

[19]中华人民共和国专利局

[51]Int.Cl<sup>6</sup>



# [12] 发明专利申请公开说明书

C07D231 / 20  
C07D231 / 08 C07D401 / 04  
C07D403 / 04 A01N 43 / 56

[21] 申请号 95193600.X

[43]公开日 1997年5月28日

[11] 公开号 CN 1150800A

[22]申请日 95.4.25

[30]优先权

[32]94.5.3 [33]DE[31]P4415483.6

[86]国际申请 PCT / EP95 / 01554 95.4.25

[87]国际公布 WO95 / 29896 德 95.11.9

[85]进入国家阶段日期 96.12.13

[71]申请人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72]发明人 K·奥伯多尔夫 H·科尼格 B·穆勒

R·基尔斯根 W·格拉迈诺斯

H·萨特 G·劳伦兹 E·阿莫曼

V·哈里斯

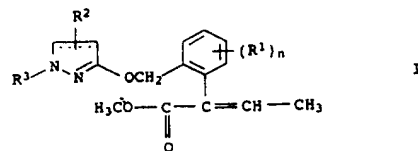
[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标  
事务所  
代理人 李 勇

权利要求书 2 页 说明书 43 页 附图页数 0 页

[54]发明名称  $\alpha$ -苯基丁烯酸甲酯

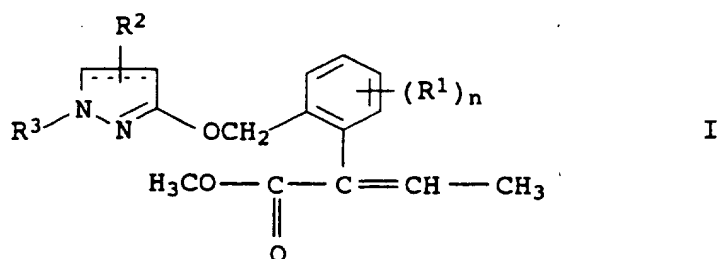
[57]摘要

公开了式 I 的  $\alpha$ -苯基丁烯酸甲酯, 其中二代表单键或双键, 符号和取代基具有下面含义: n 为 0, 1, 2, 3 和 4; R<sup>1</sup> 代表硝基、氰基、卤素、烷基、卤代烷基或烷氧基; R<sup>2</sup> 代表氢、硝基、氰基、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、硫代烷基或烷氧基羰基; R<sup>3</sup> 代表任意被取代的烷基、链烯基或炔基; 任意被取代的饱和或单或二不饱和环, 它除开碳原子外, 可含有 1—3 个选自氧、硫和氮的杂原子作为环原子, 或任意被取代的单或双核芳基, 它除碳原子外, 可含有 1—4 个氮原子或一或二个氮原子和一个氧或硫原子或一个氧或硫原子作为环原子。还公开了制备所述化合物的方法和它抵抗有害真菌或动物害虫的用途。



# 权 利 要 求 书

## 1. 式 I 所示 $\alpha$ -苯基丁烯酸甲酯



其中：— 为单键或双键，符号和取代基具有下面含义：

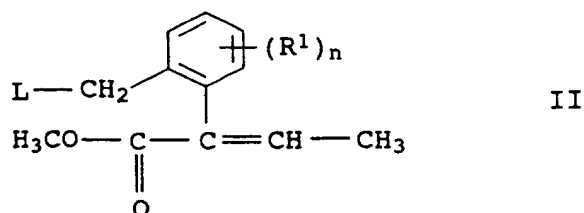
$n$  为 0、1、2、3 或 4，如果  $n$  大于 1，取代基  $R^1$  可不相同；

$R^1$  为硝基、氟基、卤素、 $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  卤代烷基或  $C_1 - C_4$  烷氧基；

$R^2$  为氢、硝基、氟基、卤素、 $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  卤代烷基、 $C_1 - C_4$  烷氧基、 $C_1 - C_4$  烷硫基或  $C_1 - C_4$  烷氧基羰基；

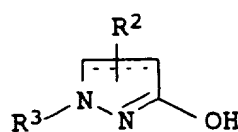
$R^3$  为：未取代或取代的烷基、链烯基或炔基；未取代或取代的饱和或者单或双不饱和环，该环除碳原子外，还可含有一至三个下述杂原子作为环原子：氧、硫和氮；或者未取代或取代的单或双核芳香基团，它除碳原子外，还可含有一至四个氮原子或者一或二个氮原子和一个氧或硫原子或者一个氧或硫原子作为环原子。

2. 一种制备权利要求 1 的式 I 化合物的方法，它包括在碱存在下使式 II 苯基衍生物



其中的 L 为可亲核置换的基团

与式 III 3-羟基(二氢)吡唑反应



III.

3. 一种适宜于防治有害真菌的混合物, 含有惰性添加剂和活性量的权利要求 1 的式 I 化合物。

4. 一种适宜于防治动物害虫的混合物, 含有惰性添加剂和活性量的权利要求 1 的式 I 化合物。

5. 一种防治有害真菌的方法, 它包括用活性量的权利要求 1 的式 I 化合物处理有害真菌, 它们的生长环境或植物、表面、材料或场地。

6. 一种防治动物害虫的方法, 它包括用活性量的权利要求 1 的式 I 化合物处理害虫, 它们的生长环境或植物、表面、材料或场地。

7. 权利要求 1 的化合物 I 在制备适宜于防治有害真菌的混合物中的应用。

8. 权利要求 1 的化合物 I 在制备适宜于防治动物害虫的混合物中的应用。

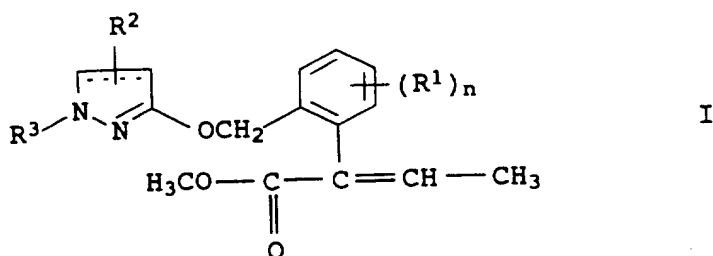
9. 权利要求 1 的化合物 I 在防治有害真菌中的应用。

10. 权利要求 1 的化合物 I 在防治动物害虫中的应用。

# 说明书

## $\alpha$ -苯基丁烯酸甲酯

本发明涉及式 I 的  $\alpha$ -苯基丁烯酸甲酯



其中：= 为单键或双键，符号和取代基具有下列含义：

n 为 0、1、2、3 或 4，如果 n 大于 1，取代基  $R^1$  可以不相同；

$R^1$  为硝基、氟基、卤素、 $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  卤代烷基或  $C_1 - C_4$  烷氧基；

$R^2$  为氢、硝基、氟基、卤素、 $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  卤代烷基、 $C_1 - C_4$  烷氧基、 $C_1 - C_4$  烷硫基或  $C_1 - C_4$  烷氧基羰基；

$R^3$  为未取代或取代的烷基、链烯基或炔基；未取代或取代的饱和或者单或双不饱和环，该环除碳原子外，可含有一至三个下列杂原子作为环原子、氧、硫和氮；或者未取代或取代的单或双核芳族基团，该芳族基团除碳原子外，可含有一至四个氮原子或者一或二个氮原子和一个氧或硫原子或一个氧或硫原子作为环原子。

本发明还涉及制备这些化合物的方法和含有它们的混合物及它们用于防治有害真菌或动物害虫的用途。

EP-A 513580 公开了具有抗有害真菌或动物害虫活性的  $\alpha$ -苯基丁烯酸甲酯，它在邻位上带有 4-吡啶基-氧亚甲基。然而，在低的使用比例时，这些化合物的活性不能令人满意。

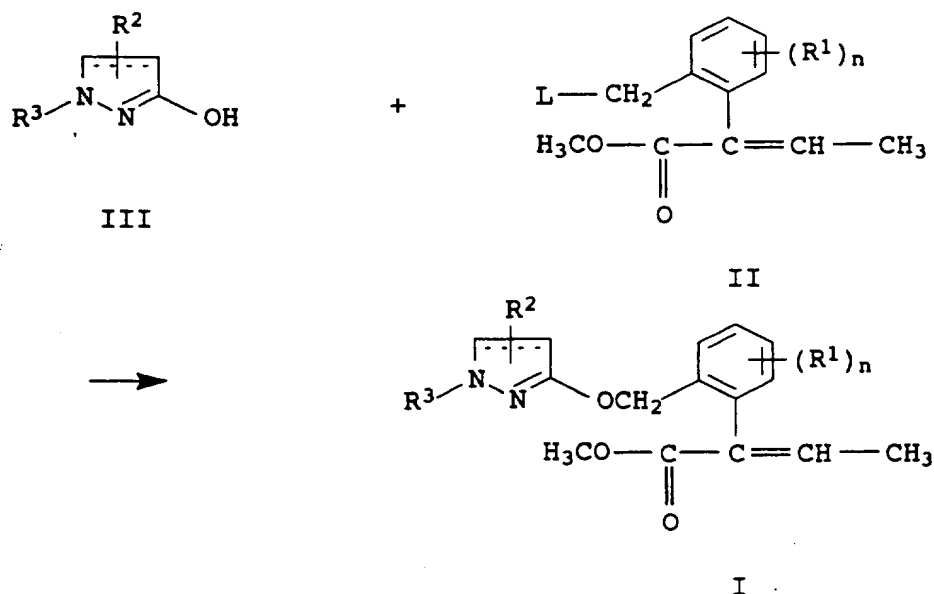
本发明的一个目的是提供具有改进活性的化合物。

我们发现这一目的已通过开头定义的化合物 I 达到。此外，我们已找到了它们的制备方法，含有它们的混合物以及使用化合物 I

防治有害真菌和动物害虫的方法。

化合物 I 可通过文献上本质已知的各种方法制备。

例如,在碱存在的情况下,通过将式 II 的苄基衍生物与式 III 的 3-羟基(二氢)-吡唑反应可制得化合物 I。



式 II 中的 L 为可亲核置换基团,例如卤素,如氯、溴或碘,或烷基-或芳基磺酸酯,如甲基磺酸酯、三氯甲基磺酸酯、苯基磺酸酯或 4-甲基苯基磺酸酯。

反应通常在 0℃ 至 80℃ 下进行,优选为 20℃ 至 60℃。

适宜的溶剂为:芳香烃,例如甲苯,邻-、间-和对-二甲苯;卤代烃,例如二氯甲烷、氯仿和氯苯;醚,例如二乙基醚、二异丙基醚、叔丁基甲基醚、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃;腈,例如乙腈和丙腈;醇,例如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇;酮,例如丙酮和甲基乙基酮;还有二甲亚砜、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、1,3-二甲基咪唑烷-2-酮和 1,2-二甲基四氢-2(1H)-嘧啶,优选二氯甲烷、丙酮和二甲基甲酰胺。还可使用上述溶剂的混合物。

适宜的碱一般为:无机化合物,如碱金属和碱土金属氢氧化物(如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾和氢氧化钙),碱金属和碱土金属氧化物(如氧化锂、氧化钠、氧化钙和氧化镁),碱金属和碱土金属氢

化物(如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙),碱金属氢化物(如氨基锂、氨基钠和氨基钾)。碱金属和碱土金属碳酸盐(如碳酸锂和碳酸钙),还有碱金属碳酸氢盐(如碳酸氢钠);有机金属化合物,尤其是碱金属烷基化物(如甲基锂、丁基锂和苯基锂),卤化烷基镁(如氯化甲基镁),还有碱金属和碱土金属醇盐(如甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾和二甲氧基镁);另外还有有机碱,如叔胺,例如三甲胺、三乙胺、三异丙基乙胺和N-甲基吡啶、吡啶,取代的吡啶,例如可力丁、卢别啶和4-二甲氨基吡啶以及二环胺。

尤其优选氢氧化钠、碳酸钾和叔丁醇钾。

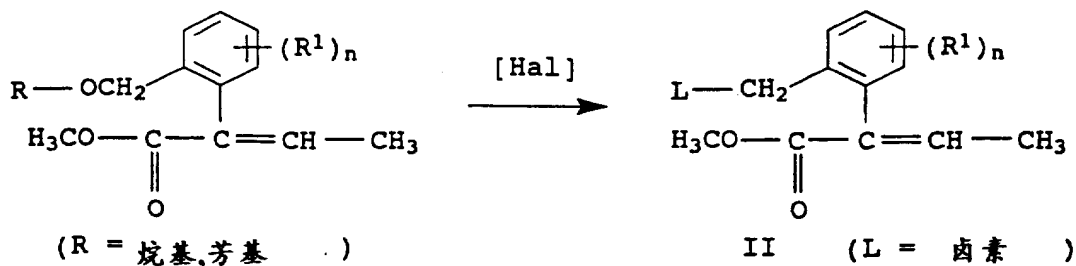
碱通常以等摩尔量、过量使用,或者(如果适宜)则作为溶剂使用。

加入催化量的冠醚(如18-冠-6或15-冠-5)对于反应可能是有利的。

反应还可在由碱金属或碱土金属氢氧化物或碳酸盐的水溶液和有机相(如芳香和/或卤代烃)组成的两相体系中进行。在这种情况下,适宜的相转移催化剂为:例如卤化铵和四氟硼酸铵(如氯化苄基三乙基铵、溴化苄基三丁基铵、氯化四丁基铵、溴化十六烷基三甲基铵或四氟硼酸四丁基铵)以及卤化镆(如四丁基氯化镆和四苄基溴化镆)。

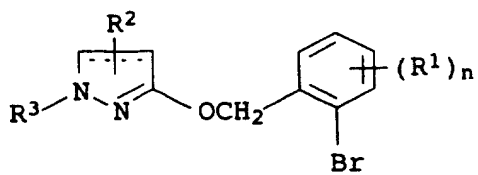
首先用碱将3-羟基(二氢)吡唑转化成相应的羟基化物,接着与苄基衍生物反应对于反应可能是有利的。

化合物I的制备所需的起始物II公开在EP-A 513580中。其中L为氯或溴的化合物II相应地通过在-30°C至40°C下在惰性溶剂(如卤代和/或芳香烃)中将适宜的醚(烷基或芳基醚)与卤化剂[Hal]反应而获得。

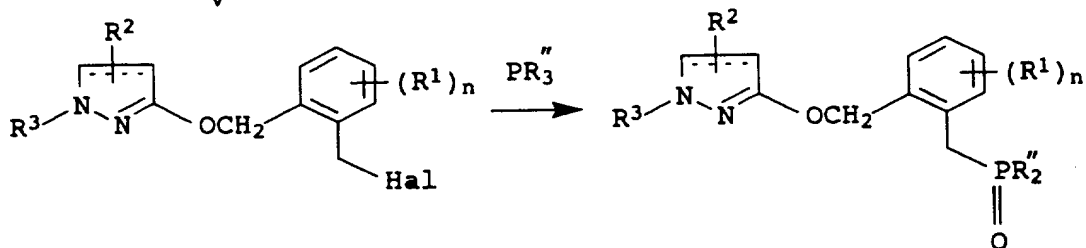
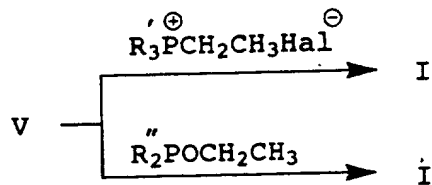
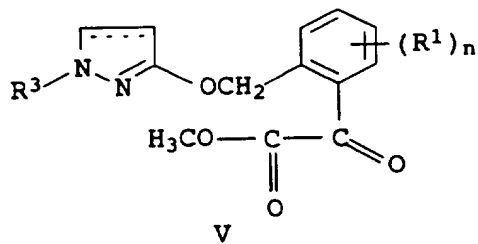


3-羟基吡唑 IIIa 和 3-羟基二氢吡唑 IIIb(或它们的互变异构体:3-吡唑啉酮)从文献中已知或可通过其中描述[IIIa:J. Heterocycl. Chem. 30(1993), 49; Chem. Ber. 107(1974), 1318; Chem. Pharm. Bull. 19(1971), 1389; Tetrahedron Lett. 11(1970), 875; Chem. Heterocycl. Comp. 5(1969), 527; Chem. Ber. 102(1969), 3260; Chem. Ber. 109(1976), 261; J. Org. Chem. 31(1966), 1538; Tetrahedron 43(1987), 607; IIIb:J. Med. Chem. 19(1976), 715]的方法制备。

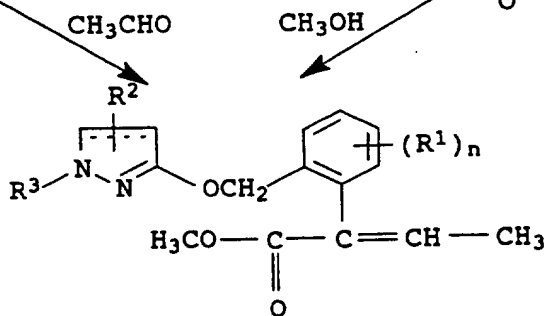
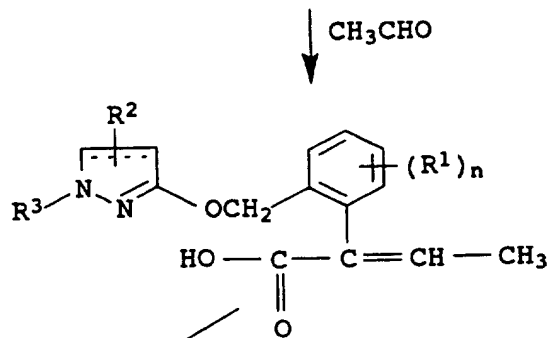
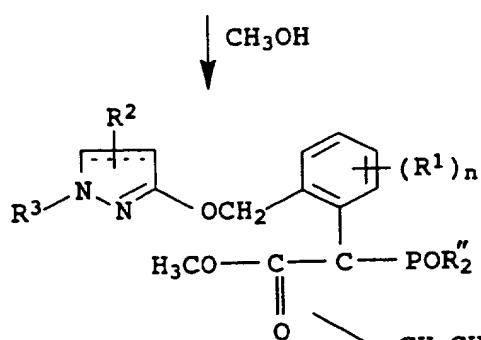
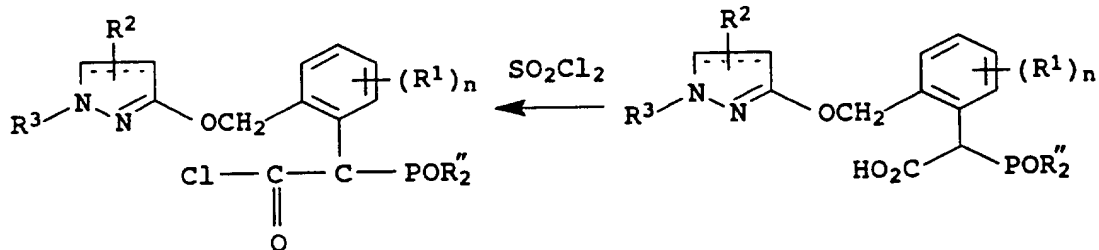
通过编集在下列反应线路的过程,按与 EP-A 513580 中描述的方法类似的方式获得化合物 I(关于反应条件,可以参考 EP-A 513580 中的说明,它的公开内容并入到本文中)。



1) Mg 或 BuLi  
2) H<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>C-COCl



1) 碱  
2) CO<sub>2</sub>  
3) H<sup>+</sup>





对于丁烯酸的双键,化合物 I 可以 E- 和 Z- 同分异构体存在。两种同分异构体可根据本发明分别或一起使用。优选同分异构体混合物,尤其 E- 同分异构体(构型根据羧酸甲酯的位置)

在上式所给的符号的定义中,采用的集合术语通常表示下列取代基:

卤素、氟、氯、溴和碘;

烷基:具有 1 至 4 个碳原子的饱和直链或支链烷基,如甲基、乙基、丙基、1-甲基-乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基和 1,1-二甲基乙基;

卤代烷基:具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链烷基(如上所述),基团上的氢原子可部分或全部被如上所述的卤原子置换,例如: $C_1$ - $C_2$ - 卤代烷基,如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟氯甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基和五氟乙基;

烷氧基:具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链烷基(如上所述),它借助于氧原子(-O-)连接到主体结构上;

烷氧基羰基:具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链烷氧基(如上所述),它借助于羰基(-CO-)连接到主体结构上;

烷硫基:具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链烷基(如上所述),它借助于硫原子(-S-)连接到主体结构上;

未取代或取代的烷基:饱和直链或支链烷基,尤其具有 1 至 10 个碳原子的烷基,例如: $C_1$ - $C_6$  烷基,如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、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-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2

- 三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基和1-乙基-2-甲基丙基；

未取代或取代的链烯基：不饱和直链或支链烃基，尤其具有2至10个碳原子、双键位于任何所需位置的链烯基，例如： $C_2 - C_6$ 链烯基，如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基和1-乙基-2-甲基-2-丙烯基；

链炔基：直链或支链烃基，尤其是具有2至20个碳原子、叁键位于任何所需位置的链炔基，例如： $C_2 - C_6$ 炔基，如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙

炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基和1-乙基-1-甲基-2-丙炔基；

未取代或取代的饱和或者单或双不饱和环，它除碳原子外，可含有一至三个下列杂原子作为环原子：氧、硫和氮，例如：碳环，如环丙基、环戊基、环己基、环戊-2-烯基、环己-2-烯基；5至6元饱和或不饱和杂环，它含有一至三个氮原子和/或一个氧或硫原子，如2-四氢呋喃基、3-四氢呋喃基、2-四氢噻吩基、3-四氢噻吩基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、3-异噁唑烷基、4-异噁唑烷基、5-异噁唑烷基、3-异噻唑烷基、4-异噻唑烷基、5-异噻唑烷基、3-吡唑烷基、4-吡唑烷基、5-吡唑烷基、2-噁唑烷基、4-噁唑烷基、5-噁唑烷基、2-噻唑烷基、4-噻唑烷基、5-噻唑烷基、2-咪唑烷基、4-咪唑烷基、1,2,4-噁二唑烷-3-基、1,2,4-噁二唑烷-5-基、1,2,4-噻二唑烷-3-基、1,2,4-噻二唑烷-5-基、1,2,4-三唑烷-3-基、1,3,4-噁二唑烷-2-基、1,3,4-噻二唑烷-2-基、1,3,4-三唑烷-2-基、2,3-二氢呋喃-2-基、2,3-二氢呋喃-3-基、2,4-二氢呋喃-2-基、2,4-二氢呋喃-3-基、2,3-二氢噻吩-2-基、2,3-二氢噻吩-3-基、2,4-二氢噻吩-2-基、2,4-二氢噻吩-3-基、2,3-吡咯啉-2-基、2,3-吡咯啉-3-基、2,4-吡咯啉-2-基、2,4-吡咯啉-3-基、2,3-异噁唑啉-3-基、3,4-异噁唑啉-3-基、4,5-异噁唑啉-3-基、2,3-异噁唑啉-4-基、3,4-异噁唑啉-4-基、4,5-异噁唑啉-4-基、2,3-

异噁唑啉-5-基、3,4-异噁唑啉-5-基、4,5-异噁唑啉-5-基、2,3-异噁唑啉-3-基、3,4-异噁唑啉-3-基、4,5-异噁唑啉-3-基、2,3-异噁唑啉-4-基、3,4-异噁唑啉-4-基、4,5-异噁唑啉-4-基、2,3-异噁唑啉-5-基、3,4-异噁唑啉-5-基、4,5-异噁唑啉-5-基、2,3-二氢吡唑-1-基、2,3-二氢吡唑-2-基、2,3-二氢吡唑-3-基、2,3-二氢吡唑-4-基、2,3-二氢吡唑-5-基、3,4-二氢吡唑-1-基、3,4-二氢吡唑-3-基、3,4-二氢吡唑-4-基、3,4-二氢吡唑-5-基、4,5-二氢吡唑-1-基、4,5-二氢吡唑-3-基、4,5-二氢吡唑-4-基、4,5-二氢吡唑-5-基、2,3-二氢噁唑-2-基、2,3-二氢噁唑-3-基、2,3-二氢噁唑-4-基、2,3-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、3,4-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基、1,3-二噁烷-5-基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基、2-四氢噻吩基、3-四氢噻吩基、4-四氢噻吩基、2-四氢嘧啶基、4-四氢嘧啶基、5-四氢嘧啶基、2-四氢吡嗪基、1,3,5-四氢三嗪-2-基和1,2,4-四氢三嗪-3-基, 优选2-四氢呋喃基、2-四氢噻吩基、2-吡咯烷基、3-异噁唑烷基、3-异噁唑烷基、1,3,4-噁唑烷-2-基、2,3-二氢噻吩-2-基、4,5-异噁唑啉-3-基、3-哌啶基、1,3-二噁烷-5-基、4-哌啶基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基;

未取代或取代的单或双核芳香环体系, 它除碳原子外, 可含有一至四个氮原子或者一或两个氮原子和一个氧或硫原子或者一个氧或硫原子作为环原子, 例如: 芳基, 例如苯基和萘基, 优选苯基或者1-或2-萘基; 和杂芳基, 如含有一至三个氮原子和/或一个氧或硫原子的5元环杂芳族化合物, 如2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-异噁唑基、4-

异噁唑基、5-异噁唑基、3-异噁唑基、4-异噁唑基、5-异噁唑基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡咯基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑

基、4-噻唑基、5-噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,5-三唑-3-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,3-三唑-5-基、1,2,3-三唑-4-基、5-四唑基、1,2,3,4-噻三唑-5-基和1,2,3,4-噁三唑-5-基,尤其是3-异噁唑基、5-异噁唑基、4-噁唑基、4-噻唑基、1,3,4-噁二唑-2-基和1,3,4-噻三唑-2-基;或例如含有一至四个氮原子作为杂原子的6元环杂芳族化合物,如2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基和1,2,4,5-四嗪-3-基,尤其是2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、2-吡嗪基和4-吡嗪基。

对于烷基、链烯基和链炔基,未取代或取代的定义意味着这些基团可被部分或全部卤代(即这些基团的氢原子可部分或全部被例如相同或不同的上面提到的卤原子置换,优选氟、氯和溴,尤其是氟和氯)和/或可带有一至三个、尤其是一个下列基团:

氟基,硝基, $C_1 - C_4$  烷氧基, $C_1 - C_4$  卤代烷氧基, $C_1 - C_4$  烷硫基,或者未取代或取代的单或双核芳环体系,它除碳原子外,可含有一至四个氮原子或者一或二个氮原子和一个氧或硫原子或者一个氧或硫原子作为环原子,即:芳基,例如苯基和萘基,优选苯基或1-或2-萘基;和杂芳基,例如含有一至三个氮原子和/或一个氧或硫原子的5元环杂芳族化合物,如2-咪唑基、3-咪唑基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-异噁唑基、4-异噁唑基、5-异噁唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,5-三唑-3-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,3-三唑-5-基、1,2,3-三唑-4-基、5-四唑基、1,2,3,4-噻三唑-5-基和1,2,3,4-噁三唑-5

-基,尤其是3-异噁唑基、5-异噁唑基、4-噁唑基、4-噻唑基、1,3,4-恶二唑-2-基和1,3,4-噻二唑-2-基;或例如含有一至四个氮原子作为杂原子的6元环杂芳基,如2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基和1,2,4,5-四嗪-3-基,尤其是2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、2-吡嗪基和4-吡嗪基。

对于环状(饱和,不饱和或芳族)基团,未取代或取代的定义意味着这些基团可被部分或全部卤代(即这些基团的氢原子可部分或全部被例如相同或不同的上面提到的卤原子置换,优选氟,氯和溴,尤其是氟和氯)和/或可带有一至三个下列基团:硝基、氟基、 $C_1-C_4$ 烷基或 $C_1-C_4$ 烷氧基。

基团中提到的单或双核芳族或杂芳族体系又可被部分或全部卤代,即这些基团的氢原子可部分或全部被例如氟,氯、溴和碘的卤原子置换,优选氟和氯。

除上述卤原子外,这些单或双核芳族或杂芳族体系可另外带有一至三个下列取代基:

硝基;

氟基、氟硫基;

烷基,尤其是如上所述的 $C_1-C_6$ 烷基,优选甲基、乙基、1-甲基乙基、1,1-二甲基乙基、丁基、己基,尤其是甲基和1-甲基乙基;

如上所述的 $C_1-C_4$ 卤代烷基,优选三氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基和五氟乙基;

$C_1-C_4$ 烷氧基,优选甲氧基、乙氧基、1-甲基乙氧基和1,1-二甲基乙氧基,尤其是甲氧基;

$C_1-C_4$ 卤代烷氧基,尤其是 $C_1-C_2$ 卤代烷氧基,优选二氟甲氧基、三氟甲氧基和2,2,2-三氟乙氧基,尤其是二氟甲氧基;

$C_1-C_4$ 烷硫基,优选甲硫基和1-甲基乙硫基,尤其是甲硫基;

$C_1-C_4$ 烷基氨基,例如甲氨基、乙氨基、丙氨基、1-甲基乙氨基、丁氨基、1-甲基丙氨基、2-甲基丙氨基和1,1-二甲基乙氨基,

优选甲氨基和 1,1—二甲基乙氨基,尤其是甲氨基;

二-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基氨基,例如 N,N-二甲基氨基、N,N-二乙基氨基、N,N-二丙基氨基、N,N-二(1-甲基乙基)氨基、N,N-二丁基氨基、N,N-二(1-甲基丙基)氨基、N,N-二(2-甲基丙基)氨基、N,N-二(1,1-二甲基乙基)氨基、N-乙基-N-甲基氨基、N-甲基-N-丙基氨基、N-甲基-N-(1-甲基乙基)氨基、N-丁基-N-甲基氨基、N-甲基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基氨基、N-乙基-N-丙基氨基、N-乙基-N-(1-甲基乙基)氨基、N-丁基-N-乙基氨基、N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-丙基氨基、N-丁基-N-丙基氨基、N-(1-甲基丙基)-N-丙基氨基、N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-丙基氨基、N-丁基-N-(1-甲基乙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基乙基)氨基、N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-丁基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基、N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基和 N-(1,1-二甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基,优选 N,N-二甲基氨基和 N,N-二乙基氨基,尤其是 N,N-二甲基氨基;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基,例如甲基羰基、乙基羰基、丙基羰基、1-甲基乙基羰基、丁基羰基、1-甲基丙基羰基、2-甲基丙基羰基、1,1-二甲基乙基羰基、戊基羰基、1-甲基丁基羰基、2-甲基丁基羰基、3-甲基丁基羰基、1,1-二甲基丙基羰基、1,2-二甲基丙基羰基、2,2-二甲基丙基羰基、1-乙基丙基羰基、己基羰基、1-甲基戊基羰基、2-甲基戊基羰基、3-甲基戊基羰基、4-甲基戊基羰基、1,1-二甲基丁基羰基、1,2-二甲基丁基羰基、1,3-二甲基丁基羰基、2,2-二甲基丁基羰基、2,3-二甲基丁基羰基、3,3-二甲基丁基羰基、1-乙基

丁基羰基、2-乙基丁基羰基、1,1,2-三甲基丙基羰基、1,2,2-三甲基丙基羰基、1-乙基-1-甲基丙基羰基和1-乙基-2-甲基丙基羰基, 优选甲基羰基、乙基羰基和1,1-二甲基羰基, 尤其是乙基羰基;

$C_1-C_6$  烷氧基羰基, 例如甲氧基羰基、乙氧基羰基、丙氧基羰基、1-甲基乙氧基羰基、丁氧基羰基、1-甲基丙氧基羰基、2-甲基丙氧基羰基、1,1-二甲基乙氧基羰基、戊氧基羰基、1-甲基丁氧基羰基、2-甲基丁氧基羰基、3-甲基丁氧基羰基、2,2-二甲基丙氧基羰基、1-乙基丙氧基羰基、己氧基羰基、1,1-二甲基丙氧基羰基、1,2-二甲基丙氧基羰基、1-甲基戊氧基羰基、2-甲基戊氧基羰基、3-甲基戊氧基羰基、4-甲基戊氧基羰基、1,1-二甲基丁氧基羰基、1,2-二甲基丁氧基羰基、1,3-二甲基丁氧基羰基、2,2-二甲基丁氧基羰基、2,3-二甲基丁氧基羰基、3,3-二甲基丁氧基羰基、1-乙基丁氧基羰基、2-乙基丁氧基羰基、1,1,2-三甲基丙氧基羰基、1,2,2-三甲基丙氧基羰基、1-乙基-1-甲基丙氧基羰基、和1-乙基-2-甲基-丙氧基羰基、优选甲氧基羰基、乙氧基羰基和1,1-二甲基乙氧基羰基, 尤其是乙氧基羰基;

$C_1-C_6$  烷氨基羰基, 例如甲氨基羰基、乙氨基羰基、丙氨基羰基、1-甲基乙氨基羰基、丁氨基羰基、1-甲基丙氨基羰基、2-甲基丙氨基羰基、1,1-二甲基乙氨基羰基、戊氨基羰基、1-甲基丁氨基羰基、2-甲基丁氨基羰基、3-甲基丁氨基羰基、2,2-二甲基丙氨基羰基、1-乙基丙氨基羰基、己氨基羰基、1,1-二甲基丙氨基羰基、1,2-二甲基丙氨基羰基、1-甲基戊氨基羰基、2-甲基戊氨基羰基、3-甲基戊氨基羰基、4-甲基戊氨基羰基、1,1-二甲基丁氨基羰基、1,2-二甲基丁氨基羰基、1,3-二甲基丁氨基羰基、2,2-二甲基丁氨基羰基、2,3-二甲基丁氨基羰基、3,3-二甲基丁氨基羰基、1-乙基丁氨基羰基、2-乙基丁氨基羰基、1,1,2-三甲基丙氨基羰基、1,2,2-三甲基丙氨基羰基、1-乙基-1-甲基丙氨基羰基和1-乙基-2-甲基丙氨基羰基, 优选甲氨基羰基和乙氨基羰基, 尤其是甲氨基羰基;



二-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基氨基羰基, 尤其是二-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基氨基羰基, 例如 N,N-二甲基氨基羰基、N,N-二乙基氨基羰基、N,N-二丙基氨基羰基、N,N-二(1-甲基乙基)氨基羰基、N,N-二丁基氨基羰基、N,N-二(1-甲基丙基)氨基羰基、N,N-二(2-甲基丙基)氨基羰基、N,N-二(1,1-二甲基乙基)氨基羰基、N-乙基-N-甲基氨基羰基、N-甲基-N-丙基氨基羰基、N-甲基-N-(1-甲基乙基)氨基羰基、N-丁基-N-甲基氨基羰基、N-甲基-N-(1-甲基丙基)氨基羰基、N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基羰基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基氨基羰基、N-乙基-N-丙基氨基羰基、N-乙基-N-(1-甲基乙基)氨基羰基、N-丁基-N-乙基氨基羰基、N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基羰基、N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基羰基、N-乙基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基羰基、N-(1-甲基乙基)-N-丙基氨基羰基、N-丁基-N-丙基氨基羰基、N-(1-甲基丙基)-N-丙基氨基羰基、N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基羰基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-丙基氨基羰基、N-丁基-N-(1-甲基乙基)-氨基羰基、N-(1-甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基羰基、N-(1-甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基羰基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基乙基)氨基羰基、N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基羰基、N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基羰基、N-丁基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基羰基、N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基羰基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基羰基和 N-(1,1-二甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基羰基, 优选 N,N-二甲基氨基羰基和 N,N-二乙基氨基羰基, 尤其是 N,N-二甲基氨基羰基;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羧基, 例如甲基羧基、乙基羧基、丙基羧基、1-甲基乙基羧基、丁基羧基、1-甲基丙基羧基、2-甲基丙基羧基、1,1-二甲基乙基羧基、戊基羧基、1-甲基丁基羧基、2-甲基丁基羧基、3-甲基丁基羧基、1,1-二甲基丙基羧基、1,2-二甲基丙基羧基、2,2-二甲基丙基羧基、1-乙基丙基羧基、己基羧基、1-甲基戊基羧基、2-甲基戊基羧基、3-甲基戊基羧基、4-甲基戊基羧基、1,1-二甲基

丁基羧基、1,2-二甲基丁基羧基、1,3-二甲基丁基羧基、2,2-二甲基丁基羧基、2,3-二甲基丁基羧基、3,3-二甲基丁基羧基、1-乙基丁基羧基、2-乙基丁基羧基、1,1,2-三甲基丙基羧基、1,2,2-三甲基丙基羧基、1-乙基-1-甲基丙基羧基和1-乙基-2-甲基丙基羧基,优选甲基羧基、乙基羧基和1,1-二甲基乙基羧基,尤其是甲基羧基和1,1-二甲基乙基羧基;

$C_1-C_6$  烷基羰基氨基,例如甲基羰基氨基、乙基羰基氨基、丙基羰基氨基、1-甲基乙基羰基氨基、丁基羰基氨基、1-甲基丙基羰基氨基、2-甲基丙基羰基氨基、1,1-二甲基乙基羰基氨基、戊基羰基氨基、1-甲基丁基羰基氨基、2-甲基丁基羰基氨基、3-甲基丁基羰基氨基、2,2-二甲基丙基羰基氨基、1-乙基丙基羰基氨基、己基羰基氨基、1,1-二甲基丙基羰基氨基、1,2-二甲基丙基羰基氨基、1-甲基戊基羰基氨基、2-甲基戊基羰基氨基、3-甲基戊基羰基氨基、4-甲基戊基羰基氨基、1,1-二甲基丁基羰基氨基、1,2-二甲基丁基羰基氨基、1,3-二甲基丁基羰基氨基、2,2-二甲基丁基羰基氨基、2,3-二甲基丁基羰基氨基、3,3-二甲基丁基羰基氨基、1-乙基丁基羰基氨基、2-乙基丁基羰基氨基、1,1,2-三甲基丙基羰基氨基、1,2,2-三甲基丙基羰基氨基、1-乙基-1-甲基丙基羰基氨基和1-乙基-2-甲基丙基羰基氨基,优选甲基羰基氨基和乙基羰基氨基,尤其是乙基羰基氨基;

$C_3-C_7$  环烷基,例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基和环庚基,优选环丙基、环戊基和环己基,尤其是环丙基;

$C_3-C_7$  环烷氧基,例如环丙氧基、环丁氧基、环戊氧基、环己氧基和环庚氧基,优选环戊氧基和环己氧基,尤其是环己氧基;

$C_3-C_7$  环烷硫基,例如环丙硫基、环丁硫基、环戊硫基、环己硫基和环庚硫基,优选环己硫基;

$C_3-C_7$  环烷基氨基,例如环丙氨基、环丁氨基、环戊氨基、环己氨基和环庚氨基,优选环丙氨基和环己氨基,尤其是环丙氨基;

$R^3$  上的两个相邻基团可具有未被取代或被氟取代的氧- $C_1-$

$C_2$ -亚烷氧基链的含义,例如  $-O-CH_2-O-$ 、 $-O-CF_2-O-$ 、 $-O-CH_2CH_2-O-$  或  $-O-CF_2CF_2-O-$  或  $C_3-C_4$  亚烷基链,例如亚丙基或亚丁基的含义。

考虑到它们的生理作用,优选其中  $n$  为 0 或 1 的化合物 I。

同样,优选其中  $R^1$  为卤素、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基或  $C_1-C_2$ -烷氧基的化合物 I。

另外,优选其中  $R^2$  为氢、硝基、卤素、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基或  $C_1-C_2$ -烷氧基羰基的化合物 I。

另外,优选其中  $R^3$  为未取代或取代的  $C_1-C_4$ -烷基或  $C_3-C_6$ -环烷基的化合物 I。

同样,优选其中  $R^3$  为未取代或取代的饱和或者单或双不饱和环(该环除碳原子外,可含有一至三个下列杂原子作为环原子:氧,硫和氮)的化合物 I。

另外,优选  $R^3$  为未取代或取代的单或双核芳基(它除碳原子外,可含有一至四个氮原子或者一或两个氮原子和一个氧或硫原子或者一个氧或硫原子作为环原子)的化合物 I。

此外,优选其中  $R^3$  为未取代或取代的 5 元环杂芳基的化合物 I。

此外,优选  $R^3$  为未取代或取代的 6 元环杂芳基的化合物 I。

尤其是,优选其中  $R^1$  为氢( $n=0$ )、氟、甲基或三氟甲基的化合物 I。

尤其是,还优选其中  $R^2$  为氢、卤素、甲基、三氟甲基或甲氧基羰基的化合物 I。

同样,尤其优选其中  $R^3$  为  $C_1-C_4$ -烷基的化合物 I。

此外,尤其优选其中  $R^3$  为可带有一至三个  $C_1-C_4$ -烷基的  $C_3-C_6$ -环烷基的化合物 I。

尤其是,还优选其中  $R^3$  为未取代或取代的苯基的化合物 I。

尤其是,还优选其中  $R^3$  为未取代或取代的吡啶基或嘧啶基的化合物 I。

尤其是, 优选其中  $R^3$  为未取代或取代的苯基或苄基的那些化合物 I, 在这些情况下, 苯基上适宜的取代基优选为卤素、氟基、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基、苯基和氧- $C_1-C_2$ -亚烷基氧基。

还优选其中  $R^3$  为未取代或取代的 5 元环杂芳基, 例如噻唑基、异噻唑基或恶唑基的化合物 I。5 元环杂芳基上的适宜取代基优选为卤素、氟基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤代烷基、 $C_1-C_2$  卤代烷氧基和苯基。

还优选其中  $R^3$  为未取代或取代的 6 元环杂芳基, 例如吡啶基、嘧啶基、哒嗪基或吡嗪基的化合物 I。6 元环杂芳基上的适宜取代基优选卤素、氟基、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_2$ -卤代烷基、 $C_1-C_2$ -卤代烷氧基和苯基。

特别优选的化合物 I 的实例汇集在下列表中。

表 1

通式 I.1 的化合物, 其中  $R^2$  为氢, 在所有情况下的化合物的取代基  $R^{n1}$  和  $R^3$  的组合对应于表 A 的一行。

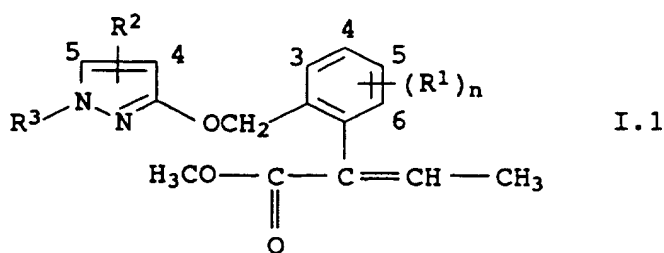


表 2

通式 I.2 的化合物, 其中  $R^2$  为氢, 在所有情况下的化合物的取代基  $R^{n1}$  和  $R^3$  的组合对应于表 A 的一行。

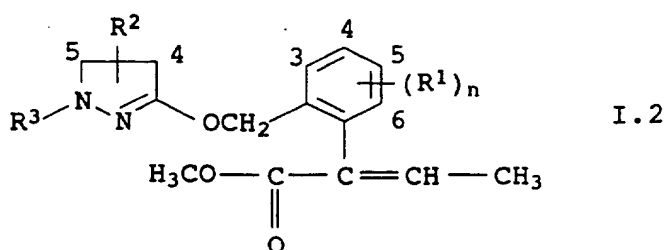


表 3

通式 I.1 的化合物, 其中  $R^2$  为 4-Cl, 在所有情况下的化合物的取代基  $Rn^1$  和  $R^3$  的组合对应于表 A 的一行。

表 4

通式 I.1 化合物, 其中  $R^2$  为 4-Br, 在所有情况下的化合物的取代基  $Rn^1$  和  $R^3$  的组合对应于表 A 的一行。

表 5

通式 I.1 化合物, 其中  $R^2$  为 5-CH<sub>3</sub>, 在所有情况下的化合物的取代基  $Rn^1$  和  $R^3$  的组合对应于表 A 的一行。

表 6

通式 I.1 化合物, 其中  $R^2$  为 5-CF<sub>3</sub>, 在所有情况下的化合物的取代基  $Rn^1$  和  $R^3$  的组合对应于表 A 的一行。

表 7

通式 I.1 化合物, 其中  $R^2$  为 4-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, 在所有情况下的化合物的取代基  $Rn^1$  和  $R^3$  的组合对应于表 A 的一行。

表 A

$R^1_n$	$R^3$
H	$C_6H_5$
3-Cl	$C_6H_5$
4-Cl	$C_6H_5$
6-Cl	$C_6H_5$
4-F	$C_6H_5$
4-OCH <sub>3</sub>	$C_6H_5$
3-CH <sub>3</sub>	$C_6H_5$
6-CH <sub>3</sub>	$C_6H_5$
H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>

$R^1_n$	$R^3$
H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

$R^1_n$	$R^3$
H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	CH <sub>3</sub>
H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
H	环丙基



R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>3</sup>
H	环己基
H	吡啶-2-基
H	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
H	3,4-[OCF <sub>2</sub> O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
H	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
H	吡嗪-2-基
H	5-氟吡啶-2-基

本发明式 I  $\alpha$ -苯基丁烯酸甲酯适宜于防治有害真菌和昆虫,蛛形纲和线虫类的动物害虫。它们可作为杀真菌剂和杀虫剂用于作物保护,卫生学、储藏物质保护和兽医等方面。

有害昆虫包括:

来自蝶(鳞翅目),例如茶小卷叶蛾(*Adoxophyes orana*)、小地老虎(*Agrotis ypsilon*)、黄地老虎(*Agrotis segetum*)、棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatallis*)、苹实巢蛾(*Argyresthia conjugella*)、汉马夜蛾(*Autographa gamma*)、卷叶蛾(*Cacocia murinana*)、卷蛾(*Capua reticulana*)、枞色卷蛾(*Choristoneura fumiferana*)、玉米螟(*Chilo partellus*)、西方云杉卷叶蛾(*Choristoneura Occidentalis*)、美洲粘虫(*Cirphis Unipuncta*)、稻纵卷叶螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、(Crocidolomia binotalis)、苹蠹蛾(*Cydia pomonella*)、欧洲松毛虫(*Dendrolimns pini*)、瓜野螟(*Diaphania nitidalis*)、巨座玉米螟(*Diatraea grandiosella*)、棉斑实蛾(*Earias insulana*)、小玉米螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、(Eupoecilia ambiguella)、粒肤地老虎(*Feltia Subterranea*)、李小食心虫(*Grapholitha funebrana*)、梨小食心虫(*Grapholitha molesta*)、棉铃虫(*Heliothis armigera*)、烟芽夜蛾(*Heliothis Virescens*)、棉铃虫(*Heliothis zea*)、菜螟(*Helula Undalis*)、(Hibernia defoliaria)、美国白蛾(*Hyphantria cunea*)、苹

果巢蛾(*Hyponomeuta malinellus*)、蕃茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*)、铁杉尺蠖(*Lambdina fiscellaria*)、甜菜夜蛾(*Laphygma exigua*)、旋纹潜蛾(*Leucoptera scitella*)、细蛾(*Lithocolletis blancardella*)、小卷蛾(*Lobesia botrana*)、黄绿条螟(*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、僧尾毒蛾(*Lymantria monacha*)、桃潜蛾(*Lyonetia clerkella*)、烟草天蛾(*Manduca sexta*)、天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、稻毛胫夜蛾(*Mocis repanda*)、冬尺蛾(*Operophthera brumata*)、花旗松毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*)、玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、林黄卷叶蛾(*Pandemis heparana*)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*)、马铃薯麦蛾(*Phthorimaea operculella*)、桔叶潜蛾(*Phyllocnistis citrella*)、大菜粉蝶(*Pieris brassicae*)、苜蓿绿夜蛾(*Plathypena scabra*)、荷兰石竹小卷蛾(*Platynota stultana*)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、桔花巢蛾(*Prays citri*)、油橄榄巢蛾(*Prays Oleae*)、斜纹夜蛾(*Prodenia sunia*)、斜纹夜蛾(*Prodenia ornithogalli*)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、二、三针松小卷蛾(*Rhyacionia frustrana*)、( *Scrobipalpula absoluta* )、大螟(*Sesamia inferens*)、葡萄长须卷蛾(*Sparganothis pilleriana*)、草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、斜纹夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜纹夜蛾(*Spodoptera litura*)、( *Syllepta elerogata* )、红带透翅蛾(*Synanthedon myopaeformis*)、( *Thaumatopoea pityocampa* )、栎绿卷叶蛾(*Tortrix viridana*)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni*)、三化螟(*Tryporyza incertulaos*)、云杉小卷叶蛾(*Zeiraphera canadensis*)、再有蜡螟(*Galleria mellonella*)和麦蛾(*Sitotroga cerealella*)、粉斑螟(*Ephestia cautella*)、幕夜蛾(*Tineola bisselliella*);

来自甲虫(鞘翅目),例如具条叩甲(*Agriotes lineatus*)、晦暗叩甲(*Agriotes Obscurus*)、棉铃象甲(*Anthonomus grandis*)、苹果花象甲(*Anthonomus pomorum*)、象甲(*Apion vorax*)、甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*)、大松小蠹(*Blastophagus piniperda*)、甜菜大龟甲(*Cassida nebulosa*)、豆叶甲(*Cerotoma trifurcata*)、甘蓝菜象甲(*Ceuthorhynchus assimilis*)、象甲(*Ceuthorhynchus napi*)、甜菜茎跳甲

(*Chaetocnema tibialis*)、烟草金针虫(*Conoderus vespertinus*)、天冬门叶甲(*Crioceris asparagi*)、小蠹(*Dendroctonus refipennis*)、长角叶甲(*Diabrotica Longicornis*)、十二斑叶甲(*Diabrotica 12 - punctata*)、玉米幼芽根叶虫甲(*Diabrotica Virgifera*)、墨西哥豆瓢虫(*Epilachna varivestis*)、烟草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、棉籽灰象甲(*Eutinobothrus brasiliensis*)、松树皮象(*Hylobius abietis*)、埃及苜蓿象甲(*Hypera brunneipennis*)、苜蓿叶象甲(*Hypera postica*)、云杉八齿小蠹(*Zps tytopographus*)、烟负尼虫(*Lema bilineata*)、橙足负泥虫(*Lema melanopus*)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、甜菜金针虫(*Limonius californicus*)、美洲稻象甲(*lissorhoptrus oryzophilus*)、玉米叩甲(*Melanotus Communis*)、油菜花露尾甲(*Meligethes aeneus*)、(*Melolontha hippocastani*)、(*Melolontha melolontha*)、稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、(*Ortiorrhynchus sulcatus*)、草耳缘象(*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿叶虫(*Phaedon cochleariae*)、庭园丽金龟(*phyllopertha horticola*)、鳃角金龟(*phyllophaga SP.*)、条跳甲(*phyllostreta chrysocephala*)、芜菁淡足跳甲(*phyllostreta nemorum*)、曲条跳甲(*phyllostreta striolata*)、日本丽金龟(*Popillia japonica*)、跳甲(*Psylliodes napi*)、栎黑小蠹(*Scolytus intricatus*)、根瘤象甲(*Sitona lineatus*)、再有蚕豆象(*Bruchus rufimanus*)、豌豆象(*Bruchus pisorum*)、豆象(*Bruchus Lentis*)、谷象(*Sitophilus granaria*)、草窃蠹(*Lasioderma serricorne*)、锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*)、谷蠹(*Rhyzopertha dominica*)、米象(*Sitophilus oryzae*)、赤拟谷盗(*Tribolium castaneum*)、谷斑及蠹(*Trogoderma granarium*)、墨西哥豆象(*Zabrotes subfasciatus*);

来自双翅目的昆虫(双翅目),例如,墨西哥桔实蝇(*Anastrepha ludens*)、地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)、高粱瘿蚊(*Contarinia sorghicola*)、瓜实蝇(*Dacus cucurbitae*)、油橄榄实蝇(*Dacus oleae*)、芸苔瘿蚊(*Dasineura brassicae*)、(*Delia coarctata*)、(*Delia radium*)、大麦水蝇(*Hydrellia griseola*)、种蝇(*Hylemyia platura*)、潜蝇(*Liriomyza sativae*)、潜蝇(*Liriomyza trifolii*)、小麦瘿蚊(*Mayetiola destructor*)、

(*Orseolia oryzae*)、瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit*)、菠菜潜叶花蝇(*Pegomya hyoscyami*)、(*Phorbia antiqua*)、(*Phorbia brassicae*)、(*Phorbia Loarctata*)、樱桃实蝇(*Rhagoletis cerasi*)、苹果实蝇(*Rhagoletis pomonella*)、大蚊(*Tipula Oleracea*)、沼泽大蚊(*Tipula paludosa*)、还有埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、骚扰伊蚊(*Aedes vexans*)、五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*)、倍氏金蝇(*Chrysomya bezziana*)、金蝇(*Chrysomya hominivorax*)、腐败金蝇(*Chrysomya macellaria*)、嗜人瘤蝇(*Cordylobia anthropophaga*)、尖音库蚊(*Culex pipiens*)、黄腹厩蝇(*Fannia canicularis*)、大马胃蝇(*Gasterophilus intestinalis*)、舌蝇(*Glossina morsitans*)、扰血蝇(*Haematobia irritans*)、(*Haplodiplosis equestris*)、纹皮蝇(*Hypoderma lineata*)、绿蝇(*Lucilia caprina*)、绿蝇(*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇(*Lucilia sericata*)、家蝇(*Musca domestica*)、厩腐蝇(*Muscina stabulans*)、羊鼻蝇(*Oestrus ovis*)、虻(*Tabanus bovinus*)、蚋(*Simulium damnosum*)；

来自蓟马(缨翅目)，例如，烟草褐蓟马(*Frankliniella fusca*)、苜蓿蓟马(*Frankliniella Occidentalis*)、花蓟马(*Frankliniella tritici*)、小麦管蓟马(*Haplothrips tritici*)、桔实蓟马(*Scirtothrips citri*)、稻蓟马(*Thrips oryzae*)、棕黄蓟马(*Thrips palmi*)、棉蓟马(*Thrips tabaci*)；

来自膜翅目的昆虫(膜翅目)，例如，菜叶蜂(*Athalia rosae*)、热带切叶蚁(*Atta cephalotes*)、切叶蚁(*Atta sexdens*)、切叶蚁(*Atta texana*)、叶蜂(*Hoplocampa minuta*)、革实叶蜂(*Hoplocampa testudinea*)、阿根廷蚁(*Iridomyrmes humilis*)、虹蚁(*Iridomyrmex purpureus*)、法老蚁(*Monomorium pharaonis*)、火蚁(*Solenopsis geminata*)、红外来火蚁(*Solenopsis invicta*)、黑外来火蚁(*Solenopsis richteri*)；

来自臭虫(异翅亚目)，例如，喜绿蝽(*Acrosternum hilare*)、玉米长蝽(*Blissus leucopterus*)、烟草黑斑盲蝽(*Lyrtopeltis notatus*)、棉红蝽(*Dysdercus cingulatus*)、红蝽(*Dysdercus intermedius*)、盾蝽(*Eurygaster integriceps*)、棉褐蝽(*Euschistus impictiventris*)、叶足缘蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、豆荚盲蝽(*Lygus hesperus*)、牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽(*Lygus pratensis*)、稻绿蝽(*Nezara viridula*)、

甜菜拟网蝽 (*Piesma quadrata*)、(*Solubea insularis*)、(*Thyanta perditor*)；

来自吮吸植物的昆虫(同翅目),例如,无网长管蚜 (*Acyrtosiphon onobrychis*)、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、落叶松球蚜 (*Adelges laricis*)、红圆蚧 (*Aonidiella aurantii*)、蚜茧蜂 (*Aphidula nasturtii*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、茄沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*)、甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*)、蓟短尾蚜 (*Brachycaudus cardui*)、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、(*Dalbulus maidis*)、(*Dreyfusia nordmanniana*)、(*Dreyfusia piceae*)、圆尾蚜 (*Dysaphis radicola*)、蚕豆微叶蜂 (*Empoasca fabae*)、苹果绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、稻灰飞虱 (*Laodelphax striatella*)、麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、马铃薯长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、(*Macrosiphon rosae*)、(*Megoura viciae*)、蔷薇麦蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、桃赤蚜 (*Myzus persicae*)、樱桃黑瘤额蚜 (*Myzus cerasi*)、黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*)、稻褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、蔗飞虱 (*Perkinsiella saccharicida*)、忽布疣额蚜 (*Phorodon humuli*)、桔粉蚧 (*Planococcus citri*)、苹木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla pyri*)、梨黄木虱 (*Psylla pyricol*)、梨笠圆盾蚧 (*Quadraspidotus perniciosus*)、玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、蝥蚧 (*Saissetia oleae*)、草间裂蚜茧蜂 (*Schizaphis graminum*)、西印度红圆质蚧 (*Selenaspidus articulatus*) (*Sitobion avenae*)、白背稻虱 (*Sogatella furcifera*)、桔二盆蚜 (*Toxoptera citricida*)、结翅粉虱 (*Trialeurodes abutilonea*)、温室白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*) 葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*)；

来自白蚁(等翅目),例如, (*Calotermes flavicollis*)、白蚁 (*Leucotermes flavipes*)、大白蚁 (*Macrotermes subhyalinus*)、黑翅土白蚁 (*Odontotermes formosanus*)、散白蚁 (*Reticulitermes lucifugus*)、白蚁 (*Termes natalensis*)；

来自直翅目昆虫(直翅目),例如欧洲蝼蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、蝗虫 (*Locusta migratoria*)、双带蚱蜢 (*Melanoplus bivittatus*)、赤腿蚱蜢 (*Melanoplus femur-rubrum*)、墨西哥蚱蜢 (*Melanoplus mexi-*

canus)、迁徙蚱蜢(*Melanoplus sanguinipes*)、落矶山蚱蜢(*Melanoplus spretus*)、红翅蝗(*Nomadacris septemfasciata*)、美洲蝗(*Schistocerca americana*)、蚱蜢(*Schistocerca peregrina*)、(Stauronotus maroccanus)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*)，还有家蟋蟀(*Acheta domestica*)、东方 蟊 (*Blatta orientalis*)、德国小蟊 (*Blattella germanica*)、美洲大蟊 (*Periplaneta americana*)；

来自蜘蛛亚纲，例如植食性螨类，如蕃茄刺皮瘿螨(*Aculops lycopersicae*)、刺皮瘿螨(*Aculops pelekassi*)、苹刺瘿螨(*Aculus schlechtendali*)、紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*)、苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*)、鹤耳柄始叶螨(*Eotetranychus carpini*)、始叶螨(*Eutetranychus banksii*)、桔瘿螨(*Eriophyes sheldoni*)、草地小爪螨(*Oligonychus pratensis*)、苹果全爪螨(*Panonychus Ulmi*)、柑桔全爪螨(*Panonychus citri*)、桔锈螨(*Phyllocoptruta Oleivora*)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus Latus*)、跗线螨(*Tarsonemus pallidus*)、朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、神泽叶螨(*Tetranychus kanzawi*)、太平洋叶螨(*Tetranychus pacificus*)、二点叶螨(*Tetranychus Urticae*)、蜱，例如美洲花蜱(*Amblyomma americanum*)、花蜱(*Amblyomma variegatum*)、波斯钝缘蜱(*Argas persicus*)、牛蜱(*Boophilus annulatus*)、牛蜱(*Boophilus decoloratus*)、微小牛蜱(*Boophilus microplus*)、森林草蜱(*Dermacentor silvarum*)、璃眼蜱(*Hyalomma truncatum*)、羊硬蜱(*Ixodes ricinus*)、硬蜱(*Zxodes rubicundus*)、非洲钝缘蜱(*Ornithodoros moubata*)、耳刺残喙蜱(*Otobius megnini*)、非洲扇头蜱(*Rhipicephalus appendiculatus*)和扇头蜱(*Rhipicephalus evertsi*)以及动物寄生螨，例如鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、羊痒螨(*Psoroptes ovis*)和疥螨(*Sarcoptes scabiei*)；

来自线虫类，例如根瘤线虫，如根瘤线虫(*Meloidogyne hapla*)、黄麻根瘤线虫(*Meloidogyne incognita*)、根瘤线虫(*Meloidogyne javanica*)、形成囊的线虫(*Z. B. Globodera pallida*)、(*Globodera rostochiensis*)、异皮线虫，(*Heterodera avenae*)、异皮线虫(*Heterodera glycines*)、史氏鞭囊线虫(*Heterodera Schachtii*)，迁移的内寄生和半

内寄生线虫,如(*Heliocotylenchus multicinctus*), (*Hirschmanniella oryzae*)、纽带线虫(*Hoplolaimus* SPP), 线虫(*Pratylenchus brachyurus*)、线虫(*Pratylenchus fallax*)、线虫(*Pratylenchus penetrans*)、线虫(*Pratylenchus vulnus*)、毕肖穿孔线虫(*Radopholus similis*)、轮转线虫(*Rotylenchus reniformis*)、(*Scutellonema bradys*)、垫刃线虫(*Tylenchulus semipenetrans*)、茎和叶小线虫,如蛇垫刃(*Anguina tritici*)、稻白端滑刃线虫(*Aphelenchoides besseyi*)、双垫刃(*Ditylenchus angustus*)、双垫刃(*Ditylenchus dipsaci*), 病毒媒介物,如长针线虫(*Longidorus* SPP), 克氏鬃根线虫(*Trichodorus christei*)、线虫(*Trichodorus viruliferus*)、剑线虫(*Xiphinema index*)、剑线虫(*Xiphinema mediterraneum*)。

活性化合物可以它们的制剂形式或由此制得的使用形式,如以直接可喷洒溶液、粉末、悬浮液或分散液、乳液、油分散液、膏、粉末组合物、分散组合物或颗粒的形式,通过喷洒、喷雾、撒粉、散布、浇洒而施用。施用形式完全取决于意欲的用途;在每种情况下它们应尽可能保证使本发明的活性化合物的最均匀分散。

在一些情况下,式I的 $\alpha$ -苯基丁烯酸甲酯作为杀真菌剂具有系统活性。它们可被采用作为叶子和土壤杀真菌剂,抵抗宽范围的植物病理学真菌,尤其是来自子囊菌纲、半知菌纲、藻形菌纲和担子菌纲的种类。

它们对于防治各种庄稼植物,如小麦、黑麦、大麦、燕麦、稻、玉米、牧草、棉花、大豆、咖啡、甘蔗、葡萄、水果和装饰植物以及蔬菜植物,如黄瓜、扁豆和南瓜,以及这些植物的种子上的多种真菌尤为重要。

化合物I特别适宜于防治下列植物疾病:

- \* 谷类作物上的禾白粉菌(*Erysiphe graminis*)(白粉菌),
- \* 南瓜上的白粉菌(*Erysiphe cichoralearum*)和单丝壳菌(*Sphaerotheca fuliginea*),
- \* 苹果上的叉丝单囊壳菌(*Podosphaera leucotricha*),
- \* 藤本植物上的钩丝壳菌(*Vincinula necator*),

- \* 谷类作物上的柄锈菌(*Puccinia species*),
- \* 棉花和牧草上的丝核菌(*Rhizoctonia species*),
- \* 谷类作物和甘蔗上的黑粉菌(*Ustilago species*),
- \* 苹果上的黑星菌(*Venturia inaequalis cscab*),
- \* 谷类作物上的长孺孢(*Helminthosporium species*),
- \* 小麦上的壳针孢(*Septoria nodorum*),
- \* 草霉、藤本植物上的葡萄孢(*Botrytis cinerea*)(gray mold),
- \* 花生上的尾孢菌(*Cercospora arachidicola*),
- \* 小麦、大麦上的 *Pseudocercospora herpotrichoides*,
- \* 稻上的 *Pyricularia Oryzae*,
- \* 马铃薯和蕃茄上的流行病疫(*phytophthora infestans*),
- \* 各种植物上的镰孢霉(*Fusarium*)和轮枝孢菌(*Verticillium*),
- \* 藤本植物上的单轴霉(*Plasmopara viticola*),
- \* 蔬菜和水果上的交链孢霉(*Alternaria*)。

本发明化合物还可用于材料的保护(木材防腐),如抵抗多变形青霉(*Paecilomyces Variotii*)。

它们可被转化成常规的剂型,如溶液剂,乳状剂、悬浮剂、粉剂、粉末剂、膏剂或颗粒剂。使用形式取决于特定的预定用途,在每一种情况下,它们应尽可能使活性化合物最均匀分散。

制剂用已知方式制备,如通过用溶剂和/或载体填充活性化合物,如果需要,使用乳化剂和分散剂,其中如果水被用作稀释剂,还可使用其它有机溶剂作为辅助溶剂。

用于这一目的的适宜助剂主要为:

- 溶剂,如芳香化合物(如二甲苯),氯代芳香化合物(如氯苯)、石蜡烃(如石油馏分)、醇(如甲醇、丁醇)、酮(如环己酮)、胺(如乙醇胺,二甲基甲酰胺)和水;
- 载体,如磨得很细的天然矿石(如高岭土、矾土、滑石、白垩)和磨得很细的合成矿石(如高度分散的硅石,硅酸盐);
- 乳状剂,如非离子和阴离子型乳化剂(如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷基磺酸盐和芳基磺酸盐)和



——分散剂,如木素-亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

适宜的表面活性物质为芳香磺酸,如木素磺酸、苯酚磺酸、萘磺酸和二丁基萘磺酸,以及脂肪酸的碱金属盐、碱土金属盐和铵盐,烷基和烷基芳基磺酸盐,烷基、月桂基醚和脂肪醇硫酸盐以及硫酸化的十六、十七和十八醇的盐,还有脂肪醇二醇醚的盐,磺化的萘和它的衍生物与甲醛的缩合产物,萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合产物,聚氧乙烯辛酚醚,乙氧基化的异辛基、辛基或壬基酚,烷基苯酚或三丁基苯基聚乙二醇醚,烷基芳基聚醚醇,异十三烷基醇,脂肪醇环氧乙烷缩合产物,乙氧基化的蓖麻油,聚氧乙烯烷基醚或聚氧丙烯,月桂醇聚乙二醇醚乙酸酯,山梨糖醇酯,木素亚硫酸盐废液或甲基纤维素。

含水使用形式可通过向乳液浓缩剂、分散剂、膏剂、可润湿的粉末剂或水可分散的颗粒剂中加入水来制备。为了制备乳剂、膏剂或油分散剂,可借助于湿润剂、粘合剂、分散剂或乳化剂将被用物均化在水中或溶解在油或溶剂中。然而,也可制备宜于用水稀释的由活性物质、湿润剂、粘合剂、分散剂或乳化剂和可能的溶剂或油组成的浓缩剂。

粉剂、散布剂和撒粉组合物可通过将活性物质与固体载体混合或共同研磨而制备。

颗粒剂如涂布的、浸渍的和均匀的颗粒剂可通过将活性化合物结合到固体载体上而制备。

固体载体为:矿物土,如硅胶、硅酸、硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、石灰石、石灰,白垩、红玄武石、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙和硫酸镁、氧化镁;磨得很细的合成物质、肥料,如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素、和植物产品,例如谷粉、树皮粉,木粉和坚果粉;纤维素粉末或其它固体载体。活性化合物在待用制剂中的浓度可在相当宽的范围内变化。

最一般的情况下,组合物含有0.0001~95%(重量)的活性化合物。

含有大于95%(重量)的活性化合物的制剂可被极其成功地运

用于超低体积方法(ULV)中,它甚至可只使用活性化合物而没有添加剂。

用作杀真菌剂时,活性化合物的浓度推荐为 0.01~95%(重量)、优选 0.5~90%(重量)。用作杀虫剂时,含有 0.0001~10%(重量)、优选 0.01~1%(重量)的活性化合物的制剂是适宜的。

活性化合物通常以 90%~100%、优选 95%~100%的纯度(按照 NMR 谱)使用。

这些制剂的实例为:

I. 90份(重量)本发明化合物 I 和 10份(重量)N-甲基- $\alpha$ -吡咯烷酮的溶液,它宜于以非常小的液滴形式使用;

II. 20份(重量)本发明化合物 I 在 80份(重量)烷基化苯、10份(重量)8-10mol 环氧乙烷与 1mol 的油酸 N-羟乙基酰胺的加成产物、5份(重量)十二烷基苯磺酸的钙盐、5份(重量)40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的加成产物组成的混合物中的溶液;通过将该制剂很好地分散在水中而获得分散剂;

III. 20份(重量)本发明化合物 I 在 40份(重量)环己酮、30份(重量)异丁醇、20份(重量)7mol 环氧乙烷与 1mol 异辛基苯酚的加成产物和 10份(重量)40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的加成产物组成的混合物中的溶液;通过将该制剂很好地分散在水中而获得分散剂;

IV. 20份(重量)本发明化合物 I 在 25份(重量)环己酮、65份(重量)沸点为 210~280°C 的石油馏分、和 10份(重量)40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的加成产物组成的混合物中的含水分散剂;通过将该制剂很好地分散在水中而获得分散剂;

V. 在锤磨机中研磨由 20份(重量)本发明化合物 I、3份(重量)二异丁基萘- $\alpha$ 磺酸的钠盐、17份(重量)来自亚硫酸废液的木素磺酸的钠盐和 60份(重量)粉状硅胶组成的混合物;喷洒混合物通过将该混合物很好地分散在水中而获得;

VI. 3份(重量)本发明化合物 I 和 97份(重量)的细粉高岭土组成的紧密混合物;这种撒粉组合物含有 3%(重量)的活性化合物;

VII. 30份(重量)本发明化合物 I、92份(重量)粉状硅胶和 8份(重量)已喷洒到硅胶表面上的液体石蜡组成的紧密混合物;这种制剂给予了活性化合物良好的粘合性;

VIII. 40份(重量)本发明化合物 I、10份(重量)的苯酚磺酸/尿素/甲醛缩合物的钠盐、2份(重量)硅胶和 48份(重量)水组成的稳定的水分散体,它可进一步被稀释;

IX. 20份(重量)本发明化合物 I、2份(重量)十二烷基苯磺酸的钙盐、8份(重量)脂肪醇聚乙二醇醚、2份(重量)苯酚磺酸/尿素/甲醛缩合物的钠盐和 68份(重量)石蜡矿物油组成的稳定的油分散剂;

X. 在锤磨机中研磨由 10份(重量)本发明化合物 I、4份(重量)二异丁基萘- $\alpha$ -磺酸的钠盐、20份(重量)的来自亚硫酸废液的木素磺酸的钠盐、38份(重量)硅胶和 38份(重量)高岭土组成的混合物。通过将该混合物很好地分散在 10,000份(重量)水中,获得含有 0.1%(重量)的活性化合物的喷洒混合物。

通过用杀真菌活性量的活性化合物处理要保护免受真菌侵袭的种子、植物、材料或土壤来使用化合物 I。

在材料,植物或种子被真菌感染之前或之后使用它们。

根据所需达到的效果的类型,施用剂量为 0.02-3kg 活性化合物/公顷,优选 0.1-1kg/公顷。

在处理种子时,一般需要活性化合物的量为 0.001-50g/千克种子,优选 0.01-10g/千克种子。

在室外条件防治害虫时,活性化合物的用量为 0.02-10kg/公顷,优选 0.1-2.0kg/公顷。

化合物 I 本身或与除草剂或杀真菌剂结合还可与其它作物保护剂一起混合使用,例如与生长调节剂或害虫或细菌防治剂一起使用,还可与肥料或用来消除营养和痕量元素缺少的矿物盐溶液一起使用。

作物保护剂和肥料可以重量比为 1:10~10:1 的比例加入到本发明的组合物中,如果适宜甚至在使用之前立即加入(桶混合)。在与杀真菌剂或杀虫剂混合时,在许多情况下获得了杀真菌作用范围

的增大。

可与根据本发明的化合物一起使用的下表的杀真菌剂意在说明这种结合的可能性,但不限于它们:

硫、二硫代氨基甲酸盐和它们的衍生物、例如二甲氨基二硫代甲酸铁、二甲氨基二硫代甲酸铁、亚乙基双氨基二硫代甲酸铁、亚乙基氨基双二硫代甲酸镁、亚乙基二胺双氨基二硫代甲酸锌镁、四甲基二硫化四烷基秋兰姆[sic]、N,N-亚乙基双氨基二硫代甲酸锌的氨配合物、N,N-亚丙基双氨基二硫代甲酸锌、N,N-聚丙烯双(氨基硫羰基)二硫化物;硝基衍生物,例如巴豆酸二硝基-(1-甲基庚基)苯酯、3,3-二甲基丙烯酸2-仲-丁基-4,6-二硝基苯酯、异丙基碳酸2-仲-丁基-4,6-二硝基苯酯、5-硝基异邻苯二甲酸二异丙酯;

杂环物质,例如2-十七烷基-2-咪唑啉乙酸酯、2,4-二氯-6-(邻-氯苯胺基)-s-三吡嗪、O,O-二乙基苯二甲酰亚氨基磷酰基硫酯、5-氨基-1-β-[双-(二甲基氨基)-氧磷基]-3-苯基-1,2,4-三唑、2,3-二氟基-1,4-二硫代-蒽醌、2-硫代-1,3-二硫-β-[4,5-b]噻啉、1-(丁基氨基甲酰基)-2-苯并咪唑氨基甲酸甲酯、2-甲氧基羰基氨基苯并咪唑、2-(咪喃-2-基)苯并咪唑、2-(噻唑-4-基)苯并咪唑、N-(1,1,2,2-四氯乙硫基)四氢苯邻二甲酰亚胺、N-三氯甲硫基四氢苯邻二甲酰亚胺、N-三氯甲硫基苯邻二甲酰亚胺、N-二氯氟甲硫基-N',N'-二甲基N-苯基硫酰胺、5-乙氧基-3-三氯甲基-1,2,3-噻二唑、2-氟硫基甲基硫代苯并三唑、1,4-二氯-2,5-二甲氧基苯、4-(2-氯苯基亚胂基)-3-甲基-5-异恶唑、吡啶-2-硫代-1-氧化物、8-羟基喹啉或它的铜盐、2,3-二氢-5-羧酰苯胺基-6-甲基-1,4-氧硫杂环己二烯、2,3-二氢-5-羧酰苯胺基-6-甲基-1,4-氧硫杂环己二烯-4,4-二氧化物、2-甲基-5,6-二氢-4H-吡喃-3-羧酰苯胺、2-甲基-吡喃-3-羧酰苯胺、2,5-二甲基吡喃-3-羧酰苯胺、2,4,5-三甲基吡喃-3-羧酰苯胺、N-环己基-2,5-二甲基-吡喃-3-羧酰胺、N-环己基-N-甲氧基-2,5-

二甲基呋喃-3-羧酰胺、2-甲基-N-苯甲酰苯胺、2-碘-N-苯甲酰苯胺、N-甲酰-N-吗啉-2,2,2-三氯乙基乙缩醛、哌嗪-1,4-二基双(1-(2,2,2-三氯乙基)甲酰胺、1-(3,4-二氯苯胺基)-1-甲酰氨基-2,2,2-三氯乙烷、2,6-二甲基-N-三癸基吗啉或它的盐、2,6-二甲基-N-环十二烷基吗啉或它的盐、N-[3-(对叔丁基苯基)-2-甲基丙基]-顺-2,6-二甲基吗啉、N-[3-(对叔丁基苯基)-2-甲基丙基]哌啶、1-[2-(2,4-二氯苯基)-4-乙基-1,3-二氧戊烷-2-基乙基]-1H-1,2,4-三唑、1-[2-(2,4-二氯苯基)-4-正丙基-1,3-二氧戊烷-2-基-乙基]-1H-1,2,4-三唑、N-(叔丙基)-N-(2,4,6-三氯苯氧基乙基)-N-咪唑基脲、1-(4-氯苯氧基)-3,3-二甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-2-丁酮、1-(4-氯苯氧基)-3,3-二甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-2-丁醇、 $\alpha$ -(2-氯苯基)- $\alpha$ -(4-氯苯基)-5-嘧啶甲醇、5-丁基-2-二甲基氨基-4-羟基-6-甲基嘧啶、双(对-氯苯)-3-吡啶甲醇、1,2-双(3-乙氧羰基-2-硫脲基)苯、1,2-双(3-甲氧羰基-2-硫脲基)苯。

还有各种杀真菌剂,例如十二烷基乙酸脲。乙酸盐、3-[3-(3,5-二甲基-2-氧环己基)-2-羟基乙基]戊二酰亚胺、六氯苯、丙氨酸DL-甲基-N-(2,6-二甲基苯基)-N-2-呋喃甲酯,DL-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(2-甲氧基乙酰基)丙氨酸甲酯、N-(2,6-二甲基苯基)-N-氯乙酰-D,L-2-氨基丁内酯、DL-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(苯基乙酰基)丙氨酸甲酯、5-甲基-5-乙烯基-3-(3,5-二氯苯基)-2,4-二氧-1,3-恶唑烷、3-[3,5-二氯苯基(-5-甲基-5-甲氧基甲基)-1,3-恶唑烷-2,4-二酮、3-(3,5-二氯苯基)-1-异丙基氨基甲酰基乙内酰脲、N-(3,5-二氯苯基)-1,2-二甲基-环丙烷-1,2-二羧酰胺、2-氨基-[N-乙基氨基羰基-2-甲脞基]-乙酰胺、1-[2-(2,4-二氯苯基)戊基]-1H-1,2,4-三唑、2,4-二氯- $\alpha$ -(1H-1,2,4-三唑基-1-甲基)二苯甲基醇、N-(3-氯-2,6-二硝基-4-三氟甲基苯基)-5-三氟甲基-3-氯-2-氨基吡啶、1-((双(4-

氟苯基)甲基甲硅烷基)甲基)-1H-1,2,4-三唑。

### 合成实施例

下面合成实施例描述的方法是将起始化合物适宜改性而获得化合物 I。在下表中列出了由此获得的化合物及其物理数据。实施例 1:  $\alpha$ -{2-[1-(4-氟苯基)吡唑-3-基氧甲基]苯基}丁-2-烯酸甲酯

#### 1.a $\alpha$ -(2-溴甲基苯基)丁-2-烯酸甲酯

在  $-5^{\circ}\text{C}$  将溴化氢通入 14.8g 的  $\alpha$ -[2-(2-甲基苯基氧甲基)苯基]丁-2-烯酸甲酯在 250ml 的二氯甲烷的溶液中,直至饱和(约 18gHBr)。反应结束后( $25^{\circ}\text{C}$  下约 2 小时),在减压下将溶剂蒸出。将由此获得的残余物溶解在 300ml 环己烷中。用 5% 浓度的氢氧化钠溶液、并接着用水洗涤该溶液,干燥和浓缩有机相后,获得 8g 的标题化合物(m. p. : $64-66^{\circ}\text{C}$ )。

#### 1.b 1-(4-氟苯基)-3-羟基吡唑

首先分批用 100.8g 的叔丁醇钾、接着(搅拌 10 分钟后)在  $45^{\circ}\text{C}$  -  $50^{\circ}\text{C}$  下在 45 分钟期间用 27.7g 丙炔酸甲酯在 90ml 叔丁醇的溶液处理 57.5g 4-氟苯基胼硫酸氢盐在 1000ml 叔丁醇中的溶液。在达沸点 1 小时后,冷却混合物,在减压下除去溶剂。将由此获得的残余物溶解在 1200ml 水中。首先用二氯甲烷洗涤水相,接着酸化,产物以固体沉淀。获得 47.6g 标题化合物, m. p. : $185-187^{\circ}\text{C}$ 。

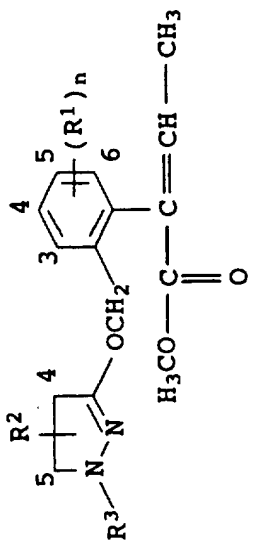
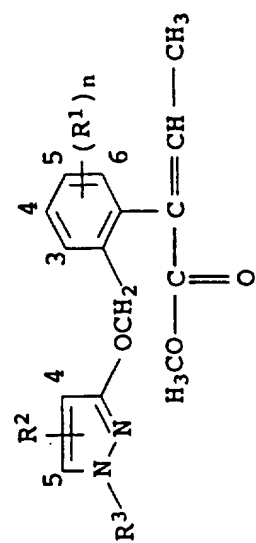
1.c 在  $60^{\circ}\text{C}$  将 2.43g 来自 1.b 的产物、2.58g 碳酸钾、3.36g 来自 1.a 的产物和 33ml 二甲基甲酰胺的混合物搅拌 4 小时。冷却后,将反应混合物溶解在 300ml 水中。在用甲基叔丁基醚萃取水溶液后,从有机相中分离产物,接着用色谱法纯化(硅胶,环己烷/MTBE 3:1)。(4.5g 标题化合物, m. p. : $65-66^{\circ}\text{C}$ )。

实施例 2:  $\alpha$ -{2-[1-苯基-4,5-二氢吡唑-3-基氧甲基]苯基}丁-2-烯酸甲酯

在  $60^{\circ}\text{C}$  将 2.43g N-苯基吡唑烷-3-酮、3.1g 碳酸钾、4.04g 来自 1.a 的产物和 40ml 二甲基甲酰胺的混合物搅拌 4 小时。冷却后,将反应混合物溶解在 300ml 氯化钠溶液中(稀释)。在用甲基叔

丁基醚萃取水溶液后,从有机相分离产物,接着使用环己烷/甲基叔丁基醚 5:1 在硅胶上色谱纯化(1.4g 标题化合物, m.p. 90 - 92°C)。

表



号	式	R <sup>1n</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	m.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
1	I.1	H	H	苯基	68-69
2	I.1	H	H	4-甲基苯基	65-66
3	I.1	H	H	3-氯苯基	58-59
4	I.1	H	H	4-氯苯基	65-66
5	I.1	H	H	4-氟苯基	53-54
6	I.1	H	H	2, 4-(Cl) <sub>2</sub> -苯基	72-74
7	I.1	H	H	2, 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基	1716, 1541, 1483, 1463, 1434, 1358, 1253, 1206, 1036, 747
8	I.1	H	H	2-CH <sub>3</sub> -4-氯-苯基	1715, 1543, 1495, 1480, 1465, 1357, 1254, 1036, 940, 748



号	式	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	m.p. [°C]/IR[cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
9	I.1	H	H	2-Cl- 苯基	1715, 1546, 1495, 1477, 1451, 1358, 1254, 1036, 758
10	I.1	H	H	3,5-(Cl) <sub>2</sub> - 苯基	90-92
11	I.1	H	H	2,6-(Cl) <sub>2</sub> - 苯基	1714, 1547, 1494, 1469, 1439, 1356, 1254, 1037, 793, 749
12	I.1	H	H	2-CH <sub>3</sub> - 苯基	1715, 1541, 1482, 1463, 1435, 1358, 1254, 1048, 1036
13	I.1	H	H	3-CH <sub>3</sub> - 苯基	1715, 1545, 1495, 1483, 1465, 1356, 1253, 1052, 1036
14	I.1	H	H	4-OCH <sub>3</sub> - 苯基	1714, 1543, 1517, 1484, 1465, 1442, 1359, 1251, 1049, 1035
15	I.1	H	H	2,5-(Cl) <sub>2</sub> - 苯基	1715, 1548, 1490, 1472, 1434, 1346, 1254, 1056, 1029, 747
16	I.1	H	H	3,4-(Cl) <sub>2</sub> - 苯基	97-98
17	I.1	H	H	3-CF <sub>3</sub> - 苯基	78-79
18	I.1	H	H	5-CF <sub>3</sub> - 吡啶 - 2 - 基	54-56
19	I.1	H	4-Cl	4-CH <sub>3</sub> - 苯基	67-68

号	式	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	m.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
20	I.1	H	4-Cl	4-Cl-苯基	1713, 1555, 1512, 1496, 1435, 1357, 1255, 1123, 936, 828
21	I.1	H	H	3-OCH <sub>3</sub> -苯基	1714, 1607, 1597, 1545, 1476, 1356, 1252, 1220, 1046, 1037
22	I.1	H	H	3,4-[O-CF <sub>2</sub> -O]- 苯基	69-71
23	I.1	H	4-COOCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基	118-119
24	I.1	H	4-COOCH <sub>3</sub>	2,4-(Cl) <sub>2</sub> -苯基	1715, 1564, 1511, 1494, 1436, 1298, 1284, 1254, 1209, 1112
25	I.1	H	H	4-CF <sub>3</sub> -苯基	1714, 1617, 1551, 1435, 1329, 1323, 1255, 1121, 1112
26	I.1	H	H	吡啶-2-基	1715, 1594, 1547, 1485, 1471, 1451, 1355, 1254, 1047, 776
27	I.1	H	5-CH <sub>3</sub>	苯基	73-74
28	I.1	H	5-CF <sub>3</sub>	2,4-(Cl) <sub>2</sub> -苯基	1,61 (d, 3H); 3,69 (s, 3H); 5,08 (s, 2H); 6,19 (s, 1H); 7,08-7,60 (8H)
29	I.1	H	4-NO <sub>2</sub>	2,4-(Cl) <sub>2</sub> -苯基	116-118
30	I.1	H	4-Cl	2,4-(Cl) <sub>2</sub> -苯基	112-114

号	式	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	m.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
31	I.1	H	4-COOCH <sub>3</sub>	苯基	117-118
32	I.1	H	4-Cl	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	107-109
33	I.2	H	H	苯基	90-92
34	I.1	3-Cl	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	1717, 1546, 1477, 1354, 1261, 1218, 1055
35	I.1	3-Cl	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	1715, 1591, 1578, 1549, 1458, 1436, 1352, 1258
36	I.1	3-Cl	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1716, 1542, 1517, 1486, 1357, 1252, 1045, 1029
37	I.1	3-Cl	H	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	116-118
38	I.2	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1715, 1639, 1598, 1495, 1434, 1415, 1354, 1255
39	I.2	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	115-116
40	I.1	H	H	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1714, 1537, 1490, 1455, 1434, 1362, 1254, 1049, 1036
41	I.1	H	H	CH <sub>2</sub> -(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	1714, 1537, 1492, 1434, 1362, 1254, 1049, 1036, 1016
42	I.1	H	5-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1720, 1543, 1481, 1455, 1435, 1261, 1207, 1089, 1037
43	I.1	H	H	5-Cl-吡啶-2-基	76-78
44	I.1	H	H	6-Cl-吡啶-3-基	106-108
45	I.1	H	H	吡啶-2-基	89-91

号	式	R <sup>1n</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	m.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
46	I.1	H	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1713, 1599, 1555, 1512, 1500, 1357, 1254, 1121
47	I.1	H	4-Cl	吡啶-2-基	97-99
48	I.1	H	4-Br	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	88-90
49	I.1	H	4-NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	112-114
50	I.1	H	H	CH <sub>2</sub> -(2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )	61-64
51	I.1	H	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	1715, 1547, 1505, 1481, 1465, 1358, 1257, 1205, 1051, 1038
52	I.1	H	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	55-57
53	I.2	H	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	82-84
54	I.1	H	H	6-Cl-吡啶-2-基	111-113

## 抵抗有害真菌活性的实施例

通过下面实验可以证明式 I 化合物的杀真菌活性：

将活性化合物制备成在 70% (重量) 环己烷、20% (重量) Nekanil<sup>®</sup>LN (Lutensol<sup>®</sup>Ap6, 基于乙氧基化的烷基苯酚的具有乳化和分散作用的湿润剂) 和 10% (重量) Emulphor<sup>®</sup>EL (Emulan<sup>®</sup>EL, 基于乙氧基化的脂肪醇的乳化剂) 组成的混合物中的 20% 浓度的乳液, 并相应地用水稀释至所需浓度。

所用对照化合物为公开在 EP - A 513580 中的下列活性化合物：

- A EP - A 513580 的实施例 17
- B EP - A 513580 的实施例 56
- C EP - A 513580 的实施例 57
- D EP - A 513580 的实施例 143
- E EP - A 513580 的实施例 144
- F EP - A 513580 的实施例 145

### 1. 禾白粉菌 (*Erysiphe graminis* var *tritici*)

首先用活性化合物的含水制剂 (含有 16ppm 的制剂) 处理小麦秧苗的叶子 (Friihgold 变种)。约 24 小时后, 用小麦霉菌 (禾白粉菌) 的孢子撒粉于植物上。接着将用这种方式处理的植物在 20 - 22°C 和相对湿度为 75 - 80% 下培养 7 天。接着确定真菌病害情况。肉眼进行评价。

在这个试验中, 用本发明化合物 1、2、3、4、5、6、10、12、13、15、16 和 17 处理的植物有 15% 或更少发生病害, 然而用已知活性化合物处理的植物发病率为 70% (A 和 C)、60% (B) 或 30% (D、E 和 F)。在未处理的对照植物的情况下, 发病率为 70%。

### 2. 单轴霉 (*Plasmopara viticola*)

用活性化合物制剂喷洒盆栽的葡萄藤 (变种. Müller Thurgau) 直至完全滴湿。8 天后, 用单轴霉菌的游动孢子的悬浮液喷洒植物, 在 20 - 30°C 和高空气湿度下保持 5 天。在评价前, 接着将植物在高

空气湿度下保持 16 小时。肉眼进行评价。

在这个试验中,用含有 63ppm 本发明化合物 1、2、4、5、6、7、8、9、12、13、14 和 18 的制剂处理的植物有 5% 或更少发生病害,然而用含有 125ppm 已知活性化合物的制剂处理的植物发病率为 60% (A 和 F)、40% (C) 或 25% (E)。未处理的对照植物的发病率为 60%。