



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 103003248 B

(45) 授权公告日 2015. 01. 07

(21) 申请号 201180035251. 8

(22) 申请日 2011. 11. 18

(66) 本国优先权数据

201010554472. 3 2010. 11. 19 CN

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2013. 01. 30

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/CN2011/082439 2011. 11. 18

(87) PCT国际申请的公布数据

W02012/065574 ZH 2012. 05. 24

(73) 专利权人 中国中化股份有限公司

地址 100031 中国北京市西城区复兴门内大街 28 号

专利权人 沈阳化工研究院有限公司

(72) 发明人 刘长令 柴宝山 李志念 孙旭峰

单中刚

(74) 专利代理机构 沈阳科苑专利商标代理有限公司 21002

代理人 许宗富 何薇

(51) Int. Cl.

C07D 239/47(2006. 01)

A01N 43/54(2006. 01)

A01P 3/00(2006. 01)

(56) 对比文件

CN 1098717 A, 1995. 02. 15, 全文.

US 5075316, 1991. 12. 24, 第 1 栏第 1 段, 第 13 栏化合物 2. 25.

审查员 秦雪

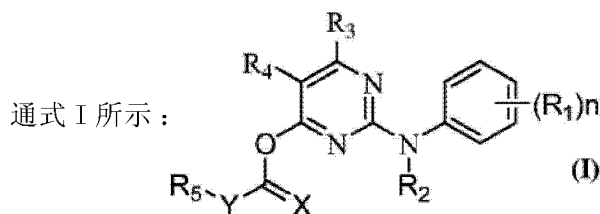
权利要求书1页 说明书28页

(54) 发明名称

取代嘧啶氨类化合物及其用途

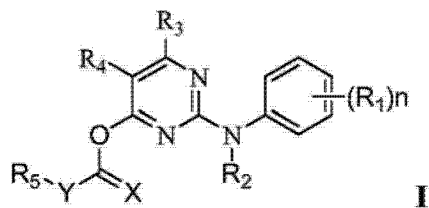
(57) 摘要

本发明公开了一种取代嘧啶氨类化合物, 如



式中各取代基的定义见说明书。通式 I 化合物可用于防治在多种植物上由卵菌纲、担子菌纲、子囊菌和半知菌类等多种病菌引起的病害, 尤其是对小麦白粉病等病害活性更优。

1. 一种取代嘧啶氨类化合物, 如通式 I 所示:



式中:

n 选自 0;

R₂ 选自氢;

R₃ 选自甲基;

R₄ 选自正丁基;

或者 R₃ 和 R₄ 同与之相连的碳原子一起形成饱和的 5 元或 6 元碳环;

R₅ 选自甲基、乙基、异丙基、正丁基、CH₂CH₂OCH₃、苄基或呋喃甲基;

X、Y 均选自 0。

2. 一种按照权利要求 1 所述的通式 I 化合物用于制备农业领域中防治病菌的杀菌剂药物的用途。

3. 一种杀菌组合物, 其特征在于: 含有作为活性组分的如权利要求 1 所述的通式 I 化合物和农业上可接受的载体, 组合物中活性组分的重量百分含量为 0.1-99%。

取代嘧啶氨类化合物及其用途

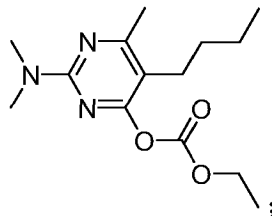
技术领域

[0001] 本发明属农用杀菌剂领域。具体地涉及一种取代嘧啶氨类化合物及其用途。

背景技术

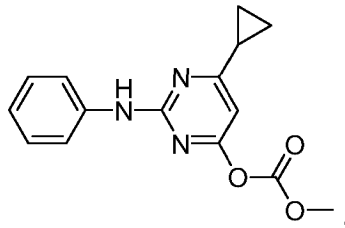
[0002] 已知某些嘧啶氨类化合物具有良好的生物活性。专利 US3962442 中报道了以下化合物（代号 K1）具有杀虫杀菌活性：

[0003]



[0004] 专利 US5075316 中报道了以下化合物（代号 K2）具有杀菌活性：

[0005]



[0006] 尽管已有多件专利,但仍需要不断研发新的杀菌化合物以控制农业、民用和动物技术领域中有害的病菌。上述专利中所有公开的化合物虽与本发明化合物有一定的相似之处,但结构仍存在显著的不同。

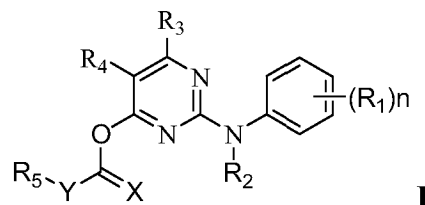
发明内容

[0007] 本发明的目的在于提供一种在很小的剂量下就可以控制有害病菌的一种含取代嘧啶氨类化合物。

[0008] 本发明的技术方案如下：

[0009] 本发明提供一种嘧啶氨类化合物,如通式 I 所示：

[0010]



[0011] 式中：

[0012] R_1 选自卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_{12} 烷基、卤代 C_1 - C_{12} 烷基、 C_1 - C_{12} 烷氧基、卤代 C_1 - C_{12} 烷氧基、 C_3 - C_6 环烷基、卤代 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_{12} 烷基氨基、卤代 C_1 - C_{12} 烷基氨基、 C_1 - C_{12} 二烷基

氨基、 C_1-C_{12} 烷硫基、卤代 C_1-C_{12} 烷硫基、 C_1-C_{12} 烷基磺酰基、卤代 C_1-C_{12} 烷基磺酰基、 C_1-C_{12} 烷基羰基、卤代 C_1-C_{12} 烷基羰基、 C_1-C_{12} 烷氧基 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷氧基 C_1-C_{12} 烷基、2, 3- 甲叉二氧基、3, 4- 甲叉二氧基、2, 3- 二氟甲叉二氧基或 3, 4- 二氟甲叉二氧基 ;n 选自 0-5 ;

[0013] R_2 选自氢或 C_1-C_6 烷基 ;

[0014] R_3 选自氢、卤素、 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基、卤代 C_1-C_{12} 烷氧基、未取代的或被 1-5 个独立选自以下基团进一步取代的苯基、苄基或杂芳基 : 卤素、硝基、氰基、 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基、卤代 C_1-C_{12} 烷氧基、 C_3-C_6 环烷基、卤代 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_{12} 烷基氨基、卤代 C_1-C_{12} 烷基氨基、 C_1-C_{12} 二烷基氨基、 C_1-C_{12} 烷硫基、卤代 C_1-C_{12} 烷硫基、 C_1-C_{12} 烷基磺酰基、卤代 C_1-C_{12} 烷基磺酰基、 C_1-C_{12} 烷基羰基、卤代 C_1-C_{12} 烷基羰基、 C_1-C_{12} 烷氧基 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷氧基 C_1-C_{12} 烷基、2, 3- 甲叉二氧基、3, 4- 甲叉二氧基、2, 3- 二氟甲叉二氧基或 3, 4- 二氟甲叉二氧基 ;

[0015] R_4 选自氢、卤素、 C_1-C_{12} 烷基或卤代 C_1-C_{12} 烷基 ;

[0016] 或者 R_3 和 R_4 同与之相连的碳原子一起形成饱和或不饱和 3-6 元碳环或杂环, 所述碳环或杂环上无取代或任选由卤素、 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基或卤代 C_1-C_{12} 烷氧基取代 ;

[0017] R_5 选自 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷基氨基 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 二烷基氨基 C_1-C_{12} 烷基、 C_2-C_{12} 烯基、未取代的或被 1-5 个独立选自以下基团进一步取代的苯基、苄基、呋喃甲基或杂芳基 : 卤素、硝基、氰基、 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基、卤代 C_1-C_{12} 烷氧基、 C_3-C_6 环烷基、卤代 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_{12} 烷基氨基、卤代 C_1-C_{12} 烷基氨基、 C_1-C_{12} 二烷基氨基、 C_1-C_{12} 烷硫基、卤代 C_1-C_{12} 烷硫基、 C_1-C_{12} 烷基磺酰基、卤代 C_1-C_{12} 烷基磺酰基、 C_1-C_{12} 烷基羰基、卤代 C_1-C_{12} 烷基羰基、 C_1-C_{12} 烷氧基 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷氧基 C_1-C_{12} 烷基、2, 3- 甲叉二氧基、3, 4- 甲叉二氧基、2, 3- 二氟甲叉二氧基或 3, 4- 二氟甲叉二氧基 ;

[0018] X、Y 可相同或不同, 分别选自 O 或 S。

[0019] 本发明较优选的化合物为通式 I 中 :

[0020] R_1 选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 环烷基、卤代 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 烷基氨基、卤代 C_1-C_6 烷基氨基、 C_1-C_6 二烷基氨基、 C_1-C_6 烷硫基、卤代 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、卤代 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基羰基、卤代 C_1-C_6 烷基羰基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷氧基羰基 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、2, 3- 甲叉二氧基、3, 4- 甲叉二氧基、2, 3- 二氟甲叉二氧基或 3, 4- 二氟甲叉二氧基 ;n 选自 0-4 ;

[0021] R_2 选自氢或 C_1-C_3 烷基 ;

[0022] R_3 选自氢、卤素、 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基、未取代的或被 1-5 个独立选自以下基团进一步取代的苯基、苄基或杂芳基 : 卤素、硝基、氰基、 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 环烷基、卤代 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 烷基氨基、卤代 C_1-C_6 烷基氨基、 C_1-C_6 二烷基氨基、 C_1-C_6 烷硫基、卤代 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、卤代 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基羰基、卤代 C_1-C_6 烷基羰基、 C_1-C_6 烷氧

基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷氧基羰基 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、2, 3- 甲叉二氧基、3, 4- 甲叉二氧基、2, 3- 二氟甲叉二氧基或 3, 4- 二氟甲叉二氧基；

[0023] R_4 选自氢、卤素、 C_1-C_8 烷基或卤代 C_1-C_8 烷基；

[0024] 或者 R_3 和 R_4 同与之相连的碳原子一起形成饱和或不饱和 3-6 元碳环或杂环，所述碳环或杂环上无取代或任选由卤素、 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基或卤代 C_1-C_6 烷氧基取代；

[0025] R_5 选自 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷基氨基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 二烷基氨基 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_8 烯基、未取代的或被 1-5 个独立选自以下基团进一步取代的苯基、苄基、呋喃甲基或杂芳基：卤素、硝基、氰基、 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、卤代 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 环烷基、卤代 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 烷基氨基、卤代 C_1-C_6 烷基氨基、 C_1-C_6 二烷基氨基、 C_1-C_6 烷硫基、卤代 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、卤代 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基羰基、卤代 C_1-C_6 烷基羰基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷氧基羰基 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、2, 3- 甲叉二氧基、3, 4- 甲叉二氧基、2, 3- 二氟甲叉二氧基或 3, 4- 二氟甲叉二氧基；

[0026] X、Y 可相同或不同，分别选自 O 或 S。

[0027] 进一步优选的化合物为：通式 I 中

[0028] R_1 选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 烷基氨基、 C_1-C_3 二烷基氨基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基磺酰基、 C_1-C_3 烷基羰基、卤代 C_1-C_3 烷基羰基、 C_1-C_3 烷氧基 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 烷氧基羰基、2, 3- 甲叉二氧基、3, 4- 甲叉二氧基、2, 3- 二氟甲叉二氧基或 3, 4- 二氟甲叉二氧基；n 选自 0-4；

[0029] R_2 选自氢或 C_1-C_3 烷基；

[0030] R_3 选自氢、卤素、 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 烷氧基或苯基；

[0031] R_4 选自氢、卤素、 C_1-C_8 烷基或卤代 C_1-C_8 烷基；

[0032] 或者 R_3 和 R_4 同与之相连的碳原子一起形成饱和或不饱和 3-6 元碳环或杂环，所述碳环或杂环上无取代或任选由卤素、 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 烷氧基或卤代 C_1-C_3 烷氧基取代；

[0033] R_5 选自 C_1-C_{12} 烷基、卤代 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_3 烷基氨基 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_3 二烷基氨基 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_8 烯基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团进一步取代的苯基、苄基、呋喃甲基、吡啶基、噻啶基、噻吩基、噻唑基或苯并噻唑基：卤素、硝基、氰基、 C_1-C_3 烷基、卤代 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 烷氧基、卤代 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 烷基氨基、 C_1-C_3 二烷基氨基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基磺酰基、 C_1-C_3 烷基羰基、 C_1-C_3 烷氧基羰基、2, 3- 甲叉二氧基、3, 4- 甲叉二氧基、2, 3- 二氟甲叉二氧基或 3, 4- 二氟甲叉二氧基；

[0034] X、Y 可相同或不同，分别选自 O 或 S。

[0035] 更进一步优选的化合物为：通式 I 中

[0036] R_1 选自卤素、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基或三氟甲氧基；n 选自 0-3；

[0037] R_2 选自氢或甲基；

[0038] R_3 选自甲基、三氟甲基或苯基；

[0039] R_4 选自氢、甲基或正丁基；

[0040] 或者 R_3 和 R_4 同与之相连的碳原子一起形成饱和的 5 元或 6 元碳环；

[0041] R_5 选自 C_1-C_4 烷基、卤代 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、未取代的或被 1-3 个独立选自以下基团进一步取代的苯基、苄基或呋喃甲基：卤素、硝基、氰基、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基或 CO_2CH_3 ；

[0042] X、Y 可相同或不同，分别选自 O 或 S。

[0043] 再进一步优选的化合物为：通式 I 中

[0044] R_1 选自氟、氯或三氟甲氧基；n 选自 0-3；

[0045] R_2 选自氢；

[0046] R_3 选自甲基、三氟甲基或苯基；

[0047] R_4 选自氢、甲基或正丁基；

[0048] 或者 R_3 和 R_4 同与之相连的碳原子一起形成饱和的 5 元或 6 元碳环；

[0049] R_5 选自甲基、乙基、异丙基、正丁基、 $CH_2CH_2OCH_3$ 、 $CH_2CH=CH_2$ 、苄基或呋喃甲基；

[0050] X 选自 O；

[0051] Y 选自 O 或 S。

[0052] 最优选的化合物为：通式 I 中

[0053] n 选自 0，此时，通式 I 结构的苯环上没有取代基，即 R_1 为氢；

[0054] R_2 选自氢；

[0055] R_3 选自甲基；

[0056] R_4 选自正丁基；

[0057] 或者 R_3 和 R_4 同与之相连的碳原子一起形成饱和的 5 元或 6 元碳环；

[0058] R_5 选自甲基、乙基、异丙基、正丁基、 $CH_2CH_2OCH_3$ 、苄基或呋喃甲基；

[0059] X、Y 均选自 O。

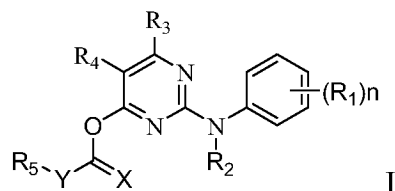
[0060] 上面给出的通式 I 化合物的定义中，汇集所用术语一般代表如下取代基：

[0061] 卤素：指氟、氯、溴或碘。烷基：直链或支链烷基，如甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基或叔丁基。环烷基：取代或未取代的环状烷基，如环丙基、环戊基或环己基。取代基如甲基、卤素等。卤代烷基：直链或支链烷基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基等。烷氧基：直链或支链烷基，经氧原子键连接到结构上，如甲氧基、乙氧基。卤代烷氧基：直链或支链烷氧基，在这些烷氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。如氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、三氟乙氧基等。烷硫基：直链或支链烷基，经硫原子键连接到结构上，如甲硫基、乙硫基。卤代烷硫基：直链或支链烷硫基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。如氯甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基等。烯基：直链或支链烯类，例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基和不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。烯基还包括多烯类，如 1,2-丙二烯基和 2,4-己二烯基。烷基磺酰基：直链或支链烷基经磺酰基 ($-SO_2-$) 连接到结构上，如甲基磺酰基。卤代烷基磺酰基：直链或支链烷基磺酰基，其烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烷基氨基：直链或支链烷基，经氮原子键连接到结构上。卤代烷基氨基：直链或支链烷基氨基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烷基羰基：直链或支链烷基经羰基 ($-CO-$) 连接到结构上，如甲酰基。卤代烷基羰基：直链或支链烷基经羰基 ($-CO-$) 连接到结构上，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，如

三氟乙酰基。烷氧基羰基：直链或支链烷氧基经羰基（-CO-）连接到结构上，如 CH_3OCO 。苄基：苯基亚甲基，经亚甲基将苯基连接到结构上。杂芳基：含 1 个或多个 N、O、S 杂原子的五元环或六元环。例如吡啶基、呋喃基、噻吩基、吡嗪基、哒嗪基、三嗪基、喹啉基、噻唑基、苯并噻唑基、苯并呋喃基等。

[0062] 本发明的部分通式 I 化合物中 $(\text{R}_1)_n$ 取代基列举于表 1，但并不限定本发明。

[0063]



[0064] 表 1

[0065]

$(\text{R}_1)_n$	$(\text{R}_1)_n$	$(\text{R}_1)_n$	$(\text{R}_1)_n$	$(\text{R}_1)_n$
—	2- NO_2	2- $\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	2,3-2F	2,3-2 CH_3
2-Cl-4-F	4- CH_3 -2-Br	2-Cl-4-Br	4- CH_3 -2-Cl	2-Cl-4-I
2-F	3- NO_2	3- $\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	2,4-2F	2,4-2 CH_3
3-F	4- NO_2	4- $\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	2,5-2F	2,5-2 CH_3
4-F	2- SCF_3	2- CO_2CH_3	2,6-2F	2,6-2 CH_3
2-Cl	3- SCF_3	3- CO_2CH_3	3,4-2F	3,4-2 CH_3
3-Cl	4- SCF_3	4- CO_2CH_3	3,5-2F	3,5-2 CH_3
4-Cl	2- OCH_3	2- $\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	2,3-2Cl	2,3-2 C_2H_5
2-Br	3- OCH_3	3- $\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	2,4-2Cl	2,4-2 C_2H_5
3-Br	4- OCH_3	4- $\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	2,5-2Cl	2,5-2 C_2H_5
4-Br	2- COCH_3	2- $\text{N}(\text{CH}_3)_2$	2,6-2Cl	2,6-2 C_2H_5
2-I	3- COCH_3	3- $\text{N}(\text{CH}_3)_2$	3,4-2Cl	3,4-2 C_2H_5

[0066]

3-I	4-COCH ₃	4-N(CH ₃) ₂	3,5-2Cl	3,5-2C ₂ H ₅
4-I	2-CH ₂ Ph	2-N(C ₂ H ₅) ₂	2,3-2Br	2,3-2CF ₃
2-CH ₃	3-CH ₂ Ph	3-N(C ₂ H ₅) ₂	2,4-2Br	2,4-2CF ₃
3-CH ₃	4-CH ₂ Ph	4-N(C ₂ H ₅) ₂	2,5-2Br	2,5-2CF ₃
4-CH ₃	2-C(CH ₃) ₃	4-Ph	2,6-2Br	2,6-2CF ₃
2-C ₂ H ₅	3-C(CH ₃) ₃	2-OPh	3,4-2Br	3,4-2CF ₃
3-C ₂ H ₅	4-C(CH ₃) ₃	3-OPh	3,5-2Br	3,5-2CF ₃
4-C ₂ H ₅	2-COCH ₃	4-OPh	2,3-2CN	2,6-2SCF ₃
2-CF ₃	3-COCH ₃	2,3-2OCH ₃	2,4-2CN	3,4-2SCF ₃
3-CF ₃	4-COCH ₃	2,4-2OCH ₃	2,5-2CN	3,5-2SCF ₃
4-CF ₃	2-COC ₂ H ₅	2,5-2OCH ₃	2,6-2CN	2,3-2SCH ₃
2-OCH ₃	3-COC ₂ H ₅	2,6-2OCH ₃	3,4-2CN	2,4-2SCH ₃
3-OCH ₃	4-COC ₂ H ₅	3,4-2OCH ₃	3,5-2CN	2,5-2SCH ₃
4-OCH ₃	2-SOCH ₃	3,5-2OCH ₃	2-F-4-Cl	2,6-2SCH ₃
2-SCH ₃	3-SOCH ₃	3-CONH ₂	2-F-4-Br	3,4-2SCH ₃
3-SCH ₃	4-SOCH ₃	4-CONH ₂	2-F-4-I	3,5-2SCH ₃
4-SCH ₃	2-SO ₂ CH ₃	2-OCH ₂ Ph	2-F-5-Cl	2,3-2OCF ₃
2-OCF ₃	3-SO ₂ CH ₃	3-OCH ₂ Ph	3-F-5-Cl	2,4-2OCF ₃
3-OCF ₃	4-SO ₂ CH ₃	4-OCH ₂ Ph	4-F-3-Cl	2,5-2OCF ₃
4-OCF ₃	2-SOC ₂ H ₅	2,3-2NO ₂	4-F-6-Cl	2,6-2OCF ₃
2-CN	3-SOC ₂ H ₅	2,4-2NO ₂	2,3,4-3F	3,4-2OCF ₃
3-CN	4-SOC ₂ H ₅	2,5-2NO ₂	2,3,5-3F	3,5-2OCF ₃
4-CN	2-OCHF ₂	2,6-2NO ₂	2,3,6-3F	2,3-2SCF ₃
2-Ph	3-OCHF ₂	3,4-2NO ₂	2,4,5-3F	2,4-2SCF ₃
3-Ph	4-OCHF ₂	3,5-2NO ₂	2,4,6-3F	2,5-2SCF ₃
3-Cl-4-I	2,4,6-3CH ₃	4-Cl-2-Br	2,4,6-3C ₂ H ₅	3,4,5-3F
2-NHCOCH ₃	2,3,4-3Cl	3-NHCOCH ₃	2,3,5-3Cl	4-NHCOCH ₃
2,3,6-3Cl	2-NHSO ₂ CH ₃	2,4,5-3Cl	3-NHSO ₂ CH ₃	2,4,6-3Cl
4-NHSO ₂ CH ₃	3,4,5-3Cl	2-(Ph-4-Cl)	2,3,4-3Br	3-(Ph-4-Cl)
2,3,5-3Br	4-(Ph-4-Cl)	2,3,6-3Br	2-CH(CH ₃) ₂	2,4,5-3Br
3-CH(CH ₃) ₂	2,4,6-3Br	4-CH(CH ₃) ₂	2-CH ₃ -5-F	3-CH ₃ -4-I
2-CH ₃ -4-F	3,4,5-3Br	2-CF ₃ -4-Cl	2-CH ₃ -5-Cl	2-CH ₃ -4-NO ₂
2-CH ₃ -4-Cl	4-CH ₃ -3-F	2-CF ₃ -4-Br	2-CH ₃ -5-Br	2-CH ₃ -4-I
2-CH ₃ -4-Br	4-CH ₃ -3-Cl	3-CF ₃ -4-NO ₂	2-CH ₃ -6-Cl	2-CH ₃ -6-C ₂ H ₅
4-CH ₃ -3-Br	3-CF ₃ -4-F	4-CF ₃ -2-Br	3-CH ₃ -2-Br	2-CH ₃ -6-NO ₂
2,4,6-3CF ₃	3-CF ₃ -4-Cl	2-CH ₃ -5-NO ₂	2-CH ₃ -4-OCH ₃	3-CH ₃ -4-Cl
2-CH ₃ -3-F	4-CF ₃ -2-NO ₂	2-CH ₃ -3-NO ₂	4-SO ₂ CH ₃ -2Cl	3-CH ₃ -4-Br
2-NO ₂ -4,6-2Br	4-CF ₃ -2-Cl	2-SCH ₃ -5-Cl	2,4,6-3NO ₂	2-CH ₃ -3-Cl
2,4-2F-6-Cl	2,3-2Cl-4-Br	2-OH-4-CH ₃	2-OH-4-Cl	2-OH-4-Br
5-CF ₃ -2-Cl	5-CF ₃ -2-OCH ₃	4-CH ₃ -2,6-2Br	3-CH ₃ -4-NHCOCH ₃	2-NO ₂ -4-F
5-CF ₃ -2-Br	2-CF ₃ -4-NO ₂	5-CH ₃ -4-F-6-Cl	4-CH ₃ -3-NHSO ₂ CH ₃	2-NO ₂ -4-Cl
2-CN-3-F	2,4-2NO ₂ -6-Cl	4-C(CH ₃) ₃ -2-Cl	4-CH ₃ -3-OCH ₂ Ph-6-Br	2-NO ₂ -4-Br
2-CN-3-Cl	2,4-2NO ₂ -6-Br	4-CF ₃ -2-Cl-6-Br	5-CH ₃ -2-OCH ₃ -4-Cl	2-NO ₂ -5-Cl
2-CN-4-NO ₂	2,3-2CH(CH ₃) ₂	2-COOCH ₃ -4-Br	4-COCH ₃ -2,6-2Cl	3-NO ₂ -4-Cl

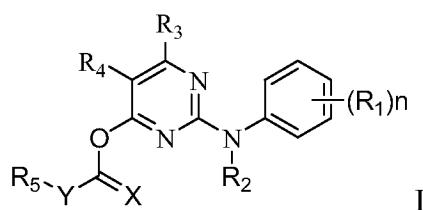
[0067]

2-CN-4-Cl	2,4-2CH(CH ₃) ₂	4-COOCH ₃ -2-Cl	5-CF ₃ -2-NHCOCH ₃	3-NO ₂ -4-Br
2-CN-4-Br	2,5-2CH(CH ₃) ₂	4-COOCH ₃ -2-Br	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-Cl	4-NO ₂ -2-Cl
4-CN-2-CF ₃	2,6-2CH(CH ₃) ₂	2,4,6-3CH(CH ₃) ₂	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-Br	5-NO ₂ -2-Cl
4-CN-2-Cl	3,4-2CH(CH ₃) ₂	2,4,6-3C(CH ₃) ₃	2-CH ₃ -6-NO ₂ -4-Cl	5-NO ₂ -2-Br
4-CN-2-NO ₂	3,5-2CH(CH ₃) ₂	2,3-2CH ₃ -6-NO ₂	2-CH ₃ -6-NO ₂ -4-Br	2-OCH ₃ -5-Cl
5-CH ₃ -2-F	2-NO ₂ -4-OCH ₃	2,4-2OCH ₃ -5-Cl	2,5-2OCH ₃ -4-NO ₂	4-OCH ₃ -3-F
4-CH ₃ -2-NO ₂	2-NO ₂ -4-OC ₂ H ₅	5-CONH ₂ -2-Cl	2,6-2CH ₃ -4-C(CH ₃) ₃	4-OCH ₃ -3-Cl
4-CH ₃ -3-NO ₂	2,3-2C(CH ₃) ₃	4-N(CH ₃) ₂ -2-NO ₂	4-CF ₃ -2-NO ₂ -5-Cl	3-NO ₂ -4-F
5-CH ₃ -2-CN	2,4-2C(CH ₃) ₃	5-N(CH ₃) ₂ -2-NO ₂	4-CF ₃ -2-NO ₂ -6-Cl	2-OCF ₃ -4-CN
5-NO ₂ -2-F	2,5-2C(CH ₃) ₃	4,5-2CH ₃ -2-NO ₂	4-CF ₃ -2-NO ₂ -6-Br	2-OCF ₃ -4-Cl
2-CF ₃ -4,6-2Cl	2,6-2C(CH ₃) ₃	2-NO ₂ -4-F-5-Cl	5-CH ₃ -2-CONH ₂	2-OCF ₃ -4-Br
2-CF ₃ -4,6-2Br	3,4-2C(CH ₃) ₃	2-CN-4-NO ₂ -6-Cl	2-CH ₃ -5-CONH ₂	2-F-4,6-2Br
3-CH ₃ -2,6-2Cl	3,5-2C(CH ₃) ₃	2-CN-4-NO ₂ -6-Br	5-NHCOCH ₃ -2-Cl	4-OCF ₃ -2-Cl
2-CH ₃ -4,6-2Br	4-SO ₂ NH ₂	2-OCH ₂ CH=CH ₂	4-O(CH ₂) ₂ N(CH ₃) ₂	4-OCF ₃ -2-Br
2,4,6-3OCH ₃	4-NO ₂ -2-OCH ₃	3-OCH ₂ CH=CH ₂	4-CH ₃ -3-OCH ₂ Ph	2,3,5,6-4F
3,4,5-3OCH ₃	2-CH ₂ CH=CH ₂	4-OCH ₂ CH=CH ₂	2-CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	2-CN-4,6-2Cl
2,4,6-3SCH ₃	3-CH ₂ CH=CH ₂	2-OCH ₂ C≡CH	3-CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	2-CN-4,6-2Br
2,4,6-3OCF ₃	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OCH ₂ C≡CH	4-CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	4-CN-2,6-2Cl
2,4,6-3SCF ₃	2-C(CH ₃)=CH ₂	4-OCH ₂ C≡CH	4-O(CH ₂) ₃ CH ₃ -2-NO ₂	4-CF ₃ -2,6-2Cl
2-CH ₂ C≡CH	3-C(CH ₃)=CH ₂	5-NO ₂ -2-OCH ₃	3-OCH ₃ -4-CO ₂ CH ₃	4-CF ₃ -2,6-2Br
3-CH ₂ C≡CH	4-C(CH ₃)=CH ₂	5-CH ₃ -2-OCH ₃	2-CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂	2,3,4,5,6-5Cl
4-CH ₂ C≡CH	4-F-2,6-2Br	4-NO ₂ -2,6-2Cl	2,3-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	2,3-(OCF ₂ O-)
2-F-3-Cl	2,4-2F-6-Cl	4-OCF ₃ -2-NO ₂	2,3-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	2,3-(OCH ₂ O-)
3-CH ₃ -2-Cl	2-F-4-Cl-6-Br	6-NO ₂ -2,3,4-3F	4-NO ₂ -2,5-2Cl	3,4-(OCH ₂ O-)
4-O(CH ₂) ₃ CH ₃	2,3,5,6-4F-4-CF ₃	4-NO ₂ -2,6-2Br	4-F-3-Cl-2,6-2Br	3,4-(OCF ₂ O-)
2-OH	3-OH	4-OH	2,4-2OH	3,4-2OH

[0068] 注：表中“-”表示 n = 0。

[0069] 部分化合物可以用表 2 中列出的具体化合物来说明本发明，但并不限定本发明。

[0070]



[0071] 表 2

[0072]

编号	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	X	Y	(R ₁) n
1	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	—
2	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-Cl
3	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-F
4	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-Br
5	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-CH ₃
6	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-C ₂ H ₅
7	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-NO ₂

[0073]

8	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-CF ₃
9	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-CN
10	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-CO ₂ CH ₃
11	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-SCH ₃
12	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-SO ₂ CH ₃
13	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-OCF ₃
14	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-OCH ₃
15	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-OCH ₂ CF ₃
16	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-OPh
17	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2-Cl
18	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2-F
19	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2-OCH ₃
20	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2-CH ₃
21	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	3-Cl
22	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,4-2Cl
23	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,3-2Cl
24	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	3,5-2Cl
25	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2-Cl-4-F
26	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,4-2F
27	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,3-2F
28	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	3,4-2OCH ₃
29	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,4-2CH ₃
30	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	3,4-2CH ₃
31	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,5-2CH ₃
32	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,6-2CH ₃
33	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-(4-Cl-Ph)
34	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-n-C ₃ H ₇
35	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	4-t-C ₄ H ₉
36	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,4,6-3CH ₃
37	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,4,6-3Cl
38	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	2,3,4-3F
39	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	S	O	—
40	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	S	O	—
41	CH ₃	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	O	—
42	CH ₃	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	—
43	H	CH ₃	n-Bu	CH ₃	O	S	—
44	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	S	—
45	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	O	S	—
46	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	—
47	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-Cl
48	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-F
49	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CH ₃
50	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-NO ₂
51	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CF ₃


















[0074]

52	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
53	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
54	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCH ₃
55	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl
56	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
57	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-OCH ₃
58	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-CH ₃
59	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	3-Cl
60	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
61	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
62	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
63	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl-4-F
64	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
65	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
66	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,4-2OCH ₃
67	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2CH ₃
68	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,4-2CH ₃
69	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,5-2CH ₃
70	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,6-2CH ₃
71	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-(4-Cl-Ph)
72	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3CH ₃
73	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3Cl
74	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
75	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	—
76	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	4-Cl
77	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	4-F
78	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	4-CH ₃
79	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	4-CN
80	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	4-OCF ₃
81	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	4-OCH ₃
82	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2-Cl
83	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2-F
84	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2-OCH ₃
85	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2-CH ₃
86	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	3-Cl
87	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,4-2Cl
88	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,3-2Cl
89	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	3,5-2Cl
90	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2-Cl-4-F
91	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,4-2F
92	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,3-2F
93	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	3,4-2OCH ₃
94	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,4-2CH ₃
95	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	3,4-2CH ₃

[0075]

96	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,6-2CH ₃
97	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	4-(4-Cl-Ph)
98	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,4,6-3CH ₃
99	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,4,6-3Cl
100	H	CH ₃	n-Bu	C ₂ H ₅	O	O	2,3,4-3F
101	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	—
102	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	4-Cl
103	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	4-F
104	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	4-CH ₃
105	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	4-CN
106	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	4-OCF ₃
107	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	4-OCH ₃
108	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2-F
109	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	3-Cl
110	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2,4-2Cl
111	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2,3-2Cl
112	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	3,5-2Cl
113	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2-Cl-4-F
114	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2,4-2F
115	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2,3-2F
116	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	3,4-2OCH ₃
117	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	3,4-2CH ₃
118	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2,6-2CH ₃
119	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2,4,6-3CH ₃
120	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2,4,6-3Cl
121	H	CH ₃	n-Bu	n-Bu	O	O	2,3,4-3F
122	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	—
123	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	4-Cl
124	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	4-F
125	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	4-CH ₃
126	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	4-CN
127	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	4-OCF ₃
128	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2-F
129	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2,4-2Cl
130	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2,3-2Cl
131	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	3,5-2Cl
132	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2-Cl-4-F
133	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2,4-2F
134	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2,3-2F
135	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2,6-2CH ₃
136	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2,4,6-3CH ₃
137	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2,4,6-3Cl
138	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	O	2,3,4-3F

[0076]

139	H	CH ₃	n-Bu		O	O	—
140	H	CH ₃	n-Bu		O	O	4-Cl
141	H	CH ₃	n-Bu		O	O	4-F
142	H	CH ₃	n-Bu		O	O	4-CH ₃
143	H	CH ₃	n-Bu		O	O	4-CN
144	H	CH ₃	n-Bu		O	O	4-OCF ₃
145	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2-F
146	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2,4-2Cl
147	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2,3-2Cl
148	H	CH ₃	n-Bu		O	O	3,5-2Cl
149	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2-Cl-4-F
150	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2,4-2F
151	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2,3-2F
152	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2,6-2CH ₃
153	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2,4,6-3CH ₃
154	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2,4,6-3Cl
155	H	CH ₃	n-Bu		O	O	2,3,4-3F
156	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	—
157	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	4-Cl
158	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	4-F
159	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	4-CH ₃
160	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	4-CN
161	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	4-OCF ₃
162	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2-F
163	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2,4-2Cl
164	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2,3-2Cl
165	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	3,5-2Cl

[0077]

166	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2-Cl-4-F
167	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2,4-2F
168	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2,3-2F
169	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2,6-2CH ₃
170	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2,4,6-3CH ₃
171	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2,4,6-3Cl
172	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ Ph	O	O	2,3,4-3F
173	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	—
174	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	4-Cl
175	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	4-F
176	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	4-CH ₃
177	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	4-CN
178	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	4-OCF ₃
179	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2-F
180	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2,4-2Cl
181	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2,3-2Cl
182	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	3,5-2Cl
183	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2-Cl-4-F
184	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2,4-2F
185	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2,3-2F
186	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2,6-2CH ₃
187	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2,4,6-3CH ₃
188	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2,4,6-3Cl
189	H	CH ₃	n-Bu	CH(CH ₃)Ph	O	O	2,3,4-3F
190	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	—
191	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	4-Cl
192	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	4-F
193	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	4-CH ₃
194	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
195	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
196	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2-F
197	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
198	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
199	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
200	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl-4-F
201	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
202	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
203	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2,6-2CH ₃
204	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3CH ₃
205	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3Cl
206	H	CH ₃	n-Bu	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
207	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	—
208	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-Cl
209	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-F

[0078]

210	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-CH ₃
211	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-NO ₂
212	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-CF ₃
213	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-CN
214	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-OCF ₃
215	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-OCH ₃
216	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2-Cl
217	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2-F
218	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2-OCH ₃
219	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2-CH ₃
220	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	3-Cl
221	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,4-2Cl
222	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,3-2Cl
223	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	3,5-2Cl
224	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2-Cl-4-F
225	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,4-2F
226	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,3-2F
227	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	3,4-2OCH ₃
228	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,4-2CH ₃
229	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	3,4-2CH ₃
230	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,5-2CH ₃
231	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,6-2CH ₃
232	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	4-(4-Cl-Ph)
233	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,4,6-3CH ₃
234	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,4,6-3Cl
235	H	CH ₃	H	CH ₃	O	O	2,3,4-3F
236	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	—
237	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	4-Cl
238	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	4-F
239	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	4-CH ₃
240	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	4-CN
241	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	4-OCF ₃
242	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2-F
243	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2,4-2Cl
244	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2,3-2Cl
245	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	3,5-2Cl
246	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2-Cl-4-F
247	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2,4-2F
248	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2,3-2F
249	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2,6-2CH ₃
250	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2,4,6-3CH ₃
251	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2,4,6-3Cl
252	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	O	2,3,4-3F
253	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	—

[0079]

254	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-Cl
255	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-F
256	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CH ₃
257	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
258	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
259	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
260	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
261	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
262	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
263	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl-4-F
264	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
265	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
266	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,6-2CH ₃
267	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3CH ₃
268	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3Cl
269	H	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
270	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	—
271	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-Cl
272	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-F
273	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CH ₃
274	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
275	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
276	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
277	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
278	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
279	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
280	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl-4-F
281	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
282	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
283	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,6-2CH ₃
284	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3CH ₃
285	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3Cl
286	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
287	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	—
288	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-Cl
289	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-F
290	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CH ₃
291	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
292	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
293	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
294	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
295	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
296	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
297	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl-4-F

[0080]

298	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
299	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
300	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,6-2CH ₃
301	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3CH ₃
302	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3Cl
303	H	Ph	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
304	H	Ph	H	CH ₃	O	O	—
305	H	Ph	H	CH ₃	O	O	4-Cl
306	H	Ph	H	CH ₃	O	O	4-F
307	H	Ph	H	CH ₃	O	O	4-CH ₃
308	H	Ph	H	CH ₃	O	O	4-CN
309	H	Ph	H	CH ₃	O	O	4-OCF ₃
310	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2-F
311	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2,4-2Cl
312	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2,3-2Cl
313	H	Ph	H	CH ₃	O	O	3,5-2Cl
314	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2-Cl-4-F
315	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2,4-2F
316	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2,3-2F
317	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2,6-2CH ₃
318	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2,4,6-3CH ₃
319	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2,4,6-3Cl
320	H	Ph	H	CH ₃	O	O	2,3,4-3F
321	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	—
322	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-Cl
323	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-F
324	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CH ₃
325	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
326	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
327	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
328	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
329	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
330	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
331	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl-4-F
332	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
333	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
334	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,6-2CH ₃
335	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3CH ₃
336	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3Cl
337	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
338	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	—
339	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	4-Cl
340	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	4-F
341	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	4-CH ₃

[0081]

342	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	4-CN
343	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	4-OCF ₃
344	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2-F
345	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2,4-2Cl
346	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2,3-2Cl
347	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	3,5-2Cl
348	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2-Cl-4-F
349	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2,4-2F
350	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2,3-2F
351	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2,6-2CH ₃
352	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2,4,6-3CH ₃
353	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2,4,6-3Cl
354	H	CF ₃	H	CH ₃	O	O	2,3,4-3F
355	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	—
356	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
357	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
358	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
359	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
360	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
361	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
362	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
363	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
364	H	CH ₃	Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
365	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	—
366	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	4-CN
367	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	4-OCF ₃
368	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	2-F
369	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	2,4-2Cl
370	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	2,3-2Cl
371	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	3,5-2Cl
372	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	2,4-2F
373	H	CH ₃	Ph	CH ₃	O	O	2,3-2F
374	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	—
375	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
376	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
377	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
378	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
379	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
380	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
381	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
382	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
383	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
384	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	—
385	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	4-CN

[0082]

386	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	4-OCF ₃
387	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	2-F
388	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	2,4-2Cl
389	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	2,3-2Cl
390	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	3,5-2Cl
391	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	2,4-2F
392	H	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	O	O	2,3-2F
393	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	
394	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	4-Cl
395	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	4-F
396	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CH ₃
397	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
398	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
399	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
400	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
401	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
402	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
403	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl-4-F
404	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
405	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
406	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2,6-2CH ₃
407	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3CH ₃
408	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3Cl
409	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
410	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	—
411	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	4-Cl
412	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	4-F
413	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	4-CH ₃
414	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	4-CN
415	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	4-OCF ₃
416	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2-F
417	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2,4-2Cl
418	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2,3-2Cl
419	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	3,5-2Cl
420	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2-Cl-4-F
421	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2,4-2F
422	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2,3-2F
423	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2,6-2CH ₃
424	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2,4,6-3CH ₃
425	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2,4,6-3Cl
426	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₃	O	O	2,3,4-3F
427	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	—
428	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	4-Cl
429	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH(CH ₃) ₂	O	O	4-F

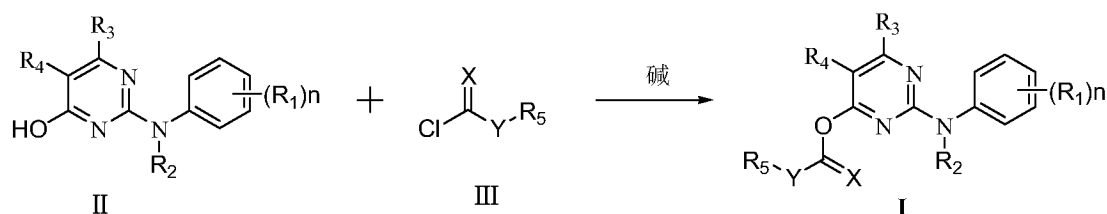
[0083]

430	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CH ₃
431	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-CN
432	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	4-OCF ₃
433	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-F
434	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2Cl
435	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2Cl
436	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	3,5-2Cl
437	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2-Cl-4-F
438	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4-2F
439	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3-2F
440	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,6-2CH ₃
441	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3CH ₃
442	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,4,6-3Cl
443	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH(CH ₃) ₂	O	O	2,3,4-3F
444	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	—
445	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	4-Cl
446	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	4-F
447	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	4-CH ₃
448	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	4-CN
449	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	4-OCF ₃
450	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2-F
451	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2,4-2Cl
452	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2,3-2Cl
453	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	3,5-2Cl
454	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2-Cl-4-F
455	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2,4-2F
456	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2,3-2F
457	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2,6-2CH ₃
458	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2,4,6-3CH ₃
459	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2,4,6-3Cl
460	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃	O	O	2,3,4-3F

[0084] 注：表中“-”表示 n = 0。

[0085] 本发明的通式 I 化合物可按照以下方法制备，式中各基团定义同前：

[0086]



[0087] 反应在适宜的溶剂中进行，适宜的溶剂可选自如四氢呋喃、乙腈、二氯甲烷、甲苯、二甲苯、苯、N,N-二甲基甲酰胺或二甲亚砜等。

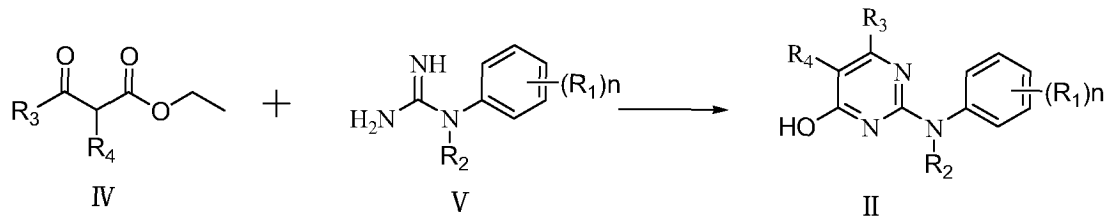
[0088] 适宜的碱可选自如氢氧化钾、氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、三乙胺、吡啶、氯化钠、叔丁醇钾或叔丁醇钠等。

[0089] 反应温度可在室温至溶剂沸点温度之间，通常为 20-100℃。

[0090] 反应时间为 30 分钟至 20 小时,通常 1-10 小时。

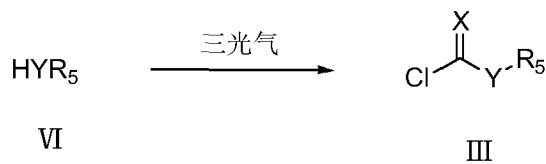
[0091] 中间体 II 可由中间体 IV 和 V 按照已知方法缩合得到,具体合成可参见 W02008145052。

[0092]



[0093] 中间体 III 可以市购或通过已知方法制得,具体合成可参见 W02008092335。

[0094]



[0095] 中间体 VI 可以市购。

[0096] 通式 I 化合物对农业、民用和动物技术领域有害的病菌都显示出高杀菌活性。因此,本发明的另一技术方案涉及通式 I 化合物在农业和其他领域中防治病菌的应用,例如通式 I 化合物用于制备农业或其他领域中防治病菌的杀菌剂药物的用途。尤其是,通式 I 化合物对下列科的重要品种有活性:黄瓜霜霉病、小麦白粉病、黄瓜灰霉病、番茄早疫病、番茄晚疫病、辣椒疫病、葡萄霜霉病、葡萄白腐病、苹果轮纹病、苹果斑点落叶病、水稻纹枯病、水稻稻瘟病、小麦锈病、小麦叶斑病、油菜菌核病、玉米小斑病等。

[0097] 由于其积极的特性,上述化合物可有利地用于保护农业和园艺业重要的作物、家畜和种畜,以及人类常去的环境免于有害病菌的伤害。

[0098] 为获得理想效果,化合物的用量因各种因素而改变,例如所用化合物、欲保护的作物、有害病菌的类型、感染程度、气候条件、施药方法、采用的剂型。

[0099] 每公顷 10 克 -5 公斤的化合物剂量能提供充分的防治效果。

[0100] 本发明的另一目的还涉及通过施用通式 I 化合物,防治农业和园艺业重要的作物和 / 或家畜和种畜和 / 或人类常去的环境中的病菌的方法。尤其是,化合物的用量在每公顷 10 克 -5 公斤内变化。

[0101] 为了实际应用于农业,使用含一种或多种通式 I 化合物的组合物通常是有益的。

[0102] 因此,本发明的另外一种技术方案还包括一种杀菌组合物,含有作为活性组分的通式 I 化合物和农业上可接受的载体,组合物中活性组分的重量百分含量为 0.1-99%。

[0103] 组合物的使用形式可以是干粉、可湿性粉剂、乳油、微乳剂、糊剂、颗粒剂、溶液、悬浮剂等;组合物类型的选择取决于具体的应用。

[0104] 组合物是以已知方式制备的,例如任选在表面活性剂的存在下,通过用溶剂介质和 / 或固体稀释剂稀释或溶解活性物质。

[0105] 可用的固体稀释剂或载体是例如:二氧化硅、高岭土、膨润土、滑石、硅藻土、白云石、碳酸钙、氧化镁、白垩、粘土、合成硅酸盐、硅镁土、海泡石。

[0106] 除水以外,可用的液体稀释剂是例如芳族有机溶剂(二甲苯或烷基苯的混合物、

氯苯等),石蜡(石油馏分),醇类(甲醇、丙醇、丁醇、辛醇、甘油),酯类(乙酸乙酯、乙酸异丁酯等),酮类(环己酮、丙酮、苯乙酮、异佛尔酮、乙基戊基酮等),酰胺类(N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮等)。

[0107] 可用的表面活性剂是烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、聚氧乙烯烷基酚、山梨醇的聚氧乙烯酯、木质素磺酸盐等的钠、钙、三乙基胺或三乙醇胺盐。

[0108] 组合物还可含特殊的添加剂用于特定的目的,例如粘合剂如阿拉伯胶、聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮等。

[0109] 上述组合物中活性成分的浓度可根据活性成分、其使用目的、环境条件和采用的制剂类型而在较宽范围内改变。通常,活性成分的浓度范围是1-90%,优选5-60%。

[0110] 如果需要,可以向组合物中添加能与通式 I 化合物兼容的其他活性成分,例如其他杀菌剂、植物生长调节剂、抗生素、除草剂、肥料等。

[0111] 几种剂型的配制方法举例如下:

[0112] 悬浮剂的配制:常用配方中活性组分含量为5%-35%。以水为介质,将原药、分散剂、助悬剂和抗冻剂等加入砂磨机中,进行研磨,制成悬浮剂。

[0113] 水乳剂的配制:将原药、溶剂和乳化剂加在一起,使溶解成均匀油相。将水、抗冻剂等混合一起,成为均一水相。在高速搅拌下,将水相加入到油相或将油相加入到水相,形成分散性良好的水乳剂。本发明的水乳剂活性组分含量一般为5%-15%。为制备浓乳剂,本发明的化合物可溶解于一种或数种混合溶剂,再加入乳化剂来增强化合物在水中的分散效果。

[0114] 可湿性粉剂的配制:按配方要求,将原药、各种表面活性剂及固体稀释剂等充分混合,经超细粉碎机粉碎后,即得到预定含量(例如10%-40%)的可湿性粉剂产品。为制备适于喷洒用的可湿性粉剂,本发明的化合物可以和研细的固体粉末如粘土、无机硅酸盐、碳酸盐以及润湿剂、粘合剂和/或分散剂组成混合物。

[0115] 水分散性粒剂的配制:将原药和粉状固体稀释剂、润湿展着剂及粘合剂等进行混合粉碎,再加水捏合后,加入装有10至100目筛网的造粒机中进行造粒,然后再经干燥、筛分(按筛网范围)。也可将原药、分散剂、崩解剂和润湿剂及固体稀释剂加入砂磨机中,以水为介质研磨,制成悬浮剂,然后进行喷雾干燥造粒,通常配制含量为20%-30%颗粒状产品。

具体实施方式

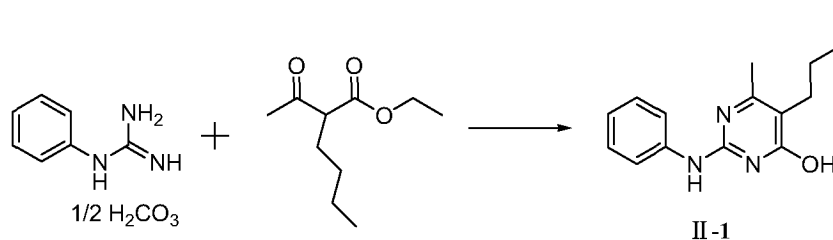
[0116] 以下具体实施例用来进一步说明本发明,但本发明绝非仅限于这些例子。(所用原料有市售)

[0117] 合成实施例

[0118] 实施例1:化合物1的制备

[0119] (1)5-丁基-6-甲基-2-(苯氨基)嘧啶-4-羟基(II-1)的合成

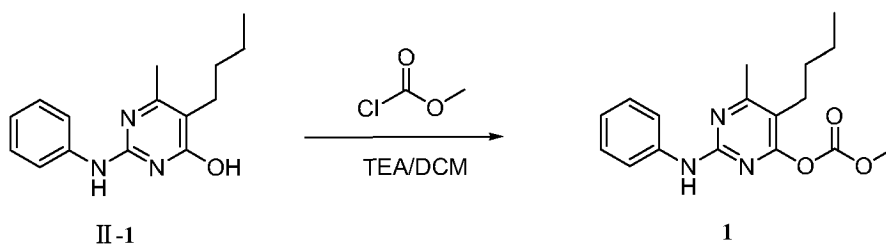
[0120]



[0121] 在 250 毫升反应瓶中依次加入苯胍碳酸盐 (13.5 克, 100 毫摩尔)、β-酮酸酯 (22.3 克, 120 毫摩尔) 及 120 毫升甲苯, 升温回流反应, 分水器分水, 直至没有水生成, 再继续回流半小时, 减压除去大部分溶剂。反应液降至室温, 过滤收集固体, 用 20% 乙醇水溶液洗涤, 干燥得白色固体 (II-1) 18.3 克, 收率 71.2%。

[0122] (2) 化合物 1 的合成

[0123]

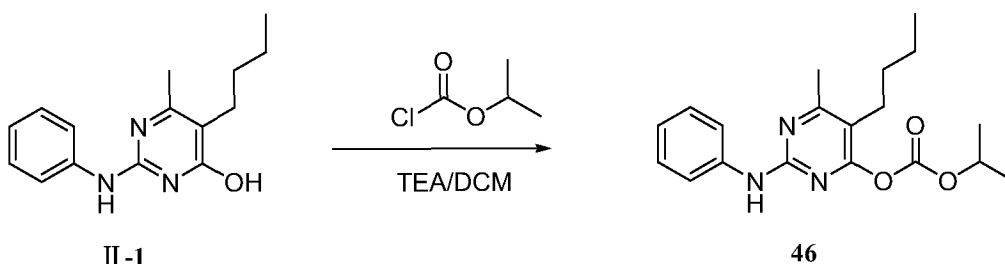


[0124] 在 50 毫升反应瓶中依次加入中间体嘧啶醇 (II-1) (0.4 克, 1.55 毫摩尔)、8 毫升二氯甲烷 (DCM) 及 0.3 毫升三乙胺 (TEA), 室温搅拌下慢慢滴加氯甲酸甲酯 (0.2 克, 2.11 毫摩尔) 和 3 毫升二氯甲烷溶液, 室温反应 1 小时, TLC 监测反应完毕。减压脱去溶剂, 残余物柱层析得 0.35 克无色油状化合物 1, 收率 71.6%。

[0125] 核磁数据 ¹H-NMR (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl₃) 如下: δ (ppm): 0.93 (t, 3H), 1.42 (m, 4H), 2.45 (s, 3H), 2.48 (m, 2H), 7.00 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.28 (m, 2H), 7.57 (m, 2H)。

[0126] 实施例 2: 化合物 46 的制备

[0127]



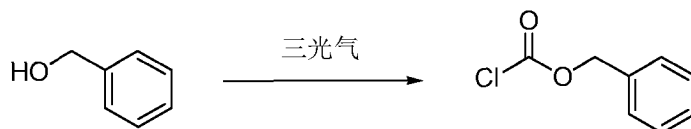
[0128] 在 50 毫升反应瓶中依次加入中间体嘧啶醇 (II-1) (0.4 克, 1.55 毫摩尔)、8 毫升二氯甲烷 (DCM) 及 0.3 毫升三乙胺 (TEA), 室温搅拌下慢慢滴加氯甲酸异丙酯 (0.3 克, 2.45 毫摩尔) 和 3 毫升二氯甲烷溶液, 室温反应 1 小时, TLC 监测反应完毕。减压脱去溶剂, 残余物柱层析得 0.31 克无色油状化合物 46, 收率 58.2%。

[0129] 核磁数据 ¹H-NMR (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl₃) 如下: δ (ppm): 0.93 (t, 3H), 1.38 (d, 6H), 1.43 (m, 4H), 2.45 (s, 3H), 2.50 (t, 2H), 5.03 (m, 1H), 6.99 (m, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.29 (m, 2H), 7.57 (m, 2H)。

[0130] 实施例 3: 化合物 156 的制备

[0131] (1) 氯甲酸苯甲酯的合成

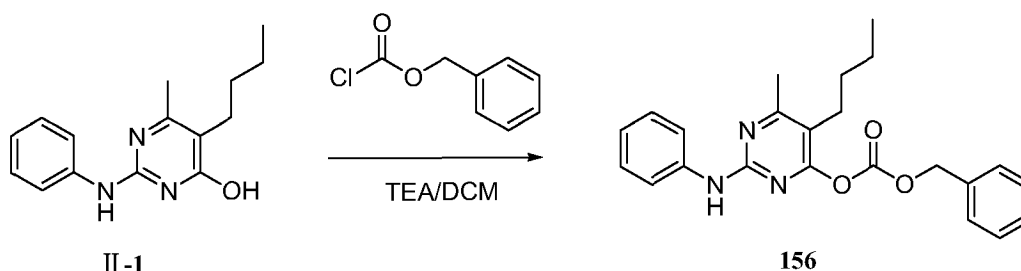
[0132]



[0133] 在 250 毫升反应瓶中依次加入三光气 (29.8 克, 0.1 摩尔)、50 毫升四氯化碳, 冰浴降温至 5℃ 以下, 搅拌下慢慢滴加苯甲醇 (10.8 克, 0.1 摩尔) 和 20 毫升四氯化碳溶液, 滴加完毕撤去冰浴, 室温反应 5 小时, TLC 监测反应完毕。减压脱去溶剂, 加入乙酸乙酯, 并用水洗涤, 干燥有机层, 脱溶得 16.31 克无色油状物, 收率 95.6%。

[0134] (2) 化合物 156 的合成

[0135]



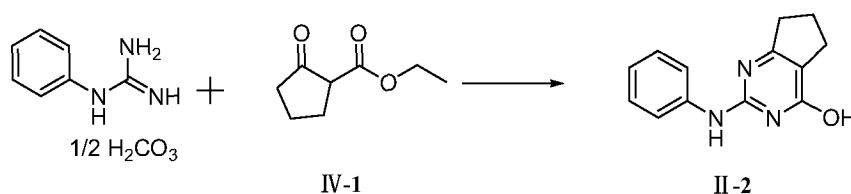
[0136] 在 50 毫升反应瓶中依次加入中间体嘧啶醇 (II-1) (0.4 克, 1.55 毫摩尔)、8 毫升二氯甲烷及 0.3 毫升三乙胺, 室温搅拌下慢慢滴加氯甲酸苯甲酯 (0.34 克, 2 毫摩尔) 和 3 毫升二氯甲烷溶液, 室温反应 1 小时, TLC 监测反应完毕。减压脱去溶剂, 残余物柱层析得 0.38 克无色油状化合物 156, 收率 62.6%。

[0137] 核磁数据 $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) 如下: δ (ppm): 0.91 (m, 3H), 1.39 (m, 4H), 2.42 (s, 3H), 2.46 (m, 2H), 5.31 (s, 2H), 6.97 (m, 1H), 7.02 (s, 1H), 7.26 (m, 2H), 7.38 (m, 5H), 7.57 (m, 2H)。

[0138] 实施例 4: 化合物 393 的制备

[0139] (1) 嘧啶醇中间体 (II-2) 的合成

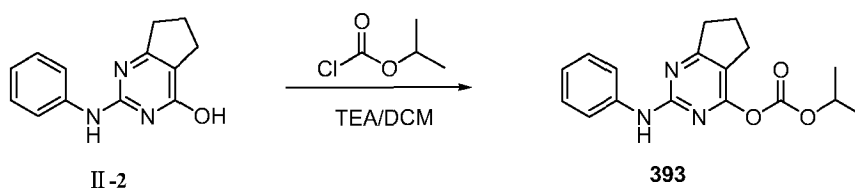
[0140]



[0141] 在 250 毫升反应瓶中依次加入苯胍碳酸盐 (13.5 克, 100 毫摩尔)、 β -酮酸酯 (IV-1) (18.7 克, 120 毫摩尔) 及 120 毫升甲苯, 升温回流反应, 分水器分水, 直至没有水生成, 再继续回流半小时, 减压除去大部分溶剂。反应液降至室温, 过滤收集固体, 用 20% 乙醇水溶液洗涤, 干燥得白色固体 (II-2) 15.8 克, 收率 69.5%。

[0142] (2) 化合物 393 的合成

[0143]



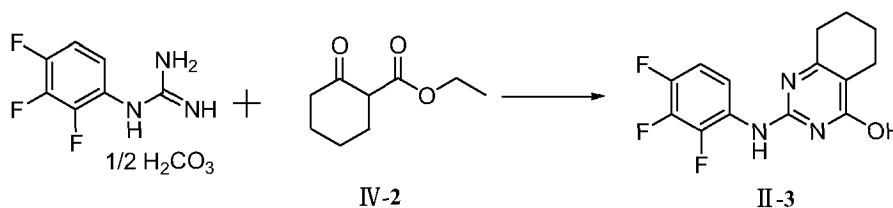
[0144] 在 50 毫升反应瓶中依次加入中间体嘧啶醇 (II-2) (0.4 克, 1.76 毫摩尔)、10 毫升二氯甲烷及 0.4 毫升三乙胺, 室温搅拌下慢慢滴加氯甲酸异丙酯 (0.34 克, 2 毫摩尔) 和 3 毫升二氯甲烷溶液, 室温反应 1 小时, TLC 监测反应完毕。减压脱去溶剂, 残余物柱层析得 0.41 克白色固体化合物 393, 收率 74.3%。熔点 124-126℃。

[0145] 核磁数据 $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) 如下: δ (ppm): 1.39 (d, 6H), 2.13 (m, 2H), 2.82 (q, 2H), 2.94 (q, 2H), 5.02 (m, 1H), 7.04 (m, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.28 (m, 2H), 7.59 (m, 2H)。

[0146] 实施例 5: 化合物 443 的制备

[0147] (1) 嘧啶醇中间体 (II-2) 的合成

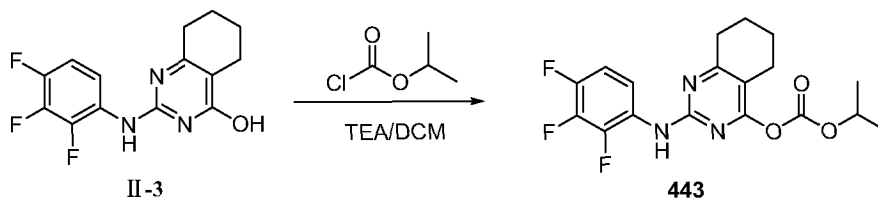
[0148]



[0149] 在 250 毫升反应瓶中依次加入 2,3,4-三氟苯胍碳酸盐 (18.9 克, 100 毫摩尔)、 β -酮酸酯 (IV-2) (20.4 克, 120 毫摩尔) 及 120 毫升甲苯, 升温回流反应, 分水器分水, 直至没有水生成, 再继续回流半小时, 减压除去大部分溶剂。反应液降至室温, 过滤收集固体, 用 20% 乙醇水溶液洗涤, 干燥得白色固体 (II-2) 16.1 克, 收率 54.6%。

[0150] (2) 化合物 443 的合成

[0151]



[0152] 在 50 毫升反应瓶中依次加入中间体嘧啶醇 (II-2) (0.4 克, 1.35 毫摩尔)、10 毫升二氯甲烷及 0.4 毫升三乙胺, 室温搅拌下慢慢滴加氯甲酸异丙酯 (0.34 克, 2 毫摩尔) 和 3 毫升二氯甲烷溶液, 室温反应 1 小时, TLC 监测反应完毕。减压脱去溶剂, 残余物柱层析得 0.38 克白色固体化合物 443, 收率 73.8%。熔点 124-126℃。

[0153] 核磁数据 $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) 如下: δ (ppm): 1.38 (d, 6H), 1.82 (m, 4H), 2.55 (q, 2H), 2.78 (q, 2H), 5.01 (m, 1H), 6.92 (m, 1H), 7.05 (s, 1H), 8.17 (m, 1H)。

[0154] 本发明其他化合物的制备均可参照以上实例。

[0155] 部分化合物的物性数据及核磁数据 ($^1\text{H-NMR}$, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) 如下:

[0156] 化合物 13: 熔点 90-92℃。 δ (ppm): 0.94 (t, 3H), 1.43 (m, 4H), 2.46 (s, 3H), 2.51 (t, 2H), 3.94 (s, 3H), 7.14 (s, 1H), 7.17 (m, 2H), 7.60 (m, 2H)。

[0157] 化合物 45: 粘稠状液体。 δ (ppm): 0.94 (t, 3H), 1.43 (m, 4H), 2.46 (s, 3H), 2.48 (t, 2H), 3.62 (m, 2H), 5.18 (m, 1H), 5.31 (m, 1H), 5.92 (m, 1H), 7.00 (m, 2H), 7.28 (m, 2H), 7.59 (m, 2H)。

[0158] 化合物 53: 熔点 80-81℃。 δ (ppm): 0.94 (t, 3H), 1.36 (d, 6H), 1.46 (m, 4H), 2.44 (s, 3H), 2.51 (t, 2H), 5.03 (m, 1H), 7.13 (m, 3H), 7.59 (m, 2H)。

[0159] 化合物 75:粘稠状液体。δ (ppm):0.94(t,3H),1.41(m,7H),2.45(s,3H),2.48(m,2H),4.37(q,2H),7.01(m,1H),7.17(s,1H),7.30(m,2H),7.58(m,2H)。

[0160] 化合物 101:粘稠状液体。δ (ppm):0.94(m,6H),1.43(m,6H),1.74(m,2H),2.46(s,3H),2.50(m,2H),4.31(q,2H),7.03(m,2H),7.30(m,2H),7.58(m,2H)。

[0161] 化合物 122:熔点 135-137 °C。δ (ppm):0.91(m,3H),1.43(m,4H),2.45(s,3H),2.52(m,2H),3.41(s,3H),3.69(m,2H),4.44(m,2H),7.03(m,2H),7.30(m,2H),7.58(m,2H)。

[0162] 化合物 139:熔点 135-137 °C。δ (ppm):0.91(m,3H),1.43(m,4H),1.93(m,4H),2.45(s,3H),2.50(m,2H),3.88(m,2H),4.27(m,3H),7.00(m,1H),7.11(m,1H),7.29(m,2H),7.58(m,2H)。

[0163] 化合物 173:粘稠状液体。δ (ppm):0.88(m,3H),1.37(m,7H),2.46(s,3H),2.50(m,2H),4.37(m,1H),7.01(m,3H),7.34(m,6H),7.58(m,2H)。

[0164] 化合物 223:熔点 96-98 °C。δ (ppm):2.46(s,3H),3.96(s,3H),6.53(s,1H),7.00(s,1H),7.37(s,1H),7.57(s,1H)。

[0165] 化合物 253:熔点 122-124 °C。δ (ppm):1.36(m,6H),2.07(s,3H),2.40(s,3H),5.02(m,1H),7.00(m,1H),7.08(s,1H),7.29(m,2H),7.58(m,2H)。

[0166] 化合物 270:粘稠状固体。δ (ppm):1.39(m,6H),1.42(s,3H),5.00(m,1H),6.46(s,1H),7.01(m,1H),7.28(m,2H),7.33(s,1H),7.60(m,2H)。

[0167] 化合物 287:熔点 100-102 °C。δ (ppm):1.39(m,6H),5.05(m,1H),7.00(s,1H),7.06(m,1H),7.34(m,3H),7.48(m,3H),7.65(m,2H),8.04(m,2H)。

[0168] 化合物 304:熔点 133-134 °C。δ (ppm):3.97(s,3H),7.00(s,1H),7.05(m,1H),7.36(m,3H),7.49(m,3H),7.68(m,2H),8.05(m,2H)。

[0169] 化合物 330:熔点 118-120 °C。δ (ppm):1.42(d,6H),5.08(m,1H),6.95(s,1H),7.07(m,1H),7.55(m,3H)。

[0170] 化合物 347:熔点 110-112 °C。δ (ppm):3.98(s,3H),6.53(s,1H),7.00(s,1H),7.37(s,1H),7.57(s,1H)。

[0171] 化合物 409:熔点 113-115 °C。δ (ppm):1.39(d,6H),2.15(m,2H),2.83(q,2H),2.95(q,2H),5.00(m,1H),6.93(m,1H),7.17(s,1H),8.17(m,1H)。

[0172] 化合物 427:熔点 114-116 °C。δ (ppm):1.38(d,6H),1.82(m,4H),2.54(q,2H),2.77(q,2H),5.02(m,1H),6.97(m,1H),7.02(s,1H),7.28(m,2H),7.58(m,2H)。

[0173] 制剂实施例(各组分加入量均为重量百分含量,活性化合物折百后计量加入)

[0174] 实施例 6:30%化合物 1 可湿性粉剂

[0175]

化合物 1	30%
十二烷基硫酸钠	2%
木质素磺酸钠	3%
萘磺酸甲醛缩合物	5%
轻质碳酸钙	补足至 100%

[0177] 将化合物 1 及其他组分充分混合,经超细粉碎机粉碎后,即得到 30%的可湿性粉剂产品。

[0178] 实施例 7:40%化合物 1 浓悬浮剂

[0179]

化合物 1	40%
乙二醇	10%
壬基苯酚聚乙二醇醚	6%
木质素磺酸钠	10%
羧甲基纤维素	1%
37% 甲醛水溶液	0.2%
75% 硅油水乳液	0.8%
水	补足至 100%

[0180] 化合物 1 及其他组分充分混合,由此得到的浓悬浮剂,用水稀释所得悬浮剂可得到任何所需浓度的稀释液。

[0181] 实施例 8 :60% 化合物 46 水分散性粒剂

[0182]

化合物 46	60%
萘磺酸钠甲醛缩合物	12%
<i>N</i> -甲基- <i>N</i> -油酰基-牛磺酸钠	8%
聚乙烯吡咯烷酮	2%
羧甲基纤维素	2%
高岭土	补足至 100%

[0183] 将化合物 46 及其他组分混合粉碎,再加水捏合后,加入 10-100 目筛网的造粒机中进行造粒,然后再经干燥、筛分(按筛网范围)。

[0184] 生物活性测定实例

[0185] 生物活性测定实例

[0186] 实施例 9 杀菌活性测定

[0187] 用本发明化合物样品对植物的多种真菌病害进行了活体保护效果和离体抑菌活性试验。

[0188] 活体保护效果试验方法如下:

[0189] 选择生长一致的盆栽黄瓜幼苗,剪去生长点保留两片真叶,作为试验材料。用本发明化合物按照设计浓度进行叶面喷雾处理,另设喷清水的空白对照,3 次重复。处理后第二天接种黄瓜霜霉病孢子悬浮液,然后放置于人工气候室(温度:昼 25℃、夜 20℃,相对湿度:95~100%)保湿培养,24 小时后放置于温室(25±2℃)并正常管理,5 天后调查防治效果。病害分级参照中华人民共和国国家标准《农药田间药效试验准则》,以病情指数计算防治效果。

[0190] 选择生长一致的两叶期小麦盆栽幼苗作为小麦白粉病试验材料,用本发明化合物按照设计浓度进行叶面喷雾处理,另设喷清水的空白对照,3 次重复。处理后第二天采用孢子抖落法接种,然后放置于温室(25±2℃)并正常管理,7 天后调查防治效果。病害分级参照中华人民共和国国家标准《农药田间药效试验准则》,以病情指数计算防治效果。

[0191] 选择生长一致的两叶期玉米盆栽幼苗,用本发明化合物按照设计浓度进行叶面喷雾处理,另设喷清水的空白对照,3 次重复。处理后第二天接种玉米锈病孢子悬浮液,然后放置于人工气候室(温度:昼 25℃、夜 20℃,相对湿度:95~100%)保湿培养,24 小时后放置于温室(25±2℃)并正常管理,7 天后调查防治效果,病害分级参照中华人民共和国国家

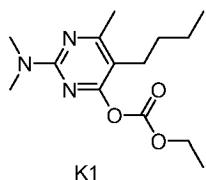
标准《农药田间药效试验准则》，以病情指数计算防治效果。

[0192] 离体抑菌活性试验方法如下：

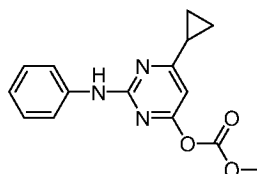
[0193] 离体抑菌试验采用孢子萌发法。用本发明化合物按照设计浓度加入 96 孔培养板内，然后加入稻瘟病菌孢子悬浮液，另设加入清水的空白对照，3 次重复。处理后的培养板放置于培养箱（温度：24℃ -26℃）培养，1 天后调查试验结果，并计算孢子萌发率。

[0194] 文献 (US3962442, US5075316) 中已知化合物 K1, K2 作为对照。部分活体保护活性测试结果和离体抑菌活性测试结果分别见表 3、表 4。

[0195]



K1



K2

[0196] 表 3 部分活体保护活性测试结果如下（防治效果%）：

[0197]

化合物	剂量(mg/L)	黄瓜霜霉病	小麦白粉病	小麦锈病
1	400	95	100	/
	100	20	100	/
	50	0	98	/
45	400	100	100	0
46	400	95	100	100
	100	10	100	0
	50	/	98	/
53	400	95	50	0
75	400	95	95	98
	100	30	98	60
	50	/	50	30
101	400	70	100	98
	100	/	95	0
	50	/	70	/
122	400	100	95	80
	100	90	100	/
	50	90	70	/
139	400	98	100	100
	100	95	100	0
	50	0	20	/
156	400	30	100	0
	100	/	80	/
253	400	20	0	95
347	400	70	100	100
	100	/	70	30
	50	/	60	/
393	400	0	0	70
409	400	95	0	30
427	400	0	0	98
443	400	90	0	0
K1	400	0	100	0
	100	/	0	/
K2	400	0	0	0

[0198] 注：表中“/”表示未进行测试。

[0199] 表 4 部分离体抑菌活性测试结果如下（抑菌效果%）：

[0200]

化合物	剂量(mg/L)	稻瘟病
46	25	100
	8.3	100
	2.8	80
253	25	100
	8.3	80
	2.8	50
347	25	100
	8.3	100
	2.8	50
393	25	100
	8.3	80
	2.8	0
409	25	100
	8.3	80
	2.8	50
427	25	100
	8.3	80
443	25	100
	8.3	100
	2.8	50
K1	25	100
	8.3	80
	2.8	0
K2	25	80
	8.3	0