

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.
C07D 231/14 (2006.01)



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 02810844.2

[45] 授权公告日 2007 年 1 月 10 日

[11] 授权公告号 CN 1294121C

[22] 申请日 2002.5.30 [21] 申请号 02810844.2

[30] 优先权

[32] 2001.5.31 [33] JP [31] 164787/2001

[86] 国际申请 PCT/JP2002/005285 2002.5.30

[87] 国际公布 WO2002/096882 日 2002.12.5

[85] 进入国家阶段日期 2003.11.28

[73] 专利权人 日本农药株式会社

地址 日本东京都

[72] 发明人 古谷敬 山口实 远西正范 濑尾明

森本雅之 竹元刚 藤冈伸祐

[56] 参考文献

CN1226244A 1999.8.18 C07D333/38

WO0123356A1 2001.4.5 C07D213/82

EP0053011A 1982.6.2 C07D211/00

审查员 何湘琼

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利

商标事务所

代理人 张敏

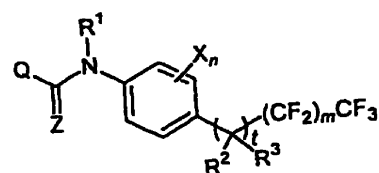
权利要求书 3 页 说明书 50 页

[54] 发明名称

取代的酰基苯胺衍生物、其中间体、农业与园艺化学品及其用途

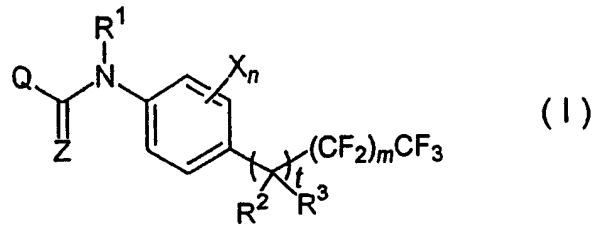
[57] 摘要

本发明涉及由通式 (I) 代表的取代的酰基苯胺衍生物、其中间体、农业与园艺化学品和它们的用途，其中 R^1 是氢原子、 $(C_1 - C_6)$ 烷基、卤代 $(C_1 - C_6)$ 烷基等； R^2 是氢原子、卤原子或卤代 $(C_1 - C_6)$ 烷基； R^3 是氢原子、卤原子、 $(C_1 - C_6)$ 烷基等； t 是 0 或 1； m 是 0 至 6 的整数；在 t 是 0 的情况下，每个 X 是 $(C_2 - C_8)$ 烷基、 $(C_1 - C_8)$ 烷氧基等，在 t 是 1 的情况下，每个 X 是卤原子、氰基等； n 是 1 至 4 的整数； Z 是 O 或 S； Q 是任意 Q1 至 Q25。



(1)

1、由通式(I)代表的取代的酰基苯胺衍生物:



其中

R^1 是氢原子;

R^2 是氢原子、卤原子或卤代(C_1-C_6)烷基;

R^3 是氢原子、卤原子、羟基或(C_1-C_6)烷氧基;

t 是 1, m 是 0 至 6 的整数;

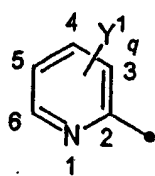
每个 X 可以是相同或不同的, 并且是(C_1-C_8)烷基、(C_2-C_8)链烯基或苯基;

n 是 1 至 4 的整数,

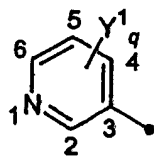
进而, 芳族环上两个相邻的 X 能够一起代表稠合的 C_6 环烷基环, 该环可以具有一个或多个可以相同或不同的取代基, 所述取代基选自(C_1-C_6)烷基,

Z 是氧原子, 和

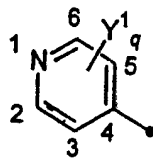
Q 是由任意式 Q_1-Q_3 、 Q_8-Q_{12} 、 $Q_{14}-Q_{16}$ 、 Q_{18} 和 Q_{21} 代表的取代基:



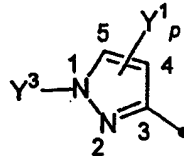
Q1



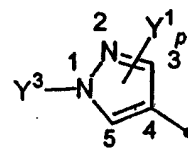
Q2



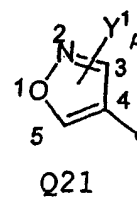
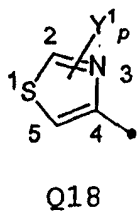
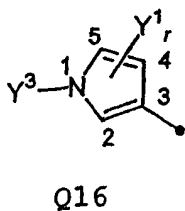
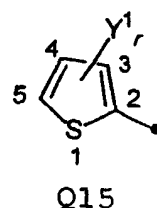
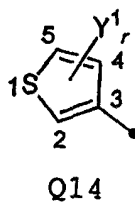
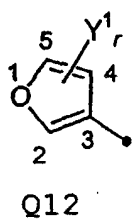
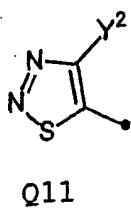
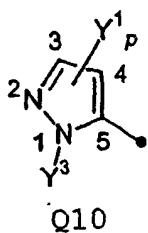
Q3



Q8



Q9



其中每个 Y^1 可以是相同或不同的，并且是卤原子；硝基； (C_1-C_6) 烷基；卤代 (C_1-C_6) 烷基； (C_1-C_6) 烷氧基； (C_1-C_6) 烷硫基； (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基； (C_1-C_6) 烷基磺酰基；苯基；取代的苯基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，所述取代基选自卤原子和 (C_1-C_6) 烷基；或苯氧基；

Y^2 是卤原子； (C_1-C_6) 烷基；卤代 (C_1-C_6) 烷基； (C_1-C_6) 烷氧基； (C_1-C_6) 烷硫基；苯基或取代的苯基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，所述取代基选自卤原子和 (C_1-C_6) 烷基；

Y^3 是 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基或苯基，

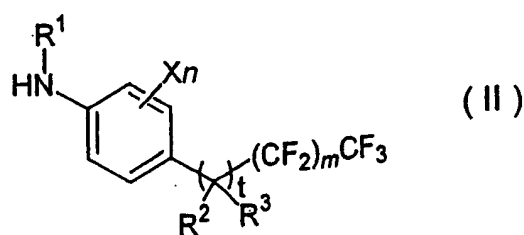
p 是 1 至 2 的整数， q 是 1 至 2 的整数， r 是 1 至 2 的整数。

2、农业与园艺化学品，包含根据权利要求 1 的取代的酰基苯胺衍生物作为活性成分。

3、根据权利要求 2 的农业与园艺化学品，它是农业与园艺杀虫剂、杀真菌剂或杀螨剂。

4、施用农业与园艺化学品的方法，其特征在于将有效剂量的根据权利要求 2 或权利要求 3 的农业与园艺化学品施用于所要保护的植物或土壤，以保护有用的植物免受害虫的侵害。

5、由通式(II)代表的取代的苯胺衍生物：



其中

R^1 是氢原子;

R^2 是氢原子、卤原子或卤代(C_1-C_6)烷基;

R^3 是氢原子、卤原子、羟基或(C_1-C_6)烷氧基;

t 是 1, m 是 0 至 6 的整数,

每个 X 可以是相同或不同的, 是(C_1-C_8)烷基、(C_2-C_8)链烯基或苯基;

n 是 1 至 2 的整数,

进而, 芳族环上两个相邻的 X 能够一起代表稠合的 C_6 环烷基环, 该环可以具有一个或多个可以相同或不同的取代基, 所述取代基选自(C_1-C_6)烷基。

取代的酰基苯胺衍生物、其中间体、 农业与园艺化学品及其用途

技术领域

本发明涉及取代的酰基苯胺衍生物；其中间体；农业与园艺化学品，尤其是农业与园艺杀虫剂、杀真菌剂或杀螨剂；和该化学品的用途。

背景技术

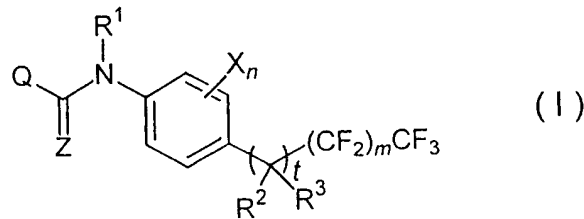
JP-A-5-221994 和 JP-A-10-251240 公开了类似于本发明取代的酰基苯胺衍生物的化合物可用作农业与园艺杀真菌剂。

农业与园艺作物等的生产仍然受到有害昆虫等的严重损害，需要开发新颖的农业与园艺化学品，尤其是农业与园艺杀虫剂，这是因为例如出现了耐受现有化学品的有害昆虫。另外，由于老年农民人口的增加等，需要各种节省体力的施用方法，需要开发具有适合于这些施用方法的性质的农业与园艺化学品。

发明的公开

本发明人为了开发新颖的农业与园艺化学品而进行了认真研究，结果发现本发明由通式(II)代表的取代的苯胺衍生物是任何文献都未知的新颖化合物，它是可用于制备各种衍生物的中间体，这些衍生物具有作为药物、农用化学品等的生理学活性，还发现从所述化合物衍生的通式(I)取代的酰基苯胺衍生物是任何文献都未知的新颖化合物，可用作农业与园艺化学品，确切为农业与园艺杀虫剂、杀真菌剂或杀螨剂，由此完成了本发明。

也就是说，本发明涉及由通式(I)代表的取代的酰基苯胺衍生物：



{其中 R^1 是氢原子、 (C_1-C_6) 烷基、卤代 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基羰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基羰基、苯基、或取代的苯基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、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_1-C_6) 烷硫基、卤代 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、单 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基——其中的 (C_1-C_6) 烷基可以是相同或不同的——和 (C_1-C_6) 烷氧基羰基，

R^2 是氢原子、卤原子或卤代 (C_1-C_6) 烷基，

R^3 是氢原子；卤原子； (C_1-C_6) 烷基；卤代 (C_1-C_6) 烷基；氰基；羰基； (C_1-C_6) 烷氧基；卤代 (C_1-C_6) 烷氧基； (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_3) 烷氧基；卤代 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_3) 烷氧基； (C_1-C_6) 烷硫基 (C_1-C_3) 烷氧基；卤代 (C_1-C_6) 烷硫基 (C_1-C_3) 烷氧基； (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基 (C_1-C_3) 烷氧基；卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基 (C_1-C_3) 烷氧基； (C_1-C_6) 烷基磺酰基 (C_1-C_3) 烷氧基；卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基 (C_1-C_3) 烷氧基；单 (C_1-C_6) 烷基氨基 (C_1-C_3) 烷氧基；二 (C_1-C_6) 烷基氨基 (C_1-C_3) 烷氧基，其中的 (C_1-C_6) 烷基可以是相同或不同的； (C_1-C_6) 烷硫基；卤代 (C_1-C_6) 烷硫基； (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基；卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基； (C_1-C_6) 烷基磺酰基；卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基；氨基；单 (C_1-C_6) 烷基氨基；二 (C_1-C_6) 烷基氨基，其中的 (C_1-C_6) 烷基可以是相同或不同的；苯氧基；取代的苯氧基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、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_1-C_6) 烷硫基、卤代 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、单 (C_1-C_6) 烷基氨基、二

(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯硫基；取代的苯硫基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯基亚磺酰基；取代的苯基亚磺酰基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯基磺酰基；取代的苯基磺酰基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯基(C₁-C₆)烷氧基；或取代的苯基(C₁-C₆)烷氧基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，

t 是 0 或 1, m 是 0 至 6 的整数,

在 t 是 0 的情况下, 每个 X 可以是相同或不同的, 是(C₂-C₈)烷基、(C₁-C₈)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺

酰基、(C₁-C₆)烷氧基(C₁-C₆)烷基、单(C₁-C₆)烷基氨基(C₁-C₆)烷基、或二(C₁-C₆)烷基氨基(C₁-C₆)烷基，其中该二(C₁-C₆)烷基氨基的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的，n是1至4的整数，

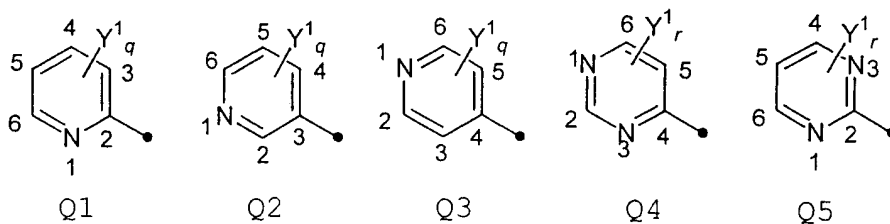
在t是1的情况下，每个X可以是相同或不同的，是卤原子；氰基；(C₁-C₈)烷基；卤代(C₁-C₈)烷基；(C₂-C₈)链烯基；卤代(C₂-C₈)链烯基；(C₂-C₈)炔基；卤代(C₂-C₈)炔基；(C₃-C₆)环烷基；(C₃-C₆)环烷基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₈)烷氧基；卤代(C₁-C₈)烷氧基；(C₁-C₆)烷基硫基；(C₁-C₆)烷基亚磺酰基；(C₁-C₆)烷基磺酰基；单(C₁-C₆)烷基氨基；二(C₁-C₆)烷基氨基，其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的；(C₁-C₈)烷基羰基；卤代(C₁-C₈)烷基羰基；(C₁-C₈)烷基硫代羰基；卤代(C₁-C₈)烷基硫代羰基；(C₁-C₆)烷基羰基(C₁-C₆)烷基；卤代(C₁-C₆)烷基羰基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷基硫代羰基(C₁-C₆)烷基；卤代(C₁-C₆)烷基硫代羰基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷氧基(C₁-C₆)烷基；卤代(C₁-C₆)烷氧基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷基硫基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷基亚磺酰基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷基磺酰基(C₁-C₆)烷基；单(C₁-C₆)烷基氨基(C₁-C₆)烷基；二(C₁-C₆)烷基氨基(C₁-C₆)烷基，其中该二(C₁-C₆)烷基氨基的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的；苯基；取代的苯基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基硫基、卤代(C₁-C₆)烷基硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯氧基；取代的苯氧基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基硫基、卤代(C₁-C₆)烷基硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯硫基；取代的苯硫基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原

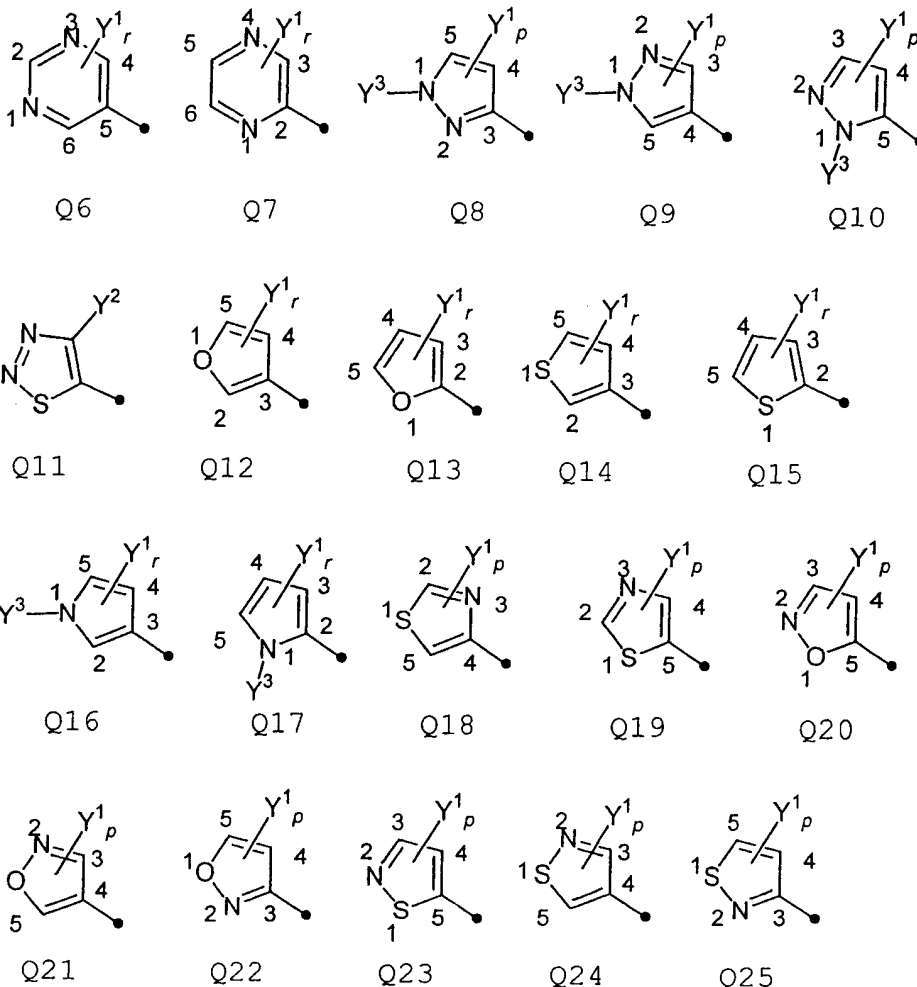
子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基硫基、卤代(C₁-C₆)烷基硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；杂环基；或取代的杂环基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基硫基、卤代(C₁-C₆)烷基硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，n 是 1 至 4 的整数，

进而，芳族环上两个相邻的 X 能够一起代表稠合的环，该环可以具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基硫基、卤代(C₁-C₆)烷基硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，并且 X 能够与 R¹ 键合构成 5 至 8 元环，该环可以在构成该环的相邻碳原子之间含有一个或两个可以相同或不同的杂原子，选自氧原子、硫原子和氮原子，

Z 是氧原子或硫原子，

Q 是由任意式 Q1 至 Q25 代表的取代基：





(其中每个 Y^1 可以是相同或不同的, 是卤原子; 氰基; 硝基; (C_1-C_6) 烷基; 卤代 (C_1-C_6) 烷基; (C_2-C_6) 链烯基; 卤代 (C_2-C_6) 链烯基; (C_2-C_6) 炔基; 卤代 (C_2-C_6) 炔基; (C_1-C_6) 烷氧基; 卤代 (C_1-C_6) 烷氧基; (C_1-C_6) 烷硫基; 卤代 (C_1-C_6) 烷硫基; (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基; 卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基; (C_1-C_6) 烷基磺酰基; 卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基; 单 (C_1-C_6) 烷基氨基; 二 (C_1-C_6) 烷基氨基, 其中的 (C_1-C_6) 烷基可以是相同或不同的; 苯基; 取代的苯基, 具有一个或多个可以相同或不同的取代基, 选自卤原子、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_1-C_6) 烷硫基、卤代 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、卤代 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、单 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基——其中的 (C_1-C_6) 烷基可以是相同或不同的——和 (C_1-C_6) 烷氧基羰基; 苯氧基; 取代的

苯氧基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；杂环基；或取代的杂环基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，

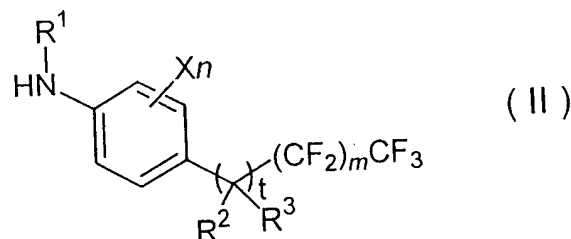
进而，芳族环上两个相邻的 Y¹ 能够一起代表稠合的环，该环可以具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，

Y² 是卤原子；氰基；硝基；(C₁-C₆)烷基；卤代(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷氧基；卤代(C₁-C₆)烷氧基；(C₁-C₆)烷硫基；卤代(C₁-C₆)烷硫基；(C₁-C₆)烷基亚磺酰基；卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基；(C₁-C₆)烷基磺酰基；卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基；单(C₁-C₆)烷基氨基；二(C₁-C₆)烷基氨基，其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的；苯基；取代的苯基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和

(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯氧基；取代的苯氧基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；杂环基；或取代的杂环基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，

Y³是氢原子、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、苯基、或取代的苯基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，

p 是 0 至 2 的整数，q 是 0 至 4 的整数，r 是 0 至 3 的整数) }、农业与园艺化学品及其用途。此外，本发明涉及由通式(II)代表的取代的苯胺衍生物：



(其中 R¹是氢原子、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、苯基、或取代的苯基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、

氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，

R² 是氢原子、卤原子或卤代(C₁-C₆)烷基，

R³ 是氢原子；卤原子；(C₁-C₆)烷基；卤代(C₁-C₆)烷基；氰基；羧基；(C₁-C₆)烷氧基；卤代(C₁-C₆)烷氧基；(C₁-C₆)烷氧基(C₁-C₆)烷氧基；卤代(C₁-C₆)烷氧基(C₁-C₆)烷氧基；(C₁-C₆)烷硫基(C₁-C₆)烷氧基；卤代(C₁-C₆)烷硫基(C₁-C₆)烷氧基；(C₁-C₆)烷基亚磺酰基(C₁-C₆)烷氧基；卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基(C₁-C₆)烷氧基；(C₁-C₆)烷基磺酰基(C₁-C₆)烷氧基；卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基(C₁-C₆)烷氧基；单(C₁-C₆)烷基氨基(C₁-C₆)烷氧基；二(C₁-C₆)烷基氨基(C₁-C₆)烷氧基，其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的；(C₁-C₆)烷硫基；卤代(C₁-C₆)烷硫基；(C₁-C₆)烷基亚磺酰基；卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基；(C₁-C₆)烷基磺酰基；卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基；氨基；单(C₁-C₆)烷基氨基；二(C₁-C₆)烷基氨基，其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的；苯氧基；取代的苯氧基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯硫基；取代的苯硫基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯基亚磺酰基；取代的苯基亚磺酰基，具有一个或多个可以

相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯基磺酰基；取代的苯基磺酰基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基；苯基(C₁-C₆)烷氧基；或取代的苯基(C₁-C₆)烷氧基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，

t 是 1，m 是 0 至 6 的整数，

每个 X 可以是相同或不同的，是卤原子；氰基；(C₁-C₈)烷基；卤代(C₁-C₈)烷基；(C₂-C₈)链烯基；卤代(C₂-C₈)链烯基；(C₂-C₈)炔基；卤代(C₂-C₈)炔基；(C₃-C₆)环烷基；(C₃-C₆)环烷基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₈)烷氧基；卤代(C₁-C₈)烷氧基；(C₁-C₆)烷硫基；(C₁-C₆)烷基亚磺酰基；(C₁-C₆)烷基磺酰基；单(C₁-C₆)烷基氨基；二(C₁-C₆)烷基氨基，其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的；(C₁-C₆)烷基羰基(C₁-C₆)烷基；卤代(C₁-C₆)烷基羰基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷基硫代羰基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷氧基(C₁-C₆)烷基；卤代(C₁-C₆)烷氧基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷硫基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷基亚磺酰基(C₁-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷基磺酰基(C₁-C₆)烷基；单(C₁-C₆)烷基氨基(C₁-C₆)烷基；二(C₁-C₆)烷基氨基(C₁-C₆)

烷基，其中该二(C₁-C₆)烷基氨基的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的；苯基；或取代的苯基，具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基，n是1至4的整数，

进而，芳族环上两个相邻的X能够一起代表稠合的环，该环可以具有一个或多个可以相同或不同的取代基，选自卤原子、氰基、硝基、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、卤代(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、卤代(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、卤代(C₁-C₆)烷基磺酰基、单(C₁-C₆)烷基氨基、二(C₁-C₆)烷基氨基——其中的(C₁-C₆)烷基可以是相同或不同的——和(C₁-C₆)烷氧基羰基)它是用于制备取代的酰基苯胺衍生物的中间体化合物。

本发明还涉及一种施用农业与园艺化学品的的方法，该方法包括将有效剂量的包含本发明通式(I)所示取代的酰基苯胺衍生物的农业与园艺化学品施用于所要保护的植物或土壤，以保护有用的植物免受害虫的侵害。

实施发明的方式

在本发明通式(I)所示取代的酰基苯胺衍生物的定义中，术语“卤原子”表示氟原子、溴原子、碘原子或氯原子。定义中，“n-”是表示“正”的前缀，“s-”是表示“仲”的前缀，“t-”是表示“叔”的前缀，“i-”是表示“异”的前缀。术语“(C₁-C₆)烷基”表示1至6个碳原子的直链或支链烷基，例如甲基、乙基、n-丙基、i-丙基、n-丁基、i-丁基、s-丁基、t-丁基、n-戊基、n-己基等。术语“卤代(C₁-C₆)烷基”表示取代的1至6个碳原子的直链或支链烷基，具有一个或多个可以相同或不同的卤原子作为取代基。术语“(C₃-C₆)环烷基”表示3至6个碳原子的环状烷基，例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基等。

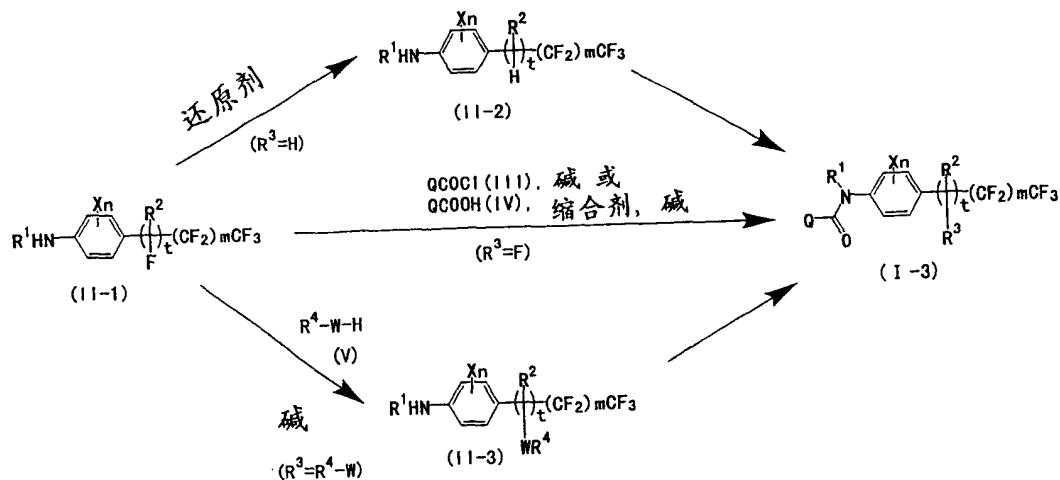
术语“杂环基”表示5或6元杂环基，具有一个或多个杂原子，选自氧原子、硫原子和氮原子。杂环基例如吡啶基、吡啶-N-氧化物、嘧啶基、咪唑基、四氢咪唑基、噻吩基、四氢噻吩基、四氢吡喃基、四氢噻喃基、噁唑基、异噁唑基、噁二唑基、噻唑基、异噻唑基、噻二唑基、咪唑基、三唑基和吡唑基。“稠合环”例如包括萘、四氢化萘、茚、二氢化茚、喹啉、喹唑啉、吲哚、二氢吲哚、苯并二氢吡喃、异苯并二氢吡喃、苯并二噁烷、苯并间二氧杂环戊烯、苯并咪唑、二氢苯并咪唑、苯并噻吩、二氢苯并噻吩、苯并噁唑、苯并噻唑、苯并咪唑和吲唑。

本发明通式(I)取代的酰基苯胺衍生物在有些情况下在其结构式中含有一个或多个不对称中心，在有些情况下具有两种或多种旋光异构体和非对映体。本发明也包括所有个别的旋光异构体和由这些异构体组成的任意比例混合物。在有些情况下，本发明通式(I)取代的酰基苯胺衍生物由于其结构式中的碳-碳双键而具有两种几何异构体。本发明也包括所有个别的几何异构体和由这些异构体组成的任意比例混合物。

在本发明通式(I)取代的酰基苯胺衍生物中，Q 优选为 Q9、Q14 和 Q15，特别优选为 Q9；Y¹ 优选为卤原子或(C₁-C₂)烷基，特别优选为 3,5-二甲基；Y³ 优选为(C₁-C₃)烷基或苯基，特别优选为甲基；X_n 优选为 2-位(C₅-C₇)烷基，特别优选为 2-位 C₆ 烷基；Z 特别优选为氧原子；R¹ 特别优选为氢原子；R² 特别优选为三氟甲基；R³ 优选为氢原子、卤原子或(C₁-C₂)烷氧基，特别优选为氢原子；m 特别优选为 0；t 特别优选为 1。

本发明由通式(I)代表的取代的酰基苯胺衍生物的典型制备方法如下所述，但是它们决不打算限制本发明的范围。

制备方法 1



其中 R¹、R²、R³、X、m、n、t 和 Q 是如上所定义的，R⁴ 是氢原子、(C₁-C₆)烷基、卤代(C₁-C₆)烷基、苯基、取代的苯基或苯基(C₁-C₄)烷基，W 是 -O-、-S- 或 -N(R⁴)-，其中 R⁴ 是如上所定义的。

取代的酰基苯胺衍生物(I-3)、也就是其中 Z 是 O 的通式(I)取代的酰基苯胺衍生物可以这样制备，在惰性溶剂中，在有或没有碱的存在下，使任何通式(II-1)至通式(II-3)苯胺衍生物与通式(III)杂环羧酸酰氯反应，或者在惰性溶剂中，在缩合剂的存在下，在有或没有碱的存在下，使任何通式(II-1)至通式(II-3)苯胺衍生物与通式(IV)杂环羧酸反应。该制备可以借助酰胺的任何常规制备方法进行。

通式(II-2)苯胺衍生物可以这样制备，在惰性溶剂中，在还原剂的存在下，还原通式(II-1)苯胺衍生物。

通式(II-3)苯胺衍生物可以这样制备，在惰性溶剂中，在有或没有碱的存在下，使通式(II-1)苯胺衍生物与通式(V)醇衍生物、硫醇衍生物或胺衍生物反应。

通式(II-1)→通式(II-2)

可用在本反应中的还原剂例如包括金属氢化物，例如氢化铝锂、硼氢化锂、硼氢化钠、氢化二异丁基铝、氢化双(2-甲氧基乙氧基)铝钠等；和金属或金属盐，例如金属锂等。至于所用还原剂的量，还原剂的用量可以在 1 当量至过量当量每当量通式(II-1)苯胺衍生物的范围

加以适当选择。

作为用在反应中的惰性溶剂，可以使用任何惰性溶剂，只要它不明显抑制反应的进程即可。可以例证的惰性溶剂例如包括芳族烃，例如苯、甲苯、二甲苯等；卤代烃，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等；卤代芳族烃，例如氯苯、二氯苯等；和无环或环状醚，例如乙醚、二噁烷、四氢呋喃等。这些惰性溶剂可以单独或者混合使用。

至于反应温度，反应可以在室温至所用惰性溶剂的沸点下进行。尽管反应时间因反应的规模、反应温度等而异，不过反应可以进行若干分钟至 50 小时。

反应完成后，借助常规方法从含有所需化合物的反应系统中分离所需化合物，如果必要的话借助重结晶、柱色谱等纯化，由此可以制备所需化合物。所需化合物可以进行随后的反应步骤，而无需从反应系统中分离。

通式(II-1)→通式(II-3)

可用在本反应中的碱包括金属氢化物，例如氢化锂、氢化钠、氢化钾等；金属醇化物，例如甲醇钠、乙醇钠、t-丁醇钾等；和烷基金属，例如 n-丁基锂、s-丁基锂、t-丁基锂等。至于所用碱的量，碱的用量可以在 1 当量至过量当量每当量通式(II-1)苯胺衍生物的范围以内加以适当选择。

作为用在反应中的惰性溶剂，可以使用任何惰性溶剂，只要它不明显抑制反应的进程即可。可以例证的惰性溶剂例如包括芳族烃，例如苯、甲苯、二甲苯等；醇，例如甲醇、乙醇等；和无环或环状醚，例如乙醚、1,2-二甲氧基乙烷、二噁烷、四氢呋喃等。这些惰性溶剂可以单独或者混合使用。

至于反应温度，反应可以在-70°C 至所用惰性溶剂的沸点下进行。尽管反应时间因反应的规模、反应温度等而异，不过反应可以进行若干分钟至 50 小时。

反应完成后，借助常规方法从含有所需化合物的反应系统中分离所需化合物，如果必要的话借助重结晶、柱色谱等纯化，由此可以制

备所需化合物。所需化合物可以进行随后的反应步骤，无需从反应系统中分离。

通式(II-1)、通式(II-2)或通式(II-3) → 通式(I-3)

用在本反应中的缩合剂例如包括氰基膦酸二乙酯(DEPC)、羰基二咪唑(CDI)、1,3-二环己基碳二亚胺(DCC)、氯碳酸酯和 2-氯-1-甲基吡啶鎓碘化物。

作为用在反应中的碱，例如有无机碱或有机碱。无机碱例如包括碱金属原子的氢氧化物，例如氢氧化钠、氢氧化钾等；碱金属的氢化物，例如氢化钠、氢化钾等；醇的碱金属盐，例如乙醇钠、t-丁醇钾等；和碳酸盐，例如碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠等。有机碱例如包括三乙胺、吡啶和 DBU。至于所用碱的量，碱的用量可以在 1 摩尔至过量摩尔每摩尔通式(IV)杂环羧酸衍生物的范围以内加以适当选择。

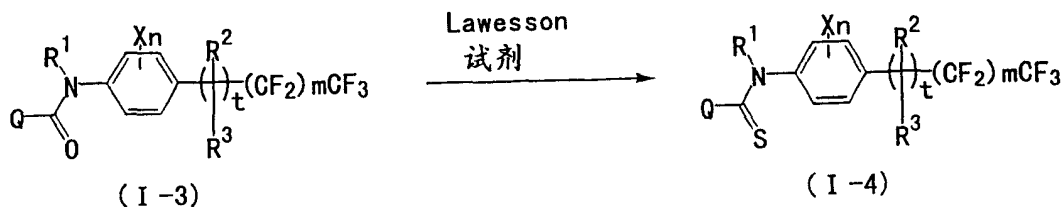
作为用在反应中的惰性溶剂，可以使用任何惰性溶剂，只要它不明显抑制反应的进程即可。可以例证的惰性溶剂例如包括芳族烃，例如苯、甲苯、二甲苯等；卤代烃，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等；卤代芳族烃，例如氯苯、二氯苯等；无环或环状醚，例如乙醚、二噁烷、四氢呋喃等；酯，例如乙酸乙酯等；酰胺，例如二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺等；二甲基亚砷；1,3-二甲基-2-咪唑烷酮；丙酮；甲乙酮；等等。这些惰性溶剂可以单独或者混合使用。

由于反应是一种等摩尔反应，使用等摩尔量的反应物足矣，不过它们也可以过量使用。至于反应温度，反应可以在室温至所用惰性溶剂的沸点下进行。尽管反应时间因反应的规模、反应温度等而异，不过反应可以进行若干分钟至 48 小时。

反应完成后，借助常规方法从含有所需化合物的反应系统中分离所需化合物，如果必要的话借助重结晶、柱色谱等纯化，由此可以制备所需化合物。

通式(II-1)苯胺衍生物，即反应原料可以按照 JP-A-11-302233 或 JP-A-2001-122836 所公开的制备方法加以制备。

制备方法 2

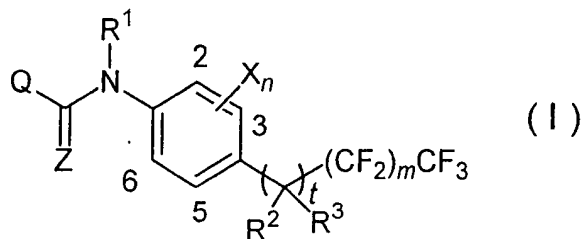


其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 m 、 n 、 t 和 Q 是如上所定义的。

取代的酰基苯胺衍生物(I-4)、也就是其中 Z 是 S 的通式(I)取代的酰基苯胺衍生物可以这样制备, 按照熟知的方法使通式(I-3)取代的酰基苯胺衍生物与 Lawesson 试剂反应(Tetrahedron Lett., 21(42), 4061 (1980))。

作为通式(I)取代的酰基苯胺衍生物的典型化合物列在表 1 至 4 中, 作为通式(II)取代的苯胺衍生物的典型化合物列在表 6 中, 但是它们决不算限制本发明的范围。在表 1 至 4 和表 6 中, 物理性质是熔点($^{\circ}\text{C}$)或折光指数(括号内的数值是温度($^{\circ}\text{C}$)), “Me”表示甲基, “Et”表示乙基, “Pr”表示丙基, “Bu”表示丁基, “Ph”表示苯基。

通式 (I)

表 1 (Q=Q9, R¹=H, R²=CF₃, Z=O, t=1)

No.	Xn	Y _p ¹	Y ³	m	R ³	物理性质
1-1	2-Me	3-CF ₃	Me	0	F	146-148
1-2	2-Et-6-s-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	119
1-3	2-n-Pr	3-CF ₃	Me	0	F	152-153
1-4	2-n-Pr	3-Me-5-Cl	Me	0	H	85-87
1-5	2-i-Pr	3-CF ₃	Me	0	F	170-172
1-6	2-i-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	
1-7	2-i-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-8	2-s-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	106
1-9	2-s-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-10	2-t-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	124-125
1-11	2-t-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-12	2-(CH ₂) ₄ -3	3-CF ₃	Me	0	F	125-128
1-13	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	
1-14	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	165-166
1-15	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-16	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	

表 1 (续)

No.	Xn	Y _p ¹	Y ³	m	R ³	物理性质
1-17	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	130-131
1-18	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-19	2-Ph	3-CF ₃	Me	0	F	139-140
1-20	2-Ph	3-Me-5-Cl	Me	0	H	145-147
1-21	2-CH(Me)CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	121
1-22	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	0	H	82-83
1-23	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	1.4983 (19.1)
1-24	2-CH(Me)CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	F	
1-25	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3,5-Me ₂	Me	0	H	1.5051 (20.1)
1-26	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3,5-Me ₂	Me	0	OMe	1.4921 (20.2)
1-27	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	H	Me	0	H	
1-28	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	0	F	138-139
1-29	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Et	0	H	
1-30	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	0	H	146-147
1-31	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	0	OMe	
1-32	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	0	OEt	
1-33	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	CHF ₂	0	H	1.4650 (19.9)
1-34	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	0	H	1.4970 (19.9)
1-35	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et	Me	0	H	35-38
1-36	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>i</i> -Pr	Me	0	H	45-47
1-37	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-F	Me	0	H	

表 1 (续)

No.	Xn	Y _p ¹	Y ³	m	R ³	物理性质
1-38	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Me	0	H	
1-39	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Br	Me	0	H	1.5111 (22.2)
1-40	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-I	Me	0	H	无定形
1-41	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-SMe	Me	0	H	129-130
1-42	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-SOMe	Me	0	H	
1-43	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-SO ₂ Me	Me	0	H	
1-44	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-OMe	Me	0	H	102-105
1-45	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-Me	Me	0	H	1.4790 (25.2)
1-46	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-SMe	Me	0	H	1.6201 (16.8)
1-47	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-SOMe	Me	0	H	1.4930 (23.7)
1-48	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-SO ₂ Me	Me	0	H	48
1-49	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-F	Me	0	H	
1-50	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	Me	0	H	
1-51	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	Et	0	H	1.5110 (21.7)
1-52	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	CH ₂ CH ₂ F	0	H	1.4931 (22.5)
1-53	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-Br	Me	0	H	
1-54	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-Br	Et	0	H	1.5061
1-55	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-Br	<i>t</i> -Bu	0	H	67-68
1-56	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-I	Me	0	H	119-120
1-57	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-I	Et	0	H	132-133
1-58	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-I	<i>t</i> -Bu	0	H	98-99
1-59	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	5-I	Ph	0	H	127-128
1-60	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Cl-5-Me	Me	0	H	95-97

表 1 (续)

No.	Xn	Y _p ¹	Y ³	m	R ³	物理性质
1-61	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Br-5-Me	Me	0	H	1.5208 (21.1)
1-62	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-I-5-Me	Me	0	H	1.5252 (21.1)
1-63	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-I-5-Me	Et	0	H	170-171
1-64	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	F	
1-65	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	H	1.4974 (22.8)
1-66	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	OMe	
1-67	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	F	
1-68	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	H	
1-69	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	OMe	
1-70	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	88-90
1-71	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	H	1.5025 (23.7)
1-72	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	无定形
1-73	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	OEt	1.5003 (15.7)
1-74	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	F	
1-75	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	H	
1-76	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	OMe	
1-77	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	OEt	
1-78	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	H	1.4905 (21.2)
1-79	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	OMe	
1-80	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	OEt	
1-81	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Me	0	H	134-135
1-82	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Me	0	OMe	96-97
1-83	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Et	0	OH	1.5140 (22.2)

表 1 (续)

No.	Xn	Y _p ¹	Y ³	m	R ³	物理性质
1-84	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Et	0	H	153-155
1-85	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Br	Me	0	H	110-112
1-86	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Br	Me	0	OMe	无定形
1-87	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Me	0	H	184-185
1-88	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Me	0	OMe	
1-89	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Et	0	H	174
1-90	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SMe	Me	0	H	1.5140(22.2)
1-91	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SMe	Me	0	OMe	
1-92	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SOMe	Me	0	H	42-43
1-93	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SOMe	Me	0	OMe	
1-94	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SO ₂ Me	Me	0	H	1.4993(22.1)
1-95	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SO ₂ Me	Me	0	OMe	
1-96	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OMe	Me	0	H	1.5020(20.9)
1-97	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OMe	Me	0	OMe	
1-98	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OPh	Me	0	H	1.5182(20.5)
1-99	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OPh	Me	0	OMe	
1-100	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-OMe-5-Br	Me	0	H	143-144
1-101	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-OMe-5-SPr-n	Me	0	H	102
1-102	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Et	0	H	
1-103	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Me	0	H	102-104

表 1 (续)

No.	Xn	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物理性质
1-104	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Me	0	OMe	1.4712(18.2)
1-105	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-OPh	Me	0	H	1.4951(19.4)
1-106	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	F	81-82
1-107	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	H	1.4958(15.7)
1-108	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	OMe	94-96
1-109	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	OEt	1.4958(20.1)
1-110	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	1	F	
1-111	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	1	H	
1-112	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	1	OMe	
1-113	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	1	OEt	
1-114	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Et	0	F	1.4950(18.4)
1-115	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Et	0	H	
1-116	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Et	0	OMe	
1-117	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Et	0	OEt	
1-118	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	n-Pr	0	F	1.4907(19.2)
1-119	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	n-Pr	0	H	1.4970(17.4)
1-120	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	n-Pr	0	OMe	
1-121	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	n-Pr	0	OEt	
1-122	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Ph	0	F	
1-123	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Ph	0	H	
1-124	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Ph	0	OMe	
1-125	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Ph	0	OEt	
1-126	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-F ₂	Me	0	F	

表 1 (续)

No.	Xn	Y _p ¹	Y ³	m	R ³	物理性质	
1-127	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-F ₂	Me	0	H	73 129-130 无定形 1.4890(21.5) 1.4822(20.3) 1.4881(20.3)	
1-128	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-F ₂	Me	0	OMe		
1-129	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Cl ₂	Me	0	H		
1-130	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Cl ₂	Me	0	OMe		
1-131	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Cl ₂	Et	0	H		
1-132	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Cl	Me	0	H		
1-133	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>n</i> -Pr-5-Cl	Me	0	H		
1-134	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>i</i> -Pr-5-Cl	Me	0	H		
1-135	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>t</i> -Bu-5-Cl	Me	0	H		
1-136	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	F		
1-137	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	H		
1-138	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe		
1-139	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	F		
1-140	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	H		
1-141	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	OMe		
1-142	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	0	F		1.4931(19.5)
1-143	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	0	H		1.5020(19.5)
1-144	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	1.5003(19.6)	
1-145	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	1.4907(20.3)	
1-146	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	H	1.4905(20.4)	
1-147	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe		

表 1 (续)

No.	X _n	Y _p ¹	Y ³	m	R ³	物理性质
1-148	2-CH(Me) (CH ₂) ₂ CH Me ₂	3,5-Me ₂	Me	0	F	无定形
1-149	2-CH(Me) (CH ₂) ₂ CH Me ₂	3,5-Me ₂	Me	0	H	
1-150	2-CH(Me) (CH ₂) ₂ CH Me ₂	3,5-Me ₂	Me	0	OMe	
1-151	2-CH(Me) CH ₂ CH(Me) CH ₂ CH ₃	3,5-Me ₂	Me	0	F	1.4904 (25.5)
1-152	2-CH(Me) CH ₂ CH(Me) CH ₂ CH ₃	3,5-Me ₂	Me	0	H	1.4863 (25.5)
1-153	2-CH(Me) CH ₂ CH(Me) CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-154	2-C(Me)=CHCHMe ₂ -3-Me	3,5-Me ₂	Me	0	F	1.4950 (25.5)
1-155	2-C(Me)=CHCHMe ₂ -3-Me	3,5-Me ₂	Me	0	H	1.5052 (25.2)
1-156	2-CH(Me) CH ₂ CH(Me) CH ₂ CH ₃	3,5-Me ₂	Me	0	OMe	
1-157	2-CH(Me) Ph	3,5-Me ₂	Me	0	F	
1-158	2-CH(Me) Ph	3,5-Me ₂	Me	0	H	
1-159	2-CH(Me) Ph	3,5-Me ₂	Me	0	OMe	
1-160	2-CH(Me) CH ₂ CMe ₃	3,5-Me ₂	Me	0	F	
1-161	2-CH(Me) CH ₂ CMe ₃	3,5-Me ₂	Me	0	H	
1-162	2-CH(Me) CH ₂ CMe ₃	3,5-Me ₂	Me	0	OMe	
1-163	2,3-Me ₂	3,5-Me ₂	Me	0	F	132-136
1-164	2,3-Me ₂	3,5-Me ₂	Me	0	H	167-170

表2 (Q=Q9, R¹=H, Z=O, t=1)

No.	Xn	Y _p ¹	Y ³	m	R ²	R ³	物理性质
2-1	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	F	F	
2-2	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	H	H	
2-3	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	2	F	F	
2-4	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	2	H	H	
2-5	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	4	F	F	
2-6	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	4	H	H	
2-7	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	6	F	F	
2-8	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	6	H	H	
2-9	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	F	
2-10	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	H	H	
2-11	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	2	F	F	
2-12	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	2	H	H	
2-13	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	4	F	F	
2-14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	4	H	H	
2-15	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	6	F	F	
2-16	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	6	H	H	

表 3 ($R^1=H$, $R^2=CF_3$, $Z=O$, $m=0$, $t=1$)

No.	Q	Xn	$Y^1_{p,q,r}$ 或 Y^2	R^3	物理性质
3-1	Q1	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	H	
3-2	Q1	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Cl ₂	H	108-109
3-3	Q2	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	4-CF ₃	H	1.4860 (22.7)
3-4	Q2	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2-Cl	H	68
3-5	Q2	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2-Cl-6-Me	H	无定形
3-6	Q3	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	H	
3-7	Q3	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2,6-Cl ₂	H	1.5182 (20.5)
3-8	Q6	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2-SMe-4-CF ₃	H	
3-9	Q6	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	4-CF ₃	H	
3-10	Q11	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	Me	F	104
3-11	Q11	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	Me	H	无定形
3-12	Q11	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	CF ₃	H	85-88
3-13	Q12	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	H	72-73
3-14	Q12	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	OMe	
3-15	Q13	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Br	F	
3-16	Q13	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Br	H	
3-17	Q13	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Br	OMe	
3-18	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2-Br	H	

表 3 (续)

No.	Q	Xn	$Y^1_{p,q,r}$ 或 Y^2	R^3	物理性质	
3-19	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2-Br	OMe	1.5080 (20.4)	
3-20	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2-Br	OEt		
3-21	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	4-Br	H		
3-22	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	4-Br	OMe		
3-23	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	4-Br	OEt		
3-24	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	H		
3-25	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	OMe		
3-26	Q14	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	OEt		
3-27	Q15	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	H	H		133.5-135
3-28	Q15	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	H		
3-29	Q15	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-Br	H		
3-30	Q15	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-I	H		1.5365 (18.4)
3-31	Q15	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3-I	OMe		1.5081 (18.5)
3-32	Q18	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2-Cl	H		104.5-106
3-33	Q18	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	2-Me-5-(2-Cl-Ph)	H	1.5425 (21.1)	
3-34	Q21	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	H	无定形	
3-35	Q21	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	OMe	1.4870 (19.4)	
3-36	Q24	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	H		
3-37	Q24	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	OMe		

表4 ($R^1=H$, $R^2=CF_3$, $Z=O$, $m=0$, $t=1$)

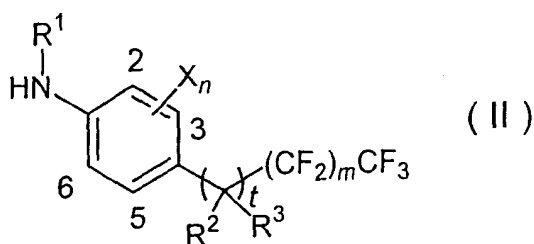
No.	Q	Xn	Y^1_p 或 r	Y^3	R^3	物理性质
4-1	Q8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Cl-5-Me	Me	H	160
4-2	Q8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br-5-Me	Me	H	149-150
4-3	Q10	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	H	1.4848(23.6)
4-4	Q10	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-Cl	Me	H	108-109
4-5	Q10	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-Br	Me	H	112-113
4-6	Q10	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>t</i> -Bu-4-Cl	Me	H	1.4915(23.9)
4-7	Q10	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-NO ₂	Me	H	1.4971(25.3)
4-8	Q16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	Me	F	
4-9	Q16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	Me	H	1.5062(18.4)
4-10	Q16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	Me	OMe	
4-11	Q16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	Me	OEt	
4-12	Q16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	Et	F	
4-13	Q16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	Et	H	
4-14	Q16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	Et	OMe	
4-15	Q16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	Et	OEt	
4-16	Q17	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	F	
4-17	Q17	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	H	
4-18	Q17	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	OMe	
4-19	Q17	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	OEt	
4-20	Q17	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	F	
4-21	Q17	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	H	
4-22	Q17	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	OMe	
4-23	Q17	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	OEt	

表5显示表1至4中物理性质以“无定形”表示的化合物的¹H-NMR数据。

表 5

No.	$^1\text{H-NMR}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta \text{ 值 (ppm)}]$
1-40	8.20 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.32-7.25 (m, 2H), 4.05 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.20 (m, 1H), 1.65-1.40 (m, 3H), 1.24 (d, 3H), 0.84 (m, 6H)
1-72	8.04 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.46-7.39 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 3.03 (m, 3H), 2.52 (s, 3H), 1.69-1.40 (m, 3H), 1.23 (d, 3H), 0.84 (d, 6H)
1-86	8.01 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.47-7.39 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 3.07 (m, 1H), 2.94 (m, 1H), 1.67-1.40 (m, 3H), 1.30-1.20 (m, 6H), 0.84 (d, 6H)
1-132	7.98 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.30-7.21 (m, 2H), 4.04 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.10-2.80 (m, 3H), 1.63-1.40 (m, 3H), 1.33-1.18 (m, 6H), 0.84 (d, 6H)
1-148	8.13 (d, 1H), 7.50-7.40 (m, 2H), 7.33 (s, 1H), 3.77 (s, 3H), 2.82 (m, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 1.72-1.52 (m, 2H), 1.52-1.39 (m, 1H), 1.27 (d, 3H), 1.21-1.10 (m, 1H), 1.10-0.91 (m, 1H), 0.82 (d, 6H)
3-5	8.32 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.35-7.20 (m, 3H), 4.06 (m, 1H), 3.05 (m, 1H), 2.61 (s, 3H), 1.60-1.40 (m, 3H), 1.22 (d, 3H), 0.84 (d, 6H)
3-34	7.85 (d, 1H), 7.31-7.20 (m, 3H), 4.06 (m, 1H), 2.92 (m, 1H), 2.67 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 1.60-1.40 (m, 3H), 1.22 (t, 3H), 0.85 (m, 6H)

通式 (II)

表 6 (R¹=H, t=1)

No.	X _n	m	R ²	R ³	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 值 (ppm)]
5-1	2- <i>n</i> -Pr	0	CF ₃	H	7.12-7.02 (m, 2H), 6.69 (d, 1H), 4.0-3.7 (m, 3H), 2.52 (q, 2H), 1.27 (t, 3H)
5-2	2- <i>t</i> -Bu	0	CF ₃	H	7.17 (s, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.64 (d, 1H), 4.1-3.9 (br, 2H), 3.91 (m, 1H), 1.41 (s, 9H)
5-3	2-Ph	0	CF ₃	H	7.52-7.32 (m, 5H), 7.19-7.10 (m, 2H), 6.77 (d, 1H), 4.08-3.85 (m, 3H)
5-4	2-CH(Me) CHMe ₂	0	CF ₃	H	7.08-7.01 (m, 2H), 6.71 (s, 1H), 3.91 (m, 1H), 2.50 (m, 1H), 1.87 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.92 (d, 3H), 0.87 (d, 3H)
5-5	2-CH(Me) CHMe ₂ -6-Et	0	CF ₃	H	6.96 (d, 2H), 3.92 (m, 1H), 3.85-3.70 (br, 2H), 2.65 (m, 1H), 2.53 (dd, 2H), 1.80-1.50 (m, 2H), 1.23 (d, 3H), 0.90 (t, 3H)
5-6	2-(CH ₂) ₄ -3	0	CF ₃	H	7.24 (d, 1H), 6.60 (d, 1H), 4.41 (m, 1H), 3.76 (br, 2H), 2.70 (br, 2H), 2.47 (br, 2H), 1.84 (m, 4H)

表 6 (续)

No.	Xn	m	R ²	R ³	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 值 (ppm)]
5-7	2-CH=CH-CH =CH-3	0	CF ₃	H	7.91-7.84 (m, 2H), 7.68-7.47 (m, 3H), 6.82 (d, 1H), 4.96 (m, 1H), 4.40-4.20 (br, 2H)
5-8	2-CH (Me) CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	7.06-6.98 (m, 2H), 6.67 (d, 1H), 3.91 (m, 1H), 3.85-3.70 (br, 2H), 2.62 (m, 1H), 1.78-1.50 (m, 2H), 1.22 (d, 3H), 0.89 (t, 3H)
5-9	2-CH (Me) CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	7.08-7.00 (m, 2H), 6.67 (d, 1H), 3.91 (m, 1H), 3.82-3.70 (br, 2H), 2.71 (m, 1H), 1.70-1.50 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 5H), 0.90 (t, 3H)
5-10	2-CH (Me) CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	OMe	7.24 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.00-3.82 (br, 2H), 3.43 (s, 3H), 2.73 (m, 1H), 1.70-1.45 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 5H), 0.90 (t, 3H)
5-11	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	0	CF ₃	H	7.10-7.00 (m, 2H), 6.69 (s, 1H), 3.91 (m, 1H), 2.80 (m, 1H), 1.65-1.50 (m, 2H), 1.43-1.32 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.89 (t, 6H)
5-12	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	0	CF ₃	OH	7.39 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.68 (d, 1H), 3.90-3.60 (br, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.61-1.50 (m, 1H), 1.45-1.35 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.89 (q, 6H)
5-13	2-CH (Me) CH ₂ CHMe ₂	0	CF ₃	OMe	7.26 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.00-3.65 (br, 2H), 3.43 (s, 1H), 2.79 (m, 1H), 1.56 (m, 2H), 1.37 (m, 1H), 1.20 (d, 3H), 0.91 (t, 6H)
5-14	2-CH (Me)CH ₂ CHMe ₂	0	CF ₃	OEt	7.26 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 3.98-3.67 (br, 2H), 3.59 (q, 2H), 2.80 (m, 1H), 1.56 (m, 2H), 1.38 (m, 1H), 1.30 (t, 3H), 1.20 (d, 3H), 0.89 (t, 6H)

表 6 (续)

No.	Xn	m	R ²	R ³	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ 值 (ppm)]
5-15	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH Me ₂	0	CF ₃	H	7.08-7.00 (m, 2H), 6.68 (d, 1H), 3.92 (m, 1H), 3.99-3.70 (br, 2H), 2.65 (m, 1H), 1.78-1.42 (m, 4H), 1.30-1.10 (m, 5H), 0.86 (d, 6H)
5-16	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	7.26 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.71 (d, 1H), 3.95-3.78 (br, 2H), 2.69 (m, 1H), 1.72-1.42 (m, 2H), 1.40-1.18 (m, 7H), 0.88 (t, 3H)
5-17	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	0	H	H	6.98 (s, 1H), 6.92 (d, 1H), 6.65 (d, 1H), 3.85-3.60 (br, 2H), 3.24 (dd, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.65-1.48 (m, 2H), 1.45-1.30 (m, 1H), 1.19 (d, 3H), 0.90 (t, 6H)
5-18	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	2	H	H	6.97 (s, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.65 (d, 1H), 3.82-3.40 (br, 2H), 3.23 (t, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.70-1.50 (m, 2H), 1.39 (m, 1H), 1.20 (d, 3H), 0.90 (t, 6H)
5-19	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	4	H	H	6.97 (s, 1H), 6.92 (d, 1H), 6.65 (d, 1H), 4.00-3.70 (br, 2H), 3.24 (t, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.68-1.48 (m, 2H), 1.45-1.30 (m, 1H), 1.22 (d, 3H), 0.89 (m, 6H)
5-20	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	6	H	H	6.97 (s, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.65 (d, 1H), 3.24 (t, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.67-1.45 (m, 2H), 1.42-1.30 (m, 1H), 1.22 (d, 3H), 0.90 (t, 6H)

下面描述本发明的典型实施例、制剂例和试验例，但是它们不应被解释为限制发明的范围。

实施例 1-1

2-(1,3-二甲基丁基)-4-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺(化合物 No. 5-11)的制备

将氢化铝锂(2g, 52.7mmol)悬浮在四氢呋喃(60ml)中，然后向其中滴加 2-(1,3-二甲基丁基)-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺(14g, 40.5mmol)，将所得混合物在回流温度下搅拌 3 小时。在冰冷却下分小批量向反应混合物加入水，然后搅拌 10 分钟。向其中加入硫酸镁，然后搅拌 10 分钟。通过 C 盐过滤反应混合物，在减压下浓缩滤液，得到 13g 所需化合物。

收率：98%。

实施例 1-2

N-{2-(1,3-二甲基丁基)-4-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-5-氯-1-甲基-3-三氟甲基吡唑-4-羧酰胺(化合物 No. 1-103)的制备

将 5-氯-1-甲基-3-三氟甲基吡唑-4-羧酸(230mg, 1mmol)溶于亚硫酸氯(2ml)，将溶液在回流温度下搅拌 2 小时。在减压下浓缩后，在冰冷却下将所得酰氯加入到 2-(1,3-二甲基丁基)-4-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺(330mg, 1mmol)与三乙胺(150mg, 1.5mmol)的四氢呋喃(10ml)溶液中，将所得混合物在室温下搅拌 2 小时。反应混合物用乙酸乙酯稀释，然后用水洗涤。有机层经无水硫酸镁干燥，然后在减压下浓缩，分离所得残余物，经过硅胶柱色谱纯化(己烷:乙酸乙酯 = 3:1)，得到 233mg 所需化合物。

物理性质：熔点 102 - 104°C。收率：43%。

实施例 2-1

2-(1,3-二甲基丁基)-4-[1-甲氧基-2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺(化合物 No. 5-13)的制备

将钠(533mg, 23mmol)溶于甲醇(40ml)，然后向其中加入 2-(1,3-二甲基丁基)-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺(2g, 5.8mmol)，将所

得混合物在回流温度下搅拌 3 小时。在减压下浓缩反应混合物，残余物用乙酸乙酯稀释，用水洗涤。有机层经硫酸镁干燥，然后在减压下浓缩，分离所得残余物，经过硅胶柱色谱纯化（己烷：乙酸乙酯 = 6:1），得到 1.8g 所需化合物。

收率：87%。

实施例 2-2

N-{2-(1,3-二甲基丁基)-4-[1-甲氧基-2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-1,3,5-三甲基吡唑-4-羧酰胺(化合物 No. 1-108)的制备

将 1,3,5-三甲基吡唑-4-羧酸(154mg, 1mmol)溶于亚硫酸酐(5ml)，将溶液在回流下加热 2 小时。在减压下浓缩反应溶液，在冰冷却下将所得酐加入 2-(1,3-二甲基丁基)-4-[1-甲氧基-2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺(345mg, 1mmol)与三乙胺(150mg, 1.5mmol)的四氢呋喃(10ml)溶液中，然后将所得混合物在回流下加热 2 小时。反应混合物用乙酸乙酯稀释，然后用水洗涤。有机层经无水硫酸镁干燥，然后在减压下浓缩，分离所得残余物，经过硅胶柱色谱纯化（己烷：乙酸乙酯 = 1:2），得到 200mg 所需化合物。

物理性质：熔点 94 - 96°C。收率：41%。

实施例 3-1

2-(1-羟基-1,4-二甲基戊基)苯胺的制备

向乙醚(15ml)加入镁(960mg, 40mmol)，再加入催化量的碘，然后向其中缓慢加入异戊酰溴(6.04g, 40mmol)，同时回流，将所得混合物在回流温度下搅拌 30 分钟，然后在室温下搅拌 30 分钟。在冰冷却下向所得溶液加入 2-氨基苯乙酮(1.8g, 13.3mmol)，然后在室温下搅拌 3 小时。向其中加入氯化铵，所得混合物用乙酸乙酯稀释，用水洗涤。有机层经硫酸镁干燥，然后在减压下浓缩，得到 2.7g 2-(1-羟基-1,4-二甲基戊基)苯胺。

物理性质：¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ值(ppm)]

7.10-7.00 (m, 2H), 6.72-6.60 (m, 2H), 4.00-3.70 (br, 2H), 2.03 (m, 2H), 1.61 (s, 3H),

1.50 (m, 2H), 1.20-1.00 (m, 1H), 0.90-0.83
(m, 6H).

收率: 99%.

实施例 3-2

2-(1,4-二甲基戊基)苯胺的制备

将 2.7g (13.1mol) 实施例 3-1 所得 2-(1-羟基-1,4-二甲基戊基)苯胺用甲苯稀释后, 向其中加入对-甲苯磺酸一水合物(225mg), 利用迪安-斯塔克捕集器使所得混合物脱水, 同时回流 3 小时。将反应混合物用乙酸乙酯稀释, 然后用碳酸氢钠水溶液和饱和氯化钠水溶液洗涤。有机层经硫酸镁干燥, 然后在减压下浓缩。将所得残余物溶于乙醇, 然后向其中加入 5% 钨-碳(100mg), 将所得混合物在室温氢气氛下搅拌 12 小时。通过 C 盐过滤反应混合物, 在减压下浓缩残余物, 得到 2.2g 2-(1,4-二甲基戊基)苯胺。

物理性质: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 值(ppm)]

7.10 (dd, 2H), 7.02 (dt, 1H), 6.79 (dt, 1H),
6.69 (dd, 1H), 3.67 (bs, 2H), 2.68 (m, 1H),
1.80-1.42 (m, 4H), 1.30-1.10 (m, 5H),
0.87 (d, 6H).

收率: 87%.

实施例 3-3

2-(1,4-二甲基戊基)-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺的制备

将实施例 3-2 所得 2-(1,4-二甲基戊基)苯胺(1.8g, 9.4mmol)溶于由 t-丁基甲基醚与水按 1:1 组成的溶液(50ml)。向所得溶液加入 1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基碘(2.78g, 9.4mmol)、四-n-丁基铵硫酸氢盐(318mg, 0.94mmol)、碳酸氢钠(795mg, 9.4mmol)、然后是连二亚硫酸钠(1.63g, 9.4mmol), 将所得混合物在室温下搅拌 12 小时。将反应混合物用己烷稀释, 用 3N 盐酸洗涤两次, 然后用碳酸氢钠水溶液和饱和

氯化钠水溶液洗涤。有机层经硫酸镁干燥，然后在减压下浓缩，得到 3.28g 所需化合物。

物理性质: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 值(ppm)]

7.26(s, 1H), 7.21(d, 1H), 6.72(d, 1H),
4.05-3.80(br, 2H), 2.67(m, 1H), 1.78-
1.40(m, 4H), 1.30-1.00(m, 5H), 0.85(d,
6H).

收率: 97%.

实施例 3-4

2-(1,4-二甲基戊基)-4-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺(化合物 No. 5-15)的制备

除了使用 2-(1,4-二甲基戊基)-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺代替 2-(1,3-二甲基丁基)-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺以外，按照与实施例 1-1 相同的方式进行反应 4 小时，得到所需化合物。

收率: 82%.

实施例 3-5

N-{2-(1,4-二甲基戊基)-4-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-5-氯-1,3-二甲基吡唑-4-羧酰胺(化合物 No. 1-146)的制备

将 5-氯-1,3-二甲基吡唑-4-羧酸(349mg, 2mmol)溶于亚硫酸氯(10ml)，将溶液在回流温度下搅拌 2 小时。在减压下浓缩后，在冰冷却下将所得酰氯加入到 2-(1,4-二甲基戊基)-4-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]苯胺(682mg, 2mmol)与三乙胺(300mg, 3mmol)的四氢呋喃(20ml)溶液中，将所得混合物在回流温度下搅拌 2 小时。反应混合物用乙酸乙酯稀释，然后用水洗涤。有机层经无水硫酸镁干燥，然后在减压下浓缩，分离所得残余物，经过硅胶柱色谱纯化(己烷:乙酸乙酯 = 2:3)，得到 200mg 所需化合物。

物理性质: 折光指数 1.4905 (20.4°C)。收率: 41%.

实施例 4-1

4-碘-2-(1,3-二甲基丁基)苯胺的制备

在甲醇中溶解 2.53g (10mmol)碘, 在冰冷却下向其中加入 2-(1,3-二甲基丁基)苯胺(1.77g, 10mmol), 然后向其中加入碳酸氢钠水溶液(1.26g, 15mmol), 将所得混合物在 0°C 下搅拌 4 小时。向反应混合物加入硫代硫酸钠, 在减压下浓缩所得混合物, 用乙酸乙酯稀释, 然后用水洗涤。有机层经硫酸镁干燥, 分离残余物, 经过硅胶柱色谱纯化(己烷:乙酸乙酯 = 10:1), 得到 2.71g 所需化合物。

收率: 89%。

实施例 4-2

2-(1,3-二甲基丁基)-4-五氟乙基苯胺的制备

向二甲基亚砷(10ml)加入 4-碘-2-(1,3-二甲基丁基)苯胺(1.35g, 4.45mmol)、铜粉(0.85g, 13.4mmol)和五氟乙基碘(1.42g, 5.77mmol), 将所得混合物在 130°C 下搅拌 4 小时。通过 C 盐过滤混合物, 滤液用乙酸乙酯稀释, 用水洗涤 4 次。有机层经硫酸镁干燥, 然后在减压下浓缩, 得到 1.24g 所需化合物。

物理性质: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 值(ppm)]

7.26(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.70(d, 1H),
4.00-3.85(br, 2H), 3.00(m, 1H), 1.68-
1.50(m, 2H), 1.48-1.30(m, 1H), 1.22(t,
3H), 0.94(m, 6H)。

收率: 95%。

实施例 4-3

2-(1,3-二甲基丁基)-4-(2,2,2-三氟乙基)苯胺(化合物 No. 5-17)的制备

将氢化铝锂(1.62g, 4.26mmol)溶于四氢呋喃(20ml), 然后向其中滴加 2-(1,3-二甲基丁基)-4-五氟乙基苯胺(974mg, 3.3mmol), 将所得混合物在回流温度下搅拌 3 小时。在冰冷却下分小批量向反应混合物加入水, 然后搅拌 10 分钟。向其中加入硫酸镁, 然后搅拌 10 分钟。通过

C 盐过滤反应混合物，在减压下浓缩滤液，然后分离残余物，经过硅胶柱色谱纯化（己烷：乙酸乙酯 = 9:1），得到 260mg 所需化合物。

收率：30%。

实施例 5-1

2-(1,3-二甲基丁基)-4-九氟丁基苯胺的制备

除了使用九氟丁基碘代替五氟乙基碘以外，按照与实施例 4-2 相同的方式进行反应 4 小时，得到所需化合物。

物理性质： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 值(ppm)]

7.25 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.71 (d, 1H),
4.02-3.85 (m, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.68-
1.50 (m, 2H), 1.50-1.35 (m, 1H), 1.22 (d,
3H), 0.90 (t, 6H).

收率：90%。

实施例 5-2

2-(1,3-二甲基丁基)-4-(2,2,3,3,4,4,4-七氟己基)苯胺(化合物 No. 5-18)的制备

除了使用 2-(1,3-二甲基丁基)-4-九氟丁基苯胺代替 2-(1,3-二甲基丁基)-4-五氟乙基苯胺以外，按照与实施例 4-3 相同的方式搅拌 3 小时，得到所需化合物。

收率：92%。

实施例 6-1

2-(1,3-二甲基丁基)-4-十三氟己基苯胺的制备

除了使用十三氟己基碘代替五氟乙基碘以外，按照与实施例 4-2 相同的方式进行反应 4 小时，得到所需化合物。

物理性质： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 值(ppm)]

7.25 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.71 (d, 1H),
4.05-3.87 (m, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.68-
1.50 (m, 2H), 1.48-1.30 (m, 1H), 1.22 (d,

3H), 0.90 (t, 6H).

收率: 87%.

实施例 6-2

2-(1,3-二甲基丁基)-4-(2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,6-十一氟己基)苯胺(化合物 No. 5-19)的制备

除了使用 2-(1,3-二甲基丁基)-4-十三氟己基苯胺代替 2-(1,3-二甲基丁基)-4-五氟乙基苯胺以外, 按照与实施例 4-3 相同的方式搅拌 3 小时, 得到所需化合物。

收率: 85%.

实施例 7-1

2-(1,3-二甲基丁基)-4-十七氟辛基苯胺的制备

除了使用十七氟辛基碘代替五氟乙基碘以外, 按照与实施例 4-2 相同的方式进行反应 4 小时, 得到所需化合物。

物理性质: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 值(ppm)]

7.24 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.70 (d, 1H),
4.05-3.85 (br, 2H), 2.78 (m, 1H), 1.67-
1.50 (m, 3H), 1.50-1.32 (m, 1H), 1.21 (d,
3H), 0.89 (t, 6H).

收率: 40%.

实施例 7-2

2-(1,3-二甲基丁基)-4-(2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,6-十五氟辛基)苯胺(化合物 No. 5-20)的制备

除了使用 2-(1,3-二甲基丁基)-4-十七氟辛基苯胺代替 2-(1,3-二甲基丁基)-4-五氟乙基苯胺以外, 按照与实施例 4-3 相同的方式搅拌 3 小时, 得到所需化合物。

收率: 58%.

含有本发明由式(I)代表的取代的酰基苯胺衍生物或其盐作为活性

成分的农艺药品、尤其是农艺杀虫剂或杀螨剂适合于防治各种有害昆虫，例如农艺有害昆虫、储存谷物有害昆虫、卫生有害昆虫、线虫等，这些对稻谷、果树、蔬菜、其他作物、花卉和观赏植物等是有害的。它们具有显著的杀虫效果，例如对鳞翅目，包括棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana fasciata*)、茶小卷叶蛾 (*Adoxophyes* sp.)、苹小食心虫 (*Grapholitha inopinata*)、梨小食心虫 (*Grapholitha molesta*)、大豆食心虫 (*Leguminovora glycinivorella*)、桑小卷蛾 (*Olethreutes mori*)、茶细蛾 (*Caloptilia thevivor*)、猛花细蛾 (*Caloptilia zachrysa*)、金纹小潜细蛾 (*Phyllonorycter ringoniella*)、梨潜皮细蛾 (*Spulerina astaurota*)、茶粉蝶日本亚种 (*Pieris rapae crucivora*)、烟芽夜蛾 (*Heliothis* sp.)、苹果皮小卷蛾 (*Laspeyresia pomonella*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、苹果银蛾 (*Argyresthia conjugella*)、桃柱果蛾 (*Carposina niponensis*)、二化螟 (*Chilo suppressalis*)、稻纵卷叶野螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、烟草粉斑螟 (*Ephestia elutella*)、桑绢野螟 (*Glyphodes pyloalis*)、三化螟 (*Scirpophaga incertulas*)、直纹稻弄蝶 (*Parnara guttata*)、粘虫 (*Pseudaletia separata*)、稻蛀茎夜蛾 (*Sesamia inferens*)、斜纹贪夜蛾 (*Spodoptera litura*)、贪夜蛾 (*Spodoptera exigua*)等；半翅目，包括二点叶蝉 (*Macrostelus fascifrons*)、黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*)、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、橘木虱 (*Diaphorina citri*)、日本葡萄粉虱 (*Aleurolobus taonabae*)、甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*)、温室粉虱 (*Trialetodes vaporariorum*)、萝卜蚜 (*Lipaphis erysimi*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、角蜡蚧 (*Ceroplastes ceriferus*)、橘绵蚧 (*Pulvinaria aurantii*)、樟网盾蚧 (*Pseudaonidia duplex*)、圣琼斯康盾蚧 (*Comstockaspis perniciosus*)、矢尖盾蚧 (*Unaspis yanonensis*)等；垫刃线虫科，包括短体线虫属 (*Pratylenchus* sp.)、多色异丽金龟 (*Anomala rufocuprea*)、日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*)、烟草窃蠹 (*Lasioderma serricorne*)、褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、马铃薯瓢虫 (*Epilachna vigintiotopunctata*)、绿豆象 (*Callosobruchus chinensis*)、蔬菜象 (*Listroderes costirostris*)、玉米象 (*Sitophilus*

zeamais)、棉铃象(*Anthonomus grandis grandis*)、稻水象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、黄守瓜(*Aulacophora femoralis*)、水稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、黄曲条菜跳甲(*Phyllotreta striolata*)、纵坑切梢小蠹(*Tomicus piniperda*)、马铃薯叶甲(*Leptinotarsa decemlineata*)、Mexican bean beetle (*Epilachna varivestis*)、corn rootworm (*Diabrotica sp.*)等；双翅目，包括瓜寡鬃实蝇(*Dacus (Zeugodacus) cucurbitae*)、橘实果蝇(*Dacus (Bactrocera) dorsalis*)、大麦毛眼水蝇(*Agnomyza oryzae*)、葱地种蝇(*Delia antiqua*)、灰地种蝇(*Delia platura*)、soybean pod gall midge (*Asphondylia sp.*)、家蝇(*Musca domestica*)、尖音库蚊(*Culex pipiens pipiens*)等；垫刃线虫科，包括短体线虫(*Pratylenchus sp.*)、咖啡短体线虫(*Pratylenchus coffeae*)、马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*)、根结线虫(*Meloidogyne sp.*)、半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*)、*Aphelenchus sp.* (*Aphelenchus avenae*)、菊叶芽滑刃线虫(*Aphelenchoides ritzemabosi*)等；和螨目，包括柑橘全爪螨(*Panonychus citri*)、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*)、朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、神泽氏叶螨(*Tetranychus Kanzawai Kishida*)、二斑叶螨(*Tetranychus urticae Koch*)、茶兴叶瘿螨(*Acaphylla theae*)、橘刺皮瘿螨(*Aculops pelekassi*)、龙首丽瘿螨(*Calacarus carinatus*)、梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*)等。

含有由通式(I)代表的取代的酰基苯胺衍生物的农艺药品也可用作农艺杀真菌剂，它们对各种病害表现非常高的杀真菌效果。本发明化合物表现显著效果的具体病害实例包括稻瘟病(*Pyricularia oryzae*)、稻叶鞘枯锈病(*Rhizoctonia solani*)、稻胡麻斑病(*Cochliobolus miyabeanus*)、各种宿主植物的白粉病，例如大麦和小麦的白粉病(*Erysiphe graminis*)，燕麦冠锈病(*Puccinia coronata*)、其他植物的茎锈病、番茄晚疫病(*Phytophthora infestans*)、其他植物的晚疫病、各种植物的晚疫病或疫霉腐病，例如黄瓜霜霉病(*Pseudoperonospora cubensis*)、葡萄霜霉病(*Plasmopara viticola*)等，苹果黑星病(*Venturia inaequalis*)、苹果轮斑落叶病(*Alternaria mali*)、梨黑斑病(*Alternaria*

kikuchiana)、柑桔褐蒂腐病(*Diaporthe citri*)、由假单孢菌属引起的细菌疾病,例如黄瓜白叶枯病(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)和马铃薯青枯病(*Pseudomonas solanacearum*),由黄杆菌属引起的细菌疾病,例如甘蓝黑腐病(*Xanthomonas campestris*)、稻白叶枯病(*Xanthomonas oryzae*)和柑桔溃疡病(*Xanthomonas citri*),由欧文氏菌属引起的细菌疾病,例如卷心菜软腐病(*Erwinia carotovora*),和病毒疾病,例如烟草普通花叶病(tobacco mosaic virus)等。

含有本发明由通式(I)代表的取代的酰基苯胺衍生物或其盐作为活性成分的农艺药品、尤其是农艺杀虫剂对上述例证的有害昆虫具有显著的杀虫效果,这些对稻田作物、旱地作物、果树、蔬菜、其他作物、花卉和观赏植物等是有害的。因此,在有害昆虫预期出现的季节、在它们出现之前或者在确认它们出现之时,将本发明农艺杀虫剂施用于稻田水、果树茎与叶、蔬菜、其他作物、花卉和观赏植物、土壤等,可以获得本发明农艺杀虫剂的所需效果。

一般按照普通的农用化学品制备方法将本发明的农艺杀虫剂制成常用的剂型。

也就是说,将通式(I)取代的酰基苯胺衍生物或其盐和可选的助剂按适当比例与适合的惰性载体掺合,通过溶解、分散、悬浮、混合、浸渍、吸附或附着作用,制成适合的剂型,例如悬液、乳油、可溶性浓缩物、可湿性粉剂、颗粒剂、粉剂、片剂、药包等。

可用于本发明的惰性载体既可以是固体也可以是液体。作为可用作固体载体的原料,可供例证的是大豆粉、谷粉、木粉、树皮粉、锯屑、烟草茎粉、胡桃壳粉、糠、纤维素粉、蔬菜提取残余物、合成聚合物或树脂粉、粘土(例如高岭土、膨润土和酸性粘土)、滑石(例如滑石和寿山石)、二氧化硅粉或薄片(例如硅藻土、硅沙、云母和白炭(合成的高分散性硅酸,也称微细粉碎的水合二氧化硅或水合硅酸,有些商业上可得到的产品含有硅酸钙作为主要组分)、活性炭、硫粉、浮石、煅烧硅藻土、磨碎的砖、飞灰、沙子、碳酸钙、磷酸钙和其他无机或矿物粉末,化学肥料(例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素、

氯化铵)和堆肥。这些载体可以单独使用,或者作为混合物使用。

可用作液体载体的材料选自这样的材料,它们本身具有溶解性,或者虽然没有溶解性但是能够借助助剂分散活性成分。下面是液体载体的典型实例,它们可以单独使用,或者作为混合物使用:水、醇(例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇和乙二醇)、酮(例如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮、二异丁酮和环己酮)、醚(例如乙醚、二噁烷、溶纤剂、二丙醚和四氢呋喃)、脂族烃(例如煤油和矿物油)、芳族烃(例如苯、甲苯、二甲苯、溶剂汽油和烷基萘)、卤代烃(例如二氯乙烷、氯仿、四氯化碳和氯苯)、酯(例如乙酸乙酯、邻苯二甲酸二异丙基酯、邻苯二甲酸二丁基酯和邻苯二甲酸二辛基酯)、酰胺(例如二甲基甲酰胺、二乙基甲酰胺和二甲基乙酰胺)、腈(例如乙腈)和二甲基亚砷。

下面是助剂的典型实例,它们是根据目的而使用的,单独使用或者在有些情况下两种或以上助剂结合使用,或者根本不必使用。

为了乳化、分散、溶解和/或湿润活性成分,使用表面活性剂。作为表面活性剂,可供例证的是聚氧乙烯烷基醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯高级脂肪酸酯、聚氧乙烯树脂酸酯、聚氧乙烯脱水山梨醇一月桂酸酯、聚氧乙烯脱水山梨醇一油酸酯、烷基芳基磺酸盐、萘磺酸缩合产物、木素磺酸盐和高级醇硫酸盐。

进而,为了稳定作为活性成分的化合物分散系,增粘之和/或粘合之,还可以使用下面例证的助剂,也就是还可以使用酪蛋白、明胶、淀粉、甲基纤维素、羧甲基纤维素、阿拉伯胶、聚(乙烯醇)、松节油、糠油、膨润土和木素磺酸盐。

为了提高固体产品的可流动性,还可以使用下列助剂,也就是可以使用蜡、硬脂酸盐、烷基磷酸酯等。

诸如萘磺酸缩合产物和磷酸盐的缩聚物等助剂可以用作可分散产品的胶溶剂。

诸如硅酮油等助剂也可以用作消泡剂。

也可以加入诸如1,2-苯并异噻唑啉-3-酮、4-氯-3,5-二甲苯酚、对-羟基苯甲酸丁酯等助剂作为防腐剂。

进而，如果必要的话，也可以加入功能扩展剂，活性增强剂、例如代谢分解抑制剂（象胡椒基丁醚），防冻剂、例如丙二醇，抗氧化剂、例如 BHT，紫外吸收剂等。

作为活性成分的化合物含量可以因需要而异，作为活性成分的化合物的使用比例可以在 0.01 至 90 重量份每 100 份农业与园艺药剂的范围内加以适当选择。例如，在粉剂或颗粒剂中，作为活性成分的化合物的适合含量为 0.01 至 50 重量%。在乳油或可流动的可湿性粉剂中，含量也是 0.01 至 50 重量%。

本发明的农艺药品用于以下列方式防治各种有害昆虫：将其本身或者用水等适当稀释或悬浮后，施用于预期出现有害昆虫的农作物或者不希望有害昆虫出现或生长的位置，用量对防治有害昆虫来说是有效的。

本发明的农艺杀虫剂的施用剂量因各种因素而异，例如目的、所要防治的有害昆虫、植物的生长状态、有害昆虫出现的趋势、天气、环境条件、剂型、施药方法、施药位置和施药时间。根据目的，可以在每 10 公顷 0.001g 至 10kg（以作为活性成分的化合物计）、优选为 0.01g 至 1kg 的范围内加以适当选择。

本发明的农艺药品可以与其他农艺杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生物农药等结合使用，目的是扩大可防治有害昆虫种类的范围，延长有效施药时间或者减少剂量。此外，本发明的农艺杀虫剂可以与除草剂、植物生长调节剂、肥料等结合使用，这因施药情形而异。

作为用于上述目的的其他农艺杀虫剂、杀螨剂和杀线虫剂，可供例证的农艺杀虫剂、杀螨剂和杀线虫剂例如乙硫磷、敌百虫、甲胺磷、高灭磷、敌敌畏、速灭磷、久效磷、马拉松、乐果、安果、灭蚜磷、蚜灭多、甲基乙拌磷、乙拌磷、异砒磷、二溴磷、甲基一六零五、杀螟松、杀螟腈、丙虫磷、倍硫磷、丙硫磷、丙溴磷、丙胺磷、双硫磷、稻丰散、甲基毒虫畏、毒虫畏、杀虫畏、膈肪磷、异噁唑磷、吡唑硫磷、杀扑磷、毒死蜱、甲基毒死蜱、打杀磷、二嗪农、虫螨磷、伏杀

磷、亚胺硫磷、杀抗松、喹噁磷、特丁磷、灭克磷、硫线磷、甲亚砷磷、DPS (NK-0795)、乙丙磷威、克线磷、isoamidophos、噻唑酮磷、氯唑磷、灭克磷、倍硫磷、伐线丹、除线磷、硫磷嗪、乙丙硫磷、丰索磷、除线特、除虫菊酯、丙烯菊酯、炔酮菊酯、苄呋菊酯、氯菊酯、七氯菊酯、氟氯菊酯、甲氟菊酯、氯氟菊酯、 α -氯氟菊酯、(RS)氯氟菊酯、 λ -(RS)氯氟菊酯、溴氟菊酯、氟酯菊酯、杀灭菊酯、高氟戊菊酯、氟氟戊菊酯、氟胺氟菊酯、乙氟菊酯、醚菊酯、卤醚菊酯、灭虫硅醚、氟胺氟菊酯、灭多虫、甲氧叉威、硫双灭多威、涕灭威、棉铃威、巴丹、速灭威、灭杀威、残杀威、phenoxycarb、丁苯威、苯虫威、苯硫威、联苯胍酯、BPMC、西维因、抗蚜威、虫螨威、丁硫克百威、呋线威、丙硫克百威、砒灭威、杀螨硫隆、氟脲杀、伏虫隆、氟铃脲、双苯氟脲、氟丙氧脲、氟虫脲、定虫隆、杀螨锡、三环锡、油酸钠、油酸钾、蒙五一五、蒙五一二、乐杀螨、虫螨脲、开乐散、Kersen、Chlorobenzilate、溴螨酯、三氯杀螨砒、杀虫磺、苯螨特、双苯酰肼、甲氧苯酰肼、chromafenozide、克螨特、杀螨醌、硫丹、噁茂醚、氟唑虫清、唑螨酯、tolfenpyrad、锐劲特、吡螨胺、唑蚜威、特苯噁唑、噻螨酮、烟碱、硝胺烯啶、吡虫清、thiacloprid、吡虫啉、thiamethoxam、clothianidin、nidinotefuran、氟啶胺、蚊蝇醚、灭蚁脞、噻胺苯醚、哒螨酮、灭蝇胺、TPIC (异氰尿酸三丙酯(tripropyl isocyanurate))、拒嗉酮、四螨嗪、buprofedin、硫环杀、喹螨醚、灭螨猛、噁二唑虫、素酯混剂、米尔螨素、齐墩螨素、emamectin-benzoate、艾克敌 105、BT (苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*))、艾扎丁、鱼藤酮、羟丙基淀粉、保松塞、威百亩、Morantel tartrate、棉隆、杨菌胺、侵入巴斯德氏芽菌(*Pasteuria penetrans*)、*Monacrosporium phymatophagum* 等。作为用于上述相同目的的农艺杀真菌剂，可供例证的农艺杀真菌剂例如硫磺、石硫合剂、碱性硫酸铜、异稻瘟净、克瘟散、甲基立枯磷、福美双、福代锌、代森锌、代森锰、代森锰锌、甲基代森锌、托布津、甲基托布津、苯菌灵、双胍辛醋酸盐(Iminoctadin acetate)、双八胍盐(Iminocutadin albecylate)、丙氧灭锈胺、氟酰胺、

戊菌隆、吡唑灵、溴氟唑菌、甲霜灵、噁霜灵、氯环丙酰胺、抑菌灵、磺菌胺、百菌清、亚胺菌、fenoxanil (NNF-9425)、himexazol、氯唑灵、氟菌安、杀菌利、烯菌酮、异丙定、三唑酮、氟菌唑、双苯三唑醇、环戊唑醇、fluconazole、丙环唑、diphenconazole、腈菌唑、氟醚唑、己唑醇、戊唑醇、酰胺唑、丙氯灵、稻瘟酯、环唑醇、富士一号、异噻菌醇、二甲噻菌胺、噻菌胺、啉斑肱、氟啉胺、噻氮灵、吡菌清、腈噻菌酯、代森环、克菌丹、噻菌灵、噻二唑素-S-甲基 (CGA-245704)、四氯苯酞、三环唑、咯嗪酮、灭螨猛、啞菌酮、二噻农、春雷霉素、有效霉素、多氧霉素、灭瘟素、链霉素等。类似地，作为除草剂，可供例证的除草剂例如草甘膦、草硫膦、草甘双膦 (Glyphosate)、双丙氨酰膦、草胺磷、禾草畏、苄草丹、杀草丹、稗草畏、黄草灵、利谷隆、香草隆、苄噻黄隆、环丙黄隆、醚黄隆、吡噻黄隆、四唑黄隆、啉咪黄隆、tenylchlor、草不绿、丙草胺、稗草胺、乙苯酰草、苯噻草胺、胺硝草、治草醚、氟锁草醚、乳氟禾草灵、cyhalofop-butyl、碘苯腈、溴丁酰草胺、枯杀达、稀禾定、草萘胺、indanofan、吡唑特、吡草酮、氟唑草酯、灭草烟、磺胺草唑、cafenstrole、bentoxazon、恶草灵、对草快、敌草快、肱啉草 (pyriminobac)、西玛津、阿特拉津、戊草津、苯氧丙胺津、benflesate、达草氟、啞禾灵、噻草平、过氧化钙等。

关于生物农药，使用本发明的农艺药品例如与下列的混合物，预期可以获得上述相同的效果：从细胞核多羟病毒(NPV)、微粒子病病毒(GV)、细胞质多羟病毒(CPV)、entomopox 病毒(EPV)等获得的病毒制剂；用作杀昆虫剂或杀线虫剂的微生物农药，例如 *Monacrosporium phymatophagum*、*Steinernema carpocapsae*、*Steinernema kushidai*、侵入巴斯德氏芽菌(*Pasteuria penetrans*)等；用作杀真菌剂的微生物农药，例如木质素木霉(*Trichoderma lignorum*)、放射形土壤杆菌(*Agrobacterium radiobacter*)、非致病的胡萝卜欧文氏杆菌(*Erwinia carotovora*)、枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*)等；和用作除草剂的生物农药，例如野油菜黄单孢菌(*Xanthomonas campestris*)等。

另外，本发明的农艺药品可以与生物农药结合使用，包括天敌，例如温室粉虱思蚜小蜂 (*Encarsia formosa*)、寄生蜂 (*Aphidius colemani*)、Gall-mildge (*Aphidoletes aphidimyza*)、豌豆潜叶蝇姬小蜂 (*Diglyphus isaea*)、寄生螨 (*Dacnusa sibirica*)、智利小植绥螨 (*Phytoseiulus persimilis*)、捕食螨 (*Amblyseius cucumeris*)、东亚小花椿 (*Orius sauteri*)等；微生物农药，例如 *Beauveria brongniartii* 等；和性外激素类，例如 (Z)-10-十四碳烯基=乙酸酯、(E,Z)-4,10-十四碳二烯基=乙酸酯、(Z)-8-十二碳烯基=乙酸酯、(Z)-11-十四碳烯基=乙酸酯、(Z)-13-二十碳烯-10-酮、(Z)-8-十二碳烯基=乙酸酯、(Z)-11-十四碳烯基=乙酸酯、(Z)-13-二十碳烯-10-酮、14-甲基-1-十八碳烯等。

下面描述本发明的典型实例，但是它们不应被解释为限制发明的范围。

实施例中所用的术语“份数”均以重量表示。

制剂例 1

表 1 至 4 所列各化合物	10 份
二甲苯	70 份
N-甲基吡咯烷酮	10 份
聚氧乙烯壬基苯基醚与烷基苯磺酸钙的混合物	10 份

将上述成分均匀混合进行溶解，制得乳油。

制剂例 2

表 1 至 4 所列各化合物	3 份
粘土粉	82 份
硅藻土粉	15 份

将上述成分均匀混合并研磨，制得粉剂。

制剂例 3

表 1 至 4 所列各化合物	5 份
膨润土与粘土的混合粉末	90 份
木素磺酸钙	5 份

将上述成分均匀混合，将所得混合物与适量水一起捏和，然后造

粒并干燥，制得颗粒剂。

制剂例 4

表 1 至 4 所列各化合物	20 份
高岭土与合成高分散性硅酸的混合物	75 份
聚氧乙烯壬基苯基醚与烷基苯磺酸钙的混合物	5 份

将上述成分均匀混合并研磨，制得可湿性粉剂。

试验例 1: 对小菜蛾(Plutella xylostella)的杀虫效果

释放成年小菜蛾，使其在中国卷心菜幼苗上产卵。释放后两天，将其上沉积有卵的幼苗浸入液体化学品达约 30 秒钟，液体化学品是这样制备的，稀释含有表 1 至 4 所列各化合物作为活性成分的制剂，调节浓度至 500ppm。风干后，放置在恒温在 25℃ 的房间内。浸入液体化学品后六天，统计孵化的昆虫，根据下列等式计算死亡率，由此根据下示标准判断杀虫效果。试验重复进行三组，每组 10 只昆虫。

$$\text{校正的死亡率(\%)} = \frac{\text{未处理组孵化昆虫数} - \text{处理组孵化昆虫数}}{\text{未处理组孵化昆虫数}} \times 100$$

判断标准:

- A--- 死亡率 100%
- B--- 死亡率 99-90%
- C--- 死亡率 89-80%
- D--- 死亡率 79-50%

结果，下列化合物被评为 B 级或以上：化合物 No. 1-2, 1-4, 1-10, 1-14, 1-17, 1-20, 1-21, 1-26, 1-28, 1-33, 1-35, 1-41, 1-48, 1-52, 1-56, 1-57, 1-58, 1-65, 1-70, 1-73, 1-82, 1-103, 1-107, 1-108, 1-132, 1-133, 1-143, 1-145, 1-146, 1-163, 1-164, 3-2, 3-3, 3-4, 3-10, 3-12, 4-1, 4-4 和 4-5。

试验例 2: 对茶小卷叶蛾(Adxophyes sp.)的杀虫作用

将茶叶浸入液体化学药品达约 30 秒钟，液体化学药品是这样制备的，稀释含有表 1 至 4 所列各化合物作为活性成分的制剂，调节浓度至 500ppm。风干后，将茶叶放置在直径 9cm 的塑料陪替氏培养皿中，

接种茶小卷叶蛾幼虫，然后将培养皿放置在恒温 25℃ 和 70%湿度的房间内。接种后八天，统计死亡的和存活的幼虫数。根据下列等式计算死亡率，根据试验例 1 所示标准判断杀虫效果。试验重复进行三组，每组 10 只昆虫。

$$\text{校正的死亡率(\%)} = \frac{\text{未处理组存活幼虫数} - \text{处理组存活幼虫数}}{\text{未处理组存活幼虫数}} \times 100$$

结果，下列化合物被评为 B 级或以上：化合物 No. 1-52, 1-60, 1-103, 3-12, 3-28, 3-30 和 3-31。

试验例 3：对二斑叶螨(Tetranychus urticae)的杀螨效果

取菜豆叶，制成直径 2cm 的叶片，置于湿滤纸上，接种雌性二点叶螨成虫，然后在转盘上均匀喷洒 50ml 液体化学药品，液体化学药品是这样制备的；稀释含有表 1 至 4 所列各化合物作为活性成分的制剂，调节浓度至 500ppm。喷洒后，将叶片置于恒温在 25℃ 的房间内。用制剂处理后两天，计数死亡的昆虫，根据试验例 1 所示标准判断杀螨效果。试验重复进行两次，每次 10 只昆虫。

上述试验的结果发现，下列化合物具有 B 级或以上的活性：1-22, 1-23, 1-25, 1-26, 1-34, 1-39, 1-40, 1-51, 1-52, 1-54, 1-60 至 1-62, 1-65, 1-70 至 1-73, 1-78, 1-81, 1-82, 1-103, 1-104, 1-106 至 1-109, 1-119, 1-132, 1-143, 1-146, 3-13, 3-21, 3-30 至 3-32 和 4-3。

试验例 4：对桃蚜(Myzus persicae)的杀虫效果

在每个直径 8cm、高 8cm 的塑料罐内种植中国卷心菜植株，在植株上有桃蚜繁殖。然后，向茎和叶充分喷洒液体化学药品，液体化学药品是这样制备的，稀释含有表 1 至 4 所列各化合物作为活性成分的制剂，调节浓度至 500ppm。风干后，将罐子放置在温室内。喷洒后六天，计数每株中国卷心菜植株上的桃蚜寄生虫，计算防治效果，由此根据下示标准判断杀螨效果。

$$\text{防治效果(\%)} = 100 - [(T \times Ca) / (Ta \times C)] \times 100$$

Ta: 处理组喷洒前的寄生虫数，

T: 处理组喷洒后的寄生虫数,
Ca: 未处理组喷洒前的寄生虫数,
C: 未处理组喷洒后的寄生虫数.

判断标准:

A: 防治效果 100%
B: 防治效果 99 至 90%
C: 防治效果 89 至 80%
D: 防治效果 79 至 50%

上述试验的结果发现, 下列化合物具有 B 级或以上的活性: 1-4, 1-8, 1-25, 1-35, 1-41, 1-52, 1-65, 1-81, 1-87, 1-106 至 1-108, 1-146, 3-27, 3-13, 3-34 和 4-1.

试验例 5: 对大麦白粉病的防治效果

向处于 1 叶期的罐栽大麦植物接种以白粉菌(*Erysiphe graminis hordei*)的孢子。一天后, 向它们喷洒液体化学药品, 液体化学药品是这样制备的, 稀释含有表 1、表 3 或表 4 所列各化合物作为活性成分的制剂, 调节浓度至 200ppm。然后, 将它们置于恒温在 25°C 的房间内。接种后一周, 测量每片叶子的损伤面积, 然后与未处理罐中的植物相比, 由此根据下列标准判断防治效果。

判断标准:

A: 防治效果 100 至 95%
B: 防治效果 94 至 80%
C: 防治效果 79 至 60%
D: 防治效果 59 至 0%

上述试验的结果发现, 下列化合物具有 B 级或以上的活性: 1-5, 1-12, 1-23, 1-30, 1-45, 1-47, 1-52, 1-54, 1-83, 1-133, 3-30, 3-31 和 4-3.