	156~157
1-93	Me	Me	H	4-OMe	2-Cl	112~114
1-94	Me	Me	H	4-OCHF <sub>2</sub>	H	
1-95	Me	Me	H	4-OCHF <sub>2</sub>	2-Cl	65~70
1-96	Me	Me	H	4-OCF <sub>3</sub>	H	
1-97	Me	Me	H	4-OCF <sub>3</sub>	2-Cl	
1-98	Me	Me	H	4-SMe	H	158~160
1-99	Me	Me	H	4-SMe	2-Cl	128~129
1-100	Me	Me	H	4-SOMe	H	
1-101	Me	Me	H	4-SO <sub>2</sub> Me	H	222~225
1-102	Me	Me	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
1-103	Me	Me	H	4-SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	H	
1-104	Me	Me	H	4-NO <sub>2</sub>	H	
1-105	Me	Me	H	4-NO <sub>2</sub>	2-F	
1-106	Me	Me	H	4-NO <sub>2</sub>	2-Cl	
1-107	Me	Me	H	4-NO <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>	

表 1 (续)

化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y	物性(熔点°C)
1-108	Me	Me	H	4-CN	H	
1-109	Me	Me	H	4-CN	2-Cl	
1-110	Me	Me	H	4-CN	2-CF <sub>3</sub>	
1-111	Me	Me	H	H	2-CN	
1-112	Me	Me	H	4-Cl	2-CN	
1-113	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	3,5-Cl <sub>2</sub>	4-Et	
1-114	Me	Me	H	H	2-OCF <sub>3</sub>	
1-115	Me	Me	H	4-Cl	2-OCF <sub>3</sub>	
1-116	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	2-Cl	3,5-Me <sub>2</sub>	
1-117	Me	Me	CO <sub>2</sub> Me	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	
1-118	Me	Me	CH <sub>2</sub> OEt	4-NO <sub>2</sub>	4-Cl	
1-119	Me	Me	H	4-[X-1]	3,5-Cl <sub>2</sub>	
1-120	Me	Me	H	4-[X-2]	2-Cl	
1-121	Me	Me	H	4-[X-3]	H	
1-122	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	2-F	154~157
1-123	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	2-Cl	155~161
1-124	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	2,6-F <sub>2</sub>	178~180
1-125	Me	Me	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	140~143
1-126	Me	Me	H	3-F	2,6-F <sub>2</sub>	142~144
1-127	Me	Me	H	4-F	2,3-F <sub>2</sub>	119~122
1-128	Me	Me	H	4-F	2,6-F <sub>2</sub>	141~143
1-129	Me	Me	H	3,4-F <sub>2</sub>	H	148~150
1-130	Me	Me	H	3,4-F <sub>2</sub>	2-F	101~104
1-131	Me	Me	H	3,4-F <sub>2</sub>	2-Cl	97~100
1-132	Me	Me	H	3,4-F <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>	157~161
1-133	Me	Me	H	3,4-F <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	141~145
1-134	Me	Me	H	2-Cl	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-135	Me	Me	H	3-Cl	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-136	Me	Me	H	4-Cl	2-NO <sub>2</sub>	174~178
1-137	Me	Me	H	4-Cl	2-Cl-4-NO <sub>2</sub>	141~145
1-138	Me	Me	H	4-Cl	2-Cl-4-F	126~130
1-139	Me	Me	H	4-Cl	2,3-F <sub>2</sub>	116~119
1-140	Me	Me	H	4-Cl	2,4-F <sub>2</sub>	98~100
1-141	Me	Me	H	4-Cl	2,5-F <sub>2</sub>	107~109
1-142	Me	Me	H	4-Cl	2-Cl-6-F	105~110
1-143	Me	Me	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	100~103
1-144	Me	Me	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	H	159~161

表 1 (续)

化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y	物性(熔点℃)
1-145	Me	Me	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	2-Cl	199~204
1-146	Me	Me	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	156~158
1-147	Me	Me	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	140~145
1-148	Me	Et	H	4-Cl	H	158~160
1-149	Me	Et	H	4-Cl	2-Cl	127~129
1-150	Me	Et	H	4-Cl	2,4-F <sub>2</sub>	84~86
1-151	Me	Et	H	4-Cl	2,6-F <sub>2</sub>	115~117
1-152	Et	Et	H	4-Cl	2-Cl	158~160
1-153	Et	Et	H	4-Cl	2-CF <sub>3</sub>	150~152
1-154	Et	Et	H	4-Cl	2,6-F <sub>2</sub>	138~142
1-155	Me	Me	H	4-Br	2-Cl	50~56
1-156	Me	Me	H	4-Br	2-CF <sub>3</sub>	134~140
1-157	Me	Me	H	4-Br	2,6-F <sub>2</sub>	128~133
1-158	Me	Me	H	4-Br	2-F	109~112
1-159	Me	Me	H	4-Br	2,3-F <sub>2</sub>	116~118
1-160	Me	Me	H	4-I	2-F	122~126
1-161	Me	Me	H	4-I	2-CF <sub>3</sub>	165~168
1-162	Me	Me	H	4-I	2,6-F <sub>2</sub>	102~110
1-163	Me	Me	H	4-Me	2,6-F <sub>2</sub>	126~128
1-164	Me	Me	H	4-Et	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-165	Me	Me	H	4-Pr	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-166	Me	Me	H	4-CF <sub>3</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	102~110
1-167	Me	Me	H	4-CF <sub>3</sub>	2-F	91~93
1-168	Me	Me	H	4-OMe	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-169	Me	Me	H	4-OEt	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-170	Me	Me	H	4-OPr	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-171	Me	Me	H	4-OCHF <sub>2</sub>	2-F	74~77
1-172	Me	Me	H	4-OCHF <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	90~94
1-173	Me	Me	H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-F	94~96
1-174	Me	Me	H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	139~147
1-175	Me	Me	H	4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	2-F	129~131
1-176	Me	Me	H	4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	2-Cl	135~138
1-177	Me	Me	H	4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	115~119
1-178	Me	Me	H	4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>	120~125
1-179	Me	Me	H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-F	88~91
1-180	Me	Me	H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	128~130
1-181	Me	Me	H	4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	2-F	



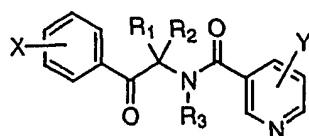
表 1 (续)

化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y	物性(熔点℃)
1-182	Me	Me	H	4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	2,6-F <sub>2</sub>	
1-183	Me	Me	H	4-allyl	2-F	
1-184	Me	Me	H	4-allyl	2,6-F <sub>2</sub>	
1-185	Me	Me	H	4-[X-4]	2-F	
1-186	Me	Me	H	4-[X-4]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-187	Me	Me	H	4-[X-5]	2-F	
1-188	Me	Me	H	4-[X-5]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-189	Me	Me	H	4-[X-6]	2-F	油状
1-190	Me	Me	H	4-[X-6]	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-191	Me	Me	H	4-O-[X-7]	2-F	
1-192	Me	Me	H	4-O-[X-7]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-193	Me	Me	H	4-O-[X-8]	2-F	
1-194	Me	Me	H	4-O-[X-8]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-195	Me	Me	H	4-S-[X-7]	2-F	
1-196	Me	Me	H	4-S-[X-7]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-197	Me	Me	H	4-S-[X-8]	2-F	
1-198	Me	Me	H	4-S-[X-8]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-199	Me	Me	H	4-[X-11]	2-F	
1-200	Me	Me	H	4-[X-11]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-201	Me	Me	H	4-[X-9]	2-F	
1-202	Me	Me	H	4-[X-9]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-203	Me	Me	H	4-[X-10]	2-F	
1-204	Me	Me	H	4-[X-10]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-205	Me	Me	H	4-Ph	2-F	155~160
1-206	Me	Me	H	4-Ph	2,6-F <sub>2</sub>	177~179
1-207	Me	Me	H	4-OPh	2-F	油状
1-208	Me	Me	H	4-OPh	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-209	Me	Me	H	4-OPh	2-CF <sub>3</sub>	143~146
1-210	Me	Me	H	4-OCH <sub>2</sub> Ph	2,6-F <sub>2</sub>	166~171
1-211	Me	Me	H	4-[X-2]	2,6-F <sub>2</sub>	75~80
1-212	Me	Me	H	4-SMe	2,6-F <sub>2</sub>	油状
1-213	Me	Me	H	4-SO <sub>2</sub> Me	2,6-F <sub>2</sub>	176~178
1-214	Me	Me	H	4-O-allyl	2-F	
1-215	Me	Me	H	4-O-allyl	2,6-F <sub>2</sub>	
1-216	Me	Me	H	4-S-allyl	2-F	
1-217	Me	Me	H	4-S-allyl	2,6-F <sub>2</sub>	
1-218	Me	Me	H	4-O-[X-11]	2-F	

表 1 (续)

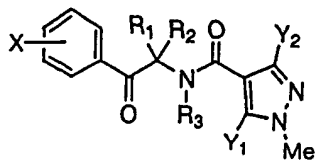
化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y	物性(熔点℃)
1-219	Me	Me	H	4-O-[X-11]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-220	Me	Me	H	4-O-[X-12]	2-F	
1-221	Me	Me	H	4-O-[X-12]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-222	Me	Me	H	4-S-[X-11]	2-F	
1-223	Me	Me	H	4-S-[X-11]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-224	Me	Me	H	4-S-[X-12]	2-F	
1-225	Me	Me	H	4-S-[X-12]	2,6-F <sub>2</sub>	
1-226	Me	Me	H	4-tert-Bu	2,6-F <sub>2</sub>	104~109

表 2



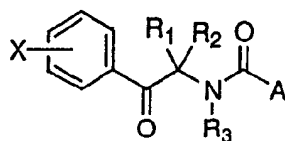
化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y	物性(熔点℃)
2-1	Me	Me	H	H	H	
2-2	Me	Me	H	H	2-Cl	213~215
2-3	Me	Me	H	H	4-Cl	
2-4	Me	Me	H	H	2-CF <sub>3</sub>	
2-5	Me	Me	H	H	4-CF <sub>3</sub>	152~154
2-6	Me	Me	H	2-Cl	2-F	
2-7	Me	Me	Me	2-Cl	2-Me	
2-8	Me	Me	H	3-Cl	H	
2-9	Me	Me	H	3-Cl	2-Cl	
2-10	Me	Me	H	4-Cl	H	
2-11	Me	Me	H	4-Cl	2-CF <sub>3</sub>	
2-12	Et	Et	H	4-Cl	H	
2-13	Me	Me	H	4-Cl	2-Cl	
2-14	Me	Me	H	4-Cl	H	
2-15	Me	Me	H	4-OCF <sub>3</sub>	2-Cl	
2-16	Me	Me	H	4-SMe	H	
2-17	Me	Me	H	4-SMe	2-Cl	
2-18	Me	Me	H	4-SOMe	H	
2-19	Me	Me	H	4-SO <sub>2</sub> Me	H	
2-20	Me	Me	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
2-21	Me	Me	H	4-SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	H	
2-22	Me	Me	H	4-NO <sub>2</sub>	H	
2-23	Me	Me	H	4-NO <sub>2</sub>	2-Cl	
2-24	Me	Et	H	4-CN	H	
2-25	Me	Me	H	4-CN	2-Cl	

表 3



化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	物性(熔点°C)
3-1	Me	Me	H	H	H	Cl	
3-2	Me	Me	H	H	H	CF <sub>3</sub>	108~110
3-3	Me	Me	H	H	Cl	Cl	
3-4	Me	Me	H	H	Cl	CF <sub>3</sub>	
3-5	Me	Me	H	H	Me	Cl	
3-6	Me	Me	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
3-7	Me	Me	H	H	Cl	Me	103~105
3-8	Me	Me	H	H	CF <sub>3</sub>	Me	
3-9	Me	Me	H	H	Me	Me	
3-10	Me	Me	COMe	H	Cl	Cl	
3-11	Me	Me	H	4-F	Cl	Me	
3-12	Me	Me	H	2-Cl	Cl	Cl	
3-13	Me	Me	H	3-Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	
3-14	Me	Me	H	4-Cl	Cl	H	
3-15	Me	Me	H	4-Cl	Cl	Me	
3-16	Me	Me	H	4-Cl	Cl	Cl	
3-17	Me	Me	H	4-Cl	Cl	CF <sub>3</sub>	
3-18	Et	Et	H	4-Cl	Cl	Cl	
3-19	Me	Me	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	Cl	Cl	
3-20	Me	Me	H	4-Me	H	Cl	
3-21	Me	Me	H	3,5-Me <sub>2</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	
3-22	Me	Me	H	4-tert-Bu	H	Cl	
3-23	Me	Me	H	4-tert-Bu	Cl	Cl	
3-24	Me	Me	H	4-OMe	Cl	Cl	
3-25	Me	Me	H	3,5-(OMe) <sub>2</sub>	Cl	Cl	

表 4



化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	A	物性(熔点°C)
4-1	Me	Me	H	H	Me	
4-2	Me	Me	H	H	Et	
4-3	Me	Me	H	H	iso-Pr	
4-4	Me	Me	H	H	tert-Bu	125~127
4-5	Me	Me	H	H	环丙基	150~152
4-6	Me	Me	H	2-Cl	tert-Bu	
4-7	Me	Me	H	2-Cl	环己基	
4-8	Me	Me	H	3-Cl	tert-Bu	
4-9	Me	Me	H	3-Cl	环戊基	
4-10	Me	Me	Me	4-Cl	Me	
4-11	Me	Me	H	4-Cl	Et	
4-12	Me	Et	H	4-Cl	iso-Pr	
4-13	Me	Me	H	4-Cl	tert-Bu	
4-14	Me	Me	H	4-Cl	环己基	
4-15	Me	Me	H	4-Me	tert-Bu	
4-16	Me	Me	H	4-OMe	tert-Bu	
4-17	Me	Me	H	3,4-(OMe) <sub>2</sub>	tert-Bu	
4-18	Me	Me	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	tert-Bu	
4-19	Me	Me	H	4-OCHF <sub>2</sub>	tert-Bu	
4-20	Me	Me	H	4-SMe	tert-Bu	
4-21	Me	Me	H	4-SMe	环戊基	
4-22	Et	Et	H	4-NO <sub>2</sub>	tert-Bu	
4-23	Me	Me	H	4-NO <sub>2</sub>	环己基	
4-24	Me	Me	H	4-CN	tert-Bu	
4-25	Me	Me	H	4-CN	环己基	

下面记述试验例。

#### 5 试验例 1 以甘薯根瘤线虫的药效试验

在被甘薯根瘤线虫污染土壤 300ml 中灌注 7ml 本发明化合物浓度为 1600ppm 药液，药液混合分散均匀后，将处理土壤装入试罐（直径 9cm、高度 8cm）。然后，在其中移植入二叶龄西红柿苗，置温室内。在移植 3~4 周后，西红柿根部形成的根瘤的附着生长程度按以下的根瘤指数进行判定。

根瘤指数	根瘤附着生长程度
0	全根上一点根瘤也没有
1	稍有根瘤
2	形成的根瘤为中等程度
3	根瘤数多
4	根瘤数特别多、且大

结果表明，上述化合物 No. 1-1、1-4、1-5、1-17、1-18、1-19、1-24、1-27、1-28、1-31、1-38、1-49、1-50、1-51、1-54、1-64、1-65、1-70、1-77、1-83、1-84、1-93、1-95、1-125、1-126、1-127、1-128、1-130、1-131、1-132、1-133、  
5 1-134、1-135、1-136、1-138、1-139、1-140、1-141、1-142、1-143、1-147、1-151、1-155、1-156、1-157、1-158、1-159、1-160、1-161、1-162、1-163、1-164、1-166、1-167、1-168、1-169、1-171、1-172、1-173、1-174、1-175、1-176、1-177、1-178、1-179、1-180、1-211、1-212、1-213 及 2-2 的根瘤指数在 1 以下，显现出较高的防治效果。

10

#### 试验例 2 对卵囊的药效试验

用小鸡感染繁殖禽艾美球虫而得新鲜未成熟的卵囊，用含有一定浓度的本发明化合物的溶液处理 10 或 30 分钟，离心处理未成熟卵囊，去除上部清液，加 2% 重铬酸钾水溶液，于 25℃ 喷药四天，证实有良好的防治卵囊效果。

15

#### 试验例 3 对犬恶丝虫的药效试验

使皮下感染了犬恶丝虫的狗口服本发明化合物，自感染 200 天后验尸，调查经过处理的动物的肺和心脏等中的犬恶丝虫寄生成虫数，证实有良好的犬恶丝虫防治效果。

20

以下记载制剂例。

#### 制剂例 1

(1) 本发明化合物	20 重量份
(2) 粘土	72 重量份
(3) 木质素磺酸钠	8 重量份

将以上化合物混合均匀制得水和剂。

#### 制剂例 2

- |            |        |
|------------|--------|
| (1) 本发明化合物 | 5 重量份  |
| (2) 滑石粉    | 95 重量份 |

将以上化合物混合均匀制得粉剂。

5

#### 制剂例 3

- |                   |        |
|-------------------|--------|
| (1) 本发明化合物        | 20 重量份 |
| (2) N, N' -二甲基乙酰胺 | 20 重量份 |
| (3) 聚氧乙烯烷基苯基醚     | 10 重量份 |
| (4) 二甲苯           | 50 重量份 |

将以上化合物混合均匀，溶解得乳剂。

#### 制剂例 4

- |                 |        |
|-----------------|--------|
| (1) 本发明化合物      | 68 重量份 |
| (2) 木质素磺酸钠      | 2 重量份  |
| (3) 聚氧乙烯烷基芳基硫酸酯 | 5 重量份  |
| (4) 二氧化硅微粉      | 25 重量份 |

10 将以上各成分的混合物与本发明化合物以 4:1 重量比相混合，制得水和剂。

#### 制剂例 5

- |                    |          |
|--------------------|----------|
| (1) 本发明化合物         | 50 重量份   |
| (2) 氧化聚烷基苯基磷酸酯三乙醇胺 | 2 重量份    |
| (3) 硅酮             | 0.2 重量份  |
| (4) 水              | 47.8 重量份 |

将上述化合物混合均匀粉碎后获得原液，然后在其中加入以下化合物。

- |           |          |
|-----------|----------|
| (5) 多羧酸钠  | 5 重量份    |
| (6) 无水硫酸钠 | 42.8 重量份 |

15 混合均匀后，造粒、干燥获得颗粒水和剂。

**制剂例 6**

- |               |          |
|---------------|----------|
| (1) 本发明化合物    | 5 重量份    |
| (2) 聚氧乙烯辛基苯基醚 | 1 重量份    |
| (3) 聚氧乙烯的磷酸酯  | 0.1 重量份  |
| (4) 粒状碳酸钙     | 93.9 重量份 |

将(1)~(3)预先均匀混合,再用适量丙酮稀释,然后喷于(4)上,再除去丙酮制得颗粒剂。

**5 制剂例 7**

- |                 |          |
|-----------------|----------|
| (1) 本发明化合物      | 2.5 重量份  |
| (2) N-甲基-2-吡咯烷酮 | 2.5 重量份  |
| (3) 大豆油         | 95.0 重量份 |

将以上组分混合均匀,溶解制得超低容量喷洒剂。