

[19]中华人民共和国专利局



[12] 发明专利说明书

[21] ZL 专利号 93119072.X

[51]Int.Cl⁶

C07D307 / 82
C07D307 / 79
C07D311 / 04 A01N 43 / 08
A01N 43 / 16

[45]授权公告日 1997年10月22日

[11] 授权公告号 CN 1036195C

[22]申请日 93.9.7 [24]颁证日 97.7.25

[21]申请号 93119072.X

[30]优先权

[32]92.9.7 [33]JP[31]262718 / 92

[32]93.1.28 [33]JP[31]31117 / 93

[32]93.7.30 [33]JP[31]208258 / 93

[73]专利权人 久美蓝化学工业株式会社

地址 日本东京

[72]发明人 柴田卓 伊东茂寿

境润悦 林 茂

[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 王其源

[56]参考文献

EP0398072 C07C271 / 06

EP425925 C07C271 / 06

EP493683 A01N47 / 12

审查员 冯吾战

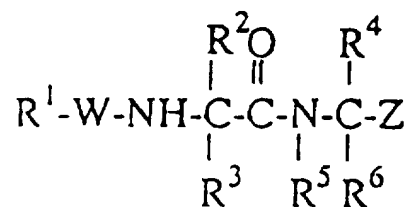
权利要求书 4 页 说明书 71 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 稠合杂环衍生物和含有上述衍生物的农用或园艺用杀真菌剂

[57]摘要

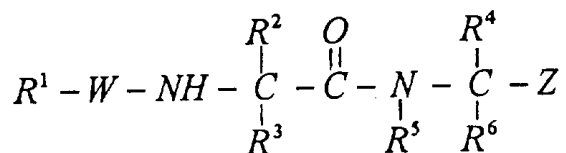
本发明提供了下式表示的稠合杂环衍生物:

其中 R¹ 代表低级烷基,链烯基,等等,R²,R³,R⁴,R⁵ 和 R⁶ 各自代表氢原子,低级烷基等等,W 用 -OC(O)-,-SC(O)-等等表示,且 Z 代表 2-吡啶基等等。本发明还提供了含有有效量的已知具有杀真菌剂效果的稠合衍生物的农用或园艺用杀真菌剂。根据本发明的农用或园艺用杀真菌剂对霜霉病和晚疫病具有优越的防治效果, 对非真菌, 光合植物无害。



权 利 要 求 书

1. 下式表示的稠合杂环衍生物:

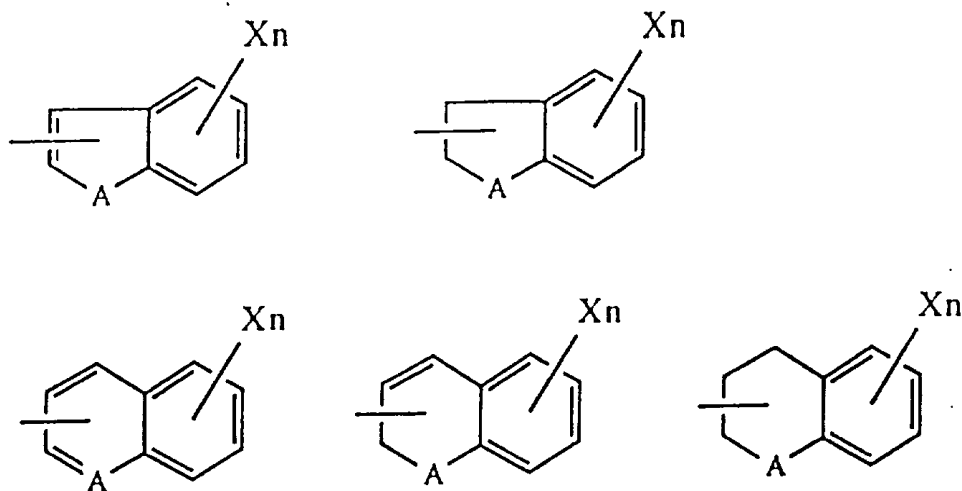


其中 R^1 代表可选择地至少具有一个选自下列取代基的 C_1-C_6 烷基, 取代基包括卤原子, 氰基, 和甲氧基; C_2-C_6 链烯基; C_2-C_6 链炔基; 可选择地至少具有一个甲基的 C_3-C_8 环烷基; 可选择地至少具有一个甲基的 C_3-C_8 环烯基; 可选择地至少具有一个甲基的 C_2-C_6 环醚基; 可选择地至少具有一个选自下列取代基的 C_7-C_{10} 芳烷基; 取代基包括甲基, 甲氧基, 和硝基; 可选择地至少具有一个选自下列取代基的苯基; 取代基包括卤原子, 甲基, 甲氧基, 硝基, 和甲氧羰基; 二甲氨基; 或乙氧羰基;

R^2, R^3, R^4, R^5 和 R^6 独立地代表氢原子, 可选择地至少具有一个卤原子的 C_1-C_6 烷基, C_3-C_6 环烷基, C_7-C_{10} 芳烷基, 苯基, 氰基, 乙酰基, 苯甲酰基, C_1-C_6 烷氧基, 或 C_1-C_6 烷氧羰基,

R^2 可同 R^3 形成具有 3 至 6 碳原子烷基环,

Z 用下式表示:



其中 X 代表氢原子, 卤原子, 可选择地至少具有一个卤原子的 C₁-C₆ 烷基, C₂-C₆ 链炔基, 甲氧基, 三氟甲氧基, 羟基, 甲氧羰基, 甲基羰基氧基, 氨基, 二甲基氨基, 硝基, 甲硫基, 甲基亚磺酰基, 甲基磺酰基, 苯基, 乙酰基, 甲酰基, 或氰基;

n 是 1, 2 或 3 的整数;

A 是 O, 和

W 代表 -C(O)-, -SO₂-, -NHC(O)-, -N(CH₃)C(O)-, -OC(O)-, -SC(O)-, -OC(S)-, 或 -SC(S)-。

2. 权利要求 1 所述的稠合杂环衍生物, 其中 R¹ 代表 C₂-C₆ 直链或支链烷基, C₃ 直链或支链链烯基, C₅-C₆ 环烷基, 或苯基,

R² 代表氢原子,

R³ 代表乙基, 异丙基, 或仲-丁基,

R⁴ 代表氢原子, 甲基, 乙基, 或苯基,

R⁵ 代表氢原子, 或甲基,

R⁶ 代表氢原子,

Z 代表包括苯并咪唑基或 2, 3-二氢苯并咪唑基取代杂环基, 杂环基具有的一或二个取代基选自包括氟原子, 氯原子, 硝基, 氰基, 和甲基,

W 代表 -OC(O)-, 且

氨基酸是 L 异构体。

3. 权利要求 1 所述的稠合杂环衍生物, 其中 R¹ 代表异丙基, 叔-丁基, 仲-丁基, 环戊基, 异丙烯基, 或苯基,

R² 代表氢原子,

R³ 代表乙基, 异丙基, 或仲丁基,

R⁴ 代表甲基,

R⁵代表氢原子,

R⁶代表氢原子,

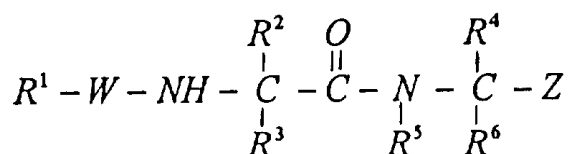
Z代表包括苯并呋喃基的取代杂环基, 其中杂环基具有的一或二个取代基包括氟原子, 氯原子, 硝基, 氰基, 和甲基,

W代表-OC(O)-, 和

氨基酸是L-异构体.

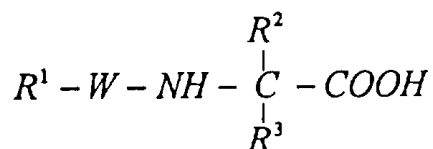
4. 权利要求1所述的稠合杂环衍生物, 其中衍生物包括 N¹-[1-(5-氯-2-苯并呋喃基)乙基]-N²-环戊基氧羰基-L-缬氨酸酰胺, N¹-[1-(5-氯-2-苯并呋喃基)乙基]-N²-异丙基氧羰基-L-缬氨酸酰胺, N¹-[1-(5-氯-2-苯并呋喃基)乙基]-N²-异丙基氧羰基-L-缬氨酸酰胺, N²-仲-丁氧羰基-N¹-[1-(5-硝基-2-苯并呋喃基)乙基]-L-缬氨酸酰胺, N²-仲-丁氧羰基-N¹-[1-(5-氯-2-苯并呋喃基)乙基]-L-缬氨酸酰胺, 或 N¹-[1-(5-氯-2-苯并呋喃基)乙基]-N²-苯氧羰基-L-缬氨酸酰胺.

5. 下式表示的稠合杂环衍生物的制备方法:

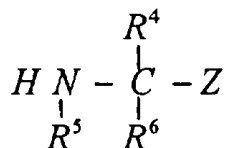


其中 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, W 和 Z 和权利要求1的定义相同;

包括的步骤为: 下式表示的氨基酸衍生物

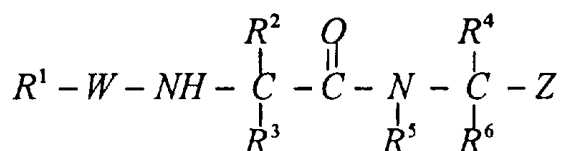


其中 R¹, R², R³, 和 W 和权利要求1中的定义相同, 或其中羧基是活化的氨基酸衍生物, 与等量或过量的下式表示的胺衍生物反应:



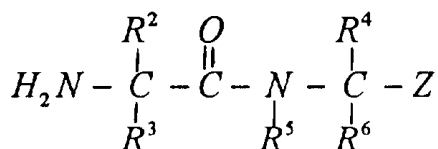
其中 R^4, R^5, R^6 , 和 Z 和权利要求 1 中的定义相同。

6. 下式表示的稠合杂环衍生物的制备方法:



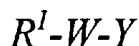
其中 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, W$ 和 Z 和权利要求 1 的定义相同;

包括的步骤为: 下式表示的胺衍生物



其中 R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 , 和 Z 和权利要求 1 中的定义相同,

或胺衍生物的无机酸或有机酸盐, 与等量或过量的下式表示的化合物反应:



其中 R^1 和 W 和权利要求 1 中的定义相同, 且 Y 代表卤原子, $R^1OC(O)O$ -基或 $R^1C(O)O$ -基, 其中 R^1 定义同上。

7. 农用或园艺用杀真菌剂, 其中包括已知具有杀真菌剂效果的, 权利要求 1 中所述的, 有效量的稠合杂环衍生物和稀释剂。

8. 防治真菌侵染农用或园艺用非真菌的光合植物的方法, 包括向植物施用有效量的已知具有杀真菌剂效果的, 权利要求 1 中所述的, 稠合杂环衍生物的步骤。

说明书

稠合杂环衍生物和含有上述衍生物的 农用或园艺用杀真菌剂

本发明涉及稠合杂环衍生物，以及含有上述衍生物作为活性成分的农用或园艺用杀真菌剂。本发明还涉及稠合杂环衍生物的制备方法。

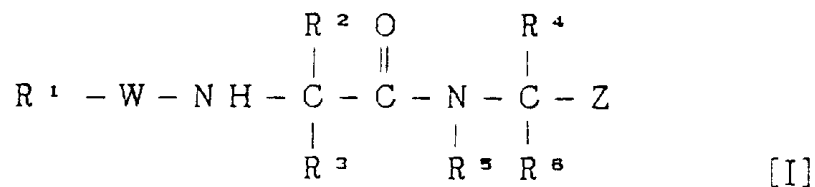
到目前为止，已经知道作为杀虫剂且也作为除草剂的一些氨基酸酰胺衍生物。例如，上述氨基酸酰胺衍生物包括 N - (叔 - 丁氧羰基) - L - 缬氨酸 - 4 - 甲氧苯基乙基酰胺 (日本专利申请首次公开号平 3-5,451)，N² - 苯氧羰基 - N¹ - [外消旋 - 1 - (4 - 氯苯基)乙基] - L - 异亮氨酸酰胺 (日本专利申请首次公开号平 3-153,657)，N - (异丙基 - 氧羰基) - L - 缬氨酸 - 4 - 甲氧苯基乙基酰胺 (日本专利申请首次公开号平 4-230,652)，N² - 苯氧羰基 - N¹ - [外消旋 - 1 - (4 - 氯苯基)乙基] - L - 环戊基甘氨酸 (日本专利申请首次公开号平 4-230,653)，N² - 仲 - 丁基氧羰基 - N¹ - [S (+) - 1 - 环己基乙基] - L - 缬氨酸酰胺 (日本专利申请首次公开号平 4-283,554)，{(D. L.) - 1 - [(3,4 - 二甲氧苯乙基)氨基甲酰基] - 2 - 丁基} 氨基甲酸苯甲酯 (日本专利申请首次公开号平 4-308,507)，N - (i - 丙基氧羰基) - L - 缬氨酸 - 二苯基甲基酰胺 (日本专利申请首次公开号平 4-338,372) 等等。

可是，这些常规的化合物，没有作为杀虫剂的足够的药效。另外，现有文件中没有公开具有稠合杂环如苯并咪唑环，苯并噻吩环，或等等的氨基酸酰胺衍生物。因此，氨基酸酰胺衍生物的运用是未知的。

本发明的目的是提供具有极好抗-真菌活性的新的稠合杂环衍生物。

本发明者合成了多种稠合杂环衍生物，并进行了与它们的真菌生理活性效果有关的大量研究。结果，我们发现根据本发明的化合物，在对植物生长无害的同时，存在广谱的抗真菌活性，特别是抗霜霉病和晚疫病。

根据本发明的第一个方面，本文提供了用式 [I] 表示的稠合杂环衍生物：

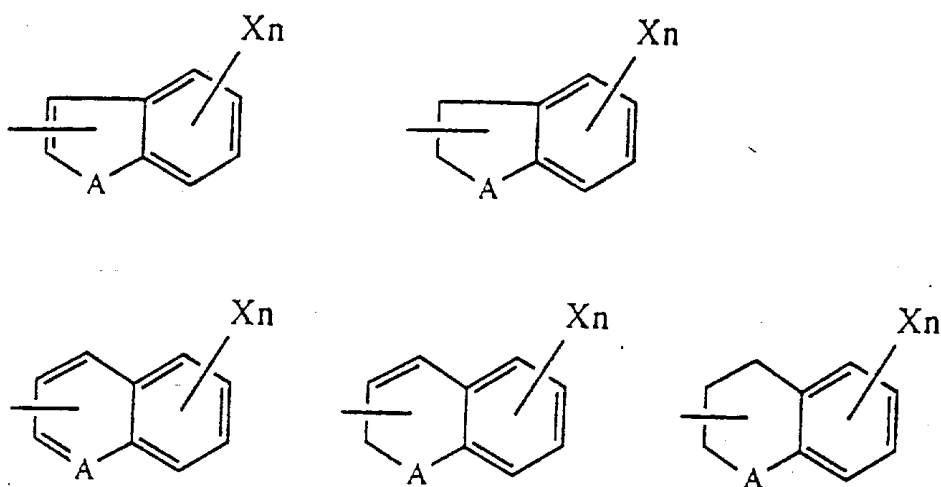


其中 R¹ 代表可选择地至少具有一个选自下列取代基的低级烷基，取代基包括卤原子，氰基，和甲氧基；链烯基；链炔基；可选择地至少具有一个甲基的环烷基；可选择地至少具有一个甲基的环烯基；可选择地至少具有一个甲基的环醚基；可选择地至少具有一个选自下列取代基的芳烷基，取代基包括甲基，甲氧基，和硝基；可选择地至少具有一个选自下列取代基的苯基，取代基包括卤原子，甲基，甲氧基，硝基，和甲氧羰基；二甲基氨基；或乙氧羰基；

R²，R³，R⁴，R⁵ 和 R⁶ 独立地代表氢原子，可选择地至少具有一个卤原子的低级烷基，环烷基，芳烷基，苯基，氰基，酰基，低级烷氧基，或低级烷氧羰基，

R² 可同 R³ 形成具有 3 至 6 碳原子烷基环，

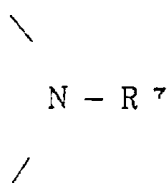
Z用下式表示：



其中X代表氢原子，卤原子，可选择地至少具有一个卤原子的烷基，链炔基，甲氧基，三氟甲氧基，羟基，甲氧羰基，甲基羰基氧基，氨基，二甲基氨基，硝基，甲硫基，甲基亚磺酰基，甲基磺酰基，苯基，乙酰基，甲酰基，或氰基；

n是1，2或3的整数；

A是O，S，N，或代表式：



其中R⁷代表氢原子，甲基，乙酰基，或苯甲酰基；和

W代表 -C(O)-, -SO₂ -, -NHC(O)-, -N(CH₃)C(O)-, -OC(O)-, -SC(O), -OC(S)-, 或 -SC(S)-。

根据本发明的第二个方面，本文提供了包含如上所述耦合杂环作

为活性成分的农用或园艺用杀真菌剂。

在本说明书中，采用的术语“低级”意为最多具有6碳原子。本文中采用的术语“烷基”意为具有1至15碳原子的直链或支链烷基，而不局限于甲基，乙基，正-丙基，异丙基，正-丁基，异丁基，仲-丁基，叔-丁基，正-戊基，1-甲基丁基，2-甲基丁基，3-甲基丁基，2,2-二甲基丙基，1,1-二甲基丙基，1-乙基丙基，正-己基，正-庚基，正-辛基，正-壬基，正-癸基，n-十一烷基，n-十二烷基，n-十三烷基，n-十四烷基，n-十五烷基，等等。

被至少一个选自下列卤原子，氟基，和甲氧基的取代基 可选择取代的低级烷基包括，例如，氯乙基，三氟乙基，1-氟乙基，1-氟-1-甲基乙基，1-甲氧-1-三氟甲基丁基，全氟-叔-丁基等等。

本文中采用的术语“卤素”意为氟原子，氯原子，溴原子，碘原子，等等。本文中采用的术语“链烯基”意为具有2至6碳原子的直链或支链链烯基，且不限定地包括，乙烯基，1-丙烯基，2-丙烯基，异丙烯基，1-丁烯基，2-丁烯基，3-丁烯基，1-甲基-1-丙烯基，2-甲基丙烯基，1-乙基乙烯基，2-戊烯基，2-己烯基，等等。本文中采用的术语“链炔基”意为具有2至6碳原子的直链或支链炔基，且包括，例如，乙炔基，丙炔基，丁炔基，1-甲基-2-丙炔基，2-戊炔基，2-己炔基等等。

本文中采用的术语“环烷基”意为具有3至8碳原子的环烷基，且不限定地包括，环丙基，环丁基，环戊基，环己基，环庚基，环辛基，等等。

可选择地至少具有一个甲基的环烷基包括，例如，1-甲基环丙基，2-甲基环丙基，1-甲基环丁基，2-甲基环丁基，1，2-二甲基环丁基，1-甲基环戊基，2-甲基环戊基，3-甲基环戊基，1，2-二甲基环戊基，1，2，3-三甲基环戊基，等等。

本文中采用的术语“环烯基”意为具有3至8碳原子的环烯基，且非限定地包括，1-环丙烯基，2-环丙烯基，1-环丁烯基，2-环丁烯基，1-环戊烯基，2-环戊烯基，3-环戊烯基，1-环己烯基，2-环己烯基，3-环己烯基，1-环庚烯基，2-环庚烯基，3-环庚烯基，4-环庚烯基，1-环辛基，2-环辛烯基，3-环辛烯基，4-环辛烯基，等等。

可选择地至少具有一个甲基的环烯基包括，例如，1-甲基-2-环戊烯基，2-甲基-1-环戊烯基，3-甲基-1-环戊烯基，3，4-二甲基-1-环戊烯基，1-甲基-2-环己烯基，4-甲基-1-环己烯基，1，2，5-三甲基-3-环己烯基，等等。

本文中采用的术语“芳烷基”意为具有7至10碳原子的芳烷基，且非限定地包括，苯甲基，苯乙基，等等。

可选择地至少具有一个选自下列基团之一的取代基的芳烷基，取代基包括甲基，甲氧基，和硝基，取代的芳烷基包括，例如4-甲基苯甲基， α -甲基苯甲基，4-甲氧苯甲基，4-硝基苯甲基，2，4-二甲基苯甲基，2-甲基-3-甲氧基-4-硝基苯甲基， α -甲基-4-甲基苯乙基等等。

本文中采用的术语“环醚基”意为具有2至6碳原子的环醚基，且包括，例如，环氧乙烷基，2-甲基环氧乙烷基，3-四氢呋喃基，2-四氢吡喃基等等。

可选择地至少具有一个甲基的环醚基包括例如，2-甲基环氧乙烷基，2-甲基-3-四氢呋喃基，2，4-二甲基-3-四氢呋喃基，2，4，5-三甲基-3-四氢呋喃基，等等。

酰基包括乙酰基，苯甲酰基，等等。

可选择地至少具有一个选自下列基团之一的取代基的苯基，取代基包括卤原子，甲基，甲氧基，硝基，和甲氧羰基，取代苯基包括例如2-氯苯基，3-甲基苯基，4-甲氧苯基，4-硝基苯基，4-甲氧羰基苯基，2-甲氧-4-硝基苯基，全氟苯基等等。

本发明优选的化合物包括式(I)表示的化合物，其中 R^1 代表具有2至6碳原子的直链或支链烷基，具有3碳原子的直链或支链链烯基，具有5至6碳原子的环烷基，或未取代苯基； R^2 代表氢原子； R^3 代表乙基，异丙基，或仲-丁基； R^4 代表氢原子，苯基，甲基，或乙基； R^5 代表氢原子或甲基； R^6 代表氢原子； W 用 $-OC(O)-$ 表示； Z 代表取代的杂环基，其中包括苯并呋喃基，苯并噻吩基，吲哚基，2,3-二氢苯并呋喃基，上述杂环基可以具有一或两个(相同或不同)的取代基，如氢原子，氟原子，氯原子，硝基，氰基，或甲基；且氨基酸是L-异构体。

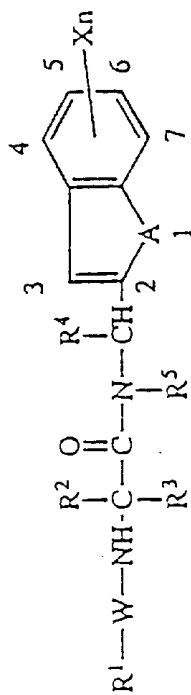
本发明更为优选的化合物包括式(I)表示的化合物，其中 R^1 代表异丙基，叔-丁基，仲-丁基，环戊基，异丙烯基，或苯基； R^2 代表氢原子； R^3 代表乙基，异丙基，或仲-丁基； R^4 代表甲基； R^5 代表氢原子； R^6 代表氢原子； W 代表 $-OC(O)-$ ； Z 代表包括苯并呋喃基的取代杂环基，其中杂环基具有的一或二个取代基包括氟原子，氯原子，硝基，氰基，和甲基；且氨基酸是L-异构体。

根据本发明式(I)表示的化合物，因为存在两个或多个手性中心，可存在立体异构体。本发明认真研究上述所有立体异构体，包括非对映体，对映体，和它们的混合物，其混合物可通过适合的方法分离。

另外，用式(I)表示的根据本发明的化合物列于表1至7。可是，应当明白本发明不限于这些化合物。在以后的描述中参照表1至7中给出的化合物号。

在表1至7中，1、2和3号化合物；68，69，和303号化合物；70，71，和296号化合物；129，130，和131号化合物；136，137，和138号化合物；108，375和109号化合物；382,23，和24号化合物；376，163和164号化合物；和377，378，和379号化合物是非对映体的混合物，且也可是单独的非对映体。另外，16和17号化合物；97和98号化合物；102和103号化合物；115和327号化合物；132和133号化合物；227和362号化合物；228和364号化合物；230和365号化合物；233和363号化合物；336和337号化合物；405和406号化合物；和423和424号化合物是非对映体的混合物，且也可分别是单个的非对映体。化合物161和162是单独的非对映体。

表 1
表 1-1



化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折光率 (n _D ²⁰)
1	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	92-96
2	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	88-90
3	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	124-126
4	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,7-Cl ₂	O	L	123-125
5	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCH ₃	O	L	94-96
6	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	O	L	103-106
7	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-Cl	O	L	53-54
8	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NH ₂	O	L	71-72
9	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-N(CH ₃) ₂	O	L	128-132
10	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CO ₂ CH ₃	O	L	135-137
11	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-Cl	O	L	58-59
12	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-Cl	O	L	94-97
13	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	DL	154-159

表 1-2

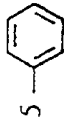
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射率 (n _D ²⁰)
14	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-CH ₃	O	L	120-125
15	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-CH ₃	O	L	60-65
16	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	O	L	124-128
17	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	O	L	123-124
18	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-CH ₃	O	L	76-80
19	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCF ₃	O	L	65-70
20	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-SCH ₃	O	L	103-108
21	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-SOCH ₃	O	L	80-83
22	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-SO ₂ CH ₃	O	L	80-82
23	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	115-116
24	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	173-175
25	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	DL	152-158
26	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	D	118-122
27	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-C ₂ H ₅	O	L	119-122
28	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5- 	O	L	98-101
29	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,6-Cl ₂	O	L	68-70

表 1-3


化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	Λ	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
30	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃	0	L	54-55
31	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃ ,5-Cl	0	L	134-136
32	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-Cl	0	L	53-56
33	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-CH ₃ ,5-Cl	0	L	120-127
34	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CHO	0	L	
35	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-C≡CH	0	L	
36	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₂ F	0	L	
37	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-COCH ₃	0	L	
38	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCOCH ₃	0	L	
39	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OH	0	L	
40	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-n-C ₅ H ₁₁	0	L	1.5114
41	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-n-C ₄ H ₉	0	L	
42	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3- 	0	L	
43	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3,5-Cl ₂	0	L	
44	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-Cl,5-NO ₂	0	L	
45	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-Cl,5-NO ₂	0	L	

表 1-4

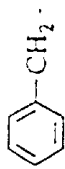
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	Λ	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
46	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂ ,6-Cl	0	L	
47	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂ ,7-Cl	0	L	
48	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃ ,5-NO ₂	0	L	
49	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-CH ₃ ,5-NO ₂	0	L	
50	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂ ,6-CH ₃	0	L	
51	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂ ,7-CH ₃	0	L	
52	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,7-(NO ₂) ₂	0	L	
53	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,6-(CN) ₂	0	L	
54	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,6,7-Cl ₃	0	L	
55	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	158-162
56	CH ₂ =CHCH ₂	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	150-155
57		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	165-170
58	n-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	162-168
59	n-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	156-160
60	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	158-161
61	n-C ₅ H ₁₁	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	141-145

表 1-5




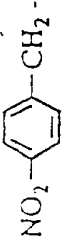
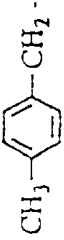
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折光率 (n _D ²⁰)
62	n-C ₆ H ₁₃	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	115-118
63	ClCH ₂ CH ₂	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	177-183
64	Cl ₃ CCH ₂	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	130-133
65	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	149-153
66	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	151-153
67		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	190-196
68		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	175-179
69		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	177-178
70	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	167-169
71	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	184-186
72	CH ₂ =C(CH ₃)-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	166-170
73	CH ₂ =CH-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	176-181
74		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	131-135
75		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	173-178

表 1-6





化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折光率 (n _D ²⁰)
76	s-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	153-158
77	CH≡CCH ₂ -	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	178-180
78	CF ₃ CH ₂ -	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	208-209
79	C ₂ H ₅ (CH ₃) ₂ C-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	53-55
80		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	170-175
81		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
82		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
83	(C ₂ H ₅) ₂ CH	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	149-151
84	(CF ₃) ₃ C	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
85	CF ₃ (CH ₃) ₂ C	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	63-66
86	ClCH ₂ -	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
87	Cl(CH ₃)CH-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	167-169
88		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	

表 1-7

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	Λ	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
89		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	
90		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	147-152
91		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	163-166
92		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	174-179
93		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	176-180
94		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	198-203
95		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	
96		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	148-152
97		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	0	L	195-199
98		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	0	L	

表 1-8

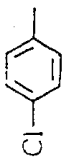
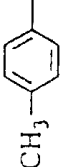





化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	Λ	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
99		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	0	L	184-188
100		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	0	L	174-179
101	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	190-191
102	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	191-193
103	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	
104		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	181-184
105		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	151-155
106		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	188-190
107	s-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	181-183
108	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	0	L	189-195
109	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	0	L	187-188
110		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	0	L	196-201
111		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	0	L	193-198

表1-9

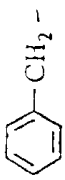
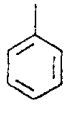

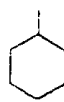
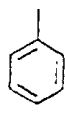
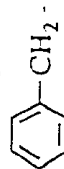
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射率 (n _D ²⁰)
112	s-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	178-183
113		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	
114	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	155-160
115	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	164-166
116		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	169-173
117		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	165-170
118		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	175-178
119	s-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	130-133
120	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	122-125
121		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	173-177
122	t-C ₄ H ₉	H	H	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	-	103-104
123	t-C ₄ H ₉	H	CH ₃	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	95-99
124	t-C ₄ H ₉	H		CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	130-136

表 I-10

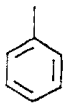
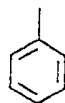

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折光率 (n _D ²⁰)
125	t-C ₄ H ₉	H	s-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	136-140
126	t-C ₄ H ₉		-(CH ₂) ₄	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	-	193-195
127	t-C ₄ H ₉		-(CH ₂) ₅	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	-	219-222
128	t-C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	106-112
129	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	56-58
130	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	125-126
131	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	142-144
132	t-C ₄ H ₉	H		CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	71-75
133	t-C ₄ H ₉	H		CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	130-132
134	t-C ₄ H ₉	H	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	105-111
135	t-C ₄ H ₉	H	n-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	93-98
136	t-C ₄ H ₉	H	t-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	124-129
137	t-C ₄ H ₉	H	t-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	164-165
138	t-C ₄ H ₉	H	t-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	137-139
139	t-C ₄ H ₉	H		CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	DL	176-178

表 1-11


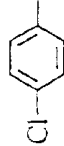
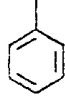
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率(n _D ²⁰)
140	t-C ₄ H ₉	CH ₃	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	DL	169-173
141	t-C ₄ H ₉		(CH ₂) ₂	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	-	59-61
142	i-C ₄ H ₉	H	CF ₃ CH- CH ₃	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	DL	159-163
143		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	CO	5-Cl	O	L	206-209
144	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	CO	5-Cl	O	L	219-222
145	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	CO	5-Cl	O	L	74-75
146	CF ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	CO	5-Cl	O	L	132-138
147	C ₂ H ₅ OC(O)	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	CO	5-Cl	O	L	75-76
148		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	SO ₂	5-Cl	O	L	149-153
149	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	SO ₂	5-Cl	O	L	172-177
150	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	NC(O) CH ₃	5-Cl	O	L	146-151
151		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	NC(O) CH ₃	5-Cl	O	L	未测定
152	(CH ₃) ₂ N-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	SO ₂	5-Cl	O	L	126-130

表 1-12

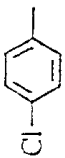
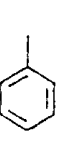
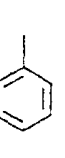
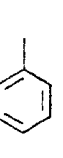
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
153		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	NHC(O)	5-Cl	O	L	255-258
154	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	SC(O)	5-Cl	O	L	163-169
155		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	SC(O)	5-Cl	O	L	181-186
156		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(S)	5-Cl	O	L	64-68
157	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	54-57
158	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	S	L	120-121
159	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	138-140
160	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃ , 5-Cl	S	L	150-152
161	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	179-180
162	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	204-206
163	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	186-188
164	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	203-205
165		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	178-180
165	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-Cl	S	L	69-71

表 1-13

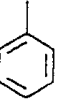
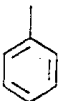
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
167	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-Cl	S	L	1.5306
168	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-Cl	S	L	1.5295
169	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	H	OC(O)	5-Cl	O	L	109-115
170	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇		H	OC(O)	5-Cl	O	L	126-132
171	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	5-Cl	O	L	135-138
172	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	O	L	135-141
173	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	OC(O)	5-Cl	O	L	
174	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	i-C ₃ H ₇	OC(O)	5-Cl	O	L	
175	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	S	L	
176	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	
177	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	182-184
178		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	184-185
179	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	H	S	L	129-130
180	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	S	L	50-54
181	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	S	L	149-156

表 1-14

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
182	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Br	S	L	139-145
183	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	S	L	
184	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	S	L	
185	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCH ₃	S	L	
186	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CF ₃	S	L	
187	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-CH ₃	S	L	
188	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-CH ₃	S	L	90-94
189	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4,7-Cl ₂	S	L	
190	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,7-Cl ₂	S	L	
191	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-OCH ₃	S	L	
192	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	S	L	135-139
193	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	S	L	181-184
194	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Br	S	L	170-173
195	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	S	L	
196	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	S	L	
197	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCH ₃	S	L	

表 1-15

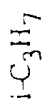
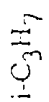
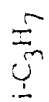
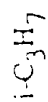
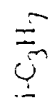
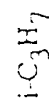
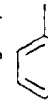

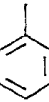


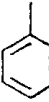

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	Λ	氨基酸 异构体	熔点(C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
198		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CF ₃	S	L	
199		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-CH ₃	S	L	
200		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-CH ₃	S	L	170-175
201		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4,7-Cl ₂	S	L	
202		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,7-Cl ₂	S	L	
203		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-OCH ₃	S	L	
204		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	S	L	174-180
205		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	S	L	194-198
206		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Br	S	L	158-163
207		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	S	L	
208		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	S	L	
209		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCH ₃	S	L	
210		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CF ₃	S	L	

表 1-16









化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
211		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-CH ₃	S	L	
212		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-CH ₃	S	L	
213		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4,7-Cl ₂	S	L	
214		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,7-Cl ₂	S	L	
215		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-OCH ₃	S	L	
216		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-Cl	S	L	
217		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-Cl	S	L	
218		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-Cl	S	L	
219	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-Cl	S	L	
220	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-Cl	S	L	
221	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-Cl	S	L	
222	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	O	L	140-145

表 1-17



化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
223		H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	O	L	
224	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	S	L	
225		H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	S	L	
226	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
227	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	69-70
228	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	NH	L	115-120
229	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	NH	L	
230	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCH ₃	NH	L	50-56
231	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	NH	L	
232	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	NH	L	
233	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	161-166
234	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	NCH ₃	L	175-178
235	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	NCH ₃	L	152-155
236	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCH ₃	NCH ₃	L	
237	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	NCH ₃	L	

表 1-18

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	Λ	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
238	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	NCH ₃	L	
239	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃	NCH ₃	L	107-110
240	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃	NH	L	155-156
241	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-OCH ₃	O	L	
242	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-OCH ₃	O	L	
243	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CF ₃	NH	L	
244	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CF ₃	NCH ₃	L	
245	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-Cl	NH	L	
246	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-Cl	NH	L	
247	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-Cl	NH	L	
248	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-Cl	NH	L	
249	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-CH ₃	NH	L	
250	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	NH	L	
251	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-CH ₃	NH	L	
252	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-CH ₃	NH	L	
253	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-OCH ₃	NH	L	

表 1-19

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	Λ	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 (n _D ²⁰)
254	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-OCH ₃	NH	L	
255	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-OCH ₃	NH	L	
256	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-CN	NH	L	
257	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-CN	NH	L	
258	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-CN	NH	L	
259	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4-NO ₂	NH	L	
260	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-NO ₂	NH	L	
261	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	7-NO ₂	NH	L	
262	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3-CH ₃ ,5-Cl	NH	L	
263	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3,5-(CH ₃) ₂	NH	L	
264	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	3,5-Cl ₂	NH	L	
265	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4,7-Cl ₂	NH	L	
266	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5,7-Cl ₂	NH	L	
267	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	4,6-Cl ₂	NH	L	
268	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	
269	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	NH	L	

表 1-20

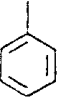
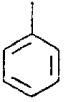
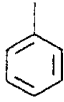
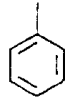
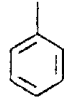
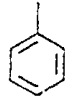
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³ _*	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折率 (n _D ²⁰)
270	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	NH	L	
271	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCH ₃	NH	L	
272	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	NH	L	
273	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	NH	L	
274	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	
275		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	NCH ₃	L	
276		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	NCH ₃	L	
277		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃ O	NCH ₃	L	
278		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	NCH ₃	L	
279		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	NCH ₃	L	
280		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	
281	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	
282	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	

表 1-21

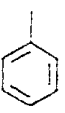
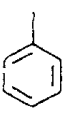
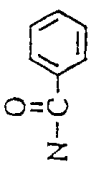
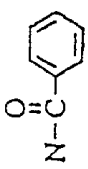
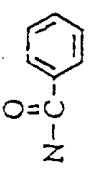
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X ⁿ	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折率 (n _D ²⁰)
283	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	NH	L	
284	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	
285	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	NH	L	
286	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	
287		H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	NH	L	
288		H	i-C ₃ H ₇	CN	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	
289	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NC(O)CH ₃	L	
290	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NC(O)CH ₃	L	
291	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H		L	
292	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H		L	
293	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl		L	
294	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	NC(O)CH ₃	L	

表 1-22


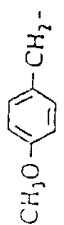





化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
295		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	211-216
296	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
297		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
298		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
299		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
300		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
301		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	
302	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	
303		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	221-233
304	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	5-Cl	O	L	177-180
305	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	
306	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	
307	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	H	O	L	110-112

表 1-23

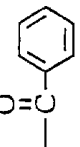


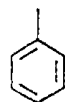
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
308	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	C(O)CH ₃	OC(O)	5-Cl	O	L	
309	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃		OC(O)	5-CN	O	L	
310	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	C(O)OCH ₃	OC(O)	5-NO ₂	O	L	
311	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	C(O)OC ₂ H ₅	OC(O)	5-Cl	O	L	
312	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	200-203
313	CH ₂ =C(CH ₃)-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	152-155
314	CH ₃ (CH ₂) ₂ - 	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	116-121
315	CH ₃ (CH ₂) ₃ - 	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	114-119
316	CH ₂ =C(CH ₃)-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	159-162
317	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	H	OC(O)	5-Cl	O	L	169-173
318		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	SC(S)	5-Cl	O	L	74-79
319	CH ₂ =C(CH ₃)-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	O	L	187-189

表 1-24

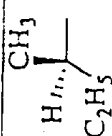
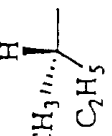



化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	A	氨基酸 异构体	熔点(C) 或折射率 (n _D ²⁰)
320		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	155-161
321		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	170-175
322	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	156-157
323		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	170-175
324		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	169-174
325	s-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	114-117
326	CH ₂ =C(CH ₃)-	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	146-148
327	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	179-182
328		H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	5-Cl	O	L	177-179
329	NCC(CH ₃) ₂	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	122-127
330	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	H	OC(O)	5-Cl	O	L	95-99
331	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	H	OC(O)	5-Cl	O	L	155-160

表 1-25

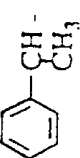




化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射率 (n _D ²⁰)
332		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	154-157
333	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-C ₅ H ₁₁	O	L	98-100
334	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-C ₉ H ₁₉	O	L	55-58
335	CH ₃ OCH ₂ -CH- CH ₃	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	125-128
336		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	192-195
337		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	195-197
338	i-C ₃ H ₇	H	s-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	159-163
339		H	s-C ₄ H ₉	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	170-176
340	i-C ₃ H ₇	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	151-154
341		H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	158-160
342	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	OC(O)	5-Cl	O	L	1.5280
343	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	OC(O)	5-Cl	O	L	
344	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-Cl	S	L	61-64

表 I-26

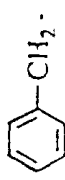
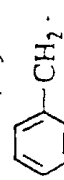
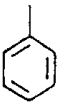
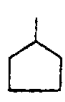
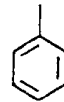
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
345	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	H	S	L	184-186
346		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	160-161
347	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	143-144
348	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	188-189
349	s-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	161-162
350		H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	196-197
351	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	NH	L	79-81
352	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	NH	L	152-154
353		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	NH	L	162-166
354		H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	195-198
355		H	i-C ₃ H ₇	H	H	OC(O)	3-CH ₃	S	L	204-207
356	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	NCH ₃	L	73-76
357	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	NCH ₃	L	163-166
358	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-OCH ₃	S	L	146-150

表 1-27



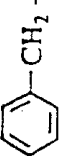
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
359	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-Cl	S	L	171-176
360	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-OCH ₃	S	L	184-185
361		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	NCH ₃	L	153-156
362	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	70-72
363	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	211-213
364	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	NH	L	192-196
365	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-OCH ₃	NH	L	75-79
366	s-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	S	L	145-149
367		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	S	L	179-184
368	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	NCH ₃	L	121-124
369		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	NCH ₃	L	202-204
370	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	6-F	S	L	160-170
371	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	NH	L	
372	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	NH	L	
373	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	OC(O)	5-CN	NH	L	

表 1-28

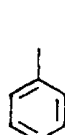
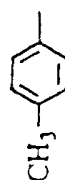
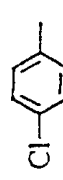
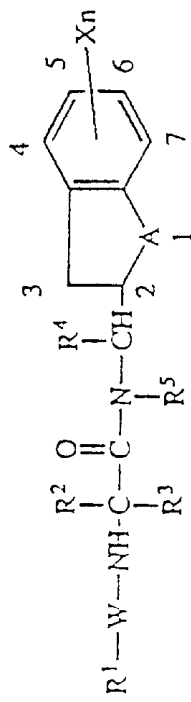
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
374	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	OCH ₃	OC(O)	5-CN	NH	L	
375	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	236-239
376	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	163-164
377	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	117-119
378	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	128-130
379	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	164-165
380	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	O	L	89-94
381	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Br	O	L	120-124
382	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	135-139
383	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CF ₃	O	L	68-73
384		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	188-190
385		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	170-175
386		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	185-189

表 2

表 2-1




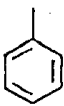

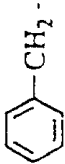
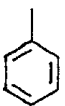
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰) ¹
387	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	144-148
388	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	159-164
389	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CH ₃	O	L	未测定
390	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	
391	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	
392		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	
393	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	58-60
394	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	
395	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	O	L	132-135
396	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-NO ₂	O	L	

表 2-2

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	Xn	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
397		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	未测定
398	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-CN	0	L	未测定
399		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-Cl	0	L	134-139
400		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	0	L	126-130
401	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	0	L	160-163
402		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	0	L	未测定
403	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	5-F	0	L	<30
404	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	99-103

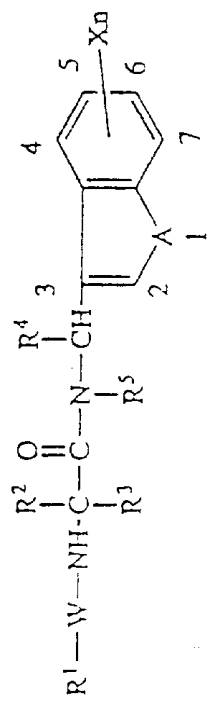
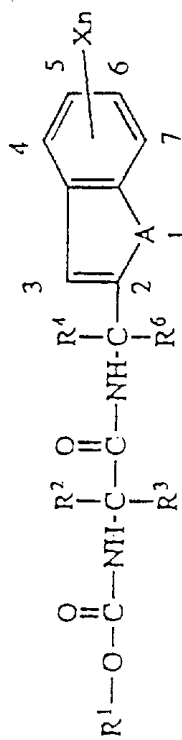


表 3

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
405	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	83-86
406	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	89-94
407	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	N-CH ₃	L	128-130
408	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	
409	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	S	L	

表 4

表 4-1



化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折率 (n _D ²⁰)
410	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	O	L	
411	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	O	L	
412		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	O	L	
413	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	5-Cl	O	L	44-46
414	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	5-Cl	O	L	68-69
415		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	5-Cl	O	L	
416	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	5-NO ₂	O	L	
417	t-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	S	L	162-165
418	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	S	L	
419	t-C ₄ H ₉	CH ₃	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	O	DL	

表 4-2

化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	X _n	Λ	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (m _D ²⁰)
420	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	H	O	L	
421	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	O	L	
422	sec-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	5-Cl	O	L	

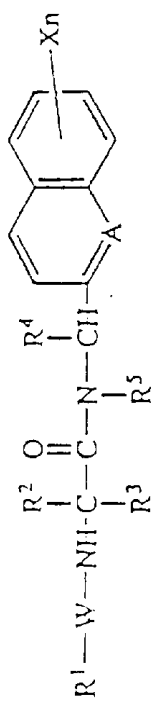


表 5

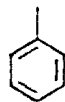
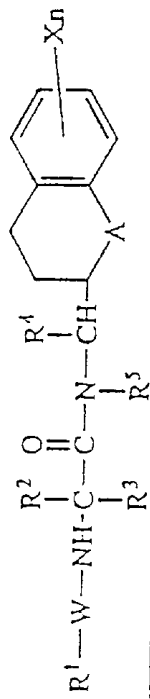
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (m _D ²⁰)
423	<i>i</i> -C ₄ H ₉	H	<i>i</i> -C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	N	L	178-182
424	<i>i</i> -C ₄ H ₉	H	<i>i</i> -C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	N	L	124-127
425	<i>i</i> -C ₃ H ₇	H	<i>i</i> -C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	N	L	186-190
426		H	<i>i</i> -C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	N	L	151-154

表 6



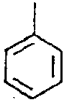
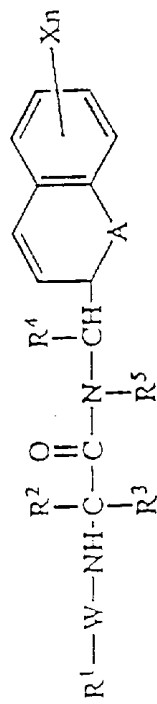
化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X ⁿ	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
427	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	未测定
428	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NCH ₃	L	160-162
429	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	
430		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	NH	L	

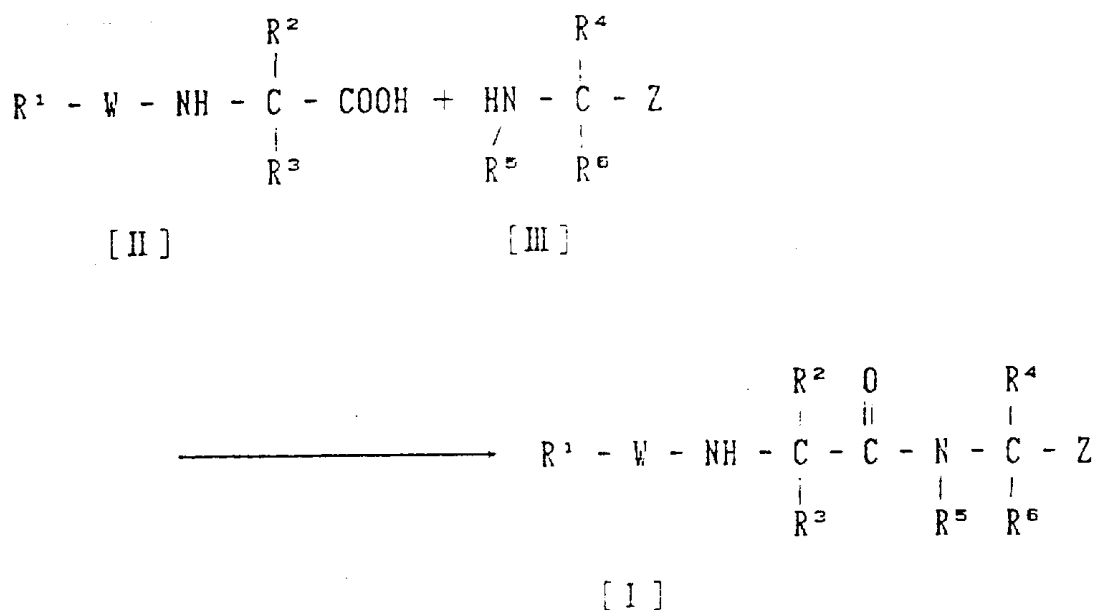
表 7



化合物 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	X _n	A	氨基酸 异构体	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
431	i-C ₄ H ₉	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	
432	i-C ₃ H ₇	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	
433		H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	OC(O)	H	O	L	未测定

根据本发明用式 (I) 表示的化合物可以下述方式制备。

制备方法 A



其中 R¹ , R² , R³ , R⁴ , R⁵ , R⁶ , W 和 Z 和上述描述的相同。

根据本发明用式 (I) 表示的化合物, 是通过用式 (II) 表示的氨基酸衍生物或其中羧基是活化的氨基酸衍生物, 在可能需要的碱和 / 或催化剂存在下, 与用式 (III) 表示的胺反应而制备。

在本反应中, 提到的是有活化羧基的用式 [II] 表示的氨基酸衍生物, 例如, 酰基卤, 如酰基氯, 从两个分子的用式 [II] 表示的氨基酸衍生物衍生的酸酐, 从用式 [II] 表示的氨基酸和其它酸的衍生物或 O - 烷基碳酸衍生的混合酸酐, 和活化酯如对 - 硝基苯酯, 2 - 四氢吡喃酯, 和 2 - 吡啶基酯等等, 这些化合物可根据常规的方法合

成 [例如, 见 Methoden der Organischen Chemie Vol 15. No2. 第 2 页; Georg Thieme Verlag stuttgart: 1974; Chemische Berichte, Vol.38,605 页 (1905); Journal of the American Chemical Society, Vol.74. 676 页 (1952)和 Journal of the American Chemical society, Vol. 86, 1839 页 (1964)]。

另外, 还可能用如 N, N' - 二环己基碳化二亚胺, 羰基二咪唑等等缩合剂进行本反应。

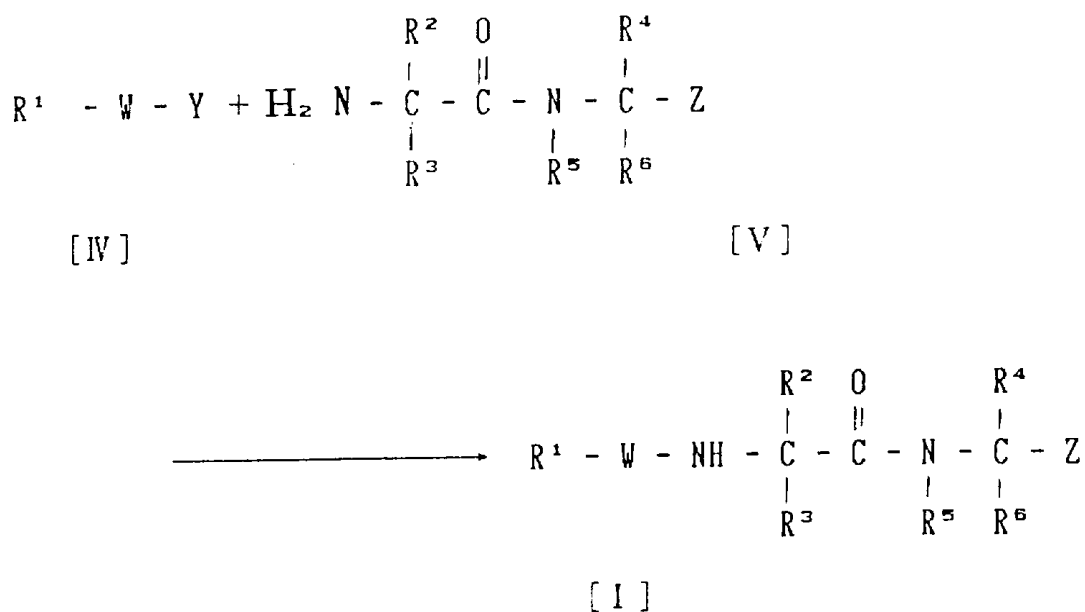
本反应可在常规的溶剂中进行: 该溶剂可以是不妨害反应的任何溶剂, 例如, 烃如戊烷, 己烷, 庚烷, 环己烷, 石油醚, 轻石油, 苯, 甲苯, 二甲苯等等, 卤代烃如二氯甲烷, 二氯乙烷, 氯仿, 四氯化碳, 氯代苯, 二氯苯等等, 醚如乙醚, 异丙基醚, 乙二醇二甲基醚, 四氢呋喃, 二噁烷等等, 酮如丙酮, 甲基乙基酮, 甲基异丙基酮, 甲基异丁基酮等等, 酯如乙酸甲酯, 乙酸乙酯, 等等, 腈如乙腈, 丙腈, 苯基腈等, 非质子传递溶剂如二甲基亚砷, 二甲基甲酰胺, 环丁砷等等, 结合选自上述溶剂的混合溶剂。

碱可以是在此类反应中通常使用的任何类型的碱。如, 在此提及的碱金属氢氧化物如氢氧化钠, 氢氧化钾等等, 碱土金属氢氧化物如, 氢氧化钙等等, 碱金属碳酸盐, 如碳酸钾等。有机碱如三乙胺, 三甲胺, 二甲基苯胺, 吡啶, N-甲基哌啶, 1, 5 - 二氮杂二环 [4. 3. 0] 壬 - 5 - 烯 (DBN), 1, 8 - 二氮杂二环 [5. 4. 0] 十一 - 7 - 烯 (DBU) 等等, 叔胺如三乙胺, 吡啶, N - 甲基哌啶等等。

本文中叙及的催化剂为 4 - 二甲基氨基吡啶, 1 - 羟苯并三唑, 二甲基甲酰胺等等。本反应在 - 75 °C 至 100 °C 优选在 - 60 °C 至 40 °C 下进行。反应时间优选为 1 至 20 小时。

另外，作为起始物的用式 [II] 表示的化合物是已知的，且可通过常规方法合成 [例如，见 Methoden der Organischen Chemie, vol. 15, No. 2, 从 2 页起; Georg Thieme Verlag stuttgart: 1974; Chemistry of Amino Acids, Vol. 2, 891 页; John Wiley & Sons, N. Y. (1964); 和 Journal of the American Chemical Society, Vol. 79, 4686 页 (1957)]。可考虑化合物 [III] 的多种制备方法，如公开在日本专利申请，首次公开号昭 63-146876 和 Synthesis, 24 页，1978 中的方法。大多数式 [III] 化合物是新化合物。

制备方法 B



其中 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , W 和 Z 代表上述相同含义，且 Y 代表卤原子， $\text{R}^1 \text{OC}(\text{O})\text{O}-$ 基或 $\text{R}^1 \text{C}(\text{O})\text{O}-$ 基。

用式 (I) 表示的本发明化合物，可通过在需要的碱存在下，用式 [IV] 表示的化合物与用式 [V] 表示的胺，胺衍生物的盐与无机

酸如盐酸等，或胺衍生物的盐与有机酸如甲苯磺酸盐等等反应的方式制备。

本发明可在常规的溶剂下进行：该溶剂可以是不妨害反应的任何溶剂，例如，烃如戊烷，己烷，庚烷，环己烷，石油醚，轻石油，苯，甲苯，二甲苯等等，卤代烃如二氯甲烷，二氯乙烷，氯仿，四氯化碳，氯代苯，二氯苯等等，醚如乙醚，二异丙基醚，乙二醇二甲基醚，四氢呋喃，二噁烷等等，酮如丙酮，甲基乙基酮，甲基异丙基酮，甲基异丁基酮等，酯如乙酸甲酯，乙酸乙酯等，腈如乙腈，丙腈，苯基腈等，非质子传递溶剂如二甲基亚砷，二甲基甲酰胺，环丁砷等等，水，结合选自上述溶剂的混合溶剂。

碱可以是在此类反应中通常使用的任何类型的碱。如，在此提及的碱金属氢氧化物，如氢氧化钠，氢氧化钾等等。碱土金属氢氧化物如氢氧化钙等等，碱金属碳酸盐，如碳酸钾等，有机碱如三乙胺，三甲胺，二甲基苯胺，N-甲基吗啉，吡啶，N-甲基哌啶，1,5-二氮杂二环[4.3.0]壬-5-烯（DBN），1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一-7-烯（DBU）等等，且优选的叔胺如三乙胺，吡啶，N-甲基哌啶等等。本反应在-20℃至100℃的温度下，优选0℃至40℃下进行。反应时间优选为30分钟至20小时。

例如，采用除去氨基酸的保护基的常规方法如催化还原反应，通过制备方法A的工艺，或通过用酸如氢氟酸，磺酸，氢氯酸，氢溴酸，甲酸水溶液等等处理合成化合物[I]的氨基甲酸酯，可以制造用式[V]表示的化合物作为起始产物的新化合物。

下述，为耦合杂环衍生物的合成实施例，其中用式[III]和[V]表示的本发明化合物的新中间体，用参考实施例提供。

[参考实施例 1]

1 - [2 - (5 - 硝基苯并咪喃基)] 乙基胺 (中间体化合物 1) 的合成

将 3.7 g 乙酸铵和 2.1 g 氰基氢硼化钠加入到含有 10g 2 - (5 - 硝基苯并咪喃基) 甲基酮的 500ml 甲醇溶液中, 在室温下搅拌所得混合物 3.0 小时。然后在减压条件下浓缩反应混合物, 并用浓盐酸酸化。然后再另外加入 300ml 乙醚和 200ml 水。随后, 用 5% 氢氧化钠水溶液使所得水层碱化, 用 300ml 乙醚提取溶液, 再用水洗涤。用无水硫酸钠充分干燥有机层, 减压条件下除去乙醚得到 4.0g 所需产物的亮棕色颗粒状结晶 (熔点: 53 - 59 °C)。

[参考实施例 2]

1 - (6 - 氯 - 2 - 苯并 [b] 噻吩基) 乙基胺 (中间体 2 号化合物) 的制备

将 2.2g 盐酸 O - 甲基羟胺和 1.3g 乙酸钾加入到含有 2.8g 2 - 乙酰基 - 6 - 氯苯并 [b] 噻吩的 50 ml 甲醇中, 在回流条件下搅拌所得混合物 1 小时。过滤掉不溶产物, 除去甲醇。随后, 用乙酸乙酯提取剩余物, 依次用 5% 盐酸, 5% 碳酸氢钠水溶液, 和水洗涤, 并用无水硫酸镁干燥, 并浓缩。

随后, 将所得的 2.7g 粗 6 - 氯 - 2 - (1 - 甲氧亚氨基乙基) 苯并 [b] 噻吩溶于 10 ml 二甲氧基乙烷, 在室温下将所得溶液滴加到 0.85g 氢硼化钠的 20 ml 二甲氧基乙烷的悬浮液中。在相同温度下剧烈搅拌 5 分钟后, 在室温下滴加含有 4.26g 三氟化硼·乙醚络合物的 5 ml 二甲氧基乙烷溶液。在相同温度下搅拌 30 分钟后, 在回流条

件下再搅拌另外的 2 小时。然后使混合物冷却至室温，再加入 10% 盐酸，调节混合物至 PH 3 - 4。浓缩二甲氧乙烷层并与水层合并。用碳酸钠使 PH 升至 7 - 8。然后用二氯甲烷进行提取，并用水洗涤二氯甲烷层，用无水硫酸镁充分干燥，通过 FLORISIL® 过滤，并浓缩得到 0.35g 所需产物的透明粘液（折射系数 $n_D^{20} = 1.5973$ ）。

通过参考实施例 1 和 2 处理得到的，用式 [III] 表示的中间体化合物的具体例子示于表 8。

[参考实施例 3]

1 - [2 - (5 - 氟基 - 2, 3 - 二氢苯并呋喃基)] 乙基胺
(中间体化合物 21 号) 的合成

将 4.0g 乙酸铵和 0.24g 氟基氢硼化钠加入到含有 1.0g 2 - (5 - 氟基 - 2, 3 - 二氢苯并呋喃基) 甲基酮 (根据公开在 Org. Prep. Proced. Int., 4, 265 (1972) 的方法制备) 的 50 ml 甲醇溶液中，在室温下搅拌所得混合物 30 小时。然后在减压下浓缩反应混合物，用浓盐酸酸化。然后再另外加入 100ml 乙醚和 50 ml 水。随后，用氢氧化钠水溶液使所得水层碱化，并用 200 ml 乙醚提取。用水洗涤有机层，并用无水硫酸镁充分干燥。然后减压下除去乙醚，得到 0.6g 所需产物，亮黄色油状物质（折射系数 $n_D^{20} = 1.5719$ ）。

通过参考实施例 3 处理得到的，用式 [III] 表示的中间体化合物的具体例子示于表 9。

[参考实施例 4]

1 - [2 - (5 - 氟苯并呋喃基)] 乙基 - N - 甲胺 (中间体化合物 25 号) 的合成

伴随搅拌，将 1.4g 无水盐酸甲胺加入到 10ml 20% 甲胺的甲醇

溶液中，接着以小份在其中加入 0.8g 氰基氢硼化钠。对所得溶液，在室温下，加入 2.8g 的 2 - (5 - 氯苯并咪喃基) 乙基酮，并搅拌混合物 20 小时。然后用 10% 盐酸酸化反应混合物，并在减压下除去甲醇，用氯仿洗涤所剩水溶液，并用氢氧化钠水溶液使其碱化。用 200ml 氯仿提取溶液，用水洗涤，并用无水硫酸镁充分干燥。随后在减压下除去氯仿，得到 1.9g 所需产物，为亮黄色油状物 (折射率 $n_D^{20} = 1.5681$)。

[参考实施例 5]

盐酸化 $N^1 - [1 - (5 - 硝基 - 2 - 苯并咪喃基) 乙基] - L -$ 缬氨酸 (中间体化合物 26 号) 的合成

在室温下，将 5.0g $N^2 -$ 叔 - 丁氧羰基 - $N^1 - [1 - (5 - 硝基 - 2 - 苯并咪喃基) 乙基] - L -$ 缬氨酸溶于 100ml 四氢呋喃中，并通入氯化氢气 1 小时，然后减压下浓缩反应混合物，用丙酮洗涤所得剩余粗结晶，得到 3.6g 所需产物 (熔点：211-216°C)。

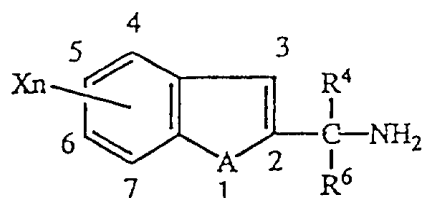
[参考实施例 6]

$N^1 - [1 - (2 - 苯并 [b] 噻吩基) 乙基] - L -$ 缬氨酸 (中间体化合物 27 号) 的合成

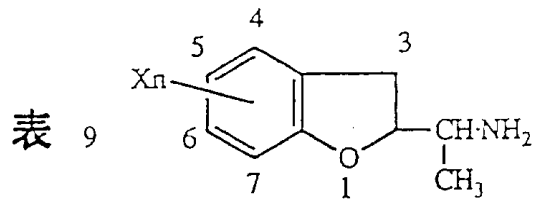
在室温下，将 11.3g 的 $N^2 -$ 叔 - 丁氧羰基 - $N^1 - [1 - (2 - 苯并 [b] 噻吩基) 乙基] - L -$ 缬氨酸溶于 150ml 乙酸乙酯中，并在所得溶液中加入 20ml 6N 盐酸。在室温下搅拌过夜后，用水冷却，加入饱和碳酸氢钠溶液，使溶液的 PH 调至 7 - 8。用水洗涤乙酸乙酯层。用无水硫酸镁充分干燥，浓缩获得粗产物。粗产物在 FLORISIL® 柱上提纯得到 6.7g 的所需产物，为白色固体物质 (熔点：70-71°C)。

通过参考实施例 5 和 6 处理得到的式 [V] 中间体的具体例子示于表 10。

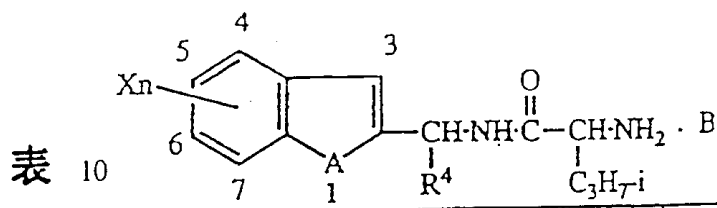
表 8



中间体 化合物 No.	Xn	R ⁴	R ⁶	A	熔点(°C) 或折射 率 (n _D ²⁰)
3	6-F	CH ₃	H	S	
4	6-CH ₃	CH ₃	H	S	
5	7-Cl	CH ₃	H	O	1.5866
6	6-Cl	CH ₃	H	O	1.5780
7	4-Cl	CH ₃	H	O	1.5861
8	7-CH ₃	CH ₃	H	O	1.5649
9	5-CH ₃	CH ₃	H	O	1.5671
10	4-CH ₃	CH ₃	H	O	1.5698
11	5-F	CH ₃	H	O	1.5750
12	5-CO ₂ CH ₃	CH ₃	H	O	1.5840
13	5-OCF ₃	CH ₃	H	O	未测定
14	5-SCH ₃	CH ₃	H	O	1.6109
15	5-CN	CH ₃	H	O	49-52
16	5,6-Cl ₂	CH ₃	H	O	1.5982
17	5-Cl,4-CH ₃	CH ₃	H	O	1.5780
18	H	CH ₃	CH ₃	O	
19	5-Cl	CH ₃	CH ₃	O	1.5693
20	5-F	CH ₃	H	S	37-38



中间体 化合物号	Xn	折射率 (n_D^{20})
22	5-Cl	1.5580
23	5-F	1.5316
24	5-CH ₃	1.5402



中间体 化合物号	Xn	R ⁴	A	B	熔点 (°C)
28	5-Cl	CH ₃	O	HCl	184-189
29	5-CN	CH ₃	O	HCl	202-205
30	5-F	CH ₃	O	HCl	90-93
31	3-CH ₃	CH ₃	S		58-62
32	H	H	S		76-77

根据本发明方法制备的化合物以及化合物的应用将在下述实施例中详细描述。

[实施例 1]

N^2 - 叔 - 丁氧羰基 - N^1 - [1 - (5 - 氟基 - 2 - 苯并呋喃基) 乙基] - L - 缬氨酸 (16 号化合物) 的合成

在 -20°C 或略低, 将 0.4g N - 甲基哌啶加入到含 0.8g N - 叔 - 丁氧羰基 - L - 缬氨酸的 40ml 二氯甲烷溶液中。在此温度下搅拌混合物 10 分钟后, 在 -40°C 向混合物中加入 0.5g 氯甲酸异丁基酯, 在 -40°C 至 -15°C 间搅拌 1 小时, 在 -20°C , 将 0.7g 的 1 - (5 - 氟基 - 2 - 苯并呋喃基) 乙胺加入到混合物中。然后放置反应混合物并伴随搅拌使之自然升至室温。随后将水加入到反应混合物中。用 5% 碳酸氢钠水溶液和水连续洗涤二氯甲烷层后, 用硫酸镁充分干燥有机层并浓缩。粗结晶剩余物用硅胶柱色谱纯化。由此获得 0.7g 白色固体粉末状的所需产物。

[实施例 2]

N^1 - [1 - (5 - 氟 - 2 - 苯并呋喃基) 乙基] - N^2 - 异丙氧羰基 - L - 缬氨酸 (70、71 和 296 号化合物) 的合成

在 -15°C 将 0.54g N - 甲基吗啉和相续的 0.7g 氯甲酸异丙基酯加入到含 1.57g 盐酸化 N - [1 - (5 - 氟 - 2 - 苯并呋喃基) 乙基] - 2 - 氨基 - 3 - 甲基丁酰胺的 40 ml 二氯甲烷中。搁置混合物并使之自然升至室温, 在室温下搅拌 15 小时。随后将水加到反

应混合物中。用水洗涤二氯甲烷层后，用无水硫酸镁充分干燥有机层并浓缩。粗结晶剩余物，在硅胶柱色谱上纯化，由此获得 0.85g 白色粉末状的所需产物。

采用液相色谱分离从上述反应中获得的 0.8g 非对映体的混合物。浓缩第一洗脱成分和第二洗脱成分，由此获得 0.4g 白色粉末状的所需非对映体。

[实施例 3]

N^2 - 异丙氧羰基 - N^1 - [1 - (5 - 硝基 - 2 - 苯并呋喃基) 乙基] - L - 缬氨酰胺 (108 号化合物) 的合成

在 -15°C 将 0.17g N - 甲基吗啉，和相续的 0.18g 氯甲酸异丙酯加入到含 0.5g N - [1 - (5 - 硝基 - 2 - 苯并呋喃基) 乙基] - 2 - 氨基 - 3 - 甲基丁酰胺的 40 ml 二氯甲烷中。搁置混合物并使之自然升至室温，在室温下搅拌 15 小时。随后将水加到反应混合物中。用水洗涤二氯甲烷层后，用硫酸镁充分干燥有机层，随后浓缩。粗结晶剩余物，用硅胶柱色谱纯化，由此获得 0.1g 白色粉末状的所需产物。

[实施例 4]

N^1 - [1 - (5 - 氟 - 2 - 苯并呋喃基) 乙基] - N^2 - 异丙氧羰基 - L - 缬氨酰胺 (115 号化合物) 的合成

在 -20°C 将 4.7g N - 甲基哌啶加入到含 9.7g N - 异丙氧羰基 - L - 缬氨酸的 100ml 二氯甲烷溶液中，并在相同温度下搅拌混合物 15 分钟。随后在 -30°C ，将 6.5g 氯甲酸异丁基酯加入到混

合物中，在 -30°C 至 -20°C 间搅拌整个混合物 30 分钟。在 -50°C 将 8.5g 1 - (5 - 氟 - 2 - 苯并咪喃基) 乙胺加入到混合物中。搁置混合物，使之自然升至室温，然后在室温下搅拌 15 小时。接着将水加到反应混合物中。用水洗涤二氯甲烷层后，有机层用无水硫酸镁充分干燥并浓缩。粗结晶剩余物，用硅胶柱色谱纯化，由此获得 10.6g 白色粉末状的所需产物。

[实施例 5]

2 - 叔 - 丁氧羰基氨基 - N - [1 - (5 - 氟 - 2 - 苯并咪喃基) 乙基] - 2, 3 - 二甲基丁酰胺 (140 号化合物) 的合成

在 0°C 将 2.6ml 1M 碳酸氢钠水溶液和 0.62g 二 - 叔 - 丁基二碳酸酯加入到含 0.8g 2 - 氨基 - N - [1 - (5 - 氟 - 2 - 苯并咪喃基) 乙基] - 2, 3 - 二甲基丁酰胺的 15 ml 二噁烷 / 水 (2 / 1) 溶液中。在室温下搅拌反应混合物 30 分钟，并浓缩。剩余物用乙酸乙酯提取用水洗涤有机层，随后用无水硫酸镁充分干燥，并在减压下浓缩。剩余物用硅胶柱色谱纯化，由此获得 0.52g 白色粉末状产物。

[实施例 6]

N^1 - [1 - (5 - 氟 - 2 - 苯并咪喃基) 乙基] - N^2 - (N - 甲基苯胺基羰基) - L - 缬氨酸酰胺 (151 号化合物) 的合成

在 -15°C 将 0.34g N - 甲基吗啉和 0.57g N - 甲基 - N - 苯基氨基甲酰氯相继加入到含 1.1g 盐酸化 N - [1 - (5 - 氟 - 2 - 苯并咪喃基) 乙基] - 2 - 氨基 - 3 - 甲基丁酰胺的 30 ml 二氯甲

烷溶液。搁置混合物，使之自然升至室温，并在室温下搅拌 15 小时。随后将水加到反应混合物中。用水洗涤二氯甲烷层后，用无水硫酸镁充分干燥有机层并浓缩。通过硅胶柱色谱纯化剩余的粗结晶，由此获得 1.1g 白色粉末状的所需产物。

[实施例 7]

N^2 - 叔 - 丁氧羰基 - N^1 - { 1 - [3 - 甲基 - 2 - 苯并 [b] 噻吩基] 乙基 } - L - 缬氨酸 (159 号化合物) 的合成

在 -20°C 或略低，将 0.5g N - 甲基哌啶加入到含有 1.3g N - 叔 - 丁氧羰基 - L - 缬氨酸的 25 ml 二氯甲烷溶液中。在此温度下，搅拌反应混合物 10 分钟。在 -40°C ，再向混合物中加入 0.7g 氯甲酸异丁基酯，在 -40°C 和 -15°C 下搅拌 1 小时。在 -20°C 向混合物中加入 1.0g 1 - [3 - 甲基 - 2 - 苯并 [b] 噻吩基] 乙基胺。搁置混合物伴随搅拌使之自然升至室温。随后将水加到混合物中。用 5% 碳酸氢钠水溶液和水依次洗涤二氯甲烷层后，用无水硫酸镁充分干燥有机层，并浓缩。在硅胶柱色谱上纯化剩余的粗结晶，由此获得 0.8g 白色粉末状的所需产物。

[实施例 8]

N^1 - [1 - (5 - 氟苯并 [b] 噻吩 - 2 - 基) 乙基] - N^2 - 异丙氧羰基 - L - 缬氨酸 (192 号化合物) 的合成

在 -20°C 将 5.1g N - 甲基哌啶加入到含 10.4g N - 异丙氧羰基 - L - 缬氨酸的 200ml 二氯甲烷溶液中，然后将 7.0g 氯甲酸异丁基酯滴加到混合物中。在 -20°C 搅拌混合物 10 分钟后，在 -

50℃向混合物中加入 10.0g 1-(5-氟苯并[b]噁吩-2-基)乙胺。在相同温度下搅拌后, 搁置混合物并使之自动升至室温, 然后在室温下搅拌 15 小时。用 10% 盐酸, 饱和碳酸氢钠溶液, 和水依次洗涤反应混合物后, 用无水硫酸镁充分干燥有机层, 并在减压下浓缩。在硅胶柱色谱上纯化剩余物, 由此获得 12.3g 白色粉末状的所需产物。

[实施例 9]

N²-叔-丁氧羰基-N¹-[1-(3-甲基-2-吡啶基)乙基]-L-缬氨酰胺(240号化合物)的合成

在-20℃或略低将 2.4g N-甲基哌啶加入到含有 3.1g N-叔-丁氧羰基-L-缬氨酸的 80 ml 二氯甲烷溶液中。在此温度下搅拌反应混合物 10 分钟。在-40℃将 2.0g 氯甲酸异丁基酯加入到混合物中, 在-40℃和-15℃之间搅拌全部混合物 1 小时。在-20℃向混合物中加入 2.5g 1-(3-甲基-2-吡啶基)乙胺。搁置混合物, 并使之自然升至室温。然后在室温下搅拌 12 小时。随后将水加到反应混合物中。依次用 5% 碳酸氢钠水溶液和水洗涤二氯甲烷层后, 用硫酸镁充分干燥有机层, 并浓缩。在硅胶柱色谱上纯化剩余物, 由此获得 2.5g 白色粉末状的所需产物。

[实施例 10]

N²-叔-丁氧羰基-N¹-[1-(2,3-二氢-2-苯并咪唑基)乙基]-L-缬氨酰胺(387号化合物)的合成

在-20℃或略低, 将 0.37g N-甲基哌啶加入到含有 0.8g

N-叔-丁氧羰基-L-缬氨酸的20ml二氯甲烷溶液中。然后在此温度下搅拌混合物10分钟。在-40℃，将0.51g氯甲酸异丁基酯加入到混合物中，在-40℃和-15℃之间搅拌全部混合物1小时。在-20℃向混合物中加入0.6g 1-(2,3-二氢-2-苯并咪唑基)乙胺。搁置混合物，伴随搅拌使之自然升至室温。然后将水加到反应混合物中。用5%碳酸氢钠水溶液和水相继洗涤二氯甲烷层后，有机层用无水硫酸镁充分干燥并浓缩。用硅胶柱色谱纯化剩余粗结晶，由此获得0.5g白色粉末状的所需产物。

[实施例 1 1]

N²-2-叔-丁氧羰基-N¹-[1-(3-咪唑基)乙基]-L-缬氨酰胺(405号化合物)的合成

在-20℃或略低，将0.7g N-甲基哌啶加入到含有1.5g N-叔-丁氧羰基-L-缬氨酸的50ml二氯甲烷溶液中，在此温度下搅拌混合物10分钟。在-40℃将0.9g氯甲酸异丁基酯加入到混合物中，并在-40℃和-15℃之间搅拌全部混合物1小时。在-20℃向混合物中加入1.1g 1-(3-咪唑基)乙胺。搁置混合物并使其自然升至室温，并在室温下搅拌12小时。随后向混合物中加入水。二氯甲烷层用5%碳酸氢钠和水依次洗涤后，有机层用硫酸镁充分干燥，并浓缩。用硅胶柱色谱上纯化剩余物，由此获得0.4g浅棕色粉末状的所需产物。

根据本发明的农用或园艺用杀真菌剂为含有作为活性成分的，式[I]表示的稠合杂环衍生物的组合物。根据本发明，化合物用作农用或园艺用杀真菌剂时，根据使用目的。可以适当配制用作活性成分的

化合物。通常用惰性液体或固体载体稀释活性成分，如果需要此外还可加入表面活性剂、分散剂、助剂、等等。采用已知方法可将混合物配制成，例如，细粉剂，可湿粉剂，乳油，颗粒剂，等等。

在制剂中使用的固体载体的适合实例如，滑石，蒙脱土，粘土，高岭土，硅藻土，白碳，硅石，熟石灰，硅砂，硫酸铵，脲素，等等。且液体载体的适合实例如异丙醇，二甲苯，环己酮，甲基萘，等等。表面活性剂和分散剂的例子包括，二萘甲烷磺酸盐，烷基芳基磺酸盐，和木质素磺酸盐，醇硫酸酯，聚氧乙烯乙二醇醚，聚氧乙烯烷基芳基醚，聚氧乙烯脱水山梨糖醇单烷基化物，等等。助剂的适合实例包括羧甲基纤维素，等等。这些制剂可直接使用，或稀释到适合浓度后使用。

可根据不同的目的使用根据本发明的农用或园艺用杀真菌剂：例如，种子处理，茎叶喷雾，注入到使用水中，和施用到土壤中。根据需要可选择活性成分的比例。当配制成细粉剂或颗粒剂时，优选为0.1%重量至20%重量的活性成分。对乳油或可湿性粉剂，5%重量至80%重量的活性成分是适合的。

根据本发明的农用或园艺用杀真菌剂的施用量可以根据使用的活性化合物的类型，被防治的有害生物或病害的种类，有害生物或病害发生的性质，损害程度，环境条件，使用的制剂形式，等等而变化。当本发明的农用或园艺用杀真菌剂，以细粉剂或颗粒剂的形式直接施用时，活性成分推荐的施用量可适当地选自每10公亩0.1g至5kg的范围内，优选的，在每10公亩1g至1kg范围内。另外，当本发明杀真菌剂以液体剂型，如乳油或可湿粉施用时，推荐的活性成分施用比例，可适当地选自0.1ppm至10,000ppm之间，且优选地在10ppm至3000ppm之间。

根据本发明化合物的上述制剂可防治，由属于卵菌纲，子囊菌纲，半知菌纲，和担子菌纲或其它致病真菌引起的植物病害。真菌不限定包括，假霜霉病如黄瓜霜霉病 (Pseudoperonospora cubensis)，晚疫病 (Phytophthora)，如马铃薯晚疫病 (phytophthora infestans)，和霜霉病如葡萄霜霉病 (Plasmopara viticola)。

根据本发明的农用或园艺用杀真菌剂可单独使用，或与其它杀真菌剂，杀虫剂，除草剂，植物生长调节剂，肥料等结合使用。

以下，参考下述的制剂实施例，例示了代表性的制剂，其中所有“%”表示“重量百分比”。

制剂实施例 1：

细粉剂

将 2% 化合物 (59)，5% 硅藻土，和 93% 粘土均匀混合，并磨成细粉剂。

制剂实施例 2：

可湿性粉剂

将 50% 化合物 (70)。45% 硅藻土，2% 二萘基甲烷二磺酸钠，和 3% 木质素磺酸钠均匀混合，并磨成可湿性粉剂。

制剂实施例 3：

乳油

将 30% 的化合物 (5)，20% 的环己酮，11% 聚氧乙烯烷基芳基醚，4% 烷基苯磺酸钙，和 35% 甲基萘，均匀溶解，由此获

得乳油。

制剂实施例 4 :

颗粒剂

将 5 % 化合物 (1 6) , 2 % 十二烷基磺酸钠, 5 % 木质素磺酸钠, 2 % 羧甲基纤维素, 和 8 6 % 的粘土混合并研磨。向 1 0 0 份以重量计的磨制混合物加入 2 0 份以重量计的水。通过挤压制粒机的方式, 将所得混合物搅拌并形成 1 4 至 3 2 目的颗粒。然后干燥成所需的颗粒剂。

根据本发明的农用或园艺用杀真菌剂具有有效控制黄瓜霜霉病 (*Pseudoperonospora cubensis*), 马铃薯晚疫病 (*Phytophthora infestans*), 和葡萄霜霉病 (*Plasmopara viticola*) 生长和传播的活性, 且对马铃薯晚疫病 (*Phytophthora infestans*) 有效。另外, 根据本发明的农用或园艺用杀真菌剂, 不仅具有对侵染真菌的活性, 而且在致病真菌侵入寄主植物后, 还具有消灭它们的活性。进而, 本发明的农用或园艺用杀真菌剂特征还在于, 它们不是有害化学品, 且具有如内吸作用, 残留活性, 和对降雨的影响效果等优异的性质。

参考下述的实验实施例, 本文中例示了根据本发明化合物的效果。

实验实施例 1

防止黄瓜霜霉病 (*Pseudoperonospora cubensis*) 侵染效果实验
在每边 9 c m 宽的方形 P V C (聚氯乙烯) 盆中, 每盆播种 1 0 粒黄瓜种 (品种: “Sagami hanjiro”)。使种子在温室中生长 7 天, 至子叶期。用水稀释如制剂实施例 2 制备的可湿性粉剂, 至活性成分

为 500ppm，然后将所得水制剂，以每盆 10 ml 的量，施用到子叶期的黄瓜苗上。空气干燥后，用黄瓜霜霉病 (Pseudoperonospora cubensis) 真菌的孢子悬浮液接种植物，然后在 22℃ 放置在潮湿小室内 24 小时，此后放在温室中。接种七天后，为了得到本发明化合物的保护效果，根据下述标准，定量评价损伤程度，实验结果示于表 11。

评价标准

A 类：未观察到损伤。

B 类：影响范围小于 25%。

C 类：影响范围大于等于 25% 且小于 50%。

D 类：影响范围大于等于 50%。

分别采用，日本专利申请首次公开号平 3-5451 和日本专利申请首次公开号 3-153657 中公开的杀真菌剂活性成分， $N^2 - (\text{叔-丁氧羰基}) - N^1 - (3 - \text{吡啶甲基}) - L - \text{缬氨酸胺}$ (比较化合物 A，本文此后称作“CA”) 和 $N^2 - (\text{苯氧羰基}) - N^1 - [1 - (2 - \text{咪唑基}) - \text{乙基}] - L - \text{缬氨酸胺}$ (比较化合物 B，本文此后称作“CB”) 作为比较。以配制本发明供试化合物的相同方法，配制比较化合物。

表 11

表 11-1

化合物 No.	评价值
1	A
2	A
4	B
5	A
6	A
7	B
8	B
9	B
10	A
11	A
12	A
13	A
14	B
15	A
16	A
17	A
18	A
19	A
20	A
23	A
25	A
27	B
28	B
29	B
33	A
40	B
55	A
56	A
58	A
59	A
60	A
61	A
63	A
64	B

表 11-2

化合物 No.	评价值
66	B
67	A
68	A
69	A
70	A
71	A
72	A
73	B
76	A
77	A
79	A
80	A
83	A
90	B
92	A
93	A
94	B
97	A
99	A
100	A
101	A
102	A
104	A
105	A
106	A
107	A
108	A
109	A
110	A
111	A
112	A
114	A
115	A
116	A

表 11-3

化合物 No.	评价值
117	A
118	A
119	A
120	A
121	A
128	B
151	B
156	A
157	A
158	A
159	A
161	A
163	A
165	A
166	A
167	A
168	A
169	A
170	A
171	B
177	A
178	A
179	A
180	A
181	A
182	B
192	A
193	A
194	A
200	A
204	A
205	A
206	B
228	A

表 11-4

化合物 No.	评价值
230	B
233	A
234	A
235	B
304	B
307	B
313	A
314	A
315	B
316	A
317	A
318	A
319	A
320	A
321	A
322	B
323	B
324	A
325	A
326	A
327	A
328	B
330	A
331	A
332	B

表 11-5

化合物 No.	评价值
335	A
336	A
337	A
344	A
350	B
351	A
352	A
353	A
356	A
357	A
358	A
359	A
360	A
362	A
363	A
364	A
365	A
366	A
367	A
368	A
370	A
376	A
377	A
378	A
380	A

表 11-6

化合物 No.	评价值
381	A
382	A
383	A
384	A
385	A
386	A
387	A
388	A
389	A
393	A
395	A
397	A
398	A
399	A
401	A
402	A
403	A
404	A
407	A
413	A
414	A
423	B
CA	D
CB	D

实验实施例 2

治疗黄瓜霜霉病 (Pseudoperonospora cubensis) 侵染效果实验

在每边 9 c m 宽的方形 P V C (聚氯乙烯) 盆中, 每盆播种 1 0 粒黄瓜种 (品种: “Sagami hanjiro”)。使种子在温室中生长 7 天, 至子叶期。用黄瓜霜霉病 (Pseudoperonospora cubensis) 真菌的孢子悬浮液接种植物, 然后在 2 2 °C 放置在潮湿小室内 2 4 小时, 在空气中干燥后, 用水稀释如制剂实施例 2 制备的可湿性粉剂, 至活性成分 500PPM, 然后将所得水制剂, 以每盆 1 0 m l 的量, 施用到黄瓜苗上。将黄瓜苗放置在温室中。接种七天后, 为了得到本发明化合物的保护效果, 根据下述标准, 定量评价损伤程度, 采用实验实施例 1 中公开的相同的比较化合物, 实验结果示于表 1 2。

评价标准

A 类: 未观察到损伤。

B 类: 影响范围小于 2 5 %。

C 类: 影响范围大于等于 2 5 % 且小于 5 0 %。

D 类: 影响范围大于等于 5 0 %。

表 12

表 12-1

化合物 No.	评价值
6	B
12	B
13	B
16	A
17	A
19	B
23	A
25	B
33	A
58	A
59	A
60	A
63	B
68	A
69	B
70	A
71	A
72	A
76	A
77	B
80	A
83	B
97	A
99	B
100	B
101	A
102	A
104	A
105	A
107	A
108	A
109	A

表 12-2

化合物 No.	评价值
112	A
114	B
115	A
116	A
117	A
119	A
120	A
157	A
158	B
161	B
163	A
165	A
169	A
177	B
179	B
180	A
192	A
193	B
194	A
200	A
204	A
233	B
313	A
316	A
317	A
319	A
320	A
321	A
325	B
326	A
327	A
331	B

表 12-3

化合物 No.	评价值
335	A
336	B
337	A
344	A
351	A
352	A
353	A
356	B
357	A
358	A
359	A
360	A
362	A
363	A
370	A
376	A
380	A
381	B
382	A
383	B
387	A
388	A
389	A
393	A
395	A
397	A
398	A
399	A
401	A
402	A
403	A
414	B
CA	D
CB	D

实验实施例 3

防止马铃薯晚疫病 (phytophthora infestans) 侵染效果实验

在每个瓷盆 (直径: 9 c m) 中, 移栽一株西红柿苗 (品种: “Ponterosa”), 在温室中培养。用水稀释如制剂实施例 2 制备的可湿性粉剂, 至活性成分为 500ppm, 然后将所得水制剂, 以每盆 20 ml 的量, 施用到 6 - 或 7 - 叶期的西红柿苗上。在空气中干燥后, 用马铃薯晚疫病 (phytophthora infestans) 真菌的游动孢子囊悬浮液接种植物, 然后在 22 °C 放置在潮湿小室中。接种后第四天, 根据影响范围确定影响系数。根据下述标准计算损害程度和防治病害的活性 (控制活性)。实验结果示于表 1 3, 采用实验实施例 1 中公开的相同的比较化合物 (C A 和 C B)。

实验标准

影响系数 0 : 未损伤

影响系数 1 : 损伤范围小于 5 %

影响系数 2 : 损伤范围大于等于 5 % 且小于 33.3%

影响系数 3 : 损伤范围大于等于 33.3 % 且小于 66.6%

影响系数 4 : 损伤范围大于等于 66.6 %

$$\text{损伤程度} = \frac{\sum (\text{影响系数} \times \text{正常叶片数})}{4 \times \text{观察的叶片数}} \times 100$$

$$\text{控制活性} = 1 - \left(\frac{\text{损害程度}}{\text{未处理区损害程度}} \right) \times 100$$

表 13-1

化合物 No.	防治 活性 (%)
2	100
6	100
16	100
17	100
20	100
23	100
25	100
33	100
55	100
56	100
58	100
59	100
60	100
63	100
67	100
68	100
69	100
70	100
71	100
72	100
76	100
77	100
79	100
80	100
83	100
92	100
93	100
97	100
99	100
100	100
101	100

表 13-2

化合物 No.	防治 活性 (%)
102	100
104	100
105	100
106	100
107	100
108	100
109	100
110	100
111	100
112	100
114	100
115	100
116	100
117	100
118	100
119	100
120	100
121	100
156	100
157	100
158	100
159	100
161	100
163	100
165	100
166	100
169	100
177	100
178	100
179	100

表 13-3

化合物 No.	防治 活性 (%)
180	100
192	100
193	100
194	100
200	100
204	100
233	100
234	100
313	100
314	100
316	100
317	100
319	100
320	100
321	100
325	100
327	100
331	100
335	100
336	100
337	100
344	100
351	100
352	100
353	100
356	100
357	100
358	100
359	100
360	100

表 13-4

化合物 No.	防治 活性 (%)
362	100
363	100
364	100
366	100
367	100
368	100
370	100
376	100
377	100
378	100
380	100
381	100
382	100
383	100
384	100
385	100
386	100
387	100
388	100
389	100
393	100
395	100
397	100
398	100
399	100
401	100
402	100
403	100
CA	2
CB	5

实验实施例 4 :

防止葡萄霜霉病 (Plasmopara viticola) 侵染效果实验

经过扦插和修剪的成活葡萄苗 (variety = "Kyoho"), 每瓷盆 (直径: 12 cm) 一株, 在温室中培养。用水稀释如制剂实施例 2 制备的可湿性粉剂, 至活性成分为 500ppm, 然后将所得水制剂, 以每盆 20 ml 的量, 施用到 4- 或 5- 叶期的葡萄苗上, 在空气中干燥后, 用葡萄霜霉病 (Plasmopara viticola) 真菌的游动孢子囊悬浮液接种植物, 然后在 22 °C 放置在潮湿小室中 24 小时。在温室中接种七天后, 为了培养分生孢子, 再次将植物在 22 °C 放置在潮湿小室中 24 小时。测定每个叶上分生孢子生长的影响范围, 并根据下述标准确定影响系数, 如实验实施例 3 所述的相同方法计算病害损伤程度, 防治病害的活性 (控制活性)。实验结果示于表 14, 采用实验实施例 1 中公开的相同的比较化合物。

实验标准

影响系数 0 : 未损伤

影响系数 1 : 损伤范围小于 5 %

影响系数 2 : 损伤范围大于等于 5 % 且小于 33.3%

影响系数 3 : 损伤范围大于等于 33.3 % 且小于 66.6%

影响系数 4 : 损伤范围大于等于 66.6 %

表 14
表 14-1

化合物 No.	防治 活性 (%)
2	100
6	100
16	100
17	100
20	100
23	100
25	100
33	100
55	100
56	100
58	100
59	100
60	100
63	100
67	100
68	100
69	100
70	100
71	100
72	100
76	100
77	100
79	100
80	100
83	100
92	100
93	100
97	100
99	100
100	100
101	100

表 14-2

化合物 No.	防治 活性 (%)
102	100
104	100
105	100
106	100
107	100
108	100
109	100
110	100
111	100
112	100
114	100
115	100
116	100
117	100
118	100
119	100
120	100
121	100
156	100
157	100
158	100
159	100
161	100
163	100
165	100
166	100
169	100
177	100
178	100
179	100

表 14-3

化合物 No.	防治 活性 (%)
180	100
192	100
193	100
194	100
200	100
204	100
233	100
234	100
313	100
314	100
316	100
317	100
319	100
320	100
321	100
325	100
327	100
331	100
335	100
336	100
337	100
344	100
351	100
352	100
353	100
356	100
357	100
358	100
359	100
360	100

表 14-4

化合物 No.	防治 活性 (%)
362	100
363	100
364	100
366	100
367	100
368	100
370	100
376	100
377	100
378	100
380	100
381	100
382	100
383	100
384	100
385	100
386	100
387	100
388	100
389	100
393	100
395	100
397	100
398	100
399	100
401	100
402	100
403	100
CA	7
CB	52