



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 103547565 B

(45) 授权公告日 2015. 05. 20

(21) 申请号 201280024754. X
 (22) 申请日 2012. 06. 15
 (66) 本国优先权数据
 201110163457. 0 2011. 06. 17 CN
 201110163460. 2 2011. 06. 17 CN
 201110163496. 0 2011. 06. 17 CN
 201110163314. X 2011. 06. 17 CN

(85) PCT国际申请进入国家阶段日
 2013. 11. 22
 (86) PCT国际申请的申请数据
 PCT/CN2012/077011 2012. 06. 15

(87) PCT国际申请的公布数据
 W02012/171484 ZH 2012. 12. 20

(73) 专利权人 中国中化股份有限公司
 地址 100031 中国北京市西城区复兴门内大街 28 号
 专利权人 沈阳化工研究院有限公司

(72) 发明人 刘长令 黄光 兰杰 郝树林
 李志念 李慧超 关爱莹 姜艾汝
 徐英

(74) 专利代理机构 沈阳科苑专利商标代理有限公司 21002
 代理人 许宗富 何薇

(51) Int. Cl.
 C07C 255/58(2006. 01)
 C07C 255/59(2006. 01)
 C07C 255/60(2006. 01)
 C07C 253/30(2006. 01)
 C07C 317/36(2006. 01)
 C07C 315/04(2006. 01)

C07C 323/36(2006. 01)
 C07C 319/20(2006. 01)
 C07C 311/39(2006. 01)
 C07C 303/40(2006. 01)
 C07D 213/74(2006. 01)
 C07D 239/52(2006. 01)
 A01N 43/40(2006. 01)
 A01N 41/10(2006. 01)
 A01N 41/06(2006. 01)
 A01N 37/48(2006. 01)
 A01N 37/44(2006. 01)
 A01N 37/34(2006. 01)
 A01P 3/00(2006. 01)

(续)

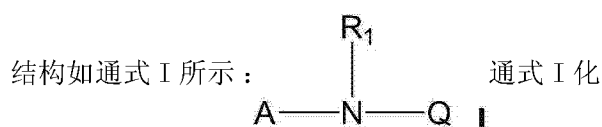
(56) 对比文件
 US 3965109 , 1976. 06. 22, 说明书第 11-12 栏化合物 33.
 GB 1383306 , 1975. 02. 12, 说明书第 4 页表 1 化合物 13.
 US 4614742 , 1986. 09. 30, 全文.
 CN 101391981 A, 2009. 03. 25, 说明书第 6-7 页.
 Chao Huang et al. Synthesis of polyhalo acridones as pH-sensitive fluorescence probes. 《Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters》. 2010, 第 20 卷第 4665 - 4669 页.
 David P. Clifford et al. The Synthesis and Biological Activity of Substituted Chlorinated Benzenedicarbonitriles. 《Pestic. Sci.》. 1988, 第 24 卷第 111-121 页.

审查员 赵永江

权利要求书4页 说明书72页

(54) 发明名称
 一种取代氰基苯胺类化合物及制备与应用

(57) 摘要
 一种取代氰基苯胺类化合物或其盐, 化合物



合物在农业领域中具有光谱的杀菌活性, 对黄瓜霜霉病、小麦白粉病、玉米锈病、稻瘟病、黄瓜灰霉病等多种病菌都有很好的防效。特别地, 对稻瘟病、黄瓜灰霉病、玉米锈病和黄瓜霜霉病, 在较低剂量下仍具有很好的防治效果。而且制备该类化合物的原料易得, 合成方法简便。

[转续页]

[接上页]

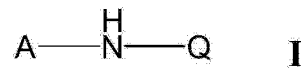
(51) Int. Cl.

A01P 7/02(2006.01)

A01P 7/04(2006.01)

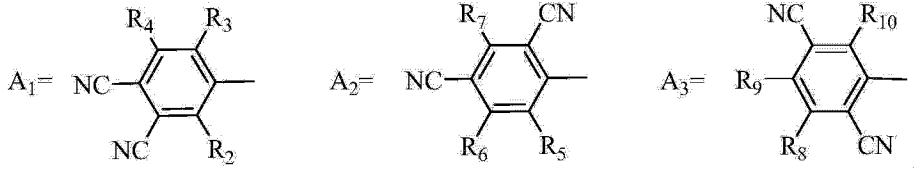
A01P 13/00(2006.01)

1. 一种取代氰基苯胺类化合物, 结构如通式 I 所示 :



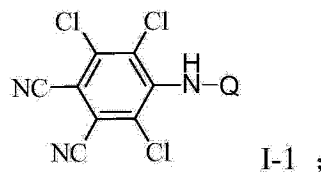
式中 :

A 选自 A₁、A₂或 A₃



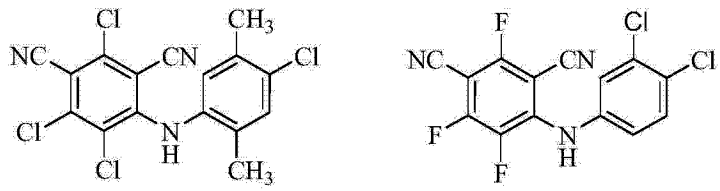
当 A 选自 A₁时, 其中 R₂、R₃、R₄选自氯 ;

Q 选自苯基, 并任选地被 (R₁₁)_n 取代, 其中 R₁₁选自卤素、硝基、氰基、C₁-C₄烷基、卤代 C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、卤代 C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷氧基羰基或甲基氨基羰基 ; n=2-4 ; 结构式如 I-1 所示 :

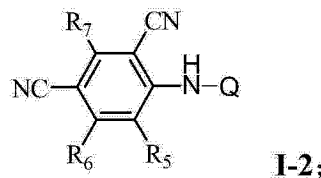


当 A 选自 A₂时, 其中 R₅、R₆、R₇相同, 选自氟或氯 ;

Q 选自苯基、吡啶 -2- 基、吡啶 -3- 基、吡啶 -4- 基、嘧啶 -2- 基、吡嗪 -2- 基或哒嗪 -3- 基, 并各自任选地被 (R₁₁)_n 取代, 其中 R₁₁选自卤素、硝基、氰基、C₁-C₄烷基、卤代 C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、卤代 C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷氧基羰基、甲基氨基羰基、苯氨基羰基、4- 氯苯氨基羰基、羧基或 CO₂Na ; n=0-5 ; 且当 Q 选自苯基时, n ≠ 0 或 1 ; 同时不包括如下化合物 :

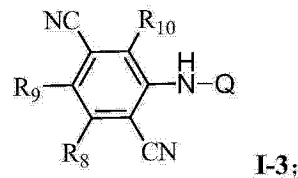


结构式如 I-2 所示 :



当 A 选自 A₃时, 其中 R₈、R₉、R₁₀相同, 选自氟或氯 ;

Q 选自苯基、吡啶 -2- 基、吡啶 -3- 基、吡啶 -4- 基或嘧啶 -2- 基, 并各自任选地被 (R₁₁)_n 取代, 其中 R₁₁选自卤素、硝基、氰基、C₁-C₄烷基、卤代 C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、卤代 C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷氧基羰基或甲基氨基羰基 ; n=2-4 ; 结构式如 I-3 所示 :



或通式 I-1、I-2 或 I-3 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

2. 根据权利要求 1 所述的化合物,其特征在於:通式 I-1 中

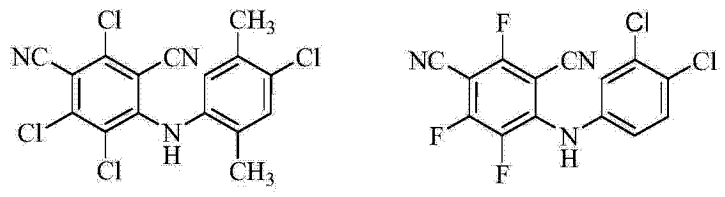
Q 选自苯基,并任选地被 $(R_{11})_n$ 取代,其中 R_{11} 选自氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、甲氧基羰基或甲基氨基羰基; $n=2-4$;

或通式 I-1 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

3. 根据权利要求 1 所述的化合物,其特征在於:通式 I-2 中

R_5 、 R_6 、 R_7 相同,选自氟或氯;

Q 选自苯基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、嘧啶-2-基、吡嗪-2-基或咪唑-3-基,并各自任选地被 $(R_{11})_n$ 取代,其中 R_{11} 选自氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基氨基羰基、苯氨基羰基、4-氯苯氨基羰基、羧基或 CO_2Na ; $n=0-5$;且当 Q 选自苯基时, $n \neq 0$ 或 1;同时不包括如下化合物:



或通式 I-2 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

4. 根据权利要求 1 所述的化合物,其特征在於:通式 I-3 中

R_8 、 R_9 、 R_{10} 相同,选自氟或氯;

Q 选自苯基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基或嘧啶-2-基,并各自任选地被 $(R_{11})_n$ 取代,其中 R_{11} 选自氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、异丙基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基或甲基氨基羰基; $n=2-4$;

或通式 I-3 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

5. 根据权利要求 2 所述的化合物,其特征在於:通式 I-1 中

Q 选自 2-氟-4-硝基苯基、2-氯-4-硝基苯基、2-氯-5-硝基苯基、2-氯-4-三氟甲基苯基、2-氯-5-三氟甲基苯基、2,4-二硝基苯基、3-三氟甲基-4-氰基苯基、2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、3-三氟甲基-4-氯苯基、2,3,4-三氟苯基;2-溴-6-氰基-4-硝基苯基、2,6-二氟-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2,6-二溴-4-硝基苯基、2-溴-6-氯-4-硝基苯基或 2-甲基-3-氯-4,6-二硝基苯基;

或通式 I-1 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形

成的盐。

6. 根据权利要求 3 所述的化合物,其特征在于:通式 I-2 中

当 R_5 、 R_6 、 R_7 选自氟时, Q 选自 2- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 氯 -4- 硝基苯基、2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基、2, 6- 二溴 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 三氟甲基苯基或 2- 溴 -6- 氰基 -4- 硝基苯基;

当 R_5 、 R_6 、 R_7 选自氯时, Q 选自 2, 6- 二氟苯基、2- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 氯 -5- 三氟甲基苯基、2- 氟 -5- 三氟甲基苯基、2- 氯 -4- 硝基苯基、2- 硝基 -4- 氯苯基、2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基、2, 4, 6- 三氯苯基、2, 3, 4- 三氟苯基、2, 4- 二硝基苯基、3- 三氟甲基 -4- 氰基苯基、2, 6- 二氟 -4- 硝基苯基、2, 4- 二氯 -6- 氰基苯基、2, 6- 二氯 -4- 氰基苯基、2, 6- 二氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 氯 -6- 氟 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 硝基苯基、2- 溴 -6- 氯 -4- 硝基苯基、2- 溴 -6- 氰基 -4- 硝基苯基、2, 6- 二溴 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 甲氧基羰基苯基、2- 甲基 -6- 氯 -4- 硝基苯基、2- 甲基 -4- 氯 -6- 硝基苯基、2, 6- 二硝基 -3- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 甲基 -3- 氯 -4, 6- 二硝基苯基、2, 3, 5- 三氯 -4, 6- 二氰基苯基、5- 溴吡啶 -2- 基、3- 氯 -5- 三氟甲基吡啶 -2- 基、3, 5, 6- 三氯吡啶 -2- 基、3, 4, 5, 6- 四氯吡啶 -2- 基、2- 氯吡啶 -3- 基、6- 溴吡啶 -3- 基、2, 5- 二氯吡啶 -3- 基、2- 氯吡啶 -4- 基、3- 溴吡啶 -4- 基、3, 5- 二氯吡啶 -4- 基、嘧啶 -2- 基、4, 6- 二甲氧基嘧啶 -2- 基、4- 三氟甲基 -5- 乙氧基羰基嘧啶 -2- 基、6- 氯吡嗪 -2- 基或 6- 氯哒嗪 -3- 基;

或通式 I-2 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

7. 根据权利要求 4 所述的化合物,其特征在于:通式 I-3 中

当 R_8 、 R_9 、 R_{10} 选自氟时, Q 选自 2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基、2- 氟 -4- 硝基苯基、2- 氯 -4- 硝基苯基、2- 氯 -5- 硝基苯基、2- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 甲氧基 -4- 硝基苯基、2- 硝基 -4- 氯苯基、3- 三氟甲基 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯 -4- 硝基苯基、2, 6- 二溴 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 溴 -6- 氰基 -4- 硝基苯基、2- 溴 -6- 氯 -4- 硝基苯基或 3, 5- 二氯吡啶 -4- 基;

当 R_8 、 R_9 、 R_{10} 选自氯时, Q 选自 2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基、2, 4- 二硝基苯基、2- 氯 -4- 硝基苯基、2- 氯 -5- 硝基苯基、2- 硝基 -4- 氯苯基、2- 甲氧基 -4- 硝基苯基、3- 三氟甲基 -4- 氯苯基、2- 氟 -4- 硝基苯基、2- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 氯 -5- 三氟甲基苯基、3- 三氟甲基 -4- 氰基苯基、2, 6- 二氯 -4- 硝基苯基、2, 6- 二溴 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氟 -4- 硝基苯基、2- 氯 -6- 氟 -4- 硝基苯基、2- 溴 -6- 氯 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 溴 -6- 氰基 -4- 硝基苯基、2- 甲基 -3- 氯 -4, 6- 二硝基苯基、2, 5- 二氯吡啶 -3- 基、3, 5- 二氯吡啶 -4- 基或嘧啶 -2- 基;

或通式 I-3 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

8. 根据权利要求 5 所述的化合物,其特征在于:通式 I-1 中

Q 选自 2- 氟 -4- 硝基苯基、2- 氯 -4- 硝基苯基、2- 氯 -5- 硝基苯基、2- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基、2- 溴 -6- 氰基 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氟 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 硝基苯基、2, 6- 二溴 -4- 硝基苯基

或 2- 溴 -6- 氯 -4- 硝基苯基 ;

或通式 I-1 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

9. 根据权利要求 6 所述的化合物,其特征在於:通式 I-2 中

当 R_5 、 R_6 、 R_7 选自氟时, Q 选自 2- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基或 2, 6- 二溴 -4- 硝基苯基 ;

当 R_5 、 R_6 、 R_7 选自氯时, Q 选自 2- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2- 氯 -5- 三氟甲基苯基、2- 氟 -5- 三氟甲基苯基、2- 氯 -4- 硝基苯基、2, 4- 二硝基苯基、2- 硝基 -4- 氯苯基、2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基、2, 3, 4- 三氟苯基、2, 4, 6- 三氯苯基、2, 6- 二氟 -4- 硝基苯基、2, 4- 二氯 -6- 氰基苯基、2, 6- 二氯 -4- 氰基苯基、2, 6- 二氯 -4- 三氟甲基苯基、2, 6- 二氯 -4- 甲氧基羰基苯基、2- 氯 -6- 氟 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 硝基苯基、2- 溴 -6- 氯 -4- 硝基苯基、2- 溴 -6- 氰基 -4- 硝基苯基、2, 6- 二溴 -4- 硝基苯基、2- 甲基 -6- 氯 -4- 硝基苯基、2- 甲基 -3- 氯 -4, 6- 二硝基苯基、2, 3, 5- 三氯 -4, 6- 二氰基苯基、3- 氯 -5- 三氟甲基吡啶 -2- 基、3, 5, 6- 三氯吡啶 -2- 基、3, 4, 5, 6- 四氯吡啶 -2- 基、2, 5- 二氯吡啶 -3- 基、3, 5- 二氯吡啶 -4- 基、6- 氯吡嗪 -2- 基或 6- 氯哒嗪 -3- 基 ;

或通式 I-2 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

10. 根据权利要求 7 所述的化合物,其特征在於:通式 I-3 中

当 R_8 、 R_9 、 R_{10} 选自氟时, Q 选自 2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基、2- 溴 -6- 氰基 -4- 硝基苯基或 2- 溴 -6- 氯 -4- 硝基苯基 ;

当 R_8 、 R_9 、 R_{10} 选自氯时, Q 选自 2- 氟 -4- 硝基苯基、2- 氯 -4- 三氟甲基苯基、2, 4- 二氯苯基、2- 氯 -4- 溴苯基、2- 溴 -4- 氯苯基、2, 6- 二氯苯基、2, 6- 二氯 -4- 硝基苯基、2, 6- 二溴 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氟 -4- 硝基苯基、2- 氯 -6- 氟 -4- 硝基苯基、2- 溴 -6- 氯 -4- 硝基苯基、2, 6- 二氯 -4- 三氟甲基苯基、2, 5- 二氯吡啶 -3- 基或 3, 5- 二氯吡啶 -4- 基 ;

或通式 I-3 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

11. 一种根据权利要求 1 所述的通式 I 化合物或其盐在农业或其他领域中用作制备杀菌剂药物的用途。

12. 一种杀菌组合物,其特征在於:含有作为活性组分的如权利要求 1 所述的通式 I 化合物和农业上可接受的载体,组合物中活性组分的重量百分含量为 0.5-90%。

一种取代氰基苯胺类化合物及制备与应用

技术领域

[0001] 本发明属于农用杀菌剂领域。具体地涉及一种取代氰基苯胺类化合物及制备与应用。

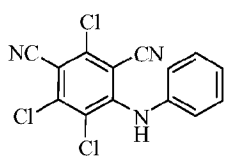
背景技术

[0002] 二苯胺 (diphenylamine) 和氟啶胺 (fluazinam) 是已知的杀菌剂,前者主要用于防治水果蔬菜仓储病害,后者主要用于大田作物防治多种病害。

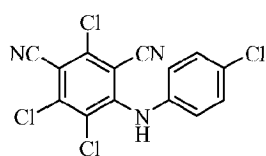
[0003] 专利 CN101391981A 公开了如下通式所示的化合物可以作为合成一种具有荧光活性及潜在药物活性的新的多卤代吡啶酮类化合物的中间体,其中提及了化合物 IV-A(KC1)、化合物 IV-B(KC2)、化合物 IV-D(KC3)、化合物 IV-E(KC4)、化合物 IV-H(KC5)、化合物 IV-C(KC6)、IV-O(KC7)、IV-P(KC8)、IV-Q(KC9)、IV-R(KC10)、IV-U(KC11),但没有任何生物活性报道;专利 US4614742A 公开了化合物 6(KC7)、7(KC8) 和 8(KC12),在 500ppm 对稻瘟病 (Blast of rice) 和柑橘腐烂病 (Canker of citrus fruit) 的抑菌圈直径分别为 22.5mm, 10.2mm, 15.5mm 和 13.8mm, 0mm, 0mm, 其中化合物 6 和 7 对梨黑星病菌的抑制率分别为 100%, 90%;JP2000169743A 报道了酞花菁类化合物的生产工艺,其中涉及了化合物 KC13。

[0004] 文献 Pesticide Science(1988),24(2),111-21 报道了化合物 XXIX(KC1)、XXX(KC14)、XXXI(KC15) 在高剂量下对有关病害如葡萄霜霉病菌 (*Plasmopora viticola*) 等有一定的活性;Journal of Medicinal Chemistry(1978),21(9),906-13 公开了编号为 28g(KC16) 的化合物具有一定抗炎活性。

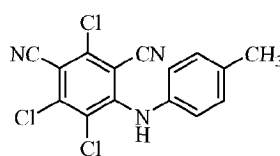
[0005]



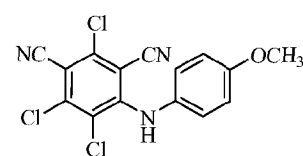
KC1



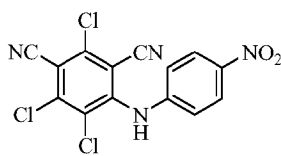
KC2



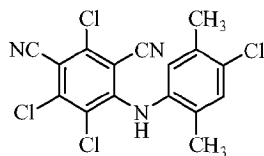
KC3



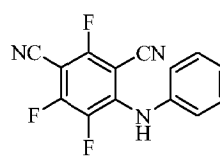
KC4



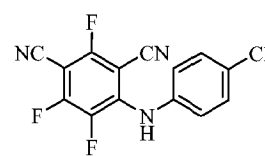
KC5



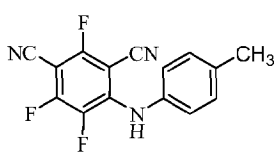
KC6



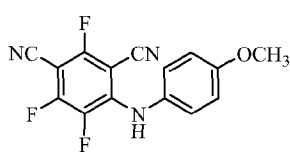
KC7



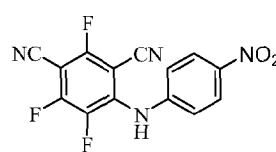
KC8



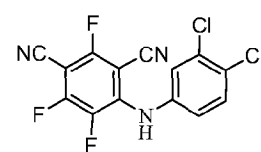
KC9



KC10

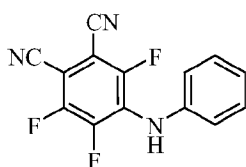


KC11

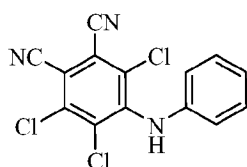


KC12

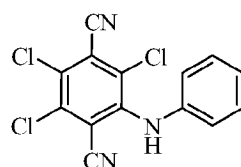
[0006]



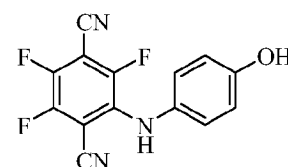
KC13



KC14



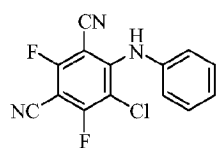
KC15



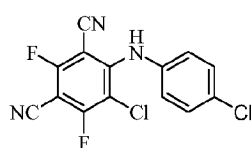
KC16

[0007] 专利 CN101391981A 还公开了如下结构的化合物 IV-I (KC17)、IV-J (KC18)、IV-K (KC19)、IV-L (KC20) 作为合成一种具有荧光活性及潜在药物活性的新的多卤代吡啶酮类化合物的中间体, 但没有任何生物活性报道。

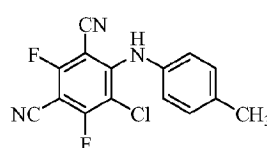
[0008]



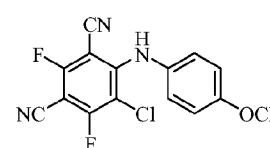
KC17



KC18



KC19



KC20

[0009] 现有技术中公开的取代氰基苯胺类化合物其右侧苯环上的取代基多为单取代, 而本发明通式所示的右侧为双取代或多取代苯环及其他含氮六元杂环的取代氰基苯胺类化合物未见报道。

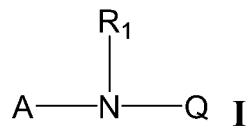
发明内容

[0010] 现代农业生产需要不断开发出结构新颖、性能优异的新农药。本发明的目的在于提供一种在很小的剂量下就可以控制多种病菌的取代氰基苯胺类化合物, 它可用于农业或其他领域中制备防治病菌的药物。

[0011] 本发明的技术方案如下:

[0012] 本发明提供一种取代氨基苯胺类化合物,结构如通式 I 所示:

[0013]

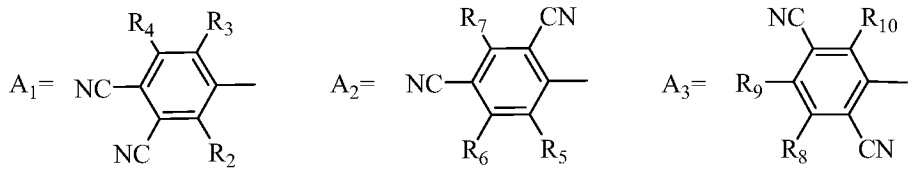


[0014] 式中:

[0015] R_1 选自氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷基羰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、苄基或苯乙基;

[0016] A 选自 A_1 、 A_2 或 A_3

[0017]



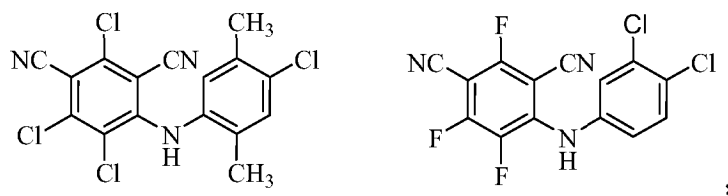
[0018] R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 可相同或不同,分别选自卤素、 C_1-C_8 烷氧基、卤代 C_1-C_8 烷氧基、 $NR_{12}R_{13}$ 、 C_1-C_8 烷基硫基、卤代 C_1-C_8 烷基硫基、 C_1-C_8 烷基亚磺酰基、卤代 C_1-C_8 烷基亚磺酰基、 C_1-C_8 烷基磺酰基、卤代 C_1-C_8 烷基磺酰基、 C_3-C_8 烯氧基、卤代 C_3-C_8 烯氧基、 C_3-C_8 炔氧基、卤代 C_3-C_8 炔氧基、 C_1-C_8 烷基羰基氧基、 C_1-C_8 烷基羰基氨基、 C_1-C_8 烷基磺酰基氧基、 C_1-C_8 烷氧基 C_1-C_8 烷氧基或 C_1-C_8 烷氧基羰基 C_1-C_8 烷氧基;

[0019] Q 选自苯基、吡啶基、嘧啶基、咪唑基、吡嗪基、均三嗪基或偏三嗪基,并各自任选地被 $(R_{11})_n$ 取代,其中 R_{11} 选自卤素、硝基、氰基、 C_1-C_8 烷基、卤代 C_1-C_8 烷基、 C_3-C_6 的环烷基、 C_1-C_8 烷氧基、卤代 C_1-C_8 烷氧基、 C_1-C_8 烷基硫基、卤代 C_1-C_8 烷基硫基、 C_2-C_8 烯基、卤代 C_2-C_8 烯基、 C_2-C_8 炔基、卤代 C_2-C_8 炔基、 C_3-C_8 烯氧基、卤代 C_3-C_8 烯氧基、 C_3-C_8 炔氧基、卤代 C_3-C_8 炔氧基、 C_1-C_8 烷基亚磺酰基、卤代 C_1-C_8 烷基亚磺酰基、 C_1-C_8 烷基磺酰基、卤代 C_1-C_8 烷基磺酰基、 C_1-C_8 烷基羰基、卤代 C_1-C_8 烷基羰基、 C_1-C_8 烷基羰基氧基、 C_1-C_8 烷基羰基氨基、 C_1-C_8 烷基磺酰基氧基、 C_1-C_8 烷氧基羰基、 C_1-C_8 烷氧基羰基 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_8 烷氧基羰基氨基、 C_1-C_8 烷氧基 C_1-C_8 烷氧基、 C_1-C_8 烷氧基羰基 C_1-C_8 烷氧基、苯氨基羰基、卤代苯氨基羰基、CHO、 CO_2H 、 CO_2Na 、 CO_2NH_4 、 $C(=O)NR_{12}R_{13}$ 、 $OC(=O)NR_{12}R_{13}$ 、 $C(=S)NR_{12}R_{13}$ 或 $SO_2NR_{12}R_{13}$; $n = 0-5$;

[0020] R_{12} 、 R_{13} 可相同或不同,分别选自氢、 C_1-C_6 烷基、卤代 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_6 环烷基;

[0021] 且当 Q 选自苯基时, $n \neq 0$ 或 1;同时不包括如下化合物:

[0022]



[0023] 或通式 I 化合物的盐。

[0024] 本发明较为优选的化合物为:通式 I 中

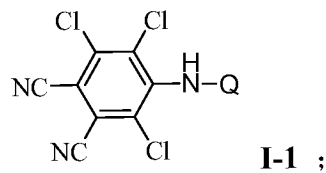
[0025] R_1 选自氢;

[0026] A 选自 A_1 ,其中 R_2 、 R_3 、 R_4 选自氯;

[0027] Q 选自苯基,并任选地被 $(R_{11})_n$ 取代,其中 R_{11} 选自卤素、硝基、氰基、 C_1-C_4 烷基、卤

代 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤代 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷氧基羰基或甲基氨基羰基； $n = 2-4$ ；结构式如 I-1 所示：

[0028]



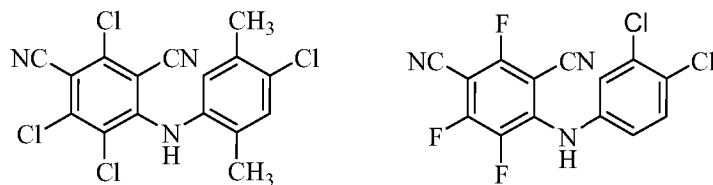
[0029] 或者, 通式 I 中

[0030] R_1 选自氢；

[0031] A 选自 A_2 , 其中 R_5 、 R_6 、 R_7 相同, 选自氟或氯；

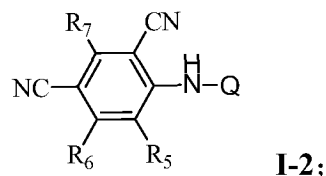
[0032] Q 选自苯基、吡啶 -2- 基、吡啶 -3- 基、吡啶 -4- 基、嘧啶 -2- 基、吡嗪 -2- 基或哒嗪 -3- 基, 并各自任选地被 $(R_{11})_n$ 取代, 其中 R_{11} 选自卤素、硝基、氰基、 C_1-C_4 烷基、卤代 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤代 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷氧基羰基、甲基氨基羰基、苯氨基羰基、4- 氯苯氨基羰基、羧基或 CO_2Na ； $n = 0-5$ ；且当 Q 选自苯基时, $n \neq 0$ 或 1；同时不包括如下化合物：

[0033]



[0034] 结构式如 I-2 所示：

[0035]



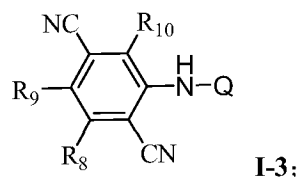
[0036] 或者, 通式 I 中

[0037] R_1 选自氢；

[0038] A 选自 A_3 , 其中 R_8 、 R_9 、 R_{10} 相同, 选自氟或氯；

[0039] Q 选自苯基、吡啶 -2- 基、吡啶 -3- 基、吡啶 -4- 基或嘧啶 -2- 基, 并各自任选地被 $(R_{11})_n$ 取代, 其中 R_{11} 选自卤素、硝基、氰基、 C_1-C_4 烷基、卤代 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、卤代 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷氧基羰基或甲基氨基羰基； $n = 2-4$ ；结构式如 I-3 所示：

[0040]



[0041] 或通式 I-1、I-2 或 I-3 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

[0042] 本发明进一步优选的化合物为：

[0043] 通式 I-1 中,

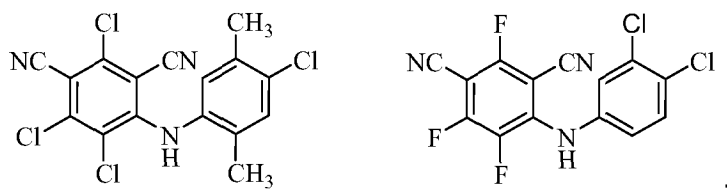
[0044] Q 选自苯基, 并任选地被 $(R_{11})_n$ 取代, 其中 R_{11} 选自氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、甲氧基羰基或甲基氨基羰基; $n = 2-4$;

[0045] 或者, 通式 I-2 中,

[0046] R_5 、 R_6 、 R_7 相同, 选自氟或氯;

[0047] Q 选自苯基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、嘧啶-2-基、吡嗪-2-基或哒嗪-3-基, 并各自任选地被 $(R_{11})_n$ 取代, 其中 R_{11} 选自氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基氨基羰基、苯氨基羰基、4-氯苯氨基羰基、羧基或 CO_2Na ; $n = 0-5$; 且当 Q 选自苯基时, $n \neq 0$ 或 1; 同时不包括如下化合物:

[0048]



[0049] 或者, 通式 I-3 中,

[0050] R_8 、 R_9 、 R_{10} 相同, 选自氟或氯;

[0051] Q 选自苯基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基或嘧啶-2-基, 并各自任选地被 $(R_{11})_n$ 取代, 其中 R_{11} 选自氟、氯、溴、硝基、氰基、甲基、异丙基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基或甲基氨基羰基; $n = 2-4$;

[0052] 或通式 I-1、I-2 或 I-3 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

[0053] 本发明再进一步优选的化合物为:

[0054] 通式 I-1 中,

[0055] Q 选自 2-氟-4-硝基苯基、2-氯-4-硝基苯基、2-氯-5-硝基苯基、2-氯-4-三氟甲基苯基、2-氯-5-三氟甲基苯基、2,4-二硝基苯基、3-三氟甲基-4-氰基苯基、2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、3-三氟甲基-4-氯苯基、2,3,4-三氟苯基; 2-溴-6-氰基-4-硝基苯基、2,6-二氟-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2,6-二溴-4-硝基苯基、2-溴-6-氯-4-硝基苯基或 2-甲基-3-氯-4,6-二硝基苯基;

[0056] 或者, 通式 I-2 中,

[0057] 当 R_5 、 R_6 、 R_7 选自氟时, Q 选自 2-氯-4-三氟甲基苯基、2-氯-4-硝基苯基、2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、2,6-二溴-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基或 2-溴-6-氰基-4-硝基苯基;

[0058] 当 R_5 、 R_6 、 R_7 选自氯时, Q 选自 2,6-二氟苯基、2-氯-4-三氟甲基苯基、2-氯-5-三氟甲基苯基、2-氟-5-三氟甲基苯基、2-氯-4-硝基苯基、2-硝基-4-氯苯基、2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、2,4,6-三氯苯基、2,3,4-三氟苯基、2,4-二硝基苯基、3-三氟甲基-4-氰基苯基、2,6-二氟-4-硝基苯基、2,4-二氯-6-氰基苯基、2,6-二氯-4-氰基苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、2-氯-6-氟-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2-溴-6-氯-4-硝基苯基、2-溴-6-氰基-4-硝基苯基、2,

6-二溴-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-甲氧基羰基苯基、2-甲基-6-氯-4-硝基苯基、2-甲基-4-氯-6-硝基苯基、2,6-二硝基-3-氯-4-三氟甲基苯基、2-甲基-3-氯-4,6-二硝基苯基、2,3,5-三氯-4,6-二氰基苯基、5-溴吡啶-2-基、3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基、3,5,6-三氯吡啶-2-基、3,4,5,6-四氯吡啶-2-基、2-氯吡啶-3-基、6-溴吡啶-3-基、2,5-二氯吡啶-3-基、2-氯吡啶-4-基、3-溴吡啶-4-基、3,5-二氯吡啶-4-基、嘧啶-2-基、4,6-二甲氧基嘧啶-2-基、4-三氟甲基-5-乙氧基羰基嘧啶-2-基、6-氯吡嗪-2-基或6-氯哒嗪-3-基；

[0059] 或者,通式 I-3 中,

[0060] 当 R_8 、 R_9 、 R_{10} 选自氟时, Q 选自 2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、2-氟-4-硝基苯基、2-氯-4-硝基苯基、2-氯-5-硝基苯基、2-氯-4-三氟甲基苯基、2-甲氧基-4-硝基苯基、2-硝基-4-氯苯基、3-三氟甲基-4-氯苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2,6-二溴-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、2-溴-6-氰基-4-硝基苯基、2-溴-6-氯-4-硝基苯基或 3,5-二氯吡啶-4-基；

[0061] 当 R_8 、 R_9 、 R_{10} 选自氯时, Q 选自 2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、2,4-二硝基苯基、2-氯-4-硝基苯基、2-氯-5-硝基苯基、2-硝基-4-氯苯基、2-甲氧基-4-硝基苯基、3-三氟甲基-4-氯苯基、2-氟-4-硝基苯基、2-氯-4-三氟甲基苯基、2-氯-5-三氟甲基苯基、3-三氟甲基-4-氰基苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2,6-二溴-4-硝基苯基、2,6-二氟-4-硝基苯基、2-氯-6-氟-4-硝基苯基、2-溴-6-氯-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、2-溴-6-氰基-4-硝基苯基、2-甲基-3-氯-4,6-二硝基苯基、2,5-二氯吡啶-3-基、3,5-二氯吡啶-4-基或嘧啶-2-基；

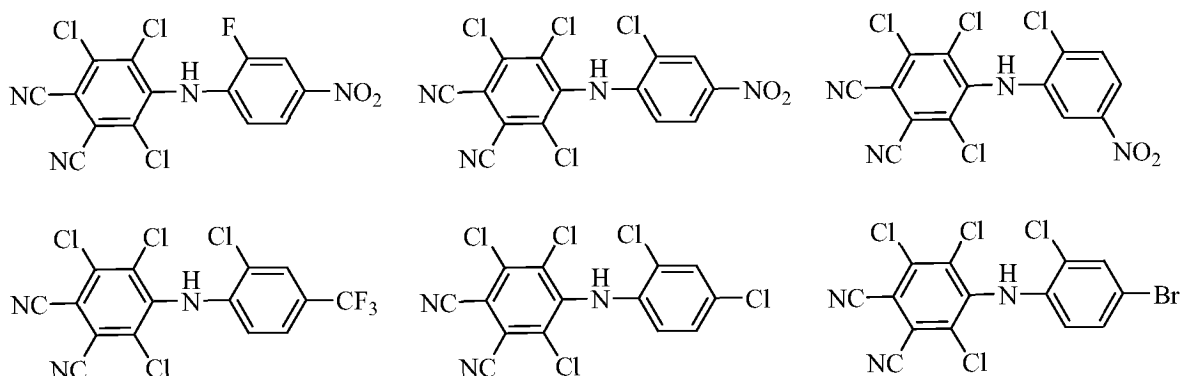
[0062] 或通式 I-1、I-2 或 I-3 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

[0063] 本发明中更进一步优选的化合物为：

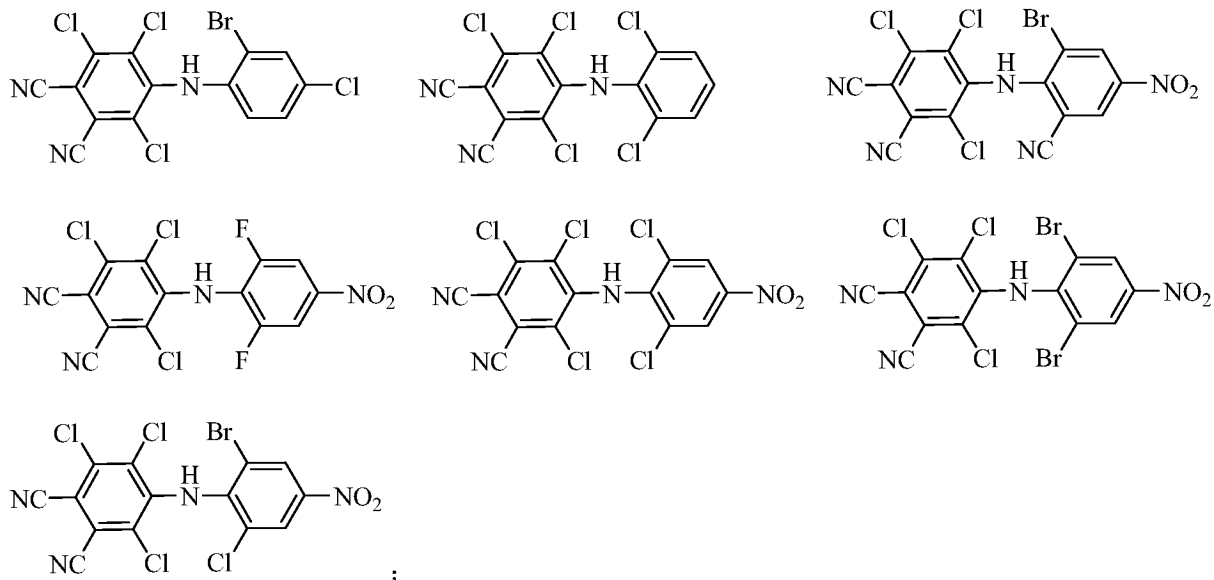
[0064] 通式 I-1 中

[0065] Q 选自 2-氟-4-硝基苯基、2-氯-4-硝基苯基、2-氯-5-硝基苯基、2-氯-4-三氟甲基苯基、2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、2-溴-6-氰基-4-硝基苯基、2,6-二氟-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2,6-二溴-4-硝基苯基或 2-溴-6-氯-4-硝基苯基；即结构如下所示的化合物：

[0066]



[0067]

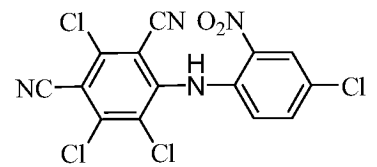
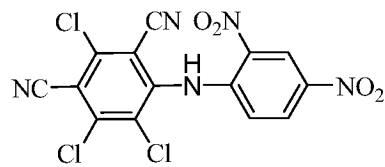
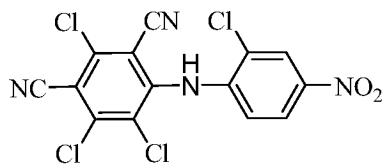
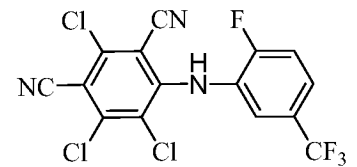
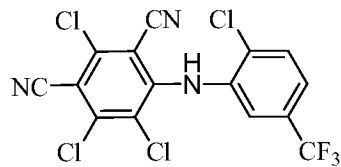
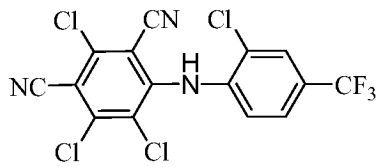
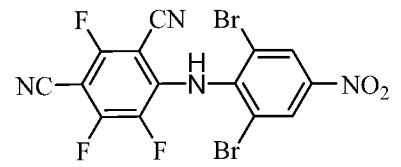
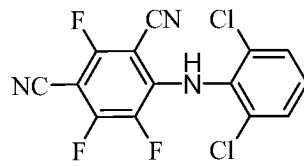
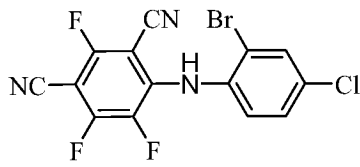
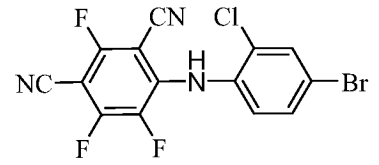
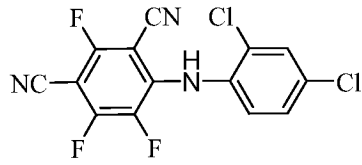
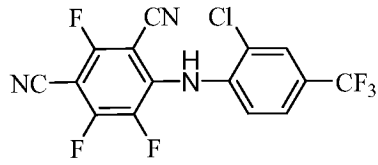


[0068] 或者,通式 I-2 中

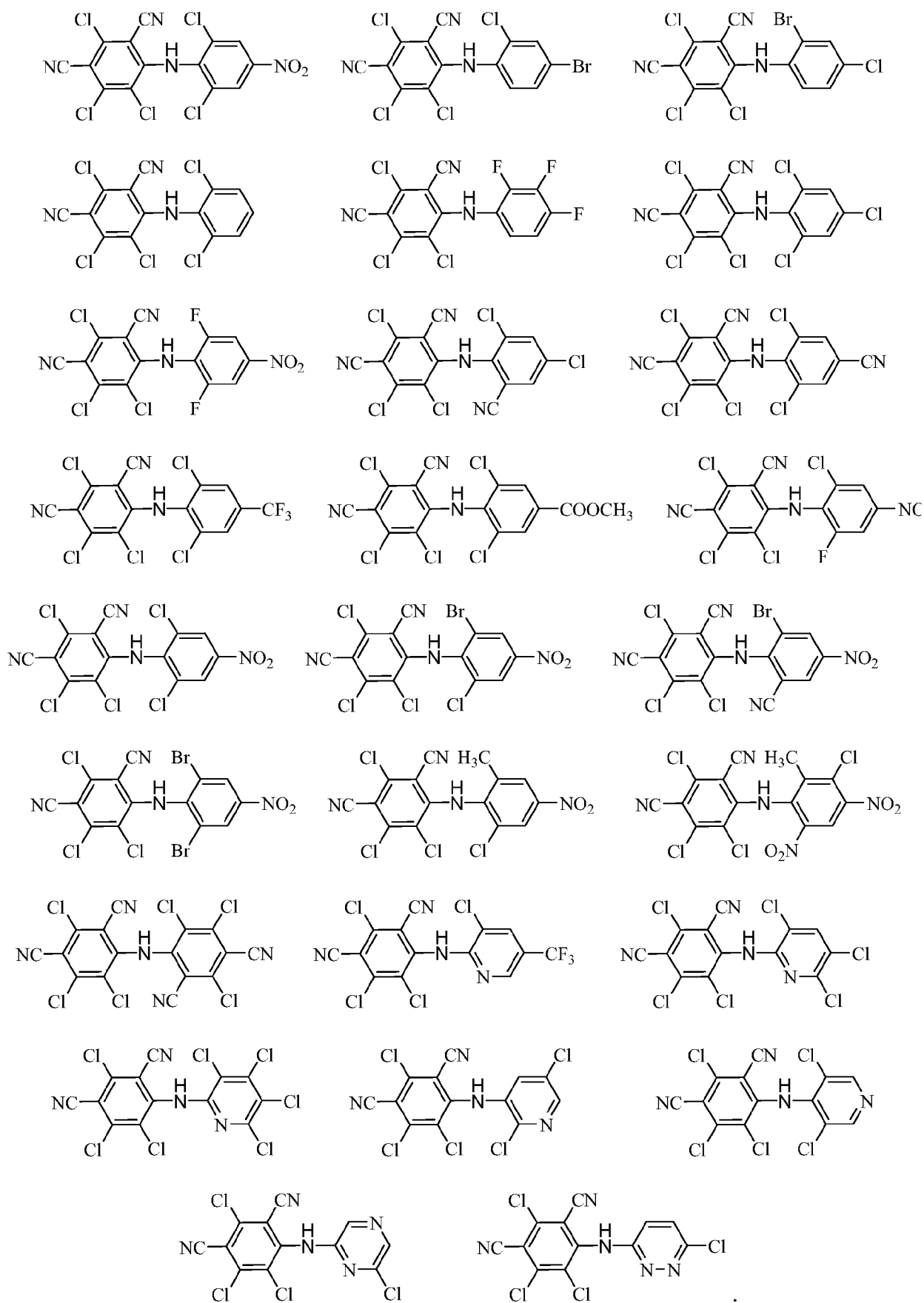
[0069] 当 R_5 、 R_6 、 R_7 选自氟时, Q 选自 2-氯-4-三氟甲基苯基、2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基或 2,6-二溴-4-硝基苯基;

[0070] 当 R_5 、 R_6 、 R_7 选自氯时, Q 选自 2-氯-4-三氟甲基苯基、2-氯-5-三氟甲基苯基、2-氟-5-三氟甲基苯基、2-氯-4-硝基苯基、2,4-二硝基苯基、2-硝基-4-氯苯基、2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、2,3,4-三氟苯基、2,4,6-三氯苯基、2,6-二氟-4-硝基苯基、2,4-二氯-6-氰基苯基、2,6-二氯-4-氰基苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、2,6-二氯-4-甲氧基羰基苯基、2-氯-6-氟-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2-溴-6-氯-4-硝基苯基、2-溴-6-氰基-4-硝基苯基、2,6-二溴-4-硝基苯基、2-甲基-6-氯-4-硝基苯基、2-甲基-3-氯-4,6-二硝基苯基、2,3,5-三氯-4,6-二氰基苯基、3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基、3,5,6-三氯吡啶-2-基、3,4,5,6-四氯吡啶-2-基、2,5-二氯吡啶-3-基、3,5-二氯吡啶-4-基、6-氯吡嗪-2-基或 6-氯哒嗪-3-基; 即结构如下所示的化合物:

[0071]



[0072]



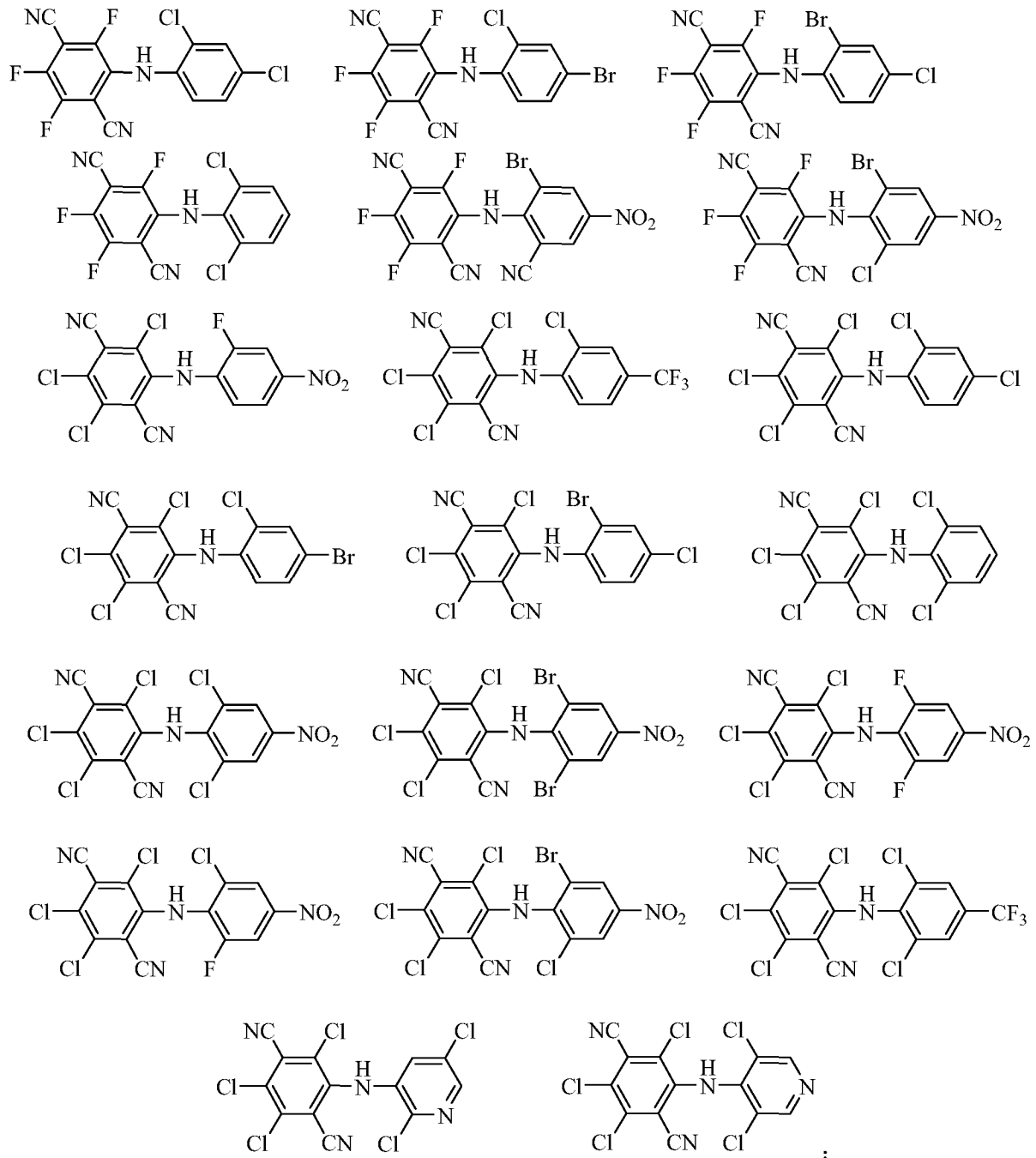
[0073] 或者,通式 I-3 中,

[0074] 当 R_8 、 R_9 、 R_{10} 选自氟时, Q 选自 2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、

2,6-二氯苯基、2-溴-6-氟-4-硝基苯基或2-溴-6-氯-4-硝基苯基；

[0075] 当 R_8 、 R_9 、 R_{10} 选自氯时，Q 选自 2-氟-4-硝基苯基、2-氯-4-三氟甲基苯基、2,4-二氯苯基、2-氯-4-溴苯基、2-溴-4-氯苯基、2,6-二氯苯基、2,6-二氯-4-硝基苯基、2,6-二溴-4-硝基苯基、2,6-二氟-4-硝基苯基、2-氯-6-氟-4-硝基苯基、2-溴-6-氯-4-硝基苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、2,5-二氯吡啶-3-基或 3,5-二氯吡啶-4-基；即结构如下所示的化合物：

[0076]



[0077] 或通式 I-1、I-2 或 I-3 化合物与盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸、对甲苯磺酸、钠或钾形成的盐。

[0078] 上面给出的通式 I 化合物的定义中，汇集所用术语一般代表如下取代基：

[0079] 卤素：指氟、氯、溴或碘。烷基：直链或支链烷基，例如甲基、乙基、丙基、异丙基或

叔丁基。环烷基：取代或未取代的环状烷基，例如环丙基、环戊基或环己基。取代基如甲基、卤素等。卤代烷基：直链或支链烷基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基等。烷氧基：直链或支链烷基，经氧原子键连接到结构上。卤代烷氧基：直链或支链烷氧基，在这些烷氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、三氟乙氧基等。烷硫基：直链或支链烷基，经硫原子键连接到结构上。卤代烷硫基：直链或支链烷硫基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如氯甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基等。烷基氨基：直链或支链烷基，经氮原子键连接到结构上。卤代烷基氨基：直链或支链烷基氨基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烯基：直链或支链烯类，例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基和不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。烯基还包括多烯类，如1,2-丙二烯基和2,4-己二烯基。卤代烯基：直链或支链烯类，在这些烯基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。炔基：直链或支链炔类，例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基和不同的丁炔基、戊炔基和己炔基异构体。炔基还包括由多个三键组成的基团，例如2,5-己二炔基。卤代炔基：直链或支链炔类，在这些炔基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烯氧基：直链或支链烯类，经氧原子键连接到结构上。卤代烯氧基：直链或支链烯氧基，在这些烯氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。炔氧基：直链或支链炔类，经氧原子键连接到结构上。卤代炔氧基：直链或支链炔氧基，在这些炔氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烷基亚磺酰基：直链或支链烷基经亚磺酰基(-SO-)连接到结构上，例如甲基亚磺酰基。卤代烷基亚磺酰基：直链或支链烷基亚磺酰基，其烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烷基磺酰基：直链或支链烷基经磺酰基(-SO₂-)连接到结构上，例如甲基磺酰基。卤代烷基磺酰基：直链或支链烷基磺酰基，其烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烷基羰基：烷基经羰基连接到结构上，例如CH₃CO-，CH₃CH₂CO-。卤代烷基羰基：烷基羰基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如CF₃CO-。烷基羰基氧基：例如CH₃COO-，CH₃CH₂NHCOO-。烷基羰基氨基：例如CH₃CONH-，CH₃CH₂NHCONH-。烷基磺酰基氧基：例如烷基-S(O)₂-O-。烷氧基烷氧基：烷基-O-烷基-O-，例如CH₃OCH₂O-。烷氧基羰基烷氧基：烷基-O-CO-烷基-O-。烷氧基羰基：烷基-O-CO-。烷氧基羰基烷基：烷氧基羰基-烷基-，例如CH₃OCOCH₂-。烷氧基羰基氨基：烷基-O-CO-NH-。苯氨基羰基：苯基-NH-CO-。卤代苯氨基羰基：苯氨基羰基的苯环的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，如4-氯苯基-NH-CO-，2,4-二氯苯基-NH-CO-。

[0080] 本发明通式 I 化合物中，R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、R₉、R₁₀和 R₁₁ 优选的部分基团及其取代基见表 1-表 3，但它们并非仅限于这些取代基。


[0081] 表 1 R₁ 取代基

[0082]

R_1	R_1	R_1
H	<i>t</i> -C ₄ H ₉	<i>t</i> -C ₄ H ₉ CO
CH ₃	CH ₃ CO	CH ₃ SO ₂
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ CO	C ₂ H ₅ SO ₂
<i>n</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₃ H ₇ CO	<i>i</i> -C ₃ H ₇ SO ₂
<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>i</i> -C ₃ H ₇ CO	Ph
<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>n</i> -C ₄ H ₉ CO	PhC ₂ H ₅

[0083] 表 2 R_2 (R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10}) 取代基

[0084]

R_2 (R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10})	R_2 (R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10})	R_2 (R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10})	R_2 (R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10})	R_2 (R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10})
F	CF ₃ O	CF ₃ CH ₂ NH	CF ₃ SO ₂	CH ₃ CONH
Cl	CF ₃ CH ₂ O	HN— 	CF ₃ CH ₂ SO ₂	C ₂ H ₅ CONH
Br	NH ₂	CH ₃ S	CH ₂ =CHCH ₂ O	CH ₃ SO ₂ O
I	CH ₃ NH	C ₂ H ₅ S	CCl ₂ =CHCH ₂ O	C ₂ H ₅ SO ₂ O
CH ₃ O	(CH ₃) ₂ N	CCl ₃ S	CBr ₂ =CHCH ₂ O	CH ₃ OCH ₂ O
C ₂ H ₅ O	C ₂ H ₅ NH	CH ₃ SO	CH≡CCH ₂ O	C ₂ H ₅ OCH ₂ O
<i>n</i> -C ₃ H ₇ O	<i>n</i> -C ₃ H ₇ NH	C ₂ H ₅ SO	C-Cl=CCH ₂ O	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O
<i>i</i> -C ₃ H ₇ O	<i>i</i> -C ₃ H ₇ NH	CH ₃ SO ₂	C-I=CCH ₂ O	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ O
<i>n</i> -C ₄ H ₉ O	<i>n</i> -C ₄ H ₉ NH	C ₂ H ₅ SO ₂	CH ₃ CO ₂	CH ₃ OCOCH ₂ O
<i>t</i> -C ₄ H ₉ O	<i>t</i> -C ₄ H ₉ NH	CF ₃ CH ₂ SO	C ₂ H ₅ CO ₂	C ₂ H ₅ OCOCH ₂ O

[0085] 表 3 R_{11} 取代基

[0086]

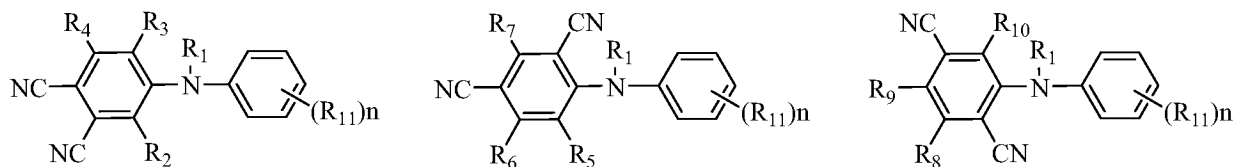
R ₁₁	R ₁₁	R ₁₁	R ₁₁
—	CH ₃ CH ₂ O	CH ₃ SO	PhNHCO
F	<i>n</i> -C ₃ H ₇ O	CH ₃ CH ₂ SO	4-ClPhNHCO
Cl	<i>i</i> -C ₃ H ₇ O	CF ₃ SO	CHO
Br	<i>n</i> -C ₄ H ₉ O	CH ₃ SO ₂	CO ₂ H
I	<i>t</i> -BuO	CH ₃ CH ₂ SO ₂	CO ₂ Na
NO ₂	CF ₃ O	CF ₃ SO ₂	CO ₂ NH ₄
CN	CF ₃ CH ₂ O	CH ₃ CO	CONH ₂
CH ₃	CF ₃ CF ₂ O	CH ₃ CH ₂ CO	CONHCH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃ S	CH ₂ BrCO	CONHCH ₂ CH ₃
<i>n</i> -C ₃ H ₇	C ₂ H ₅ S	CF ₃ CO	CONH(CH ₂) ₂ CH ₃
<i>i</i> -C ₃ H ₇	CCl ₃ S	CH ₃ COO	CONHCH(CH ₃) ₂
<i>n</i> -C ₄ H ₉	CH ₂ =CH	CH ₂ CH ₃ COO	CONH(CH ₂) ₃ CH ₃
<i>t</i> -C ₄ H ₉	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₃ CONH	CONHC(CH ₃) ₃
CH ₂ F	CCl ₂ =CH	CH ₃ CH ₂ CONH	CON(CH ₃) ₂
CH ₂ Cl	CCl ₂ =CHCH ₂	CH ₃ OCONH	CON(CH ₂ CH ₃) ₂
CH ₂ Br	CH=C	BocNH	CSNH ₂
CHF ₂	CH=CCH ₂	CH ₃ SO ₂ O	CSNHCH ₃
CF ₃	CCl=C	CH ₃ CH ₂ SO ₂ O	CSNHCH ₂ CH ₃
CF ₃ CH ₂	CH ₂ C=CCl	CH ₃ OCH ₂ O	CSN(CH ₃) ₂
CF ₃ CF ₂	CH=CH ₂ CH ₂ O	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ O	CSN(CH ₂ CH ₃) ₂
(CF ₃) ₂ CF	CCl ₂ =CHCH ₂ O	CH ₃ OCOCH ₂	SO ₂ NH ₂
	CH=CCH ₂ O	CH ₃ CH ₂ OCOCH ₂	SO ₂ NHCH ₃
CH ₃ O	CCl=CCH ₂ O	CH ₃ OCOCH ₂ O	SO ₂ NH(CH ₃) ₂

[0087] “—”代表无取代基。下同。

[0088] 通式 (I) 中 (A 为 A₁、A₂ 或 A₃) : 当 Q 为苯基时, 苯环上的取代基见表 4 ; 当 Q 为吡啶基时, 吡啶环上的取代基见表 5- 表 7 ; 当 Q 为嘧啶基时, 嘧啶环上的取代基见表 8- 表 10 ; 当 Q 为咪唑基时, 咪唑环上的取代基见表 11- 表 12 ; 当 Q 为吡嗪基时, 吡嗪环上的取代基见表 13 ; 当 Q 为三嗪基时, 三嗪环上的取代基见表 14- 表 17。

[0089] 表 4

[0090]



[0091]

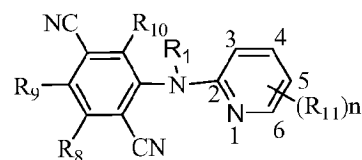
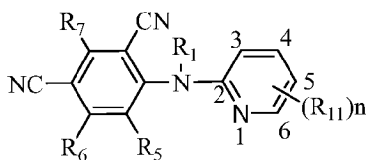
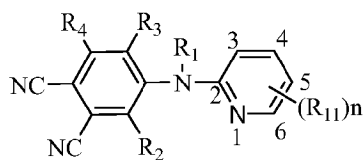
(R ₁₁)n	(R ₁₁)n	(R ₁₁)n
2-F	2-Br	2-CH ₃ -4-Cl-6-CON(CH ₃) ₂
2,4-2F	2,6-2Br-4-NO ₂	2-CH ₃ -4-Cl-6-CONHCH(CH ₃) ₂
2,6-2F	2,6-2Br-4-OCF ₃	2-CH ₃ -4-Cl-6-CONHC(CH ₃) ₃
2-F-5-CH ₃	3-Br-4-CN	2-CH ₃ -4-Br-6-CO ₂ CH ₃
2-F-5-NO ₂	4-Br	2-CH ₃ -4-Br-6-CONH ₂
2-F-4-CN	2-I	2-CH ₃ -4-Br-6-CON(CH ₃) ₂
2,3,4-3F	4-I	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-F
2-F-4-NO ₂	2-NO ₂	2-CH ₃ -6-Cl-4-NO ₂
2,6-2F-4-CF ₃	2-NO ₂ -4-Cl	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-Br
2,5-2F-4-CO ₂ C ₂ H ₅	2-NO ₂ -4-CN	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-CN
2,6-2F-4-NO ₂	2-NO ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-CF ₃
2-Br-6-CN-4-NO ₂	2,6-2NO ₂ -4-Cl	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-OCH ₃
2-Cl-6-F-4-NO ₂	2,6-2NO ₂ -4-SOCH ₃	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-SO ₂ CH ₃
2-Br-6-Cl-4-NO ₂	2,6-2NO ₂ -4-SO ₂ CH ₃	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-CO ₂ H
2,6-2F-4-OCF ₃	2-NO ₂ -4,6-2Cl-	2-CH ₃ -4-NO ₂ -6-CO ₂ CH ₃
2-F-4-NO ₂ -6-Cl	2-NO ₂ -4-Cl-6-F	2-CH ₃ -4,6-2CN
2-F-4-CN-5-CO ₂ CH ₃	2-NO ₂ -4-CN -6-Cl	2-CH ₃ -4-CN-6-NO ₂
2-F-4-CN-5-NO ₂	2-NO ₂ -3-C ₂ H ₅ -6-CO ₂ CH ₃	2-CH ₃ -4-CN-6-CF ₃
2-F-4-CN-6-OCH ₃	2-NO ₂ -4-CO ₂ CH ₃ -6-SCH ₃	4-CH ₃
2-F-4-NO ₂ -6-Cl	2-NO ₂ -4-CO ₂ CH ₃ -6-SOCH ₃	2-CH ₃ -4-CN-6-SO ₂ CH ₃
2-F-4-NO ₂ -6-Br	2-NO ₂ -4-CO ₂ CH ₃ -6-SO ₂ CH ₃	2-CH ₃ -4-CN-6-CO ₂ CH ₃
2-F-4-CN-6-Cl	2-NO ₂ -4-CO ₂ CH ₃ -6-OCH ₃	2-CH ₃ -4-CN-6-CONH ₂
3-F-6-CN	2-NO ₂ -4-CO ₂ CH ₃ -6-OCH ₂ CH=CH ₂	2-CH ₃ -4-CN-6-CONHCH ₃
3-F-4-CN	2,6-2NO ₂ -3-Cl-4-CF ₃	2-CH ₃ -4-CN-6-CONHCH(CH ₃) ₂
4-F	2,6-2NO ₂ -3-SCH ₃ -4-CF ₃	2-CH ₃ -4-CF ₃ -6-Br
2-Cl	2,6-2NO ₂ -3-SOCH ₃ -4-CF ₃	2-CH ₃ -4-CF ₃ -6-NO ₂
2,3-2Cl	2,6-2NO ₂ -3-SO ₂ CH ₃ -4-CF ₃	2-CH ₃ -4-CF ₃ -6-CN
2,4-2Cl	2,6-2NO ₂ -4-OCH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₃ -6-OCH ₃
2, 4,5-3Cl	2,6-2NO ₂ -3-OCH ₃ -4-CF ₃	2-CH ₃ -4-CF ₃ -6-CO ₂ CH ₃
2,4,6-3Cl	3-NO ₂	2-CH ₃ -4-CO ₂ C ₂ H ₅ -6-F
2,5-2Cl	4-NO ₂	2-CH ₃ -4-CO ₂ CH ₃ -6-Cl
2,6-2Cl	2-CN-5-Cl	2-CH ₃ -4-CO ₂ CH ₃ -6-NO ₂

[0092]

2-Cl-4-NO ₂	2,4-2Cl-6-CN	2-CH ₃ -4-CO ₂ CH ₃ -6-CN
2-Cl-5-NO ₂	2-CN-4-NO ₂ -6-Br	2-CH ₃ -4-CO ₂ CH ₃ -6-CF ₃
2-Cl-5-CN	2-CN-4-Cl-6-NO ₂	3-CH ₃
2-Cl-5-CH ₃	2-CN-4-Cl-6-CF ₃	3,4-2CH ₃
2-Cl-3-CH ₃	2-CN-4,6-2NO ₂	2,6-2C ₂ H ₅ -4-Cl
2-Cl-3,5-2 <i>t</i> -Bu	2-CN-4-OCH ₃ -6-CF ₃	2-C ₂ H ₅ -6-Br-4-NO ₂
2-Cl-4-CF ₃	2-CN-4-SCH ₃ -6-NO ₂	2-C ₂ H ₅ -4,6-2NO ₂
2-Cl-5-CF ₃	2-CN-4-SO ₂ CH ₃ -6-NO ₂	2-C ₂ H ₅ -4-NO ₂ -6-CN
2-Cl-4-CH=CH ₂	2-CN-4-SO ₂ CH ₃ -6-CF ₃	2-C ₂ H ₅ -4-NO ₂ -6-Cl
2,6-2Cl-4-CN	2-CN-4-OCOCH ₃ -6-CF ₃	2-C ₂ H ₅ -4-NO ₂ -6-COCH ₃
2,6-2Cl-4-CF ₃	2-CN-4-OCOCH ₂ CH ₃ -6-CF ₃	4-C ₂ H ₅
2,6-2Cl-3-CH ₃	2-CN-4-NHCOCH ₃ -6-CF ₃	2-(CH ₂) ₂ CH ₃ -4-NO ₂ -6-OC ₂ H ₅
2,6-2Cl-4-NO ₂	2-CN-4-NHCOCH ₂ CH ₃ -6-CF ₃	2-(CH ₂) ₂ CH ₃ -4-NO ₂ -6-CF ₃
2,6-2Cl-4-C=CH	3-CN-5-NO ₂	2-(CH ₂) ₂ CH ₃ -4-NO ₂ -6-CO ₂ CH ₃
2,6-2Cl-4-CO ₂ H	3-CN-5-OCH ₃	2-(CH ₂) ₂ CH ₃ -4-NO ₂ -6-SO ₂ CH ₃
2,6-2Cl-4-CO ₂ CH ₃	4-CN	2- <i>n</i> -C ₃ H ₇ -4-CN
2,6-2Cl-4-CONH ₂	2-CH ₃	2- <i>n</i> -C ₄ H ₉ -4-CN
2,6-2Cl-4-CON(CH ₃) ₂	2,5-2CH ₃	2- <i>t</i> -Bu-4-NO ₂ -6-Cl
2,6-2Cl-4-CONHC(CH ₃) ₃	2,4,6-3CH ₃	4- <i>t</i> -Bu
2,6-2Cl-4-SO ₂ NH ₂	2-CH ₃ -3-Cl	2-CH ₂ Cl-4-CN
2,6-2Cl-4-SO ₂ NHCH ₃	2-CH ₃ -4-CN	2-CF ₃ -4,6-2Cl
2-Cl-4-NO ₂ -5- <i>t</i> -Bu	2-CH ₃ -4-Cl	2-CF ₃ -4-CN
2-Cl-4-NO ₂ -5-CF ₃	2,6-2CH ₃ -4-Cl	2-CH ₃ -4-Cl-6-NO ₂
2-Cl-4-NO ₂ -6-Br-	2-CH ₃ -4-Br	2-CF ₃ -4-Cl-6-NO ₂
2-Cl-4-NO ₂ -6-SCH ₃	2-CH ₃ -5-Cl	3-CF ₃
2-Cl-4-CN-5-Br	2-CH ₃ -4-OCF ₃	3-CF ₃ -4-CN
2-Cl-4-CN-6-CON(CH ₃) ₂	2-CH ₃ -4-CO ₂ H	3-CF ₃ -4-Cl
3-Cl	2-CH ₃ -4-CO ₂ Na	3,5-2CF ₃
3,4-2Cl	2-CH ₃ -4-CO ₂ CH ₃	4-CF ₃
3,5-2Cl	2-CH ₃ -4-CO ₂ C ₂ H ₅	2-OCH ₃ -4-NO ₂
3-Cl-4-CN	2-CH ₃ -4-SO ₂ CH ₃	2-OCH ₃ -4-NO ₂ -6-Cl
3-Cl-4-NHCO ₂ CH ₃	2-CH ₃ -6-CO ₂ CH ₃	2-OCH ₃ -4-CN-6-Cl-
3-Cl-4-NHBoc	2-CH ₃ -6-CO ₂ H	3,4-2OCH ₃
3,5-2Cl-4-CH ₃	2-CH ₃ -4,6-2NO ₂	4-OCH ₃
3,5-2Cl-4-OCH ₂ CH=CCl ₂	2-CH ₃ -4-Cl-6-CN	4-OCF ₃
3,5-2Cl-4-OCH ₂ C≡CH	2-CH ₃ -4-Cl-6-CO ₂ CH ₃	2-OCH ₂ CF ₃ -4-NO ₂ -6-Br
3,5-2Cl-4OCONHCH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-6-CONH ₂	2-SOCH ₃ -4-NO ₂ -6-Cl
3,5-2Cl-4OCON(CH ₃) ₂	2-CH ₃ -4-Cl-6-CONHCH ₃	2-SO ₂ CH ₃ -4-NO ₂ -6-Cl
3,5-2Cl-4OCON(<i>n</i> -C ₃ H ₇) ₂	2-Cl-4-Br	2-COCH ₃
3,5-2Cl-4-NHBoc	2-CH ₃ -3-Cl-4,6-2NO ₂	2-CO ₂ CH ₃ -4-F
4-Cl	2,3,5-3Cl-4,6-2CN	2-Br-4-Cl
2,4-2NO ₂		

[0093] 表 5

[0094]



[0095]

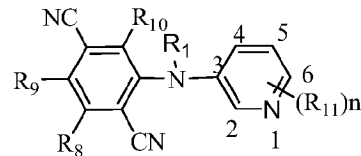
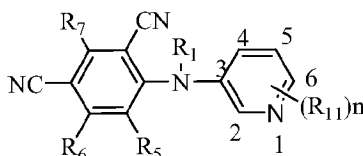
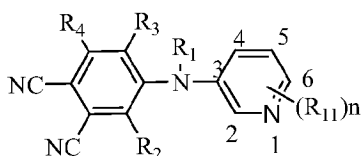
(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
—	5-COCH ₃	3-Br-5-CH ₃	3-CONH ₂ -5-Cl
3-F	5-CO ₂ CH ₃	3-Br-6-CH ₃	3-CONH ₂ -6-CF ₃
3-Cl	3-CHO	3-Br-5-CF ₃	4-CONH ₂ -6-CH ₃
3-Br	4-CHO	5-Br-6-C ₂ H ₅	4-CONH ₂ -6-OCH ₃
3-I	5-CHO	4-I-5-CH ₃	3,5-2F-4-CF ₃
4-Cl	3-NH ₂	4-I-5-CF ₃	3,6-2F-4-CF ₃
4-Br	4-NH ₂	5-I-6-C ₂ H ₅	3-F-5-CN-6-Cl
4-I	5-NH ₂	3-NO ₂ -4-Cl	3-F-5-CO ₂ CH ₃ -6-Cl
5-Cl	6-NH ₂	3-NO ₂ -4-CH ₃	3-F-5-CONH ₂ -6-Cl
5-Br	3-CONH ₂	3-NO ₂ -5-Cl	3-F-5-CONHCH(CH ₃) ₂ -6-Cl
5-I	4-CONH ₂	3-NO ₂ -5-Br	3,5-2Cl-4-CH ₃
6-Cl	5-CONH ₂	3-NO ₂ -5-I	3,5-2Cl-6-CH ₃
6-Br	3-F-5-Cl	3-NO ₂ -6-Cl	3,5-2Cl-4,6-2CH ₃
3-NO ₂	3-F-5-CN	3-NO ₂ -6-CH ₃	3,5-2Cl-6-OCH ₂ CO ₂ Me
4-NO ₂	3-F-4-CF ₃	3-NO ₂ -6-OCH ₃	3,6-2Cl-5-CF ₃
5-NO ₂	3-F-5-CF ₃	4-NO ₂ -6-CH ₃	3,5,6-3Cl
6-NO ₂	3-F-4-CHO	5-NO ₂ -6-Cl	3-Br-5-CF ₃ -6-Cl
3-CN	4,6-2F	5-NO ₂ -6-CH ₃	3,5-2Br-4-CH ₃
4-CN	5-F-6-CH ₃	5-NO ₂ -6-NHCOCH ₃	3,5-2Br-6-CH ₃
5-CN	3,5-2Cl	3-CN-6-CH ₃	3-Br-5,6-2CH ₃
6-CN	4,6-2Cl	3-CN-4-OCH ₃	3-NO ₂ -4-CH ₃ -5-Br
3-CH ₃	3,5-2Br	3-CH ₃ -5-CN	3,5-2CN-6-Cl
4-CH ₃	3-Cl-5-Br	4-CH ₃ -5-Br	3-CN-5-F-6-Cl
5-CH ₃	3-Cl-5-NO ₂	4-CH ₃ -5-NO ₂	3-CN-4-CF ₃ -6-Cl
4-C ₂ H ₅	3-Cl-5-CN	4-CH ₃ -5-NH ₂	3,5-2CN-6-CH ₃
3-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	4,6-2CH ₃	3-CN-4-CH ₃ -6-Cl
4-CF ₃	3-Cl-5-CO ₂ CH ₃	4-CH ₂ Cl-6-Cl	4-CH ₃ -5-CN-6-Cl
5-CCl ₃	3-Cl-5-CONH ₂	3-CF ₃ -5-Cl	3-CF ₃ -5-Br-6-Cl
5-CF ₃	3-Cl-5-CON(CH ₃) ₂	3-CF ₃ -5-Br	3-CO ₂ CH ₃ -5-F-6-Cl
3-OCH ₃	3-Cl-5-SO ₂ NH ₂	3-CF ₃ -6-Cl	3-CO ₂ C ₂ H ₅ -4-Cl-6-CH ₃
4-OCH ₃	4-Cl-5-NO ₂	4-CF ₃ -5-CO ₂ CH ₃	3-CONH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl
5-OCH ₃	4-Cl-6-CH ₃	4-CH ₂ CO ₂ CH ₃ -6-Cl	3-CONH ₂ -5-F-6-Cl
6-OCH ₃	5-Cl-6-CH ₃	3-CHO-4-I	3-CONHCH(CH ₃) ₂ -5-F-6-Cl
6-OC(CH ₃) ₃	3-Br-5-F	4-CHO-6-Cl	3-CN-4,6-2CH ₃ -5-Br
3-NHCOCH ₃	3-Br-5-Cl	4-CO ₂ CH ₃ -6-CH ₃	3-CSNH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl
3-CO ₂ CH ₃	3-Br-5-NO ₂	4-CO ₂ CH ₃ -6-OCH ₃	3-CSNH ₂ -5-F-6-Cl

[0096]

4-CO ₂ C ₂ H ₅	3-Br-5-CN	3-CONH ₂ -6-CH ₃	3-CSNHCH(CH ₃) ₂ -5-F-6-Cl
3,4,5,6-4Cl			

[0097] 表 6

[0098]

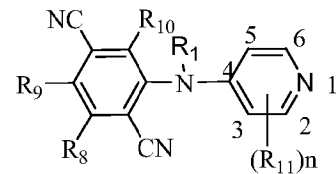
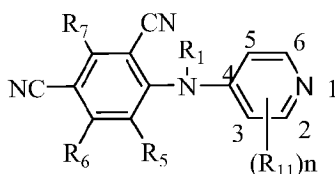
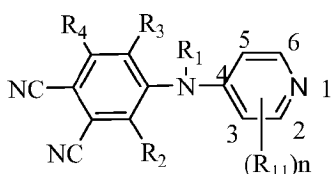


[0099]

(R ₁₁)n	(R ₁₁)n	(R ₁₁)n	(R ₁₁)n
—	2-CH ₃	2-Cl-5-CH ₃	5-CO ₂ H-6-Cl
2-F	4-CH ₃	2-Cl-5-CF ₃	5-CO ₂ CH ₃ -6-Cl
2-Br	4-CF ₃	2-Cl-4-CHO	5-CONH ₂ -6-Cl
2-Cl	5-CF ₃	2-Cl-5-SO ₂ NH ₂	2,5,6-3F
2-I	6-CF ₃	5-Cl-6-CN	2,6-2F-5-Cl
4-F	2-OCH ₃	2,6-2Br	2,6-2F-4-CF ₃
4-Cl	6-OCH ₃	2-Br-4-CH ₃	2,5-2F-4-CF ₃
4-I	6-OC ₂ H ₅	2-Br-6-OCH ₃	2,5,6-3Cl
5-F	6-NH ₂	5-Br-6-OCH ₃	2,6-2Cl-4-CF ₃
5-Cl	6-CHO	5-NO ₂ -6-Cl	2,6-2Cl-5-CN
5-Br	4-CO ₂ CH ₃	5-NO ₂ -6-Br	2,6-2Br-4-CH ₃
5-I	5-CO ₂ CH ₃	2,6-2CH ₃	2,6-2Cl-5-CO ₂ CH ₃
6-F	6-CO ₂ CH ₃	2-CH ₃ -6-F	2,6-2Cl-5-CONH ₂
6-Br	5-CONH ₂	2-CH ₃ -6-Cl	4-CF ₃ -5,6-2F
6-I	6-CONH ₂	2-CH ₃ -6-NH ₂	2-CO ₂ H-4,5,6-3Cl
2-NO ₂	2-OCH ₂ CO ₂ CH ₃	4-CH ₃ -6-Cl	2,5,6-3F-4-Br
4-NO ₂	2-F-5-CH ₃	4-CH ₃ -6-OCH ₃	2,5,6-3F-4-CN
5-NO ₂	2-F-5-CF ₃	5-CH ₃ -6-Br	2,5,6-3F-4-CO ₂ H
6-NO ₂	2,5-2Cl	2-OCH ₃ -5-Br	2,4,6-3Br-5-F
2-CN	2,6-2Cl	2-OCH ₃ -6-Br	2,4-2CH ₃ -5-CN-6-Cl
4-CN	2-Cl-4-CH ₃	2-OCH ₃ -5-CF ₃	5-CSNH ₂ -6-Cl
5-CN	2-Cl-4-CF ₃	2,6-2(OCH ₃) ₂	5-CSNHCH ₃ -6-Cl
6-CN	2-Cl-5-NO ₂	4-CHO-5-Cl	5-CSN(CH ₃) ₂ -6-Cl

[0100] 表 7

[0101]

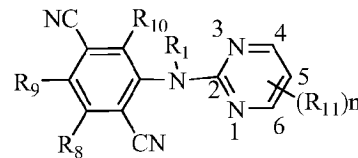
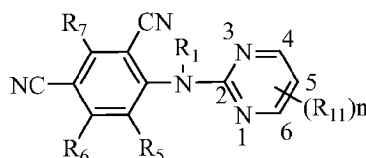
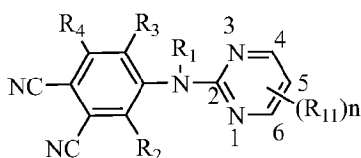


[0102]

(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
—	2-CF ₃	3,5-2Cl	2,6-2NO ₂
2-F	3-CF ₃	3,5-2Br	3,5-2CH ₃
3-F	5-CF ₃	3,5-2I	2,6-2CH ₃
2-Cl	2-OCH ₃	2-F-5-CH ₃	3-CH ₃ -2-Cl
2-Br	3-OCH ₃	2-F-3-CHO	3,6-2Cl-5-CF ₃
2-I	3-CHO	2-Cl-3-NO ₂	2-Cl-3-CO ₂ C ₂ H ₅ -6-CH ₃
3-Cl	2-CO ₂ CH ₃	2-Cl-5-CF ₃	2,6-2CH ₃ -3-CO ₂ C ₂ H ₅
3-Br	2-CONH ₂	2-Cl-3-CHO	2,3,5,6-4F
3-I	3-CO ₂ CH ₃	2-Cl-5-CO ₂ C ₂ H ₅	3,5-2F-2,6-2Br
3-NO ₂	3-SO ₂ NH ₂	3-Cl-5-NO ₂	3,5-2F-2,6-2Br
2-CH ₃	2,6-2F	3-Cl-5-CF ₃	2-CSNH ₂
3-CH ₃	2,6-2Cl	3-Br-5-CN	2-CSNHCH ₃

[0103] 表 8

[0104]

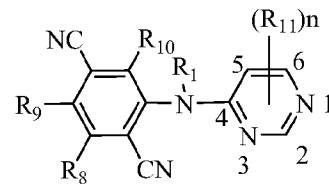
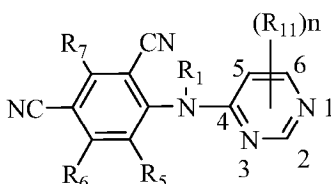
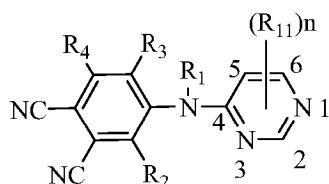


[0105]

(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
—	5-CO ₂ C ₂ H ₅	4-Cl-5-NO ₂	4-CF ₃ -5-CO ₂ C ₂ H ₅
4-F	5-CO ₂ C(CH ₃)	4-Cl-5-CN	4-CF ₃ -5-CONH ₂
4-Cl	5-CHO	4-Cl-5-CH ₃	4-OCH ₃ -5-Br
4-CN	5-NH ₂	4-Cl-6-CH ₃	4,6-2OCH ₃
4-NO ₂	5-CONH ₂	4-Cl-6-CH(CH ₃) ₂	4-CO ₂ CH ₃ -6-Cl
4-CH ₃	5-CONHCH ₃	4-Cl-5-CF ₃	4-CO ₂ C ₂ H ₅ -6-Cl
4-CF ₃	5-CONHC ₂ H ₅	4-Cl-5-OCH ₃	4-CO ₂ CH ₃ -6-CH ₃
4-OCH ₃	5-CONHCH(CH ₃) ₂	4-Cl-6-OCH ₃	4-CO ₂ C ₂ H ₅ -6-CH ₃
4-SCH ₃	5-CSNH ₂	4-Cl-5-CO ₂ CH ₃	5-CO ₂ C ₂ H ₅ -6-CH ₃
4-NH ₂	5-CSNHCH ₃	4-Cl-5-CONHCH ₃	4-N(CH ₃) ₂ -5-F
5-F	4-F-5-Cl	4-CN-6-CH ₃	4,6-2F-5-Cl
5-Br	4-Cl-5-F	4,6-2CH ₃	4,6-2F-5-Br
5-I	4,5-2Cl	4-CH ₃ -5-CO ₂ C ₂ H ₅	4,6-2Cl-5-Br
5-CN	4,6-2Cl	4-CH ₃ -5-CO ₂ H	4,5-2Cl-6-CH ₃
5-C ₂ H ₅	4-Cl-5-Br	4-CH ₃ -5-CONH ₂	4,6-2Cl-5-CHO
5-CH ₂ CH ₂ CH ₃	4-Cl-5-I	4-C(CH ₃) ₃ -6-CF ₃	4-Cl-5-NO ₂ -6-CH ₃
5-CO ₂ CH ₃	4,6-2Br	4-CF ₃ -5-CO ₂ CH ₃	4-Cl-5-NO ₂ -6-CO ₂ C ₂ H ₅

[0106] 表 9

[0107]

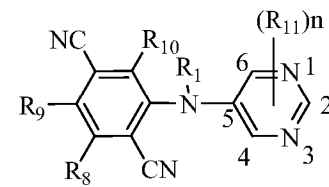
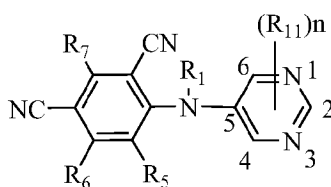
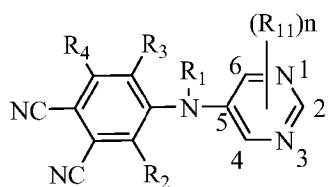


[0108]

(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
—	2,5-2Cl	2-CH ₃ -6-Cl	2-SCH ₃ -5-CONH ₂
2-F	2,6-2Cl	5-CH ₃ -6-Cl	2-SO ₂ CH ₃ -6-Cl
2-Cl	2-Cl-5-Br	2-CH ₃ -5-CN	2-SO ₂ CH ₃ -5-Br
2-OC ₂ H ₅	2-Cl-5-I	2-CH ₃ -5-C(CH ₃) ₃	2-SO ₂ CH ₃ -6-OCH ₃
2-SCH ₃	2-Cl-5-NO ₂	2-CF ₃ -5-CO ₂ C ₂ H ₅	5-CHO-6-Cl
2-SOCH ₃	2-Cl-5-CN	2-OCH ₃ -6-Cl	5-CHO-6-NH ₂
2-SO ₂ CH ₃	2-Cl-5-CH ₃	2-SCH ₃ -6-Cl	5-CO ₂ H-6-Cl
2-NHCH ₃	2-Cl-6-CH ₃	2-SCH ₃ -5-Br	2-NH ₂ -6-CH(CH ₃) ₂
5-F	2-Cl-5-CF ₃	2-SCH ₃ -5-CN	2,6-2F-5-Cl
6-Cl	2-Cl-5-OCH ₃	2-SCH ₃ -6-CH ₃	2,6-2Cl-5-NO ₂
6-NHCH ₃	2-Cl-6-CO ₂ CH ₃	2-SCH ₃ -6-CF ₃	2,6-2Br-5-NO ₂
6-CH ₃	2,6-2Br	2-SCH ₃ -5-OCH ₃	2-Cl-5-NO ₂ -6-CO ₂ C ₂ H ₅
6-CF ₃	2-Br-5-CN	2-SCH ₃ -6-OCH ₃	2-Cl-5-NO ₂ -6-CH ₃
5,6-2F	2-NO ₂ -6-NH ₂	2-SCH ₃ -5-CO ₂ C ₂ H ₅	2-CF ₃ -5,6-2CH ₃
2-F-5-Cl	5-NO ₂ -6-Cl	2-SC ₂ H ₅ -5-CO ₂ C ₂ H ₅	2-SCH ₃ -5-CN-6-Cl
2-Cl-5-F	5-CN-6-CH ₃	2-SCH ₃ -5-CO ₂ H	2-SO ₂ CH ₃ -5-CN-6-Cl

[0109] 表 10

[0110]

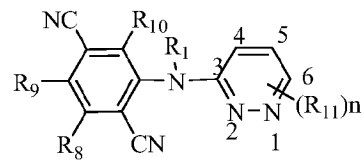
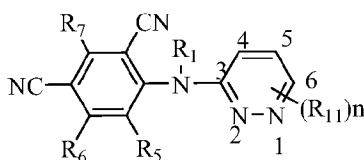
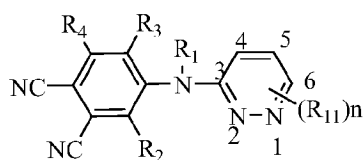


[0111]

(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
—	4-Cl	2,4-2Br	2-SCH ₃ -4-CO ₂ CH ₃
2-F	4-Br	4,6-2Br	2-SCH ₃ -4-CO ₂ H
2-Cl	2,4-2F	2-OCH ₃ -4-Cl	2-SCH ₃ -4-CONH ₂
2-Br	4,6-2F	2-OCH ₃ -4-Br	2-SCH ₃ -4-CSNH ₂
2-I	2,4,6-3F	2,4-OCH ₃	2-SO ₂ CH ₃ -4-Cl
2-CN	2,4-2Cl	4,6-OCH ₃	2-CH ₃ -4,6-2Cl
2-OCH ₃	4,6-2Cl	2-OC ₂ H ₅ -4-Cl	2-Cyclopropyl-4-Cl
2-SCH ₃	2-Cl-4-OCH ₃	2-OC ₂ H ₅ -4-Br	2-Cyclopropyl-4,6-2Cl
2-NH ₂	2-Cl-4-N(Me) ₂	2-SCH ₃ -4-Cl	2-Cyclopropyl-4,6-2OCH ₃

[0112] 表 11

[0113]

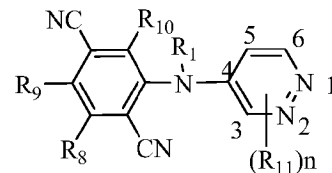
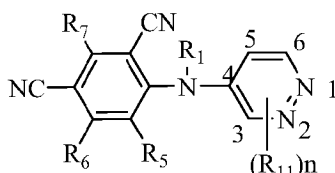
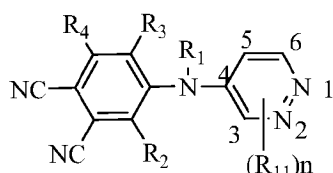


[0114]

(R ₁₁)n	(R ₁₁)n	(R ₁₁)n	(R ₁₁)n
—	6-CO ₂ CH ₃	6-CON(CH ₃) ₂	4-Cl-6-CO ₂ CH ₃
6-Cl	6-CO ₂ C ₂ H ₅	6-CON(C ₂ H ₅) ₂	4-Cl-6-CONHCH ₃
6-Br	6-CO ₂ C(CH ₃) ₃	6-CSNH ₂	5,6-2Cl
6-CN	6-CO ₂ H	6-CSNHCH ₃	4-Br-6-CN
6-CH ₃	6-NH ₂	4-F-6-CN	4-Br-6-CO ₂ CH ₃
6-OCH ₃	6-N(CH ₃) ₂	4-F-6-CO ₂ CH ₃	4-Br-6-CONHCH ₃
6-SCH ₃	6-CONH ₂	4-F-6-CONHCH ₃	4-CH ₃ -6-CN
6-SOCH ₃	6-CONHCH ₃	3-Cl-5-NHCOCH ₃	4-CH ₃ -6-CO ₂ CH ₃
6-SO ₂ CH ₃	6-CONHC ₂ H ₅	4-Cl-6-CN	4-CH ₃ -6-CONHCH ₃

[0115] 表 12

[0116]

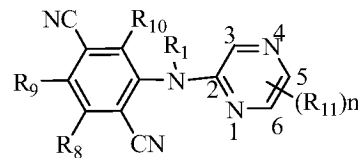
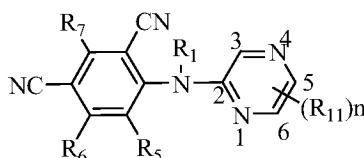
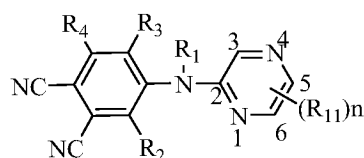


[0117]

(R ₁₁)n	(R ₁₁)n	(R ₁₁)n	(R ₁₁)n
—	5,6-2Cl	5-Cl-6-OCH ₃	3-Cl-5-NHCOCH ₃
3-Cl	3-Cl-6-OCH ₃	5-Cl-6-SCH ₃	3-Cl-5-NHCO ₂ CH ₃
6-Cl	3-Cl-6-SCH ₃	5-Cl-6-SOCH ₃	5,6-2OCH ₃
3,6-2Cl	5-Cl-6-N(CH ₃) ₂	5-Cl-6-SO ₂ CH ₃	5,6-2SCH ₃

[0118] 表 13

[0119]



[0120]

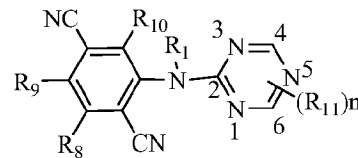
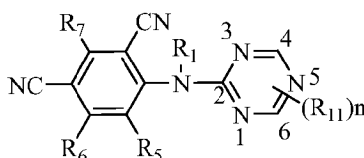
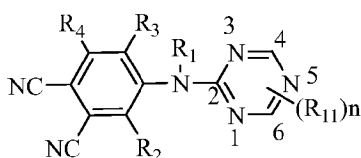
(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
—	6-CO ₂ CH ₃	6-CONHCH ₃	4-CH ₃ -6-CN
6-Cl	6-CO ₂ C ₂ H ₅	6-CONHC ₂ H ₅	4-F-6-CO ₂ CH ₃
6-Br	6-CO ₂ C(CH ₃) ₃	6-CON(CH ₃) ₂	4-Cl-6-CO ₂ CH ₃
6-CN	6-CO ₂ H	6-CSNH ₂	4-Br-6-CO ₂ CH ₃
6-CH ₃	6-CO ₂ Na	6-CSNHCH ₃	4-CH ₃ -6-CO ₂ CH ₃
6-OCH ₃	6-CO ₂ NH ₄	5,6-2Cl	4-F-6-CONHCH ₃
6-SCH ₃	6-NH ₂	4-F-6-CN	4-Cl-6-CONHCH ₃
6-SOCH ₃	6-N(CH ₃) ₂	4-Cl-6-CN	4-Br-6-CONHCH ₃

[0121]

6-SO ₂ CH ₃	6-CONH ₂	4-Br-6-CN	4-CH ₃ -6-CONHCH ₃
-----------------------------------	---------------------	-----------	--

[0122] 表 14

[0123]

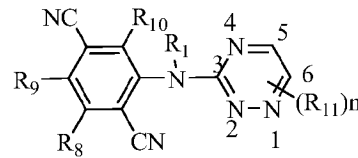
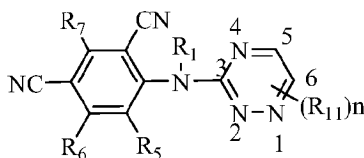
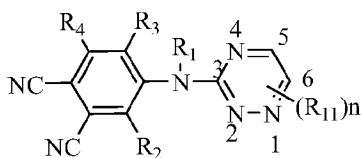


[0124]

(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
4-Cl	4-OCH ₃ -6-NHCH ₃	4-N(CH ₃) ₂	4-NH- <i>i</i> -Pr-6-NHCOCH ₃
4-CN	4,6-2SCH ₃	4-NH ₂ -6-Cl	4-NH- <i>i</i> -Pr-6-NH ₂
4-SCH ₃	4-SCH ₃ -6-Cl	4-NH ₂ -6-OCH ₃	4-NH- <i>i</i> -Pr-6-NHCH ₃
4-SOCH ₃	4-SCH ₃ -6-NHCH ₃	4-NH ₂ -6-SCH ₃	4-NH- <i>t</i> -Bu-6-Cl
4-SO ₂ CH ₃	4-SOCH ₃ -6-Cl	4-NH ₂ -6-SOCH ₃	4-NH- <i>t</i> -Bu-6-CN
4,6-2Cl	4-SO ₂ CH ₃ -6-Cl	4-NH ₂ -6-SO ₂ CH ₃	4-NH- <i>t</i> -Bu-6-OCH ₃
4-CN-6-Cl	4-NHCOCH ₃ -6-Cl	4-NH- <i>i</i> -Pr-6-Cl	4-NH- <i>t</i> -Bu-6-SCH ₃
4,6-2CH ₃	4-NHCOCH ₃ -6-OCH ₃	4-NH- <i>i</i> -Pr-6-CN	4-NH- <i>t</i> -Bu-6-NH ₂
4,6-2OCH ₃	4-NHCOCH ₃ -6-SCH ₃	4-NH- <i>i</i> -Pr-6-OCH ₃	4-NH- <i>t</i> -Bu-6-NHCH ₃
4-OCH ₃ -6-Cl	4-NHCOCH ₃ -6-SO ₂ CH ₃	4-NH- <i>i</i> -Pr-6-SCH ₃	4-NH- <i>t</i> -Bu-6-NHCOCH ₃

[0125] 表 15

[0126]

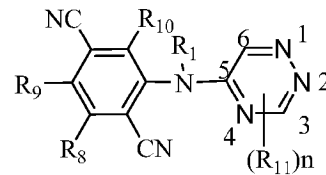
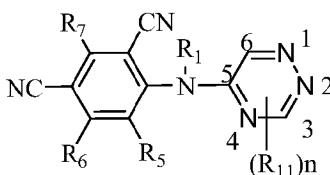
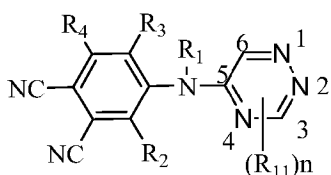


[0127]

(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
5-F-6-CN	5-Br-6-CO ₂ CH ₃	6-CO ₂ CH ₃	6-CON(C ₂ H ₅) ₂
5-Cl-6-CN	5-F-6-CONHCH ₃	6-CO ₂ H	6-CSNH ₂
5-Br-6-CN	5-Cl-6-CONHCH ₃	6-CONH ₂	6-CSNHCH ₃
5-CH ₃ -6-CN	5-Br-6-CONHCH ₃	6-CONHCH ₃	6-CSNHC ₂ H ₅
5-F-6-CO ₂ CH ₃	5-CH ₃ -6-CO ₂ CH ₃	6-CONHC ₂ H ₅	6-CSN(CH ₃) ₂
5-Cl-6-CO ₂ CH ₃	6-CN	6-CON(CH ₃) ₂	6-CSN(C ₂ H ₅) ₂

[0128] 表 16

[0129]



[0130]

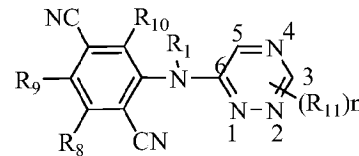
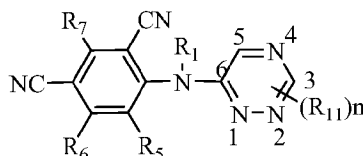
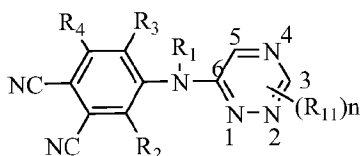
(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
3-CN	3-CONHCH ₃	3-CSN(CH ₃) ₂	3-CO ₂ CH ₃ -6-Cl
3-CO ₂ CH ₃	3-CONHC ₂ H ₅	3-CSN(C ₂ H ₅) ₂	3-CO ₂ CH ₃ -6-Br
3-CO ₂ C ₂ H ₅	3-CON(CH ₃) ₂	3-CN-6-F	3-CO ₂ CH ₃ -6-CH ₃

[0131]

3-CO ₂ H	3-CON(C ₂ H ₅) ₂	3-CN-6-Cl	3-CONHCH ₃ -6-F
3-CO ₂ Na	3-CSNH ₂	3-CN-6-Br	3-CONHCH ₃ -6-Cl
3-CO ₂ NH ₄	3-CSNHCH ₃	3-CN-6-CH ₃	3-CONHCH ₃ -6-Br
3-CONH ₂	3-CSNHC ₂ H ₅	3-CO ₂ CH ₃ -6-F	3-CONHCH ₃ -6-CH ₃

[0132] 表 17

[0133]

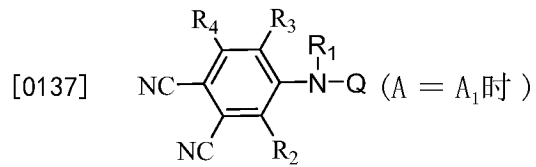


[0134]

(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n	(R ₁₁) _n
3-CN	3-CONH ₂	3-CSNHC ₂ H ₅	3-CO ₂ CH ₃ -5-Cl
3-CO ₂ CH ₃	3-CONHCH ₃	3-CSN(CH ₃) ₂	3-CO ₂ CH ₃ -5-Br
3-CO ₂ C ₂ H ₅	3-CONHC ₂ H ₅	3-CN-5-F	3-CO ₂ CH ₃ -5-CH ₃
3-CO ₂ C(CH ₃) ₃	3-CON(CH ₃) ₂	3-CN-5-Cl	3-CONHCH ₃ -5-F
3-CO ₂ H	3-CON(C ₂ H ₅) ₂	3-CN-5-Br	3-CONHCH ₃ -5-Cl
3-CO ₂ Na	3-CSNH ₂	3-CN-5-CH ₃	3-CONHCH ₃ -5-Br
3-CO ₂ NH ₄	3-CSNHCH ₃	3-CO ₂ CH ₃ -5-F	3-CONHCH ₃ -5-CH ₃

[0135] 本发明的部分化合物可以用表 18、表 19、表 20 中列出的具体化合物来说明,但并不限定本发明。

[0136] 表 18



[0138]

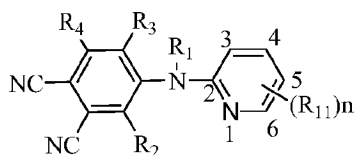
编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	(R ₁₁) _n
A-1	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃
A-2	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl
A-3	H	Cl	Cl	Cl	2-NO ₂
A-4	H	Cl	Cl	Cl	2-CONHCH ₃
A-5	H	Cl	Cl	Cl	3-CH ₃
A-6	H	Cl	Cl	Cl	3-NO ₂
A-7	H	Cl	Cl	Cl	4-CH ₃
A-8	H	Cl	Cl	Cl	4- <i>t</i> -Bu
A-9	H	Cl	Cl	Cl	4-OCH ₃
A-10	H	Cl	Cl	Cl	4-OCF ₃

[0139]

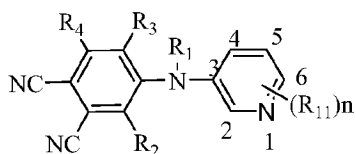
A-11	H	Cl	Cl	Cl	4-CO ₂ CH ₃
A-12	H	Cl	Cl	Cl	4-CN
A-13	H	Cl	Cl	Cl	4-CF ₃
A-14	H	Cl	Cl	Cl	2-F-4-NO ₂
A-15	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-NO ₂
A-16	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-5-NO ₂
A-17	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-CF ₃
A-18	H	Cl	Cl	Cl	2-F-5-CF ₃
A-19	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-5-CF ₃
A-20	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-NO ₂
A-21	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -6-CO ₂ CH ₃
A-22	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2-NO ₂
A-23	H	Cl	Cl	Cl	2-NO ₂ -4-Cl
A-24	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -6-Cl
A-25	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-Cl
A-26	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2 <i>i</i> -Pr
A-27	H	Cl	Cl	Cl	3-CF ₃ -4-CN
A-28	H	Cl	Cl	Cl	2-OCH ₃ -4-NO ₂
A-29	H	Cl	Cl	Cl	2,4--2Cl
A-30	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl
A-31	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2F
A-32	H	Cl	Cl	Cl	2,5-2Cl
A-33	H	Cl	Cl	Cl	3,4-2Cl
A-34	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2Cl
A-35	H	Cl	Cl	Cl	2,3-2Cl
A-36	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-Br
A-37	H	Cl	Cl	Cl	3-Cl-4-CO ₂ CH ₃
A-38	H	Cl	Cl	Cl	3,4-2CH ₃
A-39	H	Cl	Cl	Cl	3-CF ₃ -4-Cl
A-40	H	Cl	Cl	Cl	2,4,6-3CH ₃
A-41	H	Cl	Cl	Cl	2,3,4-3F
A-42	H	Cl	Cl	Cl	2-CN-6-Br-4-NO ₂
A-43	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2F-4-NO ₂
A-44	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-NO ₂
A-45	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Br-4-NO ₂
A-46	H	Cl	Cl	Cl	2-Br-6-Cl-4-NO ₂
A-47	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -6-Cl-4-NO ₂
A-48	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-6-F-4-NO ₂
A-49	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-CF ₃
A-50	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-CN-6-CONHCH ₃
A-51	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2Cl-6-CONHCH ₃
A-52	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2Cl-6-CO ₂ CH ₃

[0140]

A-53	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2Cl-6-CN
A-54	H	Cl	Cl	Cl	2,4,6-3Cl
A-55	H	Cl	Cl	Cl	2,3,4-3Cl
A-56	H	Cl	Cl	Cl	2,4,5-3Cl
A-57	H	Cl	Cl	Cl	2, 6-2Cl-4-Br
A-58	H	Cl	Cl	Cl	2, 6-2Cl-4-CN
A-59	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2CN-6-Cl
A-60	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Br-4-OCF ₃
A-61	H	Cl	Cl	Cl	2- CH ₃ -3-Cl-4,6-2NO ₂
A-62	H	Cl	Cl	Cl	2,3,5-3Cl-4,6-2CN
A-63	H	F	F	F	2-F-4-NO ₂
A-64	H	F	F	F	2-Cl-4-NO ₂
A-65	H	F	F	F	2-Cl-5-NO ₂
A-66	H	F	F	F	2-Cl-4-CF ₃
A-67	H	F	F	F	2-F-5-CF ₃
A-68	H	F	F	F	2,4,6-3Cl
A-69	H	F	F	F	2-CN-6-Br-4-NO ₂
A-70	H	F	F	F	2,4-2Cl-6-CN
A-71	H	F	F	F	2,6-2F-4-NO ₂
A-72	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-NO ₂
A-73	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-CN
A-74	H	F	F	F	2,6-2Br-4-NO ₂
A-75	H	F	F	F	2-Br-6-Cl-4-NO ₂
A-76	H	F	F	F	2-CH ₃ -6-Cl-4-NO ₂
A-77	H	F	F	F	2-Cl-6-F-4-NO ₂
A-78	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-CF ₃



编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	(R ₁₁) _n
A-79	H	Cl	Cl	Cl	5-Br
A-80	H	Cl	Cl	Cl	4-CH ₃
A-81	H	Cl	Cl	Cl	5-CH ₃
A-82	H	Cl	Cl	Cl	3-Cl-5- CF ₃
A-83	H	Cl	Cl	Cl	3,5,6-3Cl



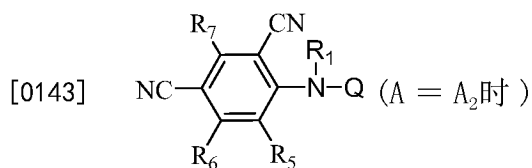
[0141]

编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	(R ₁₁) _n
A-84	H	Cl	Cl	Cl	—
A-85	H	Cl	Cl	Cl	2,5-2Cl

编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	(R ₁₁) _n
A-86	H	Cl	Cl	Cl	—
A-87	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2Cl
A-88	H	F	F	F	3,5-2Cl

编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	(R ₁₁) _n
A-89	H	Cl	Cl	Cl	—
A-90	H	Cl	Cl	Cl	4,6-2OCH ₃

[0142] 表 19



[0144]

编号	R ₁	R ₅	R ₆	R ₇	(R ₁₁) _n
B-1	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃
B-2	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl
B-3	H	Cl	Cl	Cl	2-CN
B-4	H	Cl	Cl	Cl	2-CONHCH ₃
B-5	H	Cl	Cl	Cl	3-CH ₃
B-6	H	Cl	Cl	Cl	3-Cl
B-7	H	Cl	Cl	Cl	3-CF ₃
B-8	H	Cl	Cl	Cl	3-NO ₂
B-9	H	Cl	Cl	Cl	4- <i>t</i> -Bu
B-10	H	Cl	Cl	Cl	4-CN
B-11	H	Cl	Cl	Cl	4-CF ₃

[0145]

B-12	H	Cl	Cl	Cl	4- OCF ₃
B-13	H	Cl	Cl	Cl	4- CO ₂ CH ₃
B-14	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2F
B-15	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2F
B-16	H	Cl	Cl	Cl	2,3-2Cl
B-17	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl
B-18	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2Cl
B-19	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2Cl
B-20	H	Cl	Cl	Cl	2,5-2Cl
B-21	H	Cl	Cl	Cl	3,4-2Cl
B-22	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-Cl
B-23	H	Cl	Cl	Cl	2- CH ₃ -6- Cl
B-24	H	Cl	Cl	Cl	2- CH ₃ -4- CO ₂ CH ₃
B-25	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -6-CO ₂ CH ₃
B-26	H	Cl	Cl	Cl	2,5-2CH ₃
B-27	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2 <i>i</i> -Pr
B-28	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-CF ₃
B-29	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-5-CF ₃
B-30	H	Cl	Cl	Cl	2-F-5- CF ₃
B-31	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-5-CF ₃
B-32	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-Br
B-33	H	Cl	Cl	Cl	3-Cl-4-CO ₂ CH ₃
B-34	H	Cl	Cl	Cl	2-F-4-NO ₂
B-35	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-NO ₂
B-36	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-5-NO ₂
B-37	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2NO ₂
B-38	H	Cl	Cl	Cl	2-CN-4-NO ₂
B-39	H	Cl	Cl	Cl	2-NO ₂ -4-Cl
B-40	H	Cl	Cl	Cl	3- CF ₃ -4-CN
B-41	H	Cl	Cl	Cl	2,3,4-3F
B-42	H	Cl	Cl	Cl	2,4,6-3Cl
B-43	H	Cl	Cl	Cl	2,3,4-3Cl
B-44	H	Cl	Cl	Cl	2,4,6-3CH ₃
B-45	H	Cl	Cl	Cl	2,4,5-3Cl
B-46	H	Cl	Cl	Cl	3,4,5-3Cl
B-47	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-Br
B-48	H	Cl	Cl	Cl	3-CH ₃ -2,4-2Cl
B-49	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2F-4-NO ₂
B-50	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2Cl-6-CN
B-51	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-CN
B-52	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4- CF ₃
B-53	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-6-F-4-NO ₂

[0146]

B-54	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4- NO ₂
B-55	H	Cl	Cl	Cl	2-Br-6-Cl-4-NO ₂
B-56	H	Cl	Cl	Cl	2-Br-6-CN-4-NO ₂
B-57	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Br-4- NO ₂
B-58	H	Cl	Cl	Cl	2- CH ₃ -6- Cl-4-NO ₂
B-59	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-Cl-6-NO ₂
B-60	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2 C ₂ H ₅ -4-Cl
B-61	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Br-4-OCF ₃
B-62	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4- CO ₂ CH ₃
B-62a	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-CN-6- CONHCH ₃
B-62b	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-Cl-6- CONHCH ₃
B-63	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-CONHPh
B-64	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-CONH(4-Cl-Ph)
B-65	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4- CO ₂ Na
B-66	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4- COOH
B-67	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2NO ₂ -3-Cl-4-CF ₃
B-68	H	Cl	Cl	Cl	2- CH ₃ -3-Cl-4,6-2NO ₂
B-69	H	Cl	Cl	Cl	2,3,5-3Cl-4,6-2CN
B-70	H	Cl	N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	2-NO ₂
B-71	H	Cl	NHCH ₃	NHCH ₃	2-F
B-72	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃	2-Br
B-73	H	Cl	N(CH ₃) ₂	Cl	2,6-2Cl-4- NO ₂
B-74	H	Cl	OCH ₃	Cl	2,6-2Cl-4- NO ₂
B-75	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃	2,6-2Cl-4- NO ₂
B-76	H	F	F	F	2-CH ₃
B-77	H	F	F	F	2-NO ₂
B-78	H	F	F	F	3-CH ₃
B-79	H	F	F	F	3-Cl
B-80	H	F	F	F	3-NO ₂
B-81	H	F	F	F	4-OCF ₃
B-82	H	F	F	F	4-CN
B-83	H	F	F	F	2,3-2Cl
B-84	H	F	F	F	2,5-2Cl
B-85	H	F	F	F	3,5-2Cl
B-86	H	F	F	F	2,6-2Cl
B-87	H	F	F	F	2,4-2NO ₂
B-88	H	F	F	F	2-Cl-4-Br
B-89	H	F	F	F	2-CH ₃ -4-Cl
B-90	H	F	F	F	2-CH ₃ -6- Cl
B-91	H	F	F	F	2-Me-4-NO ₂
B-92	H	F	F	F	2-Cl-4-CF ₃
B-93	H	F	F	F	2-F-5-CF ₃

[0147]

B-94	H	F	F	F	2-Cl-5-CF ₃
B-95	H	F	F	F	2-Cl-4-NO ₂
B-96	H	F	F	F	2-NO ₂ -4-Cl
B-97	H	F	F	F	3-CF ₃ -4-CN
B-98	H	F	F	F	3-CF ₃ -4-Cl
B-99	H	F	F	F	3-Cl-4-CO ₂ CH ₃
B-100	H	F	F	F	2,4,6-3CH ₃
B-101	H	F	F	F	2,3,4-3F
B-102	H	F	F	F	2,3,4-3Cl
B-103	H	F	F	F	2,4,6-3Cl
B-104	H	F	F	F	2,4,5-3Cl
B-105	H	F	F	F	3,4,5-3Cl
B-106	H	F	F	F	2, 6-2Cl-4-Br
B-107	H	F	F	F	2, 4-2Cl-6-CN
B-108	H	F	F	F	2, 6-2Cl-4-CN
B-109	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-NO ₂
B-110	H	F	F	F	2,6-2F-4-NO ₂
B-111	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-CF ₃
B-112	H	F	F	F	2-Cl-6-F-4-NO ₂
B-113	H	F	F	F	2-Br-6-Cl-4-NO ₂
B-114	H	F	F	F	2-CH ₃ -6-Cl-4-NO ₂
B-115	H	F	F	F	2,6-2Br-4-NO ₂
B-116	H	F	F	F	2-Br-6-CN-4-NO ₂
B-117	H	F	F	F	2,6-2Br-4-OCF ₃
B-118	H	F	F	F	2- CH ₃ -3-Cl-4,6-2NO ₂
B-119	H	F	F	F	2,3,5-3Cl-4,6-2CN
编号	R ₁	R ₅	R ₆	R ₇	(R ₁₁) _n
B-120	H	Cl	Cl	Cl	—
B-121	H	Cl	Cl	Cl	3-Br
B-122	H	Cl	Cl	Cl	5-Br
B-123	H	Cl	Cl	Cl	3-Br-4-CH ₃
B-124	H	Cl	Cl	Cl	3-Br-5-CH ₃
B-125	H	Cl	Cl	Cl	3-Cl-5-CF ₃
B-126	H	F	F	F	3-Cl-5-CF ₃
B-127	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2CN-6-Cl
B-128	H	Cl	Cl	Cl	3,5,6-3Cl
B-128b	H	Cl	Cl	Cl	3,4,5,6-4Cl

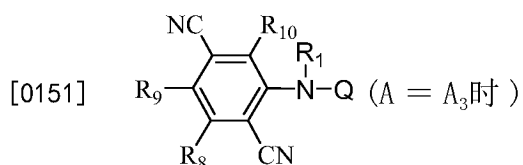
[0148]

B-129	H	F	F	F	3,5,6-3Cl
编号	R ₁	R ₅	R ₆	R ₇	(R ₁₁) _n
B-130	H	Cl	Cl	Cl	
B-131	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl
B-132	H	Cl	Cl	Cl	6-Br
B-133	H	Cl	Cl	Cl	2,5-2Cl
B-134	H	F	F	F	2,5-2Cl
B-135	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-CH ₃
编号	R ₁	R ₅	R ₆	R ₇	(R ₁₁) _n
B-136	H	Cl	Cl	Cl	—
B-137	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl
B-138	H	Cl	Cl	Cl	3-Br
B-139	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2Cl
B-140	H	F	F	F	3,5-2Cl
B-140b	H	Cl	Cl	Cl	2,3,5,6-4Cl
编号	R ₁	R ₅	R ₆	R ₇	(R ₁₁) _n
B-141	H	Cl	Cl	Cl	—
B-142	H	Cl	Cl	Cl	4,6-2CH ₃
B-143	H	Cl	Cl	Cl	4,6-2OCH ₃
B-144	H	Cl	Cl	Cl	4-CF ₃ -5-CO ₂ C ₂ H ₅
编号	R ₁	R ₅	R ₆	R ₇	(R ₁₁) _n
B-145	H	Cl	Cl	Cl	—
B-146	H	Cl	Cl	Cl	6-Cl

[0149]

B-147	H	F	F	F	6-Cl
编号	R ₁	R ₅	R ₆	R ₇	(R ₁₁) _n
B-148	H	Cl	Cl	Cl	—
B-149	H	Cl	Cl	Cl	6-Cl
B-150	H	F	F	F	6-Cl

[0150] 表 20



[0152]

编号	R ₁	R ₈	R ₉	R ₁₀	(R ₁₁) _n
C-1	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃
C-2	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl
C-3	H	Cl	Cl	Cl	2-NO ₂
C-4	H	Cl	Cl	Cl	2-CONHCH ₃
C-5	H	Cl	Cl	Cl	3-Cl
C-6	H	Cl	Cl	Cl	3-CH ₃
C-7	H	Cl	Cl	Cl	3-NO ₂
C-8	H	Cl	Cl	Cl	4-CO ₂ CH ₃
C-9	H	Cl	Cl	Cl	4- <i>t</i> -Bu
C-10	H	Cl	Cl	Cl	4-CH ₃
C-11	H	Cl	Cl	Cl	4-CF ₃
C-12	H	Cl	Cl	Cl	4-CN
C-13	H	Cl	Cl	Cl	4-OCF ₃
C-14	H	Cl	Cl	Cl	4-OCH ₃
C-15	H	Cl	Cl	Cl	2,4--2Cl
C-16	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl
C-17	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2F
C-18	H	Cl	Cl	Cl	2,5-2Cl
C-19	H	Cl	Cl	Cl	3,4-2Cl
C-20	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2Cl

[0153]

C-21	H	Cl	Cl	Cl	2,3-2Cl
C-22	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-Br
C-23	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2NO ₂
C-24	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2 <i>i</i> -Pr
C-25	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-Cl
C-26	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -6-Cl
C-27	H	Cl	Cl	Cl	2-F-4-NO ₂
C-28	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-NO ₂
C-29	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-5-NO ₂
C-30	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-CF ₃
C-31	H	Cl	Cl	Cl	2-F-5-CF ₃
C-32	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-5-CF ₃
C-33	H	Cl	Cl	Cl	2-NO ₂ -4-Cl
C-34	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -6-CO ₂ CH ₃
C-35	H	Cl	Cl	Cl	2-OCH ₃ -4-NO ₂
C-36	H	Cl	Cl	Cl	3-Cl-4-CO ₂ CH ₃
C-37	H	Cl	Cl	Cl	3,4-2CH ₃
C-38	H	Cl	Cl	Cl	3-CF ₃ -4-CN
C-39	H	Cl	Cl	Cl	3-CF ₃ -4-Cl
C-40	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-NO ₂
C-41	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Br-4-NO ₂
C-42	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-Br
C-43	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-CN
C-44	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2Cl-6-CN
C-45	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2F-4-NO ₂
C-46	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-6-F-4-NO ₂
C-47	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Br-4-OCF ₃
C-48	H	Cl	Cl	Cl	2-CN -6-Br -4-NO ₂
C-49	H	Cl	Cl	Cl	2-Br-6-Cl-4-NO ₂
C-50	H	Cl	Cl	Cl	2,6-2Cl-4-CF ₃
C-51	H	Cl	Cl	Cl	2,3,4-3F
C-52	H	Cl	Cl	Cl	2,4,5-3Cl
C-53	H	Cl	Cl	Cl	2,4,6-3Cl
C-54	H	Cl	Cl	Cl	2,3,4-3Cl
C-55	H	Cl	Cl	Cl	2,4,6-3CH ₃
C-56	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -4-Cl-6-CONHCH ₃
C-57	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -6-Cl-4-NO ₂
C-58	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2Cl-6-CONHCH ₃
C-59	H	Cl	Cl	Cl	2,4-2Cl-6-CO ₂ CH ₃
C-60	H	Cl	Cl	Cl	2-CH ₃ -3-Cl-4,6-2NO ₂
C-61	H	Cl	Cl	Cl	2,3,5-3Cl -4,6-2CN
C-62	H	OCH ₃	Cl	Cl	2-Cl-4-CF ₃

[0154]

C-63	H	F	F	F	2-CH ₃
C-64	H	F	F	F	2-NO ₂
C-65	H	F	F	F	3-CH ₃
C-66	H	F	F	F	3-Cl
C-67	H	F	F	F	3-NO ₂
C-68	H	F	F	F	4-OCH ₃
C-69	H	F	F	F	4- <i>t</i> -Bu
C-70	H	F	F	F	4-NO ₂
C-71	H	F	F	F	2,4--2Cl
C-72	H	F	F	F	2,6-2Cl
C-73	H	F	F	F	2,6-2F
C-74	H	F	F	F	2,5-2Cl
C-75	H	F	F	F	3,4-2Cl
C-76	H	F	F	F	3,5-2Cl
C-77	H	F	F	F	2,3-2Cl
C-78	H	F	F	F	2-Cl-4-Br
C-79	H	F	F	F	2-F-4-NO ₂
C-80	H	F	F	F	2-Cl-4-NO ₂
C-81	H	F	F	F	2-Cl-5-NO ₂
C-82	H	F	F	F	2-Cl-4-CF ₃
C-83	H	F	F	F	2-Cl-5-CF ₃
C-84	H	F	F	F	2-F-5-CF ₃
C-85	H	F	F	F	2-CH ₃ -4-Cl
C-86	H	F	F	F	2-CH ₃ -4-NO ₂
C-87	H	F	F	F	2-CH ₃ -6- Cl
C-88	H	F	F	F	2-OCH ₃ -4-NO ₂
C-89	H	F	F	F	2-NO ₂ -4-Cl
C-90	H	F	F	F	3-Cl-4-CO ₂ CH ₃
C-91	H	F	F	F	3-CF ₃ -4-Cl
C-92	H	F	F	F	2,6-2F-4-NO ₂
C-93	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-NO ₂
C-94	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-CN
C-95	H	F	F	F	2,4-2Cl-6-CN
C-96	H	F	F	F	2,6-2Br-4-NO ₂
C-97	H	F	F	F	2-CN-6-Br-4-NO ₂
C-98	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-CF ₃
C-99	H	F	F	F	2-Br-6-Cl-4-NO ₂
C-100	H	F	F	F	2-Cl-6-F-4-NO ₂
C-101	H	F	F	F	2-CH ₃ -6-Cl-4-NO ₂
C-102	H	F	F	F	2,6-2Br-4-OCF ₃
C-103	H	F	F	F	2,4,6-3Cl
C-104	H	F	F	F	2,3,4-3Cl

[0155]

C-105	H	F	F	F	2,4,5-3Cl
C-106	H	F	F	F	2,6-2Cl-4-Br
C-107	H	F	F	F	2,4,6-3CH ₃
编号	R ₁	R ₈	R ₉	R ₁₀	(R ₁₁) _n
C-108	H	F	F	F	5-Br
C-109	H	Cl	Cl	Cl	5-Br
C-110	H	Cl	Cl	Cl	4-CH ₃
C-111	H	Cl	Cl	Cl	5-CH ₃
C-112	H	Cl	Cl	Cl	3-Cl-5-CF ₃
C-113	H	Cl	Cl	Cl	3,5,6-3Cl
C-114	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2CN-6-Cl
编号	R ₁	R ₈	R ₉	R ₁₀	(R ₁₁) _n
C-115	H	Cl	Cl	Cl	—
C-116	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl
C-117	H	Cl	Cl	Cl	6-Br
C-118	H	Cl	Cl	Cl	2,5-2Cl
C-119	H	F	F	F	2,5-2Cl
C-120	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl-4-CH ₃
编号	R ₁	R ₈	R ₉	R ₁₀	(R ₁₁) _n
C-121	H	Cl	Cl	Cl	
C-122	H	Cl	Cl	Cl	2-Cl
C-123	H	Cl	Cl	Cl	3-Br
C-124	H	Cl	Cl	Cl	3,5-2Cl
C-125	H	F	F	F	3,5-2Cl

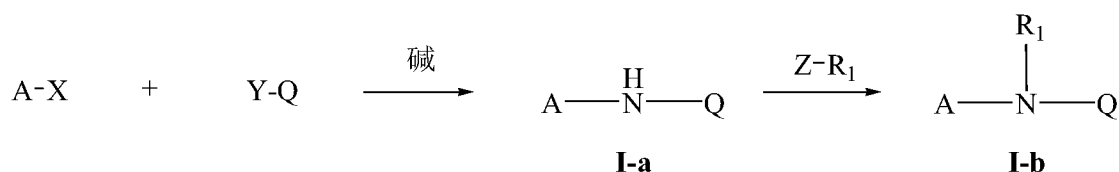
[0156]

编号	R ₁	R ₈	R ₉	R ₁₀	(R ₁₁) _n
C-126	H	Cl	Cl	Cl	—
C-127	H	Cl	Cl	Cl	4,6-2CH ₃
C-128	H	Cl	Cl	Cl	4,6-2OCH ₃
C-129	H	Cl	Cl	Cl	4-CF ₃ -5-CO ₂ C ₂ H ₅

[0157] 本发明通式 I 化合物按照以下方法制备,反应式如下,式中各基团除另有说明外定义同前:

[0158] 含有卤原子或者氨基的中间体 A-X 和含有氨基或者卤原子的中间体 Y-Q 在碱性条件下反应得到通式 I 中 R₁ = H 的化合物 I-a;将其与 Z-R₁ (R₁ ≠ H) 反应,即可得到通式 I 中 R₁ ≠ H 的化合物 I-b。

[0159]

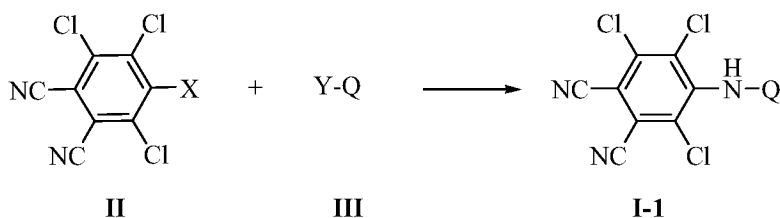


[0160] 式中:当 X 选自卤原子时,Y 选自氨基,当 X 选自氨基时,Y 选自卤原子;Z 选自碱金属原子或氢。

[0161] 对于本发明中较优选的通式 I-1、I-2、I-3 化合物,考虑到原料易得,合成方法简便,可以按照以下方法制备,式中各基团除另有说明外定义同前:

[0162] 当 A = A₁时,中间体 II 和 III 在碱性条件下反应得到通式 I-1 (R₁ = H, R₂、R₃、R₄ 均为 Cl)。

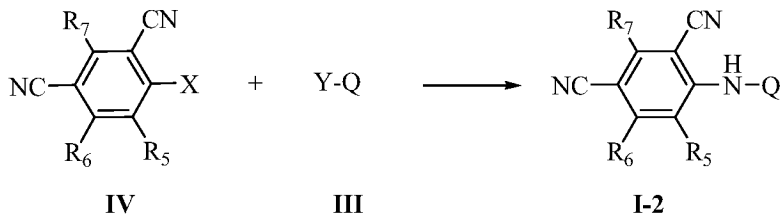
[0163]



[0164] 式中:当 X 选自 Cl 时,Y 选自氨基;当 X 选自氨基时,Y 选自卤原子。

[0165] 当 A = A₂时,中间体 IV 和中间体 III 在碱性条件下反应得到通式 I-2 (R₁ = H)。

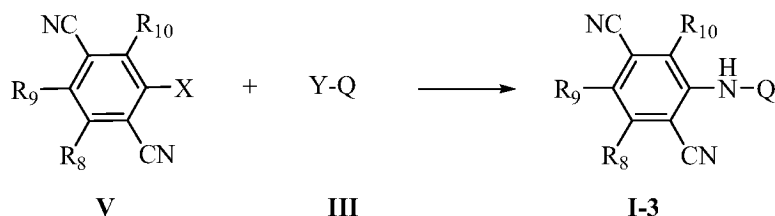
[0166]



[0167] 式中:当 R₅、R₆、R₇选自 F 时,则 X 选自 F, Y 选自氨基;当 R₅、R₆、R₇选自 Cl 时,则 X 选自 Cl, Y 选自氨基;当 X 选自氨基时,则 Y 选自卤原子。

[0168] 当 A = A₃时,中间体 V 和 III 在碱性条件下反应得到通式 I-3 (R₁ = H)。

[0169]



[0170] 式中：当 R_8, R_9, R_{10} 选自 F 时，则 X 选自 F，Y 选自氨基；当 R_8, R_9, R_{10} 选自 Cl 时，则 X 选自 Cl，Y 选自氨基；当 X 选自氨基时，则 Y 选自卤原子。

[0171] 适宜的碱可选自如氢氧化钾、氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、三乙胺、吡啶、甲醇钠、乙醇钠、氯化钠、叔丁醇钾或叔丁醇钠等。

[0172] 反应在适宜的溶剂中进行，适宜的溶剂可选自如四氢呋喃、1,4-二氧六环、乙腈、甲苯、二甲苯、苯、N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲亚砜、丙酮或丁酮等。

[0173] 反应温度可在室温至溶剂沸点温度之间，通常为 20-100℃。

[0174] 反应时间为 30 分钟至 20 小时，通常 1-10 小时。

[0175] 中间体 II，当 X 为 Cl 时，为市售商品；当 X 为氨基时，制备方法参照 Pesticide Science(1988)24(2),116-117。

[0176] 中间体 IV，当 X 为 F 或 Cl 时，为市售商品；当 X 为氨基时，制备方法参照 Pesticide Science(1988),24(2),116-117。

[0177] 中间体 V，当 X 为 F 或 Cl 时，为市售商品；当 X 为氨基时，制备方法参照 Pesticide Science(1988),24(2),116-117。

[0178] 中间体 III 多为市售商品，个别无市售的中间体可以市售商品为原料按照常规方法通过取代基的简单变换来获得；也可以按公知方法制备，例如参照文献 Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 45B(4), 972-975；2006 中介绍的方法或者文献 Tetrahedron Letters, 44(21), 4085-4088；2003 报道的方法，以及波兰专利 PL174903 中的方法等制得。

[0179] 通式 I-1、I-2、I-3 中，Q 选自苯基时，制备苯环上的三个取代位置（两个邻位和一个对位）含有一至两个硝基的化合物，可以由该三个位置中至少有一个为氢的化合物、经过硝化增加一或两个硝基而得到，制备方法参见 US4041172 等；制备苯环上的三个取代位置（两个邻位和一个对位）含有一至三个卤原子的通式化合物，可以由该三个位置中至少有一个为氢的化合物、经过卤化增加一或两个卤原子而得到。

[0180] 通式 I 化合物的盐可以由通式 I 化合物与对应的酸或碱按常规方法制得。适宜的酸选自盐酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、甲磺酸、对甲苯磺酸、苹果酸或柠檬酸等；进一步优选盐酸、硫酸、磷酸、三氟乙酸、甲磺酸、乙酸或对甲苯磺酸。适宜的碱选自氯化钠、氢氧化钠或氢氧化钾。

[0181] 虽然本发明的通式 I 化合物与现有技术中公开的某些化合物都属于二苯胺类化合物，但结构特征仍存在显著不同。并且由于这些结构上的差异而使得本发明的化合物具有意想不到的杀菌活性。当 Q 选自苯基、且当 Q 为邻对位双取代或者三取代苯基时，杀菌活性更优；特别地，当对位取代基为吸电子基团时，杀菌效果更为突出。而且，由于合成该类化合物的原料易得、方法简便，因而同已知杀菌剂相比，本发明的化合物成本低廉，具有极其广阔的应用前景。

[0182] 通式 I 化合物对农业或其他领域中的多种病菌显示出优异的活性。因此,本发明的技术方案还包括通式 I 化合物或其盐在农业或其他领域中用作制备杀菌剂药物的用途。

[0183] 下面提及的病害的例子仅用来说明本发明,但绝不限定本发明。

[0184] 通式 I 化合物可用于防治下列病害:卵菌纲病害,如霜霉病(黄瓜霜霉病、油菜霜霉病、大豆霜霉病、甜菜霜霉病、甘蔗霜霉病、烟草霜霉病、豌豆霜霉病、丝瓜霜霉病、冬瓜霜霉病、甜瓜霜霉病、白菜类霜霉病、菠菜霜霉病、萝卜霜霉病、葡萄霜霉病、葱霜霉病),白锈菌(油菜白锈病、白菜类白锈病),猝倒病(油菜猝倒病、烟草猝倒病、番茄猝倒病、辣椒猝倒病、茄子猝倒病、黄瓜猝倒病、棉苗猝倒病),绵腐病(辣椒绵腐病、丝瓜绵腐病、冬瓜绵腐病),疫病(蚕豆疫病、黄瓜疫病、南瓜疫病、冬瓜疫病、西瓜疫病、甜瓜疫病、辣椒疫病、韭菜疫病、大蒜疫病、棉花疫病),晚疫病(马铃薯晚疫病、番茄晚疫病)等;半知菌病害,如枯萎病(甘薯枯萎病、棉花枯萎病、芝麻枯萎病、蓖麻枯萎病、番茄枯萎病、菜豆枯萎病、黄瓜枯萎病、丝瓜枯萎病、南瓜枯萎病、冬瓜枯萎病、西瓜枯萎病、甜瓜枯萎病、辣椒枯萎病、蚕豆枯萎病、油菜枯萎病、大豆枯萎病),根腐病(辣椒根腐病、茄子根腐病、菜豆根腐病、黄瓜根腐病、苦瓜根腐病、棉黑根腐病、蚕豆根腐病),立枯病(棉苗立枯病、芝麻立枯病、辣椒立枯病、黄瓜立枯病、白菜立枯病),炭疽病(高粱炭疽病、棉花炭疽病、红麻炭疽病、黄麻炭疽病、亚麻炭疽病、烟草炭疽病、桑炭疽病、辣椒炭疽病、茄子炭疽病、菜豆炭疽病、黄瓜炭疽病、苦瓜炭疽病、西葫芦炭疽病、冬瓜炭疽病、西瓜炭疽病、甜瓜炭疽病、荔枝炭疽病),黄萎病(棉花黄萎病、向日葵黄萎病、番茄黄萎病、辣椒黄萎病、茄子黄萎病),黑星病(西葫芦黑星病、冬瓜黑星病、甜瓜黑星病),灰霉病(棉铃灰霉病、红麻灰霉病、番茄灰霉病、辣椒灰霉病、菜豆灰霉病、芹菜灰霉病、菠菜灰霉病、猕猴桃灰霉病),褐斑病(棉花褐斑病、黄麻褐斑病、甜菜褐斑病、花生褐斑病、辣椒褐斑病、冬瓜褐斑病、大豆褐斑病、向日葵褐斑病、豌豆褐斑病、蚕豆褐斑病),黑斑病(亚麻假黑斑病、油菜黑斑病、芝麻黑斑病、向日葵黑斑病、蓖麻黑斑病、番茄黑斑病、辣椒黑斑病、茄子黑斑病、菜豆黑斑病、黄瓜黑斑病、芹菜黑斑病、胡萝卜黑腐病、胡萝卜黑斑病、苹果黑斑病、花生黑斑病),斑枯病(番茄斑枯病、辣椒斑枯病、芹菜斑枯病),早疫病(番茄早疫病、辣椒早疫病、茄子早疫病、马铃薯早疫病、芹菜早疫病),轮纹病(大豆轮纹病、芝麻轮纹病、菜豆轮纹病),叶枯病(芝麻叶枯病、向日葵叶枯病、西瓜叶枯病、甜瓜叶枯病),茎基腐病(番茄茎基腐病、菜豆茎基腐病),及其他(玉米圆斑病、红麻腰折病、稻瘟病、栗黑鞘病、甘蔗眼斑病、棉铃曲霉病、花生冠腐病、大豆茎枯病、大豆黑点病、甜瓜大斑病、花生网斑病、茶赤叶斑病、辣椒白星病、冬瓜叶斑病、芹菜黑腐病、菠菜心腐病、红麻叶霉病、红麻斑点病、黄麻茎斑病、大豆紫斑病、芝麻叶斑病、蓖麻灰斑病、茶褐色叶斑病、茄子褐色圆星病、菜豆红斑病、苦瓜白斑病、西瓜斑点病、黄麻枯腐病、向日葵根茎腐病、菜豆炭腐病、大豆靶点病、茄子棒孢叶斑病、黄瓜靶斑病、番茄叶霉病、茄子叶霉病、蚕豆赤斑病等)等;担子菌病害,如锈病(小麦条锈病、小麦秆锈病、小麦叶锈病、花生锈病、向日葵锈病、甘蔗锈病、韭菜锈病、葱锈病、栗锈病、大豆锈病),黑穗病(玉米丝黑穗病、玉米黑粉病、高粱丝黑穗病、高粱散黑穗病、高粱竖黑穗病、高粱柱黑粉病、栗粒黑穗病、甘蔗黑穗病、菜豆锈病)及其他(如小麦纹枯病、水稻纹枯病等)等;子囊菌病害,如白粉病(小麦白粉病、油菜白粉病、芝麻白粉病、向日葵白粉病、甜菜白粉病、茄子白粉病、豌豆白粉病、丝瓜白粉病、南瓜白粉病、西葫芦白粉病、冬瓜白粉病、甜瓜白粉病、葡萄白粉病、蚕豆白粉病),菌核病(亚麻菌核病、油菜菌核病、大豆菌核病、花生菌核病、烟草菌核病、辣椒菌核病、茄

子菌核病、菜豆菌核病、豌豆菌核病、黄瓜菌核病、苦瓜菌核病、冬瓜菌核病、西瓜菌核病、芹菜菌核病),黑星病(苹果黑星病、梨黑星病)等。特别地,对玉米锈病、稻瘟病、黄瓜灰霉病和黄瓜霜霉病,在较低剂量下仍具有很好的防治效果。

[0185] 由于其积极的特性,上述化合物可有利地用于保护农业和园艺业重要的作物、家畜和种畜,以及人类常去的环境免于病菌的伤害。

[0186] 为获得理想效果,化合物的用量因各种因素而改变,例如所用化合物、预保护的作物、有害生物的类型、感染程度、气候条件、施药方法、采用的剂型。

[0187] 每公顷 10 克 -5 公斤的化合物剂量能提供充分的防治。

[0188] 本发明的另一目的还涉及通过施用通式 I 化合物,防治农业和园艺业重要的作物和 / 或家畜和种畜和 / 或人类常去的环境中的植物致病性真菌的方法。尤其是,化合物的用量在每公顷 10 克 -5 公斤内变化。

[0189] 为了实际应用于农业,使用含一种或多种通式 I 化合物的组合物通常是有益的。

[0190] 因此,本发明的另外一种技术方案还包括一种杀菌组合物,含有作为活性组分的通式 I 化合物和农业上可接受的载体,组合物中活性组分的重量百分含量为 0.5-90%。

[0191] 组合物的使用形式可以是干粉、可湿性粉剂、水乳剂、乳油、微乳剂、糊剂、水分散性粒剂、溶液、悬浮剂等;组合物类型的选择取决于具体的应用。

[0192] 组合物是以已知方式制备的,例如任选在表面活性剂的存在下,通过用溶剂介质和 / 或固体稀释剂稀释或溶解活性物质。可用的固体稀释剂或载体是例如:二氧化硅、高岭土、膨润土、滑石、硅藻土、白云石、碳酸钙、氧化镁、白垩、粘土、合成硅酸盐、硅镁土、海泡石。除水以外,可用的液体稀释剂是例如芳族有机溶剂(二甲苯或烷基苯的混合物、氯苯等),石蜡(石油馏分),醇类(甲醇、丙醇、丁醇、辛醇、甘油),酯类(乙酸乙酯、乙酸异丁酯等),酮类(环己酮、丙酮、苯乙酮、异佛尔酮、乙基戊基酮等),酰胺类(N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮等)。可用的表面活性剂是烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、聚氧乙烯烷基酚、山梨醇的聚氧乙烯酯、木质素磺酸盐等的钠、钙、三乙基胺或三乙醇胺盐。组合物还可含特殊的添加剂用于特定的目的,例如粘合剂如阿拉伯胶、聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮等。

[0193] 上述组合物中活性成分的浓度可根据活性成分、其使用目的、环境条件和采用的制剂类型而在宽范围内改变。通常,活性成分的浓度范围是 1-90%,优选 5-50%。

[0194] 如果需要,可以向组合物中添加能与通式 I 化合物兼容的其他活性成分,例如其他杀真菌剂、杀虫剂 / 杀螨剂、植物生长调节剂、抗生素、除草剂、肥料。

[0195] 几种剂型的配制方法举例如下:

[0196] 悬浮剂的配制:常用配方中活性组分含量为 5% -35%。以水为介质,将原药、分散剂、助悬剂和抗冻剂等加入砂磨机中,进行研磨,制成悬浮剂。水乳剂的配制:将原药、溶剂和乳化剂加在一起,使溶解成均匀油相。将水、抗冻剂等混合一起,成为均一水相。在高速搅拌下,将水相加入到油相或将油相加入到水相,形成分散性良好的水乳剂。本发明的水乳剂活性组分含量一般为 5% -15%。为制备浓乳剂,本发明的化合物可溶解于一种或数种混合溶剂,再加入乳化剂来增强化合物在水中的分散效果。可湿性粉剂的配制:按配方要求,将原药、各种表面活性剂及固体稀释剂等充分混合,经超细粉碎机粉碎后,即得到预定含量(例如 10% -40%)的可湿性粉剂产品。为制备适于喷洒用的可湿性粉剂,本发明的化合物可以和研细的固体粉末如粘土、无机硅酸盐、碳酸盐以及润湿剂、粘合剂和 / 或分散剂组成

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

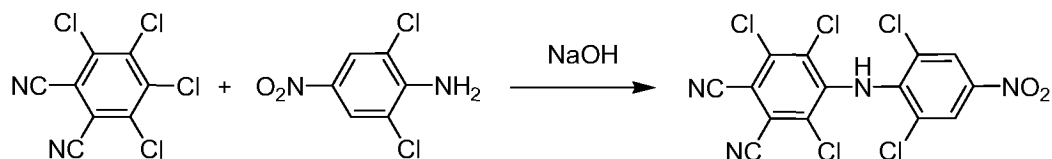
具体实施方式

[0197] 以下具体实施例用来进一步说明本发明，但本发明绝非限于这些例子。（除另有注明外，所用原料均有市售）

[0198] 合成实施例

[0199] 实施例 1：化合物 A-44 的制备

[0200]

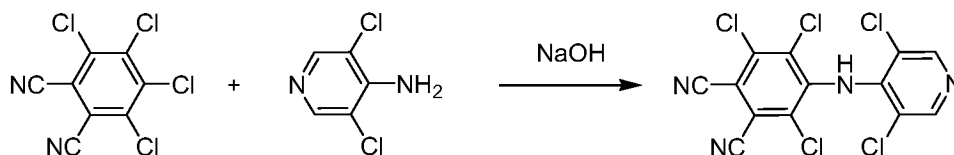


[0201] 向 1.64g (0.0075mol) 2,6-二氯-4-硝基苯胺的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入氢氧化钠 0.60g (0.015mol)，搅拌下缓缓加入 3,4,5,6-四氯-1,2-苯二甲腈 2g (0.0075mol)，加完后继续室温搅拌反应 5h，TLC 监测反应完毕后，将反应液倒入水中，乙酸乙酯萃取，有机相依次经水洗，饱和盐水洗，干燥，过滤，脱溶，残余物柱层析（洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚（沸程 60-90℃），体积比为 1：4）纯化得产品 2.8g，即化合物 A-44。黄色固体，熔点 188-190℃。

[0202] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3), δ (ppm) :6.76 (s, 1H, NH), 8.31 (s, 2H, Ph-3,5-2H)。

[0203] 实施例 2：化合物 A-87 的制备

[0204]

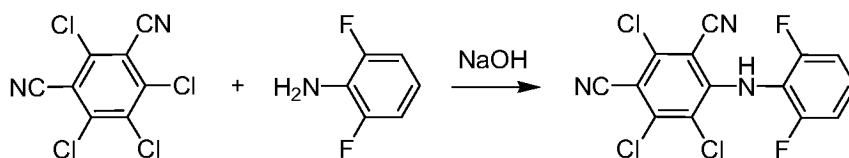


[0205] 向 1.22g (0.0075mol) 3,5-二氯-4-氨基吡啶的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入氢氧化钠 0.60g (0.015mol)，搅拌下缓缓加入 3,4,5,6-四氯-1,2-苯二甲腈 2g (0.0075mol)，加完后继续室温搅拌反应 5h，TLC 监测反应完毕后，将反应液倒入水中，乙酸乙酯萃取，有机相依次经水洗，饱和盐水洗，干燥，过滤，脱溶，残余物柱层析（洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚（沸程 60-90℃），体积比为 1：4）纯化得产品 2.6g，即化合物 A-87。黄色固体，熔点 214-216℃。

[0206] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO), 8.26 (s, 2H, Py-2,6-2H), 11.0 (br, 1H, NH)。

[0207] 实施例 3：化合物 B-15 的制备

[0208]

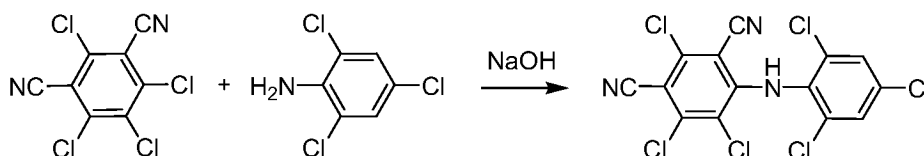


[0209] 向 1.03g(0.008mol) 2,6-二氟苯胺的 40ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中,加入氢氧化钠 0.64g(0.016mol),搅拌下缓缓加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 2.13g(0.008mol),加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后,将反应液倒入水中,乙酸乙酯萃取,有机相依次经水洗,饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1:4)纯化得产品 1.65g,即化合物 B-15。浅黄色固体,熔点 264-266℃。

[0210] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) :6.70(s, 1H, NH), 7.07(t, 2H, Ph-3, 5-2H, $J = 8.1\text{Hz}$), 7.37(m, 1H, Ph-4-1H)。

[0211] 实施例 4:化合物 B-42 的制备

[0212]

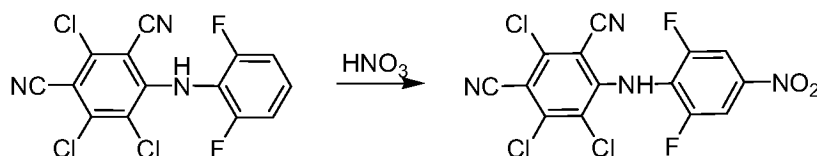


[0213] 向 1.57g(0.008mol) 2,4,6-三氟苯胺的 40ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中,加入氢氧化钠 0.64g(0.016mol),搅拌下缓缓加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 2.13g(0.008mol),加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后,将反应液倒入水中,乙酸乙酯萃取,有机相依次经水洗,饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1:4)纯化得产品 1.71g,即化合物 B-42。浅黄色固体,熔点 241-243℃。

[0214] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) :6.86(s, 1H, NH), 7.48(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0215] 实施例 5:化合物 B-49 的制备

[0216]

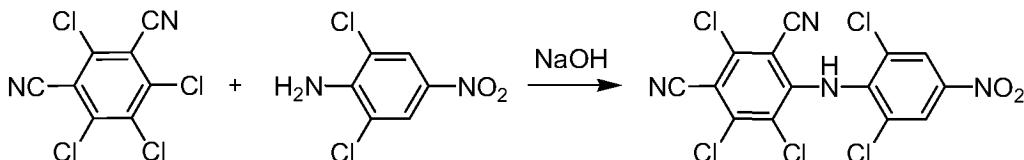


[0217] 先将 0.68g(0.002mol) 化合物 B-15 的 20ml 浓硫酸溶液置于冰浴中,搅拌下缓缓滴加配制好的混酸(硝酸和硫酸物质的量分别为 0.004mol 和 0.006mol),控制温度在 20℃ 以下。滴加完毕后,继续反应 5min, TLC 监测反应完毕后,将反应液倒入冰水中,搅拌。冷至室温后,乙酸乙酯萃取,有机相依次经饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1:4)纯化得产品 0.40g,即化合物 B-49。浅白色固体,熔点 204-206℃。

[0218] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) :6.70(s, 1H, NH), 7.97-8.01(dd, 2H, Ph-3, 5-2H, $^3J = 10.8\text{Hz}$, $^4J = 3.0\text{Hz}$)。

[0219] 实施例 6:化合物 B-54 的制备

[0220]

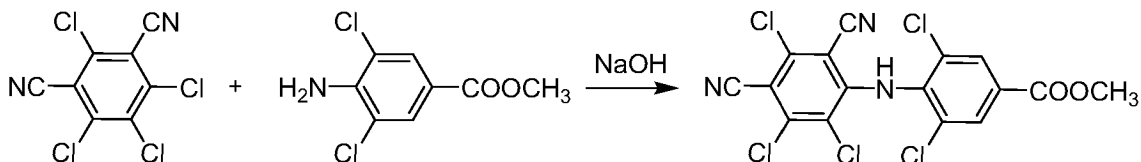


[0221] 向 0.35g (0.0013mol) 2,6-二氯-4-硝基苯胺的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入氢氧化钠 0.10g (0.0026mol), 搅拌下缓缓加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 0.27g (0.0013mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 4) 纯化得产品 0.48g, 即化合物 B-54。浅黄色固体, 熔点 250-252°C。

[0222] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) : 6.93 (s, 1H, NH), 8.34 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0223] 实施例 7 : 化合物 B-62 的制备

[0224]

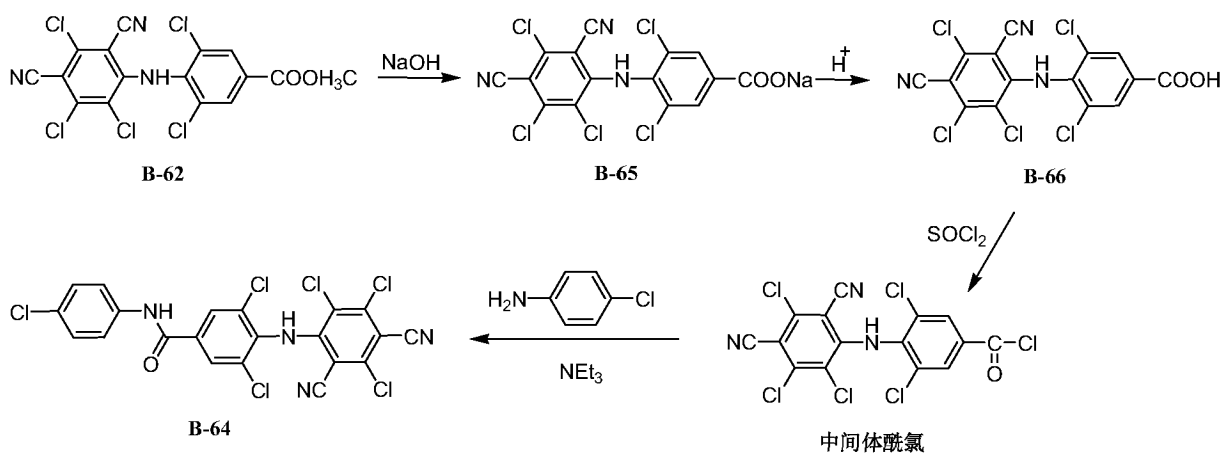


[0225] 向 10.33g (0.039mol) 4-氨基-3,5-二氯苯甲酸甲酯 (制备方法参照 W02010060379, CN101337940) 的 60ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中, 加入氢氧化钠 3.12g (0.078mol), 搅拌下缓缓加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 10.37g (0.039mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 5) 纯化得产品 13.65g, 即化合物 B-62。浅黄色固体, 熔点 229-231°C。

[0226] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) : 3.96 (s, 3H, CH_3), 6.92 (s, 1H, NH), 8.11 (s, 2H, Ph-2, 6-2H)。

[0227] 实施例 8 : 化合物 B-64 的制备

[0228]



[0229] (1) 化合物 B-66 的制备

[0230] 向 13.31g (0.031mol) 化合物 B-62 的 120ml 四氢呋喃和水的混合溶液 (体积比为 1 : 1) 中加入氢氧化钠 2.45g (0.061mol), 置于 50°C 的油浴中搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相弃去, 水相用稀盐酸调节 pH 值为 5-6, 有浅黄色固体析出, 过滤, 滤饼即为化合物 B-66, 干燥, 备用。

[0231] (2) 中间体酰氯的制备

[0232] 向 5.54g (12.72mmol) 的化合物 B-66 的 100ml 石油醚溶液中加入 2 滴 DMF, 然后加入氯化亚砷 2.27g (19.08mmol), 置于 85°C 的油浴中回流反应 2h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液减压脱溶, 所得产品为中间体酰氯。

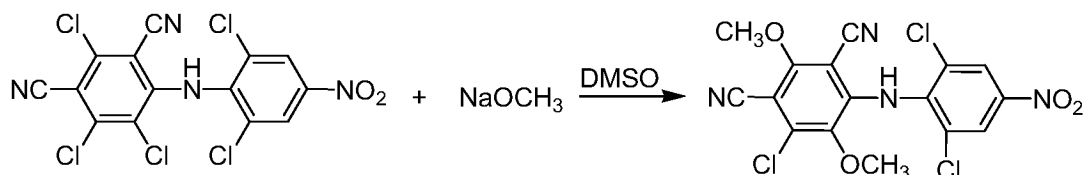
[0233] (3) 化合物 B-64 的制备

[0234] 将 0.40g (0.91mmol) 中间体酰氯滴加入对氯苯胺 0.12g (0.909mmol) 和三乙胺 0.23g (2.27mmol) 的干燥四氢呋喃 (50ml) 溶液中, 置于 45°C 油浴中反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 3) 纯化得化合物 B-64, 白色固体 0.23g, 熔点 275-276°C。

[0235] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO) δ (ppm) : 7.31-7.35 (m, 2H, 4-Cl-Ph-2, 6-2H), 7.81 (d, 2H, 4-Cl-Ph-3, 5-2H, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.13 (dd, 2H, Ph-2, 6-2H, $^3J = 15.7\text{Hz}$, $^4J = 1.2\text{Hz}$), 10.50 (d, 1H, CONH, $J = 12.9\text{Hz}$)。

[0236] 实施例 9 : 化合物 B-75 的制备

[0237]

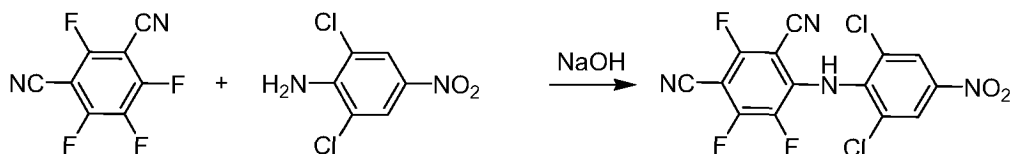


[0238] 向 0.55g (0.0013mol) 化合物 B-54 的 20ml DMSO 溶液中加入 0.14g (0.0025mol) 甲醇钠, 置于 95°C 的油浴中反应 8h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 4) 纯化得产品 0.16g, 即化合物 B-75。浅黄色固体, 熔点 151-153°C。

[0239] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) : 4.23 (t, 6H, OCH_3 , $J = 6.6\text{Hz}$), 6.78 (br, 1H, NH), 8.31 (d, 2H, Ph-3, 5-2H, $J = 3.9\text{Hz}$)。

[0240] 实施例 10 : 化合物 B-115 的制备

[0241]



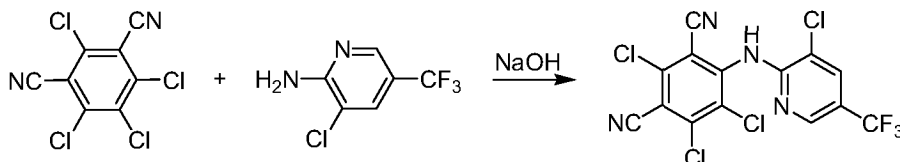
[0242] 向 8.07g (0.039mol) 2,6-二氯-4-硝基苯胺的 60ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中, 加入氢氧化钠 3.12g (0.078mol), 搅拌下缓缓加入 2,4,5,6-四氟-1,3-苯二甲腈 7.80g (0.039mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水

中,乙酸乙酯萃取,有机相依次经水洗,饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1 : 5)纯化得产品 8.08g,即化合物 B-115。浅黄色固体,熔点 164-166℃。

[0243] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) :6.88(br, 1H, NH), 8.53(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0244] 实施例 11 :化合物 B-125 的制备

[0245]

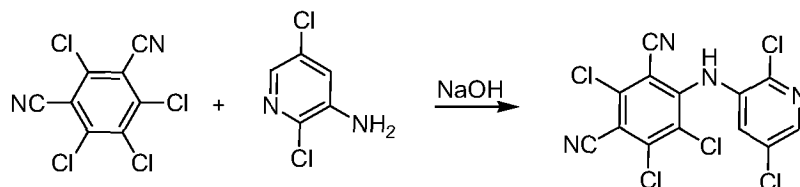


[0246] 向 0.71g (0.0036mol) 3-氯-2-氨基-5-三氟甲基吡啶的 40ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中,加入氢氧化钠 0.30g (0.0076mol),搅拌下加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 1.01g (0.0038mol),加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后,将反应液倒入水中,乙酸乙酯萃取,有机相合并,水洗,饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1 : 4)纯化得产品 1.15g,即化合物 B-125。浅黄色固体,熔点 196-198℃。

[0247] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) :7.86(d, 1H, pyridine-4-H, $J = 1.8\text{Hz}$), 9.36(s, 1H, pyridine-6-H), 10.42(s, 1H, NH)。

[0248] 实施例 12 :化合物 B-133 的制备

[0249]

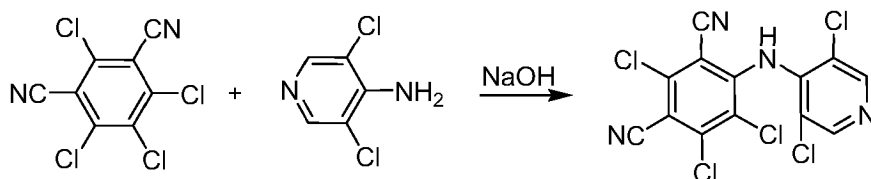


[0250] 向 1.17g (0.0072mol) 2,5-二氯-3-氨基吡啶的 40ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中,加入氢氧化钠 0.60g (0.0152mol),搅拌下加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 2.02g (0.0076mol),加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后,将反应液倒入水中,乙酸乙酯萃取,有机相合并,水洗,饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1 : 4)纯化得产品 1.32g,即化合物 B-133。白色固体,熔点 236-238℃。

[0251] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO) δ (ppm) :6.97(s, 1H, NH), 7.44(d, 1H, pyridine-4-H, $J = 2.1\text{Hz}$), 8.30(d, 1H, pyridine-6-H, $J = 2.1\text{Hz}$)。

[0252] 实施例 13 :化合物 B-139 的制备

[0253]



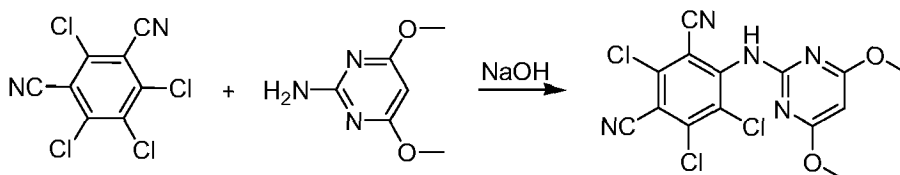
[0254] 向 1.17g (0.0072mol) 3,5-二氯-4-氨基吡啶的 40ml N,N-二甲基甲酰胺溶

液中,加入氢氧化钠 0.60g(0.0152mol),搅拌下加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 2.02g(0.0076mol),加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后,将反应液倒入水中,乙酸乙酯萃取,有机相合并,水洗,饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1:4)纯化得产品 1.49g,即化合物 B-139。黄色固体,熔点 236-238℃。

[0255] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO) δ (ppm): 8.32(s, 2H, pyridine-2,6-2H), 7.25(br, 1H, NH)。

[0256] 实施例 14: 化合物 B-143 的制备

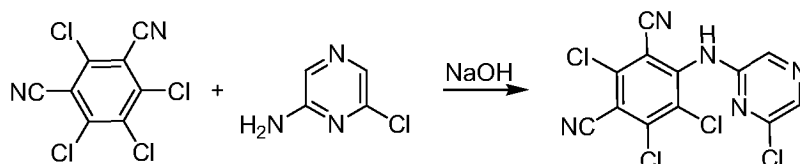
[0257]



[0258] 向 1.00g(0.0064mol) 2-氨基-4,6-二甲氧基嘧啶的 40ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中,加入氢氧化钠 0.51g(0.0128mol),搅拌下加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 1.79g(0.0067mol),加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后,将反应液倒入水中,乙酸乙酯萃取,有机相合并,水洗,饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1:4)纯化得产品 1.23g,即化合物 B-143。浅黄色固体,熔点 197-199℃。 $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm): 3.90(s, 6H, OCH_3), 5.77(s, 1H, pyrimidine-5-H), 7.36(s, 1H, NH)。

[0259] 实施例 15: 化合物 B-146 的制备

[0260]

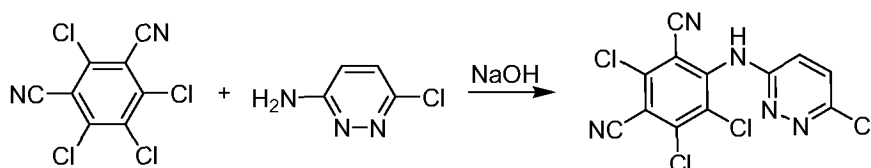


[0261] 向 0.93g(0.0072mol) 6-氯-2-氨基嘧啶的 40ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中,加入氢氧化钠 0.60g(0.0152mol),搅拌下加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 2.02g(0.0076mol),加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后,将反应液倒入水中,乙酸乙酯萃取,有机相合并,水洗,饱和盐水洗,干燥,过滤,脱溶,残余物柱层析(洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚(沸程 60-90℃),体积比为 1:4)纯化得产品 0.98g,即化合物 B-146。黄色固体,熔点 254-256℃。

[0262] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO) δ (ppm): 6.88(s, 1H, Py-4-1H), 7.20(br, 1H, NH), 7.88(s, 1H, Py-4-1H)。

[0263] 实施例 16: 化合物 B-149 的制备

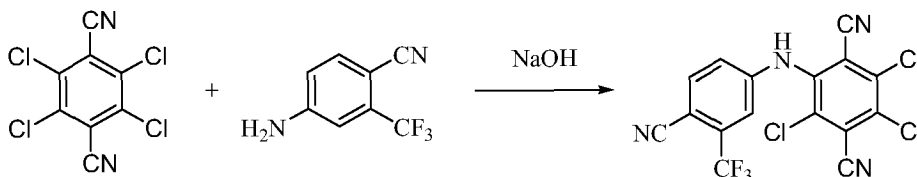
[0264]



[0265] 向 1.03g (0.008mol) 6-氯-3-氨基吡嗪的 40ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中, 加入氢氧化钠 0.67g (0.0168mol), 搅拌下加入 2,4,5,6-四氯-1,3-苯二甲腈 2.23g (0.0084mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相合并, 水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 4) 纯化得产品 1.03g, 即化合物 B-149。黄色固体, 熔点 202-204°C。¹H-NMR (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO) δ (ppm) : 6.86 (s, 1H, Py-4-1H), 7.17 (br, 1H, NH), 7.86 (s, 1H, Py-4-1H)。

[0266] 实施例 17 : 化合物 C-38 的制备

[0267]

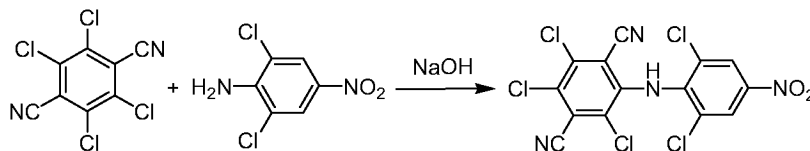


[0268] 向 0.7g (0.0037mol) 3-三氟甲基-4-氰基苯胺的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入氢氧化钠 0.30g (0.0075mol), 搅拌下缓缓加入 2,3,5,6-四氯-1,4-苯二甲腈 1g (0.0037mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 析出固体, 减压抽滤, 得到产品 1.3g, 即化合物 C-38。黄色固体, 熔点 176-178°C。

[0269] ¹H-NMR (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl₃), δ (ppm) : 6.86 (dd, 1H, Ph-6-1H), 7.16 (d, 1H, Ph-2-1H), 7.73 (d, 1H, Ph-5-1H)。

[0270] 实施例 18 : 化合物 C-40 的制备

[0271]

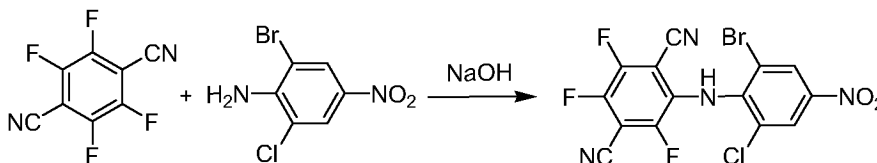


[0272] 向 1.64g (0.0075mol) 2,6-二氯-4-硝基苯胺的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入氢氧化钠 0.60g (0.015mol), 搅拌下缓缓加入 2,3,5,6-四氯-1,4-苯二甲腈 2g (0.0075mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 4) 纯化得产品 3.1g, 即化合物 C-40。黄色固体, 熔点 156-158°C。

[0273] ¹H-NMR (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl₃), δ (ppm) : 6.63 (s, 1H, NH), 8.31 (s, 2H, Ph-3,5-2H)。

[0274] 实施例 19 : 化合物 C-99 的制备

[0275]



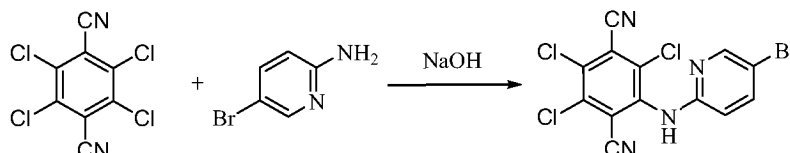
[0276] 向 1.88g (0.0075mol) 2-溴-6-氯-4-硝基苯胺的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺

溶液中加入氢氧化钠 0.60g (0.015mol), 搅拌下缓缓加入 2,3,5,6-四氯-1,4-苯二甲腈 1.50g (0.0075mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 4) 纯化得产品 2.60g, 即化合物 C-99。黄色固体。

[0277] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3), 6.38 (br, 1H, NH), 8.24 (d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H, Ph-5-H), 8.47 (d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H, Ph-3-H)。

[0278] 实施例 20 : 化合物 C-109 的制备

[0279]

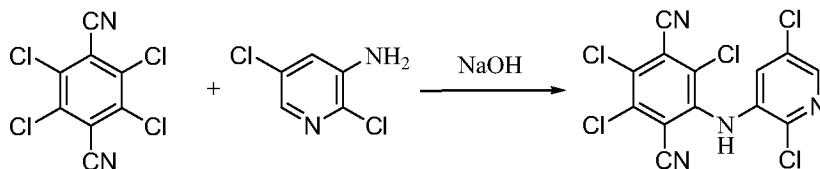


[0280] 向 1.3g (0.0075mol) 2-氨基-5-溴吡啶的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入氢氧化钠 0.60g (0.015mol), 搅拌下缓缓加入 2,3,5,6-四氯-1,4-苯二甲腈 2g (0.0075mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 3) 纯化得产品 2.5g, 即化合物 C-109。黄色固体, 熔点 154-156°C。

[0281] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl_3), δ (ppm) : 9.78 (s, 1H, NH), 6.62 (d, 1H, Py-3-1H), 7.73 (dd, 1H, Py-4-1H), 8.27 (d, 1H, Py-6-1H)。

[0282] 实施例 21 : 化合物 C-118 的制备

[0283]

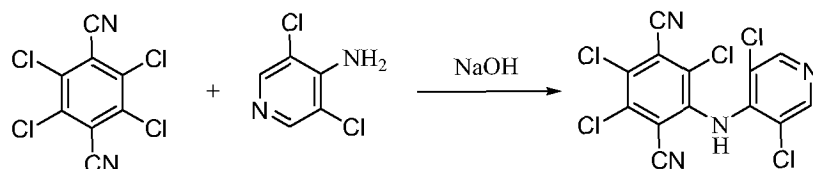


[0284] 向 1.22g (0.0075mol) 2,5-二氯-3-氨基吡啶的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入氢氧化钠 0.60g (0.015mol), 搅拌下缓缓加入 2,3,5,6-四氯-1,4-苯二甲腈 2g (0.0075mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90°C), 体积比为 1 : 3) 纯化得产品 2.21g, 即化合物 C-118。黄色固体, 熔点 202-204°C。

[0285] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO), δ (ppm) : 7.36 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H, Py-4-1H), 7.97 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H, Py-5-1H), 8.89 (br, 1H, NH)。

[0286] 实施例 22 : 化合物 C-124 的制备

[0287]



[0288] 向 1.22g (0.0075mol) 3,5-二氯-4-氨基吡啶的 40ml 的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入氢氧化钠 0.60g (0.015mol), 搅拌下缓缓加入 2,3,5,6-四氯-1,4-苯二甲腈 2g (0.0075mol), 加完后继续室温搅拌反应 5h, TLC 监测反应完毕后, 将反应液倒入水中, 乙酸乙酯萃取, 有机相依次经水洗, 饱和盐水洗, 干燥, 过滤, 脱溶, 残余物柱层析 (洗脱剂为乙酸乙酯与石油醚 (沸程 60-90℃), 体积比为 1 : 3) 纯化得产品 2.16g, 即化合物 C-124。黄色固体, 熔点 202-204℃。

[0289] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO), δ (ppm) : 7.28 (br, 1H, NH), 8.30 (s, 2H, Py-2,6-2H)。

[0290] 本发明的其他化合物可以参照以上实例制备。

[0291] 部分化合物的物性数据及核磁数据 ($^1\text{H-NMR}$, 300MHz, 内标 TMS, ppm) 如下:

[0292] 化合物 A-1 : 熔点 170-172℃。 δ (CDCl_3) : 2.32 (s, 3H, Ph-2- CH_3), 6.43 (br, 1H, NH), 6.73-6.75 (m, 1H, Ph-6-1H), 7.15-7.17 (m, 1H, Ph-5-1H), 7.19-7.22 (m, 2H, Ph-3,4-2H)。

[0293] 化合物 A-2 : 熔点 166-168℃。 δ (CDCl_3) : 6.65 (s, 1H, NH), 6.71 (d, 1H, Ph-6-1H), 7.10-7.15 (m, 1H, Ph-4-1H), 7.20-7.25 (m, 1H, Ph-5-1H), 7.46 (d, 1H, Ph-3-1H)。

[0294] 化合物 A-3 : 熔点 240-242℃ δ (CDCl_3) : 6.71 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.12 (t, 1H, Ph-5-1H), 7.54 (t, 1H, Ph-4-1H), 8.29 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-3-1H), 9.43 (br, 1H, NH)。

[0295] 化合物 A-4 : 熔点 168-170℃。 δ (CDCl_3) : 2.87 (s, 3H, NCH_3), 6.48 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.05 (t, 1H, Ph-4-1H), 7.37 (t, 1H, Ph-5-1H), 7.57 (d, J = 7.5Hz, 1H, Ph-3-1H), 10.36 (br, 1H, NH)。

[0296] 化合物 A-5 : 熔点 138-140℃。 δ (CDCl_3) : 2.34 (s, 3H, Ph-3- CH_3), 6.55 (br, 1H, NH), 6.66-6.70 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 6.94-6.96 (m, 1H, Ph-4-1H), 7.17-7.22 (m, 1H, Ph-3-1H)。

[0297] 化合物 A-6 : 熔点 230-232℃。 δ (DMSO) : 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.49 (t, 1H, Ph-5-1H), 7.70-7.78 (m, 2H, Ph-2,4-2H), 9.49 (br, 1H, NH)。

[0298] 化合物 A-7 : 熔点 158-160℃。 δ (CDCl_3) : 2.32 (s, 3H, Ph-4- CH_3), 6.41 (br, 1H, NH), 6.82 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 7.32 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-2,6-2H)。

[0299] 化合物 A-8 : 熔点 148-150℃。 δ (DMSO) : 1.32 (9H, t-Bu), 6.66 (br, 1H, NH), 6.85 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 7.35 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-2,6-2H)。

[0300] 化合物 A-9 : 熔点 168-170℃。 δ (CDCl_3) : 3.82 (s, 3H, OCH_3), 6.40 (br, 1H, NH), 6.87 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 6.92 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-2,6-2H)。

[0301] 化合物 A-10 : 熔点 176-178℃。 δ (CDCl_3) : 6.67 (s, 1H, NH), 6.93 (d, 2H, Ph-2,6-2H), 7.21 (d, 2H, Ph-3,5-2H)。

[0302] 化合物 A-11 : 熔点 198-200℃。 δ (DMSO) : 3.81 (3H, OCH_3), 6.84 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7.81 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 9.40 (br, 1H, NH)。

[0303] 化合物 A-12 : 熔点 248-250℃。 δ (CDCl_3) : 6.64 (s, 1H, NH), 6.86 (d, 2H, Ph-2,6-2H), 7.63 (d, 2H, Ph-3,5-2H)。

- [0304] 化合物 A-13 :熔点 232-233℃。 δ (CDCl₃) :6.56 (br, 1H, NH), 6.86 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-2, 6-2H), 7.56 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0305] 化合物 A-14 :熔点 210-212℃。 δ (CDCl₃) :6.58 (br, 1H, NH), 6.65 (t, 1H, Ph-6-1H), 8.05-8.16 (m, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0306] 化合物 A-15 :熔点 68-70℃。 δ (CDCl₃) :6.52 (d, 1H, Ph-6-1H), 6.88 (br, 1H, NH), 8.07 (d, 1H, Ph-5-1H), 8.40 (s, 1H, Ph-3-1H)。
- [0307] 化合物 A-16 :熔点 210-212℃。 δ (CDCl₃) :6.67 (br, 1H, NH), 7.37 (d, 1H, Ph-6-1H), 7.65 (d, 1H, Ph-3-1H), 7.94 (s, 1H, Ph-4-1H)。
- [0308] 化合物 A-17 :熔点 156-158℃。 δ (CDCl₃) :6.61 (d, 1H, Ph-6-1H, J = 8.4), 6.72 (br, 1H, NH), 7.46 (d, 1H, Ph-5-1H), 7.73 (s, 1H, Ph-3-1H)。
- [0309] 化合物 A-19 :熔点 156-158℃。 δ (CDCl₃) :6.69 (s, 1H, NH), 6.82 (d, 1H, Ph-6-H), 7.37 (dd, 1H, Ph-5-H), 7.60 (d, 1H, Ph-3-H)。
- [0310] 化合物 A-20 :熔点 196-197℃。 δ (CDCl₃) :2.46 (s, 3H, CH₃), 6.30 (br, 1H, NH), 6.83 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-6-1H), 8.08 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-5-1H), 8.19 (s, 1H, Ph-3-1H)。
- [0311] 化合物 A-21 :熔点 124-126℃。 δ (CDCl₃) :1.89 (s, 3H, CH₃), 3.90 (s, 3H, OCH₃), 7.29 (t, 1H, Ph-4-1H,), 7.36 (d, 1H, Ph-5-1H), 7.87 (d, 1H, Ph-3-1H), 8.89 (s, 1H, NH)。
- [0312] 化合物 A-23 :熔点 172-174℃。 δ (CDCl₃) :6.47 (d, 1H, Ph-6-1H, J = 9.0), 7.48 (dd, 1H, Ph-5-1H), 8.40 (d, 1H, Ph-3-1H), 9.36 (s, 1H, NH)。
- [0313] 化合物 A-24 :熔点 170-172℃。 δ (CDCl₃) :2.32 (s, 3H, Ph-3-CH₃), 6.47 (br, 1H, NH), 7.27-7.38 (m, 3H, Ph-3, 4, 5-3H)。
- [0314] 化合物 A-25 :熔点 187-188℃。 δ (CDCl₃) :2.29 (s, 3H, CH₃), 6.34 (br, 1H, NH), 6.67 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.11 (dd, J = 8.4Hz, J = 2.7Hz, 1H, Ph-5-1H), 7.27 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-3-1H)。
- [0315] 化合物 A-26 :熔点 250-252℃。 δ (CDCl₃) :1.27 (d, J = 6.9Hz, 12H, CH₃), 2.99 (m, 2H, CH), 5.85 (br, 1H, NH), 6.97 (d, J = 7.2Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.09 (d, J = 7.2Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0316] 化合物 A-27 :熔点 152-154℃。 δ (CDCl₃) :6.89 (dd, 1H, Ph-6-1H), 7.22 (d, 1H, Ph-2-1H, J = 1.8), 7.74 (d, 1H, Ph-5-1H, J = 8.1)。
- [0317] 化合物 A-28 :熔点 224-226℃。 δ (CDCl₃) :4.07 (s, 3H, O-CH₃), 6.66 (d, 1H, Ph-6-1H), 6.91 (br, 1H, NH), 7.82-7.89 (m, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0318] 化合物 A-29 :熔点 182-184℃。 δ (CDCl₃) :6.57 (br, 1H, NH), 6.63 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-6-H), 7.20 (dd, J = 8.7Hz, J = 2.4Hz, 1H, Ph-5-H,), 7.48 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-3-H)。
- [0319] 化合物 A-30 :熔点 176-178℃。 δ (CDCl₃) :6.59 (br, 1H, NH), 7.24 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.44 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0320] 化合物 A-31 :熔点 193-195℃。 δ (CDCl₃) :6.35 (br, 1H, NH), 7.01 (m, 2H, Ph-3, 5-2H), 7.22 (m, 1H, Ph-4-1H)。
- [0321] 化合物 A-32 :熔点 198-200℃。 δ (CDCl₃) :6.56 (br, 1H, NH), 6.60 (d, J = 1.8Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.07 (dd, J = 8.4Hz, J = 1.8Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.38 (d, J = 8.4Hz, 1H,

Ph-3-1H)。

[0322] 化合物 A-33 : 熔点 211-213℃。δ (CDCl₃) : 6.55 (br, 1H, NH), 6.73 (dd, J = 8.7Hz, J = 2.4Hz, 1H, Ph-4-1H), 6.99 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.40 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-3-1H)。

[0323] 化合物 A-34 : 熔点 232-234℃。δ (DMSO) : 6.80 (d, J = 1.5Hz, 2H, Ph-2, 6-2H), 6.97 (s, 1H, Ph-4-1H), 9.25 (br, 1H, NH)。

[0324] 化合物 A-35 : 熔点 147-149℃。δ (CDCl₃) : 6.65 (br, 1H, NH), 6.53 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.11 (t, 1H, Ph-5-1H), 7.27 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-4-1H)。

[0325] 化合物 A-36 : 熔点 195-197℃。δ (DMCO) : 6.92 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.44 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-5-1H), 7.69 (s, 1H, Ph-3-1H), 7.93 (br, 1H, NH)。

[0326] 化合物 A-37 : 熔点 198-200℃。δ (DMCO) : 3.90 (s, 3H, OCH₃), 6.95 (dd, J = 8.4Hz, J = 2.1Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.03 (d, J = 2.1Hz, 1H, Ph-2-1H), 7.85 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-5-1H), 8.75 (br, 1H, NH)。

[0327] 化合物 A-38 : 熔点 178-180℃。δ (CDCl₃) : 2.24 (s, 6H, Ph-3, 4-2CH₃), 6.40 (br, 1H, NH), 6.69 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-6-1H), 6.87 (s, 1H, Ph-2-1H), 7.08 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-5-1H)。

[0328] 化合物 A-39 : 熔点 224-226℃。δ (DMCO) : 7.20 (dd, J = 8.7Hz, J = 2.1Hz, 1H, Ph-6-H), 7.45 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-5-H), 7.57 (d, J = 2.1Hz, 1H, Ph-2-H), 8.62 (br, 1H, NH)。

[0329] 化合物 A-40 : 熔点 113-115℃。δ (CDCl₃) : 2.20 (s, 6H, Ph-2, 6-2CH₃), 2.31 (s, 3H, Ph-4-CH₃), 6.39 (br, 1H, NH), 6.76 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0330] 化合物 A-41 : 熔点 200-202℃。δ (DMSO) : 6.82-6.90 (m, 1H, Ph-6-1H), 7.12-7.22 (m, 1H, Ph-5-1H), 9.08 (s, 1H, NH)。

[0331] 化合物 A-42 : 黄色油状物。δ (DMCO) : 8.65 (s, 1H, Ph-5-H), 8.75 (s, 1H, Ph-3-H), 8.90 (br, 1H, NH)。

[0332] 化合物 A-43 : 熔点 196-198℃。δ (CDCl₃) : 6.43 (br, 1H, NH), 7.96 (d, J = 8.1Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0333] 化合物 A-45 : 熔点 146-148℃。δ (CDCl₃) : 6.63 (s, 1H, NH), 8.48 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0334] 化合物 A-46 : 熔点 186-188℃。δ (CDCl₃) : 6.62 (br, 1H, NH), 8.31 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-5-H), 8.45 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-3-H)。

[0335] 化合物 A-49 : 熔点 202-204℃。δ (CDCl₃) : 6.49 (br, 1H, NH), 7.69 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0336] 化合物 A-50 : 熔点 270-272℃。δ (DMSO) : 2.07 (s, 3H, Ph-2-CH₃), 3.84 (s, 3H, NHCH₃), 7.80 (br, 1H, NH), 8.64 (s, 1H, Ph-3-1H), 9.60 (s, 1H, Ph-5-1H)。

[0337] 化合物 A-51 : 黄色油状物。δ (CDCl₃) : 2.90 (s, 3H, NCH₃), 7.80 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-3-1H), 7.87 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-5-1H), 10.96 (br, 1H, NH)。

[0338] 化合物 A-52 : 黄色油状物。δ (CDCl₃) : 3.96 (s, 3H, OCH₃), 7.53 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-3-1H), 7.95 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-5-1H), 9.22 (br, 1H, NH)。

[0339] 化合物 A-54 : 熔点 204-206℃。δ (CDCl₃) : 6.59 (s, 1H, NH), 7.33 (s, 2H, Ph-3,

5-2H)。

[0340] 化合物 A-55 :熔点 206-208℃。 δ (CDCl_3) :6.20 (br, 1H, NH), 6.68 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7.30 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-5-1H)。

[0341] 化合物 A-56 :熔点 198-200℃。 δ (CDCl_3) :6.51 (br, 1H, NH), 6.70 (s, 1H, Ph-6-1H), 7.96 (s, 1H, Ph-5-1H)。

[0342] 化合物 A-57 :熔点 208-210℃。 δ (CDCl_3) :6.50 (br, 1H, NH), 7.55 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0343] 化合物 A-59 :熔点 246-248℃。 δ (DMCO) :6.92 (s, 1H, NH), 7.84 (s, 1H, Py-3-1H)。

[0344] 化合物 A-60 :熔点 192-194℃。 δ (CDCl_3) :6.54 (br, 1H, NH), 7.52 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0345] 化合物 A-61 :熔点 228-230℃。 δ (DMCO) :2.40 (s, 3H, Ph-2- CH_3), 8.64 (s, 1H, Ph-5-1H), 8.93 (br, 1H, NH)。

[0346] 化合物 A-79 :熔点 164-166℃。 $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标 TMS, 溶剂 DMSO), δ (ppm) : 6.73 (s, 1H, NH), 6.96 (d, 1H, Py-3-1H), 7.84 (dd, 1H, Py-4-1H), 8.27 (d, 1H, Py-6-1H)。

[0347] 化合物 A-80 :熔点 124-126℃。 δ (CDCl_3) :2.40 (s, 3H, CH_3), 3.66 (br, 1H, NH), 6.54 (s, 1H, Py-3-1H), 6.90 (d, 1H, Py-5-1H), 8.03 (d, 1H, Py-6-1H)。

[0348] 化合物 A-81 :熔点 182-184℃。 δ (CDCl_3) :2.36 (s, 3H, Py-5- CH_3), 6.63 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H, Py-3-H), 6.90 (br, 1H, NH), 7.44 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H, Py-4-H), 8.05 (s, 1H, Py-6-H)。

[0349] 化合物 A-85 :熔点 108-110℃。 δ (DMSO) :8.01 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H, Py-4-1H), 8.38 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H, Py-5-1H), 10.18 (br, 1H, NH)。

[0350] 化合物 A-90 :熔点 196-198℃。 δ (CDCl_3) :3.80 (s, 6H, 20 CH_3), 5.64 (s, 1H, Py-5-1H), 6.94 (br, 1H, NH)。

[0351] 化合物 B-1 :熔点 212-214℃。 δ (CDCl_3) :2.29 (s, 3H, CH_3), 7.00 (s, 1H, NH), 7.15 (d, H, Ph-6-H, $J = 7.5\text{Hz}$), 7.28-7.34 (m, 3H, Ph-3, 4, 5-3H)。

[0352] 化合物 B-2 :熔点 208-210℃。 δ (CDCl_3) :7.03 (s, 1H, NH), 7.27-7.38 (m, 3H, Ph-3, 5, 6-3H), 7.49-7.55 (m, 1H, Ph-4-H)。

[0353] 化合物 B-3 :熔点 258-260℃。 δ (CDCl_3) :7.12 (s, 1H, NH), 7.24 (d, 1H, Ph-6-H, $J = 7.5\text{Hz}$), 7.47 (t, 1H, Ph-4-H, $J = 7.2\text{Hz}$), 7.68 (t, 1H, Ph-5-H, $J = 7.5\text{Hz}$), 7.78 (d, 1H, Ph-3-H, $J = 7.8\text{Hz}$)。

[0354] 化合物 B-4 :熔点 180-182℃。 δ (CDCl_3) :2.89 (s, 3H, NCH_3), 6.49 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7.04 (t, 1H, Ph-4-1H), 7.35 (t, 1H, Ph-5-1H), 7.56 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H, Ph-3-1H), 10.36 (br, 1H, NH)。

[0355] 化合物 B-5 :熔点 248-250℃。 δ (CDCl_3) :2.40 (s, 3H, Ph-3- CH_3), 7.02 (br, 1H, NH), 7.12-7.36 (m, 4H, Ph-2, 3, 4, 6-4H)。

[0356] 化合物 B-6 :熔点 228-230℃。 δ (CDCl_3) :7.04 (br, 1H, NH), 7.09 (d, $J = 7.5\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7.20 (s, 1H, Ph-2-1H), 7.33-7.39 (m, 2H, Ph-4, 5-2H)。

[0357] 化合物 B-7 :熔点 236-238℃。 δ (CDCl_3) :7.12 (s, 1H, NH), 7.28-7.40 (m, 1H, Ph-6-H), 7.41-7.52 (m, 2H, Ph-2, 4-2H), 7.54-7.62 (m, 1H, Ph-5-H)。

- [0358] 化合物 B-8 : 熔点 250-252 °C。 δ (DMSO) : 7.54-7.64 (m, 2H, Ph-5, 6-2H), 7.94-8.00 (m, 2H, Ph-2, 4-2H), 9.86 (br, 1H, NH)。
- [0359] 化合物 B-9 : 熔点 144-146 °C。 δ (DMSO) : 1.30 (9H, t-Bu), 6.28 (br, 1H, NH), 6.64 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H, Ph-3, 5-2H), 7.18 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H, Ph-2, 6-2H)。
- [0360] 化合物 B-10 : 熔点 259-261 °C。 δ (CDCl₃) : 7.00 (s, 1H, NH), 7.17 (d, 2H, Ph-2, 6-2H, $J = 8.7$ Hz), 7.42 (d, 2H, Ph-3, 5-2H, $J = 9.0$ Hz)。
- [0361] 化合物 B-11 : 熔点 186-187 °C。 δ (CDCl₃) : 6.06 (br, 1H, NH), 6.51 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H, Ph-2, 6-2H), 7.52 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0362] 化合物 B-12 : 熔点 204-206 °C。 δ (CDCl₃) : 7.09 (s, 1H, NH), 7.22-7.32 (m, 4H, Ph-2, 3, 5, 6-4H)。
- [0363] 化合物 B-13 : 熔点 246-248 °C。 δ (CDCl₃) : 2.29 (s, 3H, COOCH₃), 7.08 (s, 1H, NH), 7.17 (d, 2H, Ph-3, 5-2H, $J = 8.7$ Hz), 8.10 (d, 2H, Ph-2, 6-2H, $J = 8.7$ Hz)。
- [0364] 化合物 B-14 : 熔点 206-208 °C。 δ (CDCl₃) : 6.88 (s, 1H, NH), 6.99 (t, 2H, Ph-5, 6-2H, $J = 8.1$ Hz), 7.32 (d, 1H, Ph-3-H, $J = 2.4$ Hz)。
- [0365] 化合物 B-16 : 熔点 218-220 °C。 δ (CDCl₃) : 7.03 (s, 1H, NH), 7.13 (dd, 1H, Ph-6-H, $^3J = 8.1$ Hz, $^4J = 0.9$ Hz), 7.28 (t, 1H, Ph-5-H, $J = 8.1$ Hz), 7.47 (dd, 1H, Ph-4-H, $^3J = 8.1$ Hz, $^4J = 0.9$ Hz)。
- [0366] 化合物 B-17 : 熔点 235-237 °C。 δ (CDCl₃) : 6.61 (s, 1H, NH), 7.36 (t, 1H, Ph-4-H, $J = 7.2$ Hz), 7.45 (d, 2H, Ph-3, 5-2H, $J = 7.2$ Hz)。
- [0367] 化合物 B-18 : 熔点 209-212 °C。 δ (CDCl₃) : 6.95 (s, 1H, NH), 7.20 (d, 1H, Ph-6-H, $J = 8.1$ Hz), 7.36 (dd, 1H, Ph-5-H, $^3J = 8.7$ Hz, $^4J = 2.7$ Hz), 7.54 (d, 1H, Ph-3-H, $J = 2.4$ Hz)。
- [0368] 化合物 B-19 : 熔点 238-242 °C。 δ (CDCl₃) : 6.95 (s, 1H, NH), 7.05 (d, 2H, Ph-2, 6-2H, $J = 1.8$ Hz), 7.32 (d, 1H, Ph-4-H, $J = 1.5$ Hz)。
- [0369] 化合物 B-20 : 熔点 203-205 °C。 δ (CDCl₃) : 6.96 (br, 1H, NH), 7.21 (s, 1H, Ph-6-1H), 7.30 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.45 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H, Ph-3-1H)。
- [0370] 化合物 B-21 : 熔点 230-232 °C。 δ (DMSO) : 7.13 (dd, $J = 8.4$ Hz, $J = 2.1$ Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.51 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H, Ph-3-1H), 9.62 (br, 1H, NH)。
- [0371] 化合物 B-22 : 熔点 200-202 °C。 δ (CDCl₃) : 2.27 (s, 3H, Ph-2-CH₃), 6.86 (s, 1H, NH), 7.07 (d, 1H, Ph-6-H, $J = 8.4$ Hz), 7.23 (dd, 1H, Ph-5-H, $^3J = 8.4$ Hz, $^4J = 2.1$ Hz), 7.33 (s, 1H, Ph-3-H)。
- [0372] 化合物 B-23 : 熔点 240-242 °C。 δ (CDCl₃) : 2.32 (s, 3H, Ph-CH₃), 6.93 (s, 1H, NH), 7.22-7.35 (m, 3H, Ph-3, 4, 5-H)。
- [0373] 化合物 B-24 : 熔点 204-205 °C。 δ (CDCl₃) : 2.36 (s, 3H, COOCH₃), 3.92 (s, 3H, Ph-3-CH₃), 6.85 (s, 1H, NH), 7.12 (d, 1H, Ph-5-1H, $J = 8.4$ Hz), 7.92 (d, 1H, Ph-6-1H, $J = 8.4$ Hz), 8.02 (s, 1H, Ph-2-1H)。
- [0374] 化合物 B-25 : 熔点 216-218 °C。 δ (CDCl₃) : 2.16 (s, 3H, Ph-2-CH₃), 3.89 (s, 3H, OCH₃), 7.39 (t, 4H, Ph-4-4H), 7.51 (d, $J = 7.8$, 2H, Ph-2, 6-2H), 7.93 (d, $J = 7.8$, 2H, Ph-2, 6-2H), 8.54 (br, 1H, NH)。

[0375] 化合物 B-26 : 熔点 198–200 °C。 δ (CDCl₃) : 2.23 (s, 3H, CH₃), 2.34 (s, 3H, CH₃), 6.95 (s, 1H, NH), 6.95 (s, 1H, Ph-6-H), 7.13–7.22 (m, 2H, Ph-3, 4-2H)。

[0376] 化合物 B-27 : 熔点 86–88 °C。 δ (CDCl₃) : 1.27 (d, J = 6.9 Hz, 12H, CH₃), 3.00 (m, 2H, CH), 5.85 (br, 1H, NH), 6.98 (d, J = 7.2 Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.10 (d, J = 7.2 Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0377] 化合物 B-28 : 熔点 166–168 °C。 δ (CDCl₃) : 7.00 (s, 1H, NH), 7.20 (d, 1H, Ph-6-H, J = 8.4 Hz), 7.57 (dd, 1H, Ph-5-H, ³J = 8.4 Hz, ⁴J = 1.5 Hz), 7.78 (s, 1H, Ph-3-H)。

[0378] 化合物 B-29 : 熔点 197–199 °C。 δ (CDCl₃) : 7.02 (s, 1H, NH), 7.45 (s, 1H, Ph-6-H), 7.55 (d, 1H, Ph-4-H, J = 8.4 Hz), 7.65 (d, 1H, Ph-3-H, J = 8.4 Hz)。

[0379] 化合物 B-30 : 熔点 209–212 °C。 6.93 (s, 1H, NH), 7.34 (t, 1H, Ph-3-H, J = 9.0 Hz), 7.52 (d, 1H, Ph-4-H, J = 7.2 Hz), 7.58–7.65 (m, 1H, Ph-3-H)。

[0380] 化合物 B-31 : 熔点 205–207 °C。 δ (CDCl₃) : 7.03 (br, 1H, NH), 7.45 (s, 1H, Ph-6-1H), 7.57 (d, J = 8.4 Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.66 (d, J = 8.4 Hz, 1H, Ph-3-1H)。

[0381] 化合物 B-32 : 熔点 180–182 °C。 δ (CDCl₃) : 6.94 (br, 1H, NH), 7.11 (d, J = 8.4 Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.47 (d, J = 8.4 Hz, 1H, Ph-5-1H), 7.68 (s, 1H, Ph-3-1H)。

[0382] 化合物 B-33 : 熔点 244–246 °C。 δ (DMCO) : 3.82 (s, 3H, OCH₃), 6.95 (dd, J = 8.4 Hz, J = 2.1 Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.03 (d, J = 2.1 Hz, 1H, Ph-2-1H), 7.37 (d, J = 8.4 Hz, 1H, Ph-5-1H), 8.75 (br, 1H, NH)。

[0383] 化合物 B-35 : 熔点 220–222 °C。 7.04 (d, 1H, Ph-6-H, J = 8.7 Hz), 7.07 (s, 1H, NH), 8.20 (dd, 1H, Ph-5-H, ³J = 9.0 Hz, ⁴J = 2.7 Hz), 8.42 (d, 1H, Ph-3-H, J = 2.7 Hz)。

[0384] 化合物 B-37 : 熔点 206–208 °C。 δ (CDCl₃) : 10.03 (br, 1H, NH), 6.89 (d, J = 9.0 Hz, 1H, Ph-6-1H), 8.41 (dd, J = 9.0 Hz, J = 2.7 Hz, 1H, Ph-5-1H), 9.21 (d, J = 2.7 Hz, 1H, Ph-3-1H)。

[0385] 化合物 B-38 : 熔点 236–238 °C。 δ (DMSO) : 7.02 (dd, 1H, Ph-6-H, ³J = 9.6 Hz, ⁴J = 2.7 Hz), 8.32 (dd, 1H, Ph-5-H, ³J = 9.3 Hz, ⁴J = 2.7 Hz), 8.63 (d, 1H, Ph-3-H, J = 2.7 Hz)。

[0386] 化合物 B-39 : 熔点 232–234 °C。 δ (CDCl₃) : 6.94 (d, 1H, Ph-6-H, J = 9.3 Hz), 7.58 (dd, 1H, Ph-5-H, ³J = 9.0 Hz, ⁴J = 2.7 Hz), 8.26 (d, 1H, Ph-3-H, J = 2.7 Hz), 9.36 (s, 1H, NH)。

[0387] 化合物 B-40 : 熔点 242–243 °C。 δ (CDCl₃) : 7.07 (s, 1H, NH), 7.25 (d, 1H, Ph-6-H, J = 2.1 Hz), 7.42 (d, 1H, Ph-2-H, J = 2.4 Hz), 7.83 (d, 1H, Ph-5-H, J = 8.4 Hz)。

[0388] 化合物 B-41 : 熔点 182–184 °C。 δ (CDCl₃) : 6.87 (s, 1H, NH), 7.05–7.09 (m, 2H, Ph-5, 6-2H)。

[0389] 化合物 B-43 : 熔点 198–200 °C。 δ (CDCl₃) : 6.98 (br, 1H, NH), 7.08 (d, J = 9.0 Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.46 (d, J = 9.0 Hz, 1H, Ph-5-1H)。

[0390] 化合物 B-44 : 熔点 199–201 °C。 δ (CDCl₃) : 2.17 (s, 6H, Ph-2, 6-2CH₃), 2.34 (s, 3H, Ph-4-CH₃), 6.81 (br, 1H, NH), 6.97 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0391] 化合物 B-45 : 熔点 253–255 °C。 δ (CDCl₃) : 6.88 (br, 1H, NH), 7.33 (s, 1H, Ph-6-1H), 7.96 (s, 1H, Ph-5-1H)。

[0392] 化合物 B-46 : 熔点 264–266 °C。 δ (DMCO) : 7.53 (s, 2H, Ph-2, 6-2H), 8.98 (br, 1H,

NH)。

[0393] 化合物 B-47 : 熔点 238-240 °C。 δ (CDCl₃) : 6.84 (br, 1H, NH), 7.63 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0394] 化合物 B-48 : 熔点 196-198 °C。 δ (CDCl₃) : 2.55 (s, 3H, CH₃), 6.99 (s, 1H, NH), 7.04 (d, 1H, Ph-6-H, J = 8.4 Hz), 7.36 (d, 1H, Ph-5-H, J = 8.4 Hz)。

[0395] 化合物 B-50 : 熔点 194-196 °C。 δ (CDCl₃) : 6.96 (s, 1H, NH), 7.67 (d, 1H, Ph-5-H, J = 2.1 Hz), 7.77 (d, 1H, Ph-3-H, J = 2.4 Hz)。

[0396] 化合物 B-51 : 熔点 259-261 °C。 δ (CDCl₃) : 6.91 (s, 1H, NH), 7.74 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0397] 化合物 B-52 : 熔点 201-203 °C。 δ (CDCl₃) : 6.91 (s, 1H, NH), 7.72 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0398] 化合物 B-53 : 熔点 197-199 °C。 6.86 (s, 1H, NH), 8.05 (dd, 1H, Ph-5-H, ³J = 9.9 Hz, ⁴J = 2.7 Hz), 8.28 (d, 1H, Ph-3-H, J = 2.4 Hz)。

[0399] 化合物 B-55 : 熔点 248-250 °C。 δ (CDCl₃) : 6.95 (s, 1H, NH), 8.37 (d, 1H, Ph-3-H, J = 2.7 Hz), 8.49 (d, 1H, Ph-5-H, J = 2.4 Hz)。

[0400] 化合物 B-57 : 熔点 247-249 °C。 δ (CDCl₃) : 6.96 (s, 1H, NH), 8.51 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0401] 化合物 B-58 : 熔点 232-234 °C。 δ (CDCl₃) : 2.43 (s, 3H, Ph-CH₃), 6.86 (s, 1H, NH), 8.14 (s, 1H, Ph-5-1H), 8.26 (s, 1H, Ph-3-1H)。

[0402] 化合物 B-59 : 熔点 228-230 °C。

[0403] 化合物 B-60 : 熔点 176-178 °C。 δ (CDCl₃) : 1.15-1.27 (m, 6H, CH₃), 2.49 (q, 4H, CH₂, J = 7.5 Hz), 6.98 (s, 1H, NH), 7.14 (d, 1H, Ph-5-H, J = 8.4 Hz), 7.47 (d, 1H, Ph-3-H, J = 8.4 Hz)。

[0404] 化合物 B-61 : 熔点 171-173 °C。 δ (CDCl₃) : 6.97 (br, 1H, NH), 7.56 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0405] 化合物 B-62a : 熔点 260-262 °C。 δ (CDCl₃) : 2.06 (s, 3H), 2.98 (d, 3H), 6.38 (m, 1H), 7.70 (s, 2H), 9.39 (s, 1H)。

[0406] 化合物 B-62b : 熔点 240-242 °C。 δ (CDCl₃) : 2.08 (s, 3H), 2.93 (d, 3H), 6.22 (m, 1H), 7.35 (t, 2H), 8.60 (s, 1H)。

[0407] 化合物 B-63 : 熔点 267-269 °C。 δ (CDCl₃) : 7.28-7.30 (m, 1H, NPh-4-H), 7.40 (t, 2H, NPh-3, 5-2H, J = 6.9 Hz), δ = 7.62 (d, 2H, NPh-2, 6-2H, J = 7.8 Hz), δ = 7.89-7.95 (m, 2H, NHCOPh-2, 6-2H)。

[0408] 化合物 B-67 : 熔点 108-110 °C。 δ (CDCl₃) : 8.88 (br, 1H, NH), 8.71 (s, 2H, Ph-5-1H)。

[0409] 化合物 B-68 : 熔点 156-158 °C。 δ (CDCl₃) : 2.51 (s, 3H, Ph-2-CH₃), 8.67 (s, 1H, Ph-5-1H), 8.86 (br, 1H, NH)。

[0410] 化合物 B-69 : 熔点 260-262 °C。

[0411] 化合物 B-70 : 黄色油状物。 δ (CDCl₃) : 1.13-1.21 (m, 6H, CH₃), 3.46 (q, 4H, CH₂, J = 7.2 Hz), 6.90 (s, 1H, NH), 7.13 (t, 2H, Ph-2, 6-2H, J = 7.5 Hz), 7.31 (d, 1H, Ph-4-H, J =

7. 5Hz), 7. 42(t, 2H, Ph-3, 5-2H, J = 7. 2Hz)。

[0412] 化合物 B-71 : 熔点 176-178 °C。 δ (CDCl₃) : 3. 26(d, 3H, NCH₃, J = 8. 7Hz), 3. 37(d, 3H, NCH₃, J = 8. 1Hz), 5. 04(br, 1H, Ph-NH-C), 5. 26(br, 1H, Ph-NH-C), 6. 35(s, 1H, Ph-NH-Ph), 7. 04(d, 2H, Ph-2, 6-2H, J = 8. 1Hz), 7. 14(t, 1H, Ph-4-H, J = 7. 2Hz), 7. 35(t, 2H, Ph-3, 5-2H, J = 7. 5Hz)。

[0413] 化合物 B-72 : 熔点 142-144 °C。 δ (CDCl₃) : 4. 14(s, 3H, OCH₃), 4. 17(t, 3H, OCH₃, J = 4. 2Hz), 6. 91(s, 1H, Ph-NH-Ph), 7. 18(d, 2H, Ph-2, 6-2H, J = 7. 8Hz), 7. 32(t, 1H, Ph-4-H, J = 7. 2Hz), 7. 42(t, 2H, Ph-3, 5-2H, J = 7. 5Hz)。

[0414] 化合物 B-73 : 熔点 127-129 °C。 δ (CDCl₃) : 3. 22(s, 6H, CH₃), 6. 85(s, 1H, NH), 8. 32(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0415] 化合物 B-74 : 熔点 198-200 °C。 δ (CDCl₃) : 4. 25(s, 3H, CH₃), 6. 87(s, 1H, NH), 8. 32(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0416] 化合物 B-76 : 熔点 118-120 °C。 δ (CDCl₃) : 2. 31(s, 3H, Ph-2-CH₃), 6. 65(br, 1H, NH), 7. 10-7. 33(m, 4H, Ph-2, 3, 4, 5-4H)。

[0417] 化合物 B-77 : 熔点 247-249 °C。 δ (CDCl₃) : 6. 32(s, 1H, NH), 7. 35(t, 1H, Ph-4-H, J = 7. 2Hz), 7. 44(d, 2H, Ph-3, 5-2H, J = 7. 2Hz)。

[0418] 化合物 B-78 : 熔点 152-154 °C。 δ (CDCl₃) : 2. 39(s, 3H, Ph-3-CH₃), 6. 85(br, 1H, NH), 7. 00-7. 02(m, 2H, Ph-2, 6-2H), 7. 17-7. 19(m, 1H, Ph-4-1H), 7. 29-7. 23(m, 1H, Ph-3-1H)。

[0419] 化合物 B-79 : 熔点 142-144 °C。 δ (CDCl₃) : 6. 86(br, 1H, NH), 7. 09(d, J = 7. 2Hz, 1H, Ph-6-1H), 7. 20(s, 1H, Ph-2-1H), 7. 31-7. 40(m, 2H, Ph-4, 5-2H)。

[0420] 化合物 B-80 : 熔点 166-168 °C。 δ (DMSO) : 7. 63-7. 68(m, 2H, Ph-5, 6-2H), 7. 98-8. 04(m, 2H, Ph-2, 4-2H), 10. 34(br, 1H, NH)。

[0421] 化合物 B-81 : 熔点 123-124 °C。 δ (CDCl₃) : 6. 38(br, 1H, NH), 7. 26(d, J = 2. 4Hz, 2H, Ph-2, 6-2H), 7. 27(d, J = 2. 4Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0422] 化合物 B-82 : 黄色油状物。 δ (DMSO) : 6. 06(br, 1H, NH), 6. 59(d, J = 9Hz, 2H, Ph-2, 6-2H), 7. 75(d, J = 9Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0423] 化合物 B-83 : 熔点 176-177 °C。 δ (CDCl₃) : 6. 80(br, 1H, NH), 7. 17(d, J = 6. 9Hz, 1H, Ph-6-1H), 7. 28(dd, J = 6. 9, J = 5. 4Hz, 1H, Ph-5-1H), 7. 48(d, J = 5. 4Hz, 1H, Ph-4-1H)。

[0424] 化合物 B-84 : 棕色液体。 δ (CDCl₃) : 6. 83(br, 1H, NH), 7. 17(s, 1H, Ph-6-1H), 7. 24(d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-4-1H), 7. 43(d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-3-1H)。

[0425] 化合物 B-85 : 熔点 178-180 °C。 δ (CDCl₃) : 6. 54(br, 1H, NH), 6. 73(t, 2H, Ph-2, 6-2H), 7. 07(d, J = 1. 5Hz, 1H, Ph-4-1H)。

[0426] 化合物 B-86 : 熔点 247-249 °C。 δ (CDCl₃) : 6. 32(s, 1H, NH), 7. 35(t, 1H, Ph-4-H, J = 7. 2Hz), 7. 44(d, 2H, Ph-3, 5-2H, J = 7. 2Hz)。

[0427] 化合物 B-88 : 黄色油状物。 δ (CDCl₃) : 6. 38(br, 1H, NH), 6. 64(d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-6-1H), 7. 45(d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-5-1H), 7. 66(s, 1H, Ph-3-1H)。

[0428] 化合物 B-89 : 黄色油状物。 δ (CDCl₃) : 2. 96(s, 3H, Ph-2-CH₃), 6. 36(br, 1H, NH),

6. 58(d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 6. 97-7. 10(m, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0429] 化合物 B-90 : 黄色油状物。 δ (CDCl_3) : 2. 19(s, 3H, Ph-3- CH_3), 6. 03(br, 1H, NH), 7. 92-7. 23(m, 3H, Ph-3, 4, 5-3H)。

[0430] 化合物 B-91 : 熔点 171-172 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 2. 46(s, 3H, CH_3), 6. 56(br, 1H, NH), 7. 20(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 8. 15(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-5-1H), 8. 22(s, 1H, Ph-3-1H)。

[0431] 化合物 B-92 : 熔点 122-124 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 82(br, 1H, NH), 7. 24(d, $J = 9.0\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H, $J = 8.4\text{Hz}$), 7. 59(d, $J = 9.0\text{Hz}$, 1H, Ph-5-1H), 7. 78(s, 1H, Ph-3-1H)。

[0432] 化合物 B-94 : 黄色油状物。 δ (CDCl_3) : 6. 98(br, 1H, NH), 7. 48(s, 1H, Ph-6-1H), 7. 56(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-4-1H), 7. 65(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-3-1H)。

[0433] 化合物 B-95 : 黄色油状物。 δ (CDCl_3) : 7. 03(br, 1H, NH), 7. 14-7. 18(m, 1H, Ph-6-1H), 8. 18-8. 21(m, 1H, Ph-5-1H), 8. 41(d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H, Ph-3-1H)。

[0434] 化合物 B-96 : 熔点 134-136 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 76(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7. 12(t, 1H, Ph-5-1H), 7. 58(t, 1H, Ph-4-1H), 8. 29(d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H, Ph-3-1H), 9. 43(br, 1H, NH)。

[0435] 化合物 B-97 : 熔点 82-84 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 92(d, $^3J = 9.0\text{Hz}$, 1H, Ph-6-H), 7. 55(dd, $^3J = 9.0\text{Hz}$, $^4J = 2.7\text{Hz}$, 1H, Ph-5-H), 8. 28(d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H, Ph-3-H), 9. 40(s, 1H, NH)。

[0436] 化合物 B-98 : 黄色油状物。 δ (CDCl_3) : 6. 70(br, 1H, NH), 7. 83(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7. 51(s, 1H, Ph-2-1H), 7. 58(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-5-1H)。

[0437] 化合物 B-99 : 黄色油状物。 δ (CDCl_3) : 3. 73(s, 3H, OCH_3), 6. 26(br, 1H, NH), 6. 48(dd, $J = 8.4\text{Hz}$, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 6. 60(d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H, Ph-2-1H), 7. 61(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-5-1H)。

[0438] 化合物 B-100 : 熔点 147-149 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 2. 17(s, 6H, Ph-2, 6-2 CH_3), 2. 33(s, 3H, Ph-4- CH_3), 6. 56(br, 1H, NH), 6. 96(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0439] 化合物 B-101 : 熔点 268-270 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (DMSO) : 9. 23(br, 1H, NH), 7. 14(d, $J = 5.4\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7. 22(m, 1H, Ph-5-1H)。

[0440] 化合物 B-102 : 熔点 156-158 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 72(br, 1H, NH), 7. 15(d, $J = 8.7\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7. 48(d, $J = 8.7\text{Hz}$, 1H, Ph-5-1H)。

[0441] 化合物 B-103 : 黄色油状物。 δ (CDCl_3) : 6. 53(br, 1H, NH), 7. 46(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0442] 化合物 B-104 : 熔点 138-140 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 70(br, 1H, NH), 6. 86(s, 1H, Ph-3, 5-1H), 7. 63(d, 1H, Ph-3, 5-1H)。

[0443] 化合物 B-105 : 熔点 75-77 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 70(m, 2H, Ph-2, 6-2H), 7. 10(br, 1H, NH)。

[0444] 化合物 B-106 : 熔点 178-180 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 60(br, 1H, NH), 7. 62(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0445] 化合物 B-109 : 熔点 164-166 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 79(br, 1H, NH), 8. 34(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0446] 化合物 B-111 : 熔点 128-130 $^{\circ}\text{C}$ 。 δ (CDCl_3) : 6. 31(br, 1H, NH), 7. 66(s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0447] 化合物 B-112 :熔点 98-100 °C。 δ (CDCl₃) :6.60 (br, 1H, NH), 7.92 (d, J = 10.8 Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0448] 化合物 B-116 :黄色油状物。 δ (CDCl₃) :6.86 (br, 1H, NH), 8.48 (d, J = 2.7 Hz, 1H, Ph-5-1H), 8.70 (d, J = 2.7 Hz, 1H, Ph-3-1H)。

[0449] 化合物 B-117 :熔点 122-124 °C。 δ (CDCl₃) :6.63 (br, 1H, NH), 7.57 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0450] 化合物 B-120 :熔点 266-268 °C。 δ (CDCl₃) :6.92-6.97 (m, 1H, pyridine-5-H), 7.47 (d, 1H, pyridine-3-H, J = 7.8 Hz), 7.67-7.72 (m, 1H, pyridine-4-H), 9.10 (d, 1H, pyridine-6-H, J = 7.5 Hz), 10.16 (s, 1H, NH)。

[0451] 化合物 B-121 :熔点 116-118 °C。 δ (CDCl₃) :6.79 (t, 1H, Py-5-H), 8.04 (dd, J = 7.2 Hz, J = 1.2 Hz, 1H, Py-4-1H), 9.09 (dd, J = 7.2 Hz, J = 1.2 Hz, 1H, Py-6-H), 10.22 (br, 1H, NH)。

[0452] 化合物 B-122 :熔点 168-170 °C。 δ (DMSO) :6.42 (d, 1H, pyridine-3-H, J = 8.1 Hz), 7.72 (d, 1H, pyridine-6-H, J = 2.4 Hz), 7.53 (dd, 1H, pyridine-4-H, ³J = 8.1 Hz, ⁴J = 2.4 Hz), 9.22 (s, 1H, NH)。

[0453] 化合物 B-123 :熔点 122-124 °C。 δ (CDCl₃) :2.37 (s, 3H, Py-4-CH₃), 7.95 (s, 1H, Py-4-H), 8.89 (s, 1H, Py-6-H), 10.14 (br, 1H, NH)。

[0454] 化合物 B-124 :熔点 122-124 °C, δ (DMSO) :2.37 (s, 3H, CH₃), 7.95 (d, 1H, pyridine-4-H, J = 1.8 Hz), 8.89 (d, 1H, pyridine-6-H, J = 1.8 Hz), 10.14 (br, 1H, NH)。

[0455] 化合物 B-127 :熔点 280 °C 不熔。 δ (DMCO) :6.95 (s, 1H, NH), 7.88 (s, 1H, Py-3-1H)。

[0456] 化合物 B-128 :熔点 136-138 °C。 δ (CDCl₃) :7.32 (br, 1H, NH), 7.84 (s, 1H, Py-4-1H)。

[0457] 化合物 B-128b :熔点 168-170 °C。

[0458] 化合物 B-130 :熔点 176-178 °C, δ (DMSO) :7.35-7.39 (m, 1H, pyridine-4-H), 7.57-7.60 (m, 1H, pyridine-5-H), 8.37 (d, 1H, pyridine-6-H, J = 4.2 Hz), 8.45 (d, 1H, pyridine-2-H, J = 2.4 Hz), 9.61 (br, 1H, NH)。

[0459] 化合物 B-131 :熔点 243-245 °C。 δ (CDCl₃) :7.03 (s, 1H, NH), 7.34-7.38 (m, 1H, pyridine-5-H), 7.54 (d, 1H, pyridine-4-H, J = 8.1 Hz), 8.38 (d, 1H, pyridine-6-H, J = 3.3 Hz)。

[0460] 化合物 B-132 :熔点 194-196 °C, δ (DMSO) :7.39 (dd, 1H, pyridine-4-1H, ³J = 8.7 Hz, ⁴J = 2.4 Hz), 7.47 (d, 1H, pyridine-5-H, J = 8.7 Hz), 8.10 (d, 1H, pyridine-2-H, J = 2.4 Hz), 9.62 (br, 1H, NH)。

[0461] 化合物 B-135 :熔点 234-236 °C, δ (DMSO) :2.33 (s, 3H, CH₃), 7.40 (d, 1H, pyridine-5-H, J = 5.1 Hz), 8.29 (d, 1H, pyridine-6-H, J = 5.1 Hz), 9.50 (s, 1H, NH)。

[0462] 化合物 B-137 :熔点 246-248 °C, δ (DMSO) :6.90-6.93 (m, 2H, pyridine-3, 5-2H), 8.12 (d, 1H, pyridine-6-H, J = 5.7 Hz), 10.03 (s, 1H, NH)。

[0463] 化合物 B-138 :熔点 220-222 °C。 δ (DMSO) :6.12 (d, 1H, pyridine-5-H, J = 6.6 Hz), 7.72 (d, 1H, pyridine-6-H, J = 6.6 Hz), 8.24 (s, 1H, pyridine-2-H), 12.18 (s, 1H, NH)。

- [0464] 化合物 B-140b :熔点 262-264℃。
- [0465] 化合物 B-141 :熔点 212-214℃, δ (DMSO) :6.93(t, 1H, pyrimidine-5-H, $J = 4.8\text{Hz}$), 8.45(d, 2H, pyrimidine-4,6-2H, $J = 5.1\text{Hz}$), 10.76(br, 1H, NH)。
- [0466] 化合物 B-142 :熔点 205-207℃, δ (CDCl_3) :2.42(d, 6H, CH_3 , $J = 3.9\text{Hz}$), 6.76(s, 1H, pyrimidine-5-H), 7.49(s, 1H, NH)。
- [0467] 化合物 B-144 :熔点 146-148℃, δ (CDCl_3) :1.54-1.59(m, 3H, CH_3), 4.39-4.44(m, 2H, CH_2), 9.08(s, 1H, pyrimidine-6-H)。
- [0468] 化合物 C-1 :熔点 176-178℃。 δ (CDCl_3) :2.33(s, 3H, Ph-2- CH_3), 6.43(br, 1H, NH), 6.68-6.70(m, 1H, Ph-6-1H), 7.10-7.13(m, 1H, Ph-5-1H), 7.23-7.25(m, 2H, Ph-3,4-2H)。
- [0469] 化合物 C-2 :熔点 180-182℃。 δ (CDCl_3) :6.55(s, 1H, NH), 6.62(d, 1H, Ph-6-1H), 7.00-7.05(m, 1H, Ph-4-1H), 7.18-7.23(m, 1H, Ph-5-1H), 7.50(dd, 1H, Ph-3-1H)。
- [0470] 化合物 C-3 :熔点 212-214℃。 δ (CDCl_3) :7.01(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7.27(t, 1H, Ph-5-1H), 7.64(t, 1H, Ph-4-1H), 8.27(d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H, Ph-3-1H), 9.43(br, 1H, NH)。
- [0471] 化合物 C-4 :熔点 134-136℃。 δ (CDCl_3) :2.88(s, 3H, NCH_3), 6.47(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 6.99(t, 1H, Ph-4-1H), 7.36(t, 1H, Ph-5-1H), 7.55(d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H, Ph-3-1H), 10.16(br, 1H, NH)。
- [0472] 化合物 C-5 :熔点 126-128℃。 δ (CDCl_3) :6.48(br, 1H, NH), 6.73(d, $J = 7.5\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 6.85(s, 1H, Ph-2-1H), 7.09-7.23(m, 2H, Ph-4,5-2H)。
- [0473] 化合物 C-6 :熔点 140-142℃。 δ (CDCl_3) :2.35(s, 3H, Ph-3- CH_3), 6.73(br, 1H, NH), 6.70-6.73(m, 2H, Ph-2,6-2H), 7.01-7.04(m, 1H, Ph-4-1H), 7.23-7.25(m, 1H, Ph-3-1H)。
- [0474] 化合物 C-7 :熔点 198-200℃。 δ (CDCl_3) :6.63(br, 1H, NH), 7.12(d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H, Ph-6-1H), 7.45(t, 1H, Ph-5-1H), 7.75-7.82(m, 2H, Ph-2,4-2H)。
- [0475] 化合物 C-8 :熔点 176-178℃。 δ (DMSO) :3.81(3H, OCH_3), 6.83(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H, Ph-2,6-2H), 7.83(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H, Ph-3,5-2H), 9.32(br, 1H, NH)。
- [0476] 化合物 C-9 :熔点 138-140℃。 δ (DMSO) :1.32(9H, t-Bu), 6.58(br, 1H, NH), 6.82(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H, Ph-3,5-2H), 7.32(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H, Ph-2,6-2H)。
- [0477] 化合物 C-10 :熔点 158-160℃。 δ (CDCl_3) :2.33(s, 3H, Ph-4- CH_3), 6.28(br, 1H, NH), 6.70(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H, Ph-3,5-2H), 7.12(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H, Ph-2,6-2H)。
- [0478] 化合物 C-11 :熔点 113-114℃。 δ (CDCl_3) :6.56(br, 1H, NH), 6.87(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H, Ph-2,6-2H), 7.57(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H, Ph-3,5-2H)。
- [0479] 化合物 C-12 :熔点 228-230℃。 δ (CDCl_3) :6.56(s, 1H, NH), 6.82(d, 2H, Ph-2,6-2H), 7.60(d, 2H, Ph-3,5-2H)。
- [0480] 化合物 C-13 :熔点 146-148℃。 δ (CDCl_3) :6.53(s, 1H, NH), 6.88(d, 2H, Ph-2,6-2H), 7.18(d, 2H, Ph-3,5-2H)。
- [0481] 化合物 C-14 :熔点 180-182℃。 δ (CDCl_3) :3.81(s, 3H, OCH_3), 6.57(br, 1H, NH), 6.85-6.88(m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H)。
- [0482] 化合物 C-15 :熔点 174-176℃。 δ (CDCl_3) :6.45(br, 1H, NH), 6.91(d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H, Ph-6-H), 7.25(dd, $J = 8.4\text{Hz}$, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H, Ph-5-H), 7.50(d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H,

Ph-3-H)。

[0483] 化合物 C-16 :熔点 235-236℃。 δ (CDCl₃) :6.52 (br, 1H, NH), 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.45 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0484] 化合物 C-17 :熔点 208-210℃。 δ (CDCl₃) :6.25 (br, 1H, NH), 7.14 (m, 2H, Ph-3, 5-2H), 7.30 (m, 1H, Ph-4-1H)。

[0485] 化合物 C-18 :熔点 254-256℃。 δ (DMSO) :6.99 (d, J = 2.1Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.05 (dd, J = 8.4Hz, J = 2.1Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.43 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-3-1H), 8.79 (br, 1H, NH)。

[0486] 化合物 C-19 :熔点 204-206℃。 δ (CDCl₃) :6.45 (br, 1H, NH), 6.69 (dd, J = 8.7Hz, J = 2.4Hz, 1H, Ph-4-1H), 6.95 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.37 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-3-1H)。

[0487] 化合物 C-20 :熔点 178-180℃。 δ (CDCl₃) :6.45 (br, 1H, NH), 6.85 (t, 2H, Ph-2, 6-2H), 6.48 (d, J = 1.5Hz, 1H, Ph-4-1H)。

[0488] 化合物 C-21 :熔点 230-232℃。 δ (CDCl₃) :6.55 (br, 1H, NH), 6.79 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.18 (t, 1H, Ph-5-1H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-4-1H)。

[0489] 化合物 C-22 :熔点 197-199℃。 δ (CDCl₃) :6.44 (br, 1H, NH), 6.82 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.40 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-5-1H), 7.64 (s, 1H, Ph-3-1H)。

[0490] 化合物 C-23 :熔点 216-218℃。 δ (CDCl₃) :6.88 (d, J = 9.0Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.47 (dd, J = 9.0Hz, J = 2.7Hz, 1H, Ph-5-1H), 9.20 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-3-1H), 9.96 (s, 1H, NH)。

[0491] 化合物 C-24 :熔点 230-231℃。 δ (CDCl₃) :1.28 (d, J = 6.9Hz, 12H, CH₃), 2.99 (m, 2H, CH), 5.85 (br, 1H, NH), 6.99 (d, J = 7.2Hz, 1H, Ph-4-1H), 7.10 (d, J = 7.2Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0492] 化合物 C-25 :熔点 161-162℃。 δ (CDCl₃) :2.30 (s, 3H, CH₃), 6.18 (br, 1H, NH), 6.61 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.09 (dd, J = 8.4Hz, J = 2.7Hz, 1H, Ph-5-1H), 7.24 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-3-1H)。

[0493] 化合物 C-26 :熔点 212-214℃。 δ (CDCl₃) :2.32 (s, 3H, Ph-3-CH₃), 6.47 (br, 1H, NH), 7.19-7.23 (m, 3H, Ph-3, 4, 5-3H)。

[0494] 化合物 C-27 :熔点 172-174℃。 δ (CDCl₃) :6.68 (br, 1H, NH), 6.84 (t, 1H, Ph-6-1H), 8.04-8.13 (m, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0495] 化合物 C-28 :熔点 172-174℃。 δ (CDCl₃) :6.68 (d, 1H, Ph-6-1H), 6.70 (br, 1H, NH), 7.83 (d, 1H, Ph-5-1H), 7.90 (d, 1H, Ph-3-1H)。

[0496] 化合物 C-29 :熔点 190-192℃。 δ (CDCl₃) :6.58 (br, 1H, NH), 7.63 (d, 1H, Ph-6-1H), 7.67 (s, 1H, Ph-3-1H), 7.97 (s, 1H, Ph-4-1H)。

[0497] 化合物 C-30 :熔点 166-168℃。 δ (CDCl₃) :6.60 (br, 1H, NH), 6.79 (d, 1H, Ph-6-1H, J = 8.4), 7.47 (d, 1H, Ph-5-1H), 7.74 (s, 1H, Ph-3-1H)。

[0498] 化合物 C-32 :熔点 178-180℃。 δ (CDCl₃) : δ 6.56 (s, 1H, NH), 7.08 (d, 1H, Ph-6-H), 7.41 (d, 1H, Ph-5-H), 7.62 (d, 1H, Ph-3-H)。

[0499] 化合物 C-33 :熔点 162-164℃。 δ (CDCl₃) :6.65 (d, 1H, Ph-6-1H,), 8.07 (dd, 1H, Ph-5-1H), 8.40 (d, 1H, Ph-3-1H,), 9.38 (br, 1H, NH)。

- [0500] 化合物 C-34 : 熔点 154-156 °C。 δ (CDCl₃) : 2.05 (s, 3H, CH₃), 3.89 (s, 3H, OCH₃), 7.29 (t, 1H, Ph-4-H), 7.46 (d, 1H, Ph-5-H), 7.93 (d, 1H, Ph-3-H), 8.66 (s, 1H, NH)。
- [0501] 化合物 C-35 : 熔点 148-150 °C。 δ (CDCl₃) : 4.06 (s, 3H, O-CH₃), 6.66 (d, 1H, Ph-6-H), 6.84 (br, 1H, NH), 7.82-7.89 (m, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0502] 化合物 C-36 : 黄色油状物。 δ (DMCO) : 3.91 (s, 3H, OCH₃), 6.68 (br, 1H, NH), 6.85 (dd, J = 8.4Hz, J = 2.1Hz, 1H, Ph-6-H), 6.97 (d, J = 2.1Hz, 1H, Ph-2-H), 7.85 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-5-H)。
- [0503] 化合物 C-37 : 熔点 154-156 °C。 δ (CDCl₃) : 2.33 (s, 3H, Ph-4-CH₃), 6.52 (br, 1H, NH), 6.62 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-6-H), 6.69 (s, 1H, Ph-2-H), 7.06 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-5-H)。
- [0504] 化合物 C-39 : 熔点 174-176 °C。 δ (CDCl₃) : 6.52 (br, 1H, NH), 6.63 (dd, J = 8.4Hz, J = 2.7Hz, 1H, Ph-6-H), 7.20 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-5-H), 7.42 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-2-H)。
- [0505] 化合物 C-41 : 熔点 98-100 °C。 δ (CDCl₃) : 6.61 (s, 1H, NH), 8.51 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0506] 化合物 C-42 : 熔点 206-208 °C。 δ (CDCl₃) : 6.43 (br, 1H, NH), 7.59 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0507] 化合物 C-45 : 熔点 166-168 °C。 δ (CDCl₃) : 6.44 (br, 1H, NH), 7.96 (d, J = 8.4Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0508] 化合物 C-46 : 熔点 196-197 °C。 δ (CDCl₃) : 6.54 (br, 1H, NH), 7.96 (d, J = 10.8Hz, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0509] 化合物 C-47 : 熔点 152-154 °C。 δ (CDCl₃) : 6.50 (br, 1H, NH), 7.55 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0510] 化合物 C-48 : 熔点 132-134 °C。 δ (DMCO) : 8.65 (s, 1H, Ph-5-H), 8.77 (s, 1H, Ph-3-H), 8.91 (br, 1H, NH)。
- [0511] 化合物 C-49 : 熔点 160-162 °C。 δ (CDCl₃) : 6.58 (br, 1H, NH), 8.34 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-5-H), 8.47 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-3-H)。
- [0512] 化合物 C-50 : 熔点 138-140 °C。 δ (CDCl₃) : 6.56 (br, 1H, NH), 7.65 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0513] 化合物 C-51 : 熔点 170-172 °C。 δ (CDCl₃) : 6.92-6.94 (m, 1H, Ph-6-H), 6.99-7.05 (m, 1H, Ph-5-H)。
- [0514] 化合物 C-52 : 熔点 204-206 °C。 δ (CDCl₃) : 6.51 (br, 1H, NH), 6.93 (s, 1H, Ph-6-H), 7.58 (s, 1H, Ph-5-H)。
- [0515] 化合物 C-53 : 熔点 176-178 °C。 δ (CDCl₃) : 9.18 (br, 1H, NH), 7.69 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0516] 化合物 C-54 : 熔点 278-280 °C。 δ (CDCl₃) : 6.49 (br, 1H, NH), 6.74 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-6-H), 7.36 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-5-H)。
- [0517] 化合物 C-55 : 熔点 174-176 °C。 δ (CDCl₃) : 2.19 (s, 6H, Ph-2, 6-2CH₃), 2.30 (s, 3H, Ph-4-CH₃), 6.42 (br, 1H, NH), 6.76 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。
- [0518] 化合物 C-56 : 熔点 194-196 °C。 δ (CDCl₃) : 2.56 (s, 3H, Ph-2-CH₃), 3.62 (s, 3H,

NHCH₃), 6.44 (br, 1H, NH), 7.57 (s, 1H, Ph-3-H), 8.06 (s, 1H, Ph-5-H)。

[0519] 化合物 C-58: 黄色油状物。δ (CDCl₃): 2.91 (s, 3H, NCH₃), 7.77 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-3-H), 7.86 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-5-H), 11.12 (br, 1H, NH)。

[0520] 化合物 C-59: 黄色油状物。δ (CDCl₃): 3.96 (s, 3H, OCH₃), 7.60 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-3-H), 7.98 (d, J = 2.7Hz, 1H, Ph-5-H), 9.15 (br, 1H, NH)。

[0521] 化合物 C-60: 熔点 236-238 °C。δ (DMCO): 2.50 (s, 3H, Ph-2-CH₃), 8.67 (s, 1H, Ph-5-H), 9.11 (br, 1H, NH)。

[0522] 化合物 C-62: 熔点 126-128 °C。δ (CDCl₃): 3.92 (s, 1H, OMe), 6.57 (s, 1H, NH), 6.83 (d, J = 9.0Hz, 1H, Ph-6-H), 7.47 (d, J = 9.0Hz, 1H, Ph-5-H), 7.72 (s, 1H, Ph-3-H)。

[0523] 化合物 C-63: 熔点 272-274 °C。δ (DMSO): 2.25 (s, 3H, Ph-2-CH₃), 6.47-6.50 (m, 1H, Ph-6-H), 6.60-6.63 (m, 1H, Ph-5-H), 6.84-6.91 (m, 2H, Ph-3, 4-2H), 7.91 (br, 1H, NH)。

[0524] 化合物 C-64: 熔点 193-195 °C。δ (CDCl₃): 6.52 (d, J = 7.5Hz, 1H, Ph-6-H), 7.15 (t, 1H, Ph-5-H), 7.53 (t, 1H, Ph-4-H), 8.27 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-3-H), 9.33 (br, 1H, NH)。

[0525] 化合物 C-65: 黄色油状物。δ (CDCl₃): 2.38 (s, 3H, Ph-3-CH₃), 6.88 (br, 1H, NH), 6.92-7.18 (m, 4H, Ph-2, 3, 4, 6-4H)。

[0526] 化合物 C-66: 熔点 114-116 °C。δ (CDCl₃): 6.75 (d, J = 8.1Hz, 1H, Ph-6-H), 6.68 (s, 1H, Ph-2-H), 7.04-7.12 (m, 2H, Ph-4, 5-2H), 10.03 (br, 1H, NH)。

[0527] 化合物 C-67: 熔点 96-98 °C。δ (DMSO): 7.58-7.65 (m, 2H, Ph-5, 6-2H), 7.96-8.02 (m, 2H, Ph-2, 4-2H), 10.08 (br, 1H, NH)。

[0528] 化合物 C-68: 熔点 140-142 °C。δ (CDCl₃): 3.83 (s, 3H, OCH₃), 6.16 (br, 1H, NH), 6.91 (d, J = 8.7Hz, 2H, Ph-3, 5-2H), 7.09 (d, J = 8.7Hz, 2H, Ph-2, 6-2H)。

[0529] 化合物 C-69: 熔点 160-162 °C。δ (DMSO): 1.32 (9H, t-Bu), 6.18 (br, 1H, NH), 6.98 (d, J = 7.8Hz, 2H, Ph-3, 5-2H), 7.38 (d, J = 7.8Hz, 2H, Ph-2, 6-2H)。

[0530] 化合物 C-70: 熔点 196-198 °C。δ (CDCl₃): 6.38 (s, 1H, NH), 6.95 (dd, 2H, Ph-2, 6-H), 8.26 (d, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0531] 化合物 C-71: 熔点 192-194 °C。δ (CDCl₃): 6.57 (br, 1H, NH), 6.63 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-6-H), 7.23 (dd, J = 8.7Hz, J = 2.4Hz, 1H, Ph-5-H), 7.46 (d, J = 2.4Hz, 1H, Ph-3-H)。

[0532] 化合物 C-72: δ (CDCl₃): 6.51 (s, 1H, NH), 7.33 (t, 1H, Ph-4-H, J = 7.2Hz), 7.47 (d, 2H, Ph-3, 5-2H, J = 7.2Hz)。

[0533] 化合物 C-73: 熔点 104-106 °C。δ (CDCl₃): 6.90 (br, 1H, NH), 7.03 (m, 2H, Ph-3, 5-2H), 7.25 (m, 1H, Ph-4-H)。

[0534] 化合物 C-74: 熔点 123-131 °C。δ (CDCl₃): 6.22 (br, 1H, NH), 6.84 (d, J = 2.1Hz, 1H, Ph-6-H), 7.09 (dd, J = 8.4Hz, J = 2.1Hz, 1H, Ph-4-H), 7.39 (d, J = 8.4Hz, 1H, Ph-3-H)。

[0535] 化合物 C-75: 黄色油状物。δ (DMSO): 6.48 (dd, J = 8.7Hz, J = 3.0Hz, 1H, Ph-4-H), 6.69 (d, J = 3.0Hz, 1H, Ph-6-H), 7.08 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-3-H), 8.11 (br, 1H, NH)。

- [0536] 化合物 C-76 :熔点 199-201℃。δ (DMSO) :6. 416. 97 (s, 1H, Ph-4-1H) , 6. 48 (d, J = 1. 5Hz, 2H, Ph-2, 6-2H) , 7. 48 (br, 1H, NH) 。
- [0537] 化合物 C-77 :熔点 132-134℃。δ (CDCl₃) :6. 36 (br, 1H, NH) , 6. 68 (d, J = 8. 1Hz, 1H, Ph-6-1H) , 6. 96 (t, 1H, Ph-5-1H) , 7. 20 (d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-4-1H) 。
- [0538] 化合物 C-78 :红棕色油状物。δ (DMCO) :6. 76 (d, J = 8. 7Hz, 1H, Ph-6-1H) , 7. 37 (d, J = 8. 7Hz, 1H, Ph-5-1H) , 7. 90 (s, 1H, Ph-3-1H) , 7. 92 (br, 1H, NH) 。
- [0539] 化合物 C-79 :δ (CDCl₃) :6. 37 (br, 1H, NH) , 6. 82 (t, 1H, Ph-6-1H) , 8. 06-8. 15 (m, 2H, Ph-3, 5-2H) 。
- [0540] 化合物 C-80 :熔点 56-58℃。δ (CDCl₃) :6. 75 (d, 1H, Ph-6-1H) , 6. 81 (br, 1H, NH) , 8. 12 (d, 1H, Ph-3-1H) , 8. 37 (s, 1H, Ph-3-1H) 。
- [0541] 化合物 C-81 :熔点 136-138℃。δ (CDCl₃) :6. 38 (br, 1H, NH) , 7. 62 (d, 1H, Ph-6-1H) , 7. 65 (s, 1H, Ph-3-1H) , 7. 95 (d, 1H, Ph-4-1H) 。
- [0542] 化合物 C-82 :熔点 138-140℃。δ (CDCl₃) :6. 43 (br, 1H, NH) , 6. 83 (d, 1H, Ph-6-1H) , 7. 49 (d, 1H, Ph-5-1H) , 7. 72 (s, 1H, Ph-3-1H) 。
- [0543] 化合物 C-83 :黄色油状物。δ (CDCl₃) :6. 34 (br, 1H, NH) , 7. 09 (s, 1H, Ph-6-1H) , 7. 36 (d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-4-1H) , 7. 59 (d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-3-1H) 。
- [0544] 化合物 C-85 :黄色油状物。δ (CDCl₃) :2. 95 (s, 3H, Ph-2-CH₃) 6. 30 (br, 1H, NH) , 6. 58 (d, J = 8. 1Hz, 1H, Ph-6-1H) , 6. 94-7. 00 (m, 2H, Ph-3, 5-2H) 。
- [0545] 化合物 C-86 :棕色液体。δ (CDCl₃) :2. 42 (s, 3H, CH₃) , 5. 67 (br, 1H, NH) , 6. 63 (d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-6-1H) , 7. 99 (d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-5-1H) , 8. 12 (s, 1H, Ph-3-1H) 。
- [0546] 化合物 C-87 :红棕色油状物。δ (CDCl₃) :2. 34 (s, 3H, Ph-3-CH₃) , 6. 03 (br, 1H, NH) , 7. 12-7. 35 (m, 3H, Ph-3, 4, 5-3H) 。
- [0547] 化合物 C-88 :δ (CDCl₃) :6. 43 (s, 1H, NH) , 8. 51 (s, 2H, Ph-3, 5-2H) 。
- [0548] 化合物 C-89 :熔点 138-140℃。δ (CDCl₃) :6. 72 (d, 1H, Ph-6-1H, J = 5. 4) , 7. 53 (dd, 1H, Ph-3-1H) , 8. 29 (d, 1H, Ph-3-1H,) , 9. 26 (s, 1H, NH) 。
- [0549] 化合物 C-90 :熔点 137-139℃。δ (DMCO) :3. 90 (s, 3H, OCH₃) , 6. 58 (dd, J = 8. 4Hz, J = 2. 1Hz, 1H, Ph-6-1H) , 6. 70 (d, J = 2. 1Hz, 1H, Ph-2-1H) , 7. 78 (d, J = 8. 4Hz, 1H, Ph-5-1H) , 8. 72 (br, 1H, NH) 。
- [0550] 化合物 C-91 :熔点 256-258℃。δ (CDCl₃) :6. 62 (br, 1H, NH) , 7. 83 (d, J = 8. 1Hz, 1H, Ph-6-1H) , 7. 49 (s, 1H, Ph-2-1H) , 7. 56 (d, J = 8. 1Hz, 1H, Ph-5-1H) 。
- [0551] 化合物 C-93 :熔点 90-92℃。δ (CDCl₃) :6. 81 (s, 1H, NH) , 8. 30 (s, 2H, Ph-3, 5-2H) 。
- [0552] 化合物 C-96 :熔点 110-112℃。δ (CDCl₃) :6. 43 (s, 1H, NH) , 8. 51 (s, 2H, Ph-3, 5-2H) 。
- [0553] 化合物 C-97 :熔点 110-112℃。δ (CDCl₃) :6. 94 (s, 1H, NH) , 8. 48 (d, 1H, Ph-5-1H) , 8. 73 (d, 1H, Ph-5-1H) 。
- [0554] 化合物 C-98 :红棕色油状物。δ (CDCl₃) :6. 26 (br, 1H, NH) , 7. 68 (s, 2H, Ph-3, 5-2H) 。
- [0555] 化合物 C-100 :熔点 124-126℃。δ (CDCl₃) :6. 49 (br, 1H, NH) , 7. 97 (d, J = 10. 8Hz, 2H, Ph-3, 5-2H) 。

[0556] 化合物 C-102 : 熔点 91-93 °C。 δ (CDCl₃) : 6.56 (br, 1H, NH), 7.54 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0557] 化合物 C-103 : 熔点 150-152 °C。 δ (CDCl₃) : 6.40 (br, 1H, NH), 7.44 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0558] 化合物 C-104 : 熔点 132-134 °C。 δ (CDCl₃) : δ . 31 (br, 1H, NH), 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-6-1H), 7.66 (d, J = 8.7Hz, 1H, Ph-5-1H)。

[0559] 化合物 C-105 : δ (CDCl₃) : 6.70 (br, 1H, NH), 6.94 (s, 1H, Ph-6-1H), 7.57 (s, 1H, Ph-5-1H)。

[0560] 化合物 C-106 : δ (CDCl₃) : 6.06 (br, 1H, NH), 7.59 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0561] 化合物 C-107 : 熔点 171-173 °C。 δ (DMCO) : 6.62 (br, 1H, NH), 6.89 (s, 2H, Ph-3, 5-2H)。

[0562] 化合物 C-108 : 熔点 76-78 °C。 δ (CDCl₃) : 3.51 (br, 1H, NH), 7.04 (t, 1H, Py-3-1H), 7.57 (t, 1H, Ph-4-1H), 7.74 (t, 1H, Ph-6-1H)。

[0563] 化合物 C-110 : 熔点 178-180 °C。 δ (CDCl₃) : 2.35 (s, 3H, CH₃), 3.66 (br, 1H, NH) 6.48 (s, 1H, Py-3-1H), 6.82 (d, 1H, Py-5-1H), 8.10 (d, 1H, Py-6-1H)。

[0564] 化合物 C-111 : 熔点 200-202 °C。 δ (CDCl₃) : 2.36 (s, 3H, Py-5-CH₃), 6.65 (d, J = 8.1Hz, 1H, Py-3-H), 6.86 (br, 1H, NH), 7.46 (d, J = 8.1Hz, 1H, Py-4-H), 8.06 (s, 1H, Py-6-H)。

[0565] 化合物 C-114 : 熔点 280-281 °C。 δ (DMCO) : 6.97 (s, 1H, NH), 7.89 (s, 1H, Py-3-1H)。

[0566] 化合物 C-125 : 熔点 120-122 °C。 δ (CDCl₃) : 6.58 (br, 1H, NH), 8.49 (s, 2H, Py-2, 6-2H)。

[0567] 化合物 C-126 : 熔点 154-156 °C。 δ (DMCO) : 6.93 (t, 1H, Py-5-1H), 8.41 (d, J = 4.8Hz, 2H, Ph-4, 6-2H), 8.96 (br, 1H, NH)。

[0568] 化合物 C-128 : 熔点 194-196 °C。 δ (CDCl₃) : 3.81 (s, 6H, 2OCH₃), 5.66 (s, 1H, Py-5-1H), 6.96 (br, 1H, NH)。

[0569] 制剂实施例

[0570] 各组分加入量均为重量百分含量, 活性化合物经折百后计量加入。

[0571] 实施例 23 : 30% 可湿性粉剂

[0572]

化合物 B-54	30%
十二烷基硫酸钠	2%
木质素磺酸钠	3%
萘磺酸甲醛缩合物	5%
轻质碳酸钙	补足至 100%

[0573] 将化合物及其他组分充分混合, 经超细粉碎机粉碎后, 即得到 30% 的可湿性粉剂产品。

[0574] 实施例 24 : 40% 浓悬浮剂

[0575]

化合物 B-54	40%
乙二醇	10%
壬基苯酚聚乙二醇醚	6%
木质素磺酸钠	10%
羧甲基纤维素	1%
37%甲醛水溶液	0.2%
75%硅油水乳液	0.8%
水	补足至 100%

[0576] 化合物及其他组分充分混合,由此得到的浓悬浮剂,用水稀释所得悬浮剂可得到任何所需浓度的稀释液。

[0577] 实施例 25 :60%水分散性粒剂

[0578]

化合物 B-54	60%
萘磺酸钠甲醛缩合物	12%
N-甲基-N-油酰基-牛磺酸钠	8%
聚乙烯吡咯烷酮	2%
羧甲基纤维素	2%
高岭土	补足至 100%

[0579] 将化合物及其他组分混合粉碎,再加水捏合后,加入 10-100 目筛网的造粒机中进行造粒,然后再经干燥、筛分(按筛网范围)。

[0580] 生物活性测定

[0581] 本发明化合物对农业领域中的多种病菌都表现出很好的活性。用本发明化合物样品对植物的多种真菌病害进行了离体抑菌活性、活体保护效果试验,并与部分已知化合物进行了药效对比试验。杀菌活性测定结果见以下各实施例。

[0582] 实施例 26 :离体杀菌活性测定

[0583] 测定方法如下:采用高通量筛选方法,即将待测化合物样品用适合的溶剂(溶剂的种类如丙酮、甲醇、DMF 等,并且依据其对样品的溶解能力而选择)溶解,配制成所需浓度待测液。在超净工作环境下,将待测液加入到 96 孔培养板的微孔中,再将病原菌繁殖体悬浮液加入其中,处理后的培养板放置在恒温培养箱中培养。24 小时后进行调查,调查时目测病原菌繁殖体萌发或生长情况,并根据对照处理的萌发或生长情况,评价化合物抑菌活性。

[0584] 部分化合物的离体抑菌活性(以抑制率表示)测试结果如下:

[0585] (1) 对水稻稻瘟病菌的抑制率:

[0586] 药液浓度为 25mg/L 时,化合物 A-9、A-14、A-15、A-16、A-17、A-19、A-27、A-29、A-39、A-42、A-43、A-44、A-45、A-46、A-50、A-61、A-79、A-85、A-87、A-90、B-13、B-15、B-16、B-18、B-22、B-28、B-29、B-30、B-35、B-37、B-38、B-39、B-40、B-41、B-42、B-49、B-50、B-51、B-52、B-53、B-54、B-55、B-57、B-58、B-59、B-62、B-67、B-68、B-69、B-73、B-74、B-75、B-92、B-95、B-109、B-111、B-115、B-116、B-122、B-123、B-124、B-125、B-128、B-128b、B-130、B-131、B-132、B-133、B-137、B-138、B-139、B-141、B-143、B-144、B-146、B-149、B-152、C-8、C-14、C-15、C-23、C-27、C-28、C-29、C-30、C-33、C-35、C-38、C-39、C-40、C-41、C-45、C-46、C-48、C-49、C-50、C-60、C-62、C-68、C-70、C-71、C-79、C-80、C-81、C-82、C-88、C-89、C-93、C-96、C-97、C-98、C-99、C-109、C-111、C-118、C-124、C-125、C-126 等的抑制率为 100%,化

合物 A-11、A-23、A-50、A-59、A-80、B-62a、B-62b、B-142、C-114 的抑制率为 80%；对照化合物 KC28 的抑制率为 80%，STM-2 的抑制率为 50%，KC1、KC2、KC3、KC12、KC21、KC22、KC23、KC25、KC26、STM-1 的抑制率均为 0；

[0587] 药液浓度为 8.3mg/L 时，化合物 A-9、A-14、A-15、A-16、A-17、A-19、A-27、A-29、A-39、A-42、A-43、A-44、A-45、A-46、A-61、A-79、A-85、A-87、B-13、B-16、B-28、B-29、B-30、B-35、B-37、B-39、B-41、B-42、B-49、B-50、B-51、B-52、B-53、B-54、B-55、B-58、B-59、B-62、B-67、B-68、B-73、B-74、B-75、B-92、B-95、B-109、B-111、B-115、B-116、B-122、B-125、B-128、B-128b、B-131、B-132、B-133、B-137、B-138、B-139、B-143、B-149、C-8、C-15、C-27、C-29、C-30、C-33、C-35、C-38、C-39、C-40、C-41、C-45、C-46、C-48、C-49、C-50、C-60、C-62、C-70、C-71、C-79、C-80、C-81、C-82、C-88、C-89、C-93、C-96、C-98、C-99、C-118、C-124、C-125 等的抑制率为 100%，化合物 B-69、B-141、B-144、C-14、C-68、C-126 等的抑制率为 80%；对照化合物 KC28 的抑制率为 50%；

[0588] 药液浓度为 2.8mg/L 时，化合物 A-9、A-14、A-15、A-16、A-17、A-19、A-29、A-42、A-43、A-44、A-45、A-46、A-61、A-85、A-87、B-13、B-16、B-28、B-29、B-30、B-35、B-37、B-39、B-41、B-42、B-49、B-50、B-51、B-52、B-53、B-55、B-58、B-59、B-62、B-67、B-68、B-73、B-74、B-75、B-92、B-95、B-109、B-111、B-115、B-116、B-125、B-128、B-128b、B-133、B-138、B-139、B-143、B-149、C-8、C-15、C-27、C-29、C-30、C-38、C-39、C-40、C-41、C-45、C-46、C-48、C-49、C-50、C-60、C-62、C-71、C-79、C-80、C-81、C-82、C-89、C-93、C-96、C-98、C-99、C-118、C-124 等的抑制率为 100%，化合物 A-27、A-39、B-54、B-122、B-137、C-35、C-70、C-88 等的抑制率为 80%；对照化合物 KC28 的抑制率为 0；

[0589] 药液浓度为 0.9mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-16、A-17、A-42、A-43、A-44、A-45、A-46、A-61、A-87、B-28、B-29、B-30、B-35、B-37、B-39、B-41、B-42、B-49、B-50、B-51、B-52、B-53、B-54、B-58、B-62、B-67、B-68、B-73、B-74、B-75、B-92、B-95、B-109、B-111、B-115、B-116、B-125、B-128、B-128b、B-133、B-139、B-149、C-8、C-15、C-27、C-30、C-39、C-40、C-41、C-45、C-46、C-49、C-50、C-89、C-93、C-96、C-98、C-99、C-118、C-124 等抑制率为 100%，化合物 A-9、A-19、A-29、C-29、C-48、C-60、C-62、C-71、C-80、C-81、C-82 的抑制率为 80%；对照化合物 KC10 的抑制率为 50%，KC4、KC11 的抑制率均为 0；

[0590] 药液浓度为 0.3mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-16、A-17、A-43、A-44、A-45、A-46、A-87、B-28、B-29、B-30、B-35、B-37、B-39、B-42、B-49、B-50、B-51、B-52、B-53、B-58、B-62、B-68、B-74、B-75、B-115、B-125、B-128、B-128b、B-133、B-139、C-27、C-30、C-40、C-41、C-45、C-46、C-49、C-50、C-99、C-118、C-124 等的抑制率为 100%，化合物 B-41、B-54、B-73、B-92 等的抑制率为 80%；对照化合物 KC6、KC10 的抑制率为 0。

[0591] (2) 对黄瓜灰霉病菌的抑制率：

[0592] 药液浓度为 25mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-43、A-44、A-45、A-46、A-85、A-87、B-13、B-29、B-35、B-37、B-38、B-42、B-49、B-50、B-51、B-52、B-53、B-54、B-55、B-57、B-58、B-59、B-62b、B-67、B-68、B-73、B-74、B-75、B-92、B-95、B-109、B-111、B-115、B-116、B-122、B-128、B-128b、B-133、B-139、C-23、C-27、C-28、C-30、C-40、C-41、C-45、C-46、C-50、C-71、C-89、C-96、C-97、C-98、C-125 等的抑制率均为 100%，化合物 A-42、A-61、B-15、B-28、B-40、B-62、B-125、C-48、C-49、C-80、C-82、C-88、C-99 等的抑制率为 80%；对照化合物 KC28 的

抑制率为 80%，KC-20 的抑制率为 50%，KC1、KC2、KC3、KC5、KC6、KC13、KC14、KC15、KC19、KC-21、KC-22、KC23、KC24、KC25、KC26、KC27、STM-1、STM-2 的抑制率均为 0；

[0593] 药液浓度为 8.3mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-43、A-44、A-45、A-46、B-35、B-37、B-42、B-49、B-50、B-51、B-52、B-53、B-54、B-55、B-57、B-58、B-68、B-74、B-75、B-92、B-95、B-109、B-115、B-116、B-122、B-128、B-128b、B-133、B-139、C-27、C-30、C-40、C-41、C-45、C-46、C-50、C-71、C-89、C-96 等的抑制率为 100%，化合物 A-87、B-29、C-98 等的抑制率为 80%；对照化合物 KC7、KC8、KC28 的抑制率为 0；

[0594] 药液浓度为 2.8mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-43、A-44、A-45、A-46、B-35、B-37、B-42、B-49、B-50、B-52、B-53、B-54、B-57、B-58、B-68、B-74、B-75、B-95、B-109、B-115、B-133、B-139、C-27、C-40、C-45、C-46、C-71、C-96 等的抑制率为 100%，化合物 A-87、B-29、B-51、B-55、B-92、B-128、B-128b、C-30、C-41、C-50、C-89、C-98 等的抑制率为 80%；对照化合物 KC4 的抑制率为 50%，KC9、KC10、KC11、KC12 的抑制率均为 0；

[0595] 药液浓度为 0.9mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-43、A-44、A-46、B-35、B-37、B-49、B-53、B-54、B-58、B-75、B-115、B-133、B-139、C-40、C-45、C-46、C-96 等的抑制率为 100%，化合物 B-68、C-27、C-71 等的抑制率为 80%；对照化合物 KC4 的抑制率为 0；

[0596] 药液浓度为 0.3mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-43、A-46、B-35、B-49、B-53、B-133、C-45、C-46 等的抑制率为 100%，化合物 B-54、B-58、B-75 等的抑制率为 80%。

[0597] 实施例 27：活体保护活性测定

[0598] 测定方法如下：采用活体盆栽测定方法，即将待测化合物样品用少量溶剂（溶剂的种类如丙酮、甲醇、DMF 等，并且依据其对样品的溶解能力而选择，溶剂量与喷液量的体积比等于或小于 0.05）溶解，用含有 0.1%吐温 80 的水稀释，配制成所需浓度待测液。在作物喷雾机上，将待测液喷施于病害寄主植物上（寄主植物为在温室内培养的标准盆栽苗），24 小时后进行病害接种。依据病害特点，将需要控温保湿培养的病态植物接种后放在人工气候室中培养，待病害完成侵染后，移入温室培养，将不需要保湿培养的病态植物直接在温室内接种并培养。待对照充分发病后（通常为一周时间）进行化合物防病效果评估。

[0599] 部分化合物的活体保护活性测试结果如下：

[0600] (1) 对黄瓜霜霉病的活体保护活性：

[0601] 药液浓度为 400mg/L 时，化合物 A-11、A-14、A-15、A-16、A-17、A-19、A-23、A-27、A-41、A-44、A-45、A-59、A-61、A-79、A-80、A-81、A-85、B-10、B-12、B-13、B-14、B-16、B-22、B-23、B-28、B-29、B-35、B-37、B-38、B-39、B-40、B-49、B-53、B-54、B-57、B-58、B-62b、B-67、B-68、B-69、B-73、B-74、B-92、B-95、B-109、B-111、B-115、B-116、B-125、B-128、B-128b、B-139、B-149、C-12、C-13、C-27、C-28、C-30、C-32、C-33、C-35、C-38、C-40、C-51、C-56、C-70、C-79、C-81、C-82、C-93、C-97、C-118、C-124、C-126 等的保护活性均为 100%，化合物 A-8、A-21、A-90、B-15、B-26、B-42、B-63、B-133、B-137、B-138、B-146、C-8、C-39、C-60、C-88、C-96 等的保护活性均大于 90%，化合物 A-50、B-9、B-62a、B-132、B-137、B-141、C-9、C-62、C-69、C-108、C-114 等的活性均不低于 80%；对照化合物 KC1、KC2、KC3、KC8、KC13、KC17、KC20、KC22、KC24、KC25、KC27、STM-1 的抑制率均为 0；

[0602] 药液浓度为 100mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-44、A-45、A-79、A-80、B-28、B-29、B-35、B-40、B-49、B-53、B-54、B-57、B-58、B-68、B-73、B-74、B-92、B-109、B-111、B-125、

B-128、B-128b、B-133、B-139、C-27、C-38、C-40、C-124 等的保护活性均达到 100%，化合物 A-11、A-16、A-17、A-27、A-41、A-61、B-37、B-95、B-115、B-138、C-60、C-81、C-82、C-88、C-93、C-96、C-97 等的保护活性均大于 95%，化合物 B-42、C-30、C-38 等的保护活性为 90%，化合物 A-19、B-137、C-70、C-79 等的保护活性不低于 80%；对照化合物 KC7、KC12、KC15、KC16 的抑制率为 20%，KC14 的抑制率为 0；

[0603] 药液浓度为 50mg/L 时，化合物 A-14、A-15、A-45、B-29、B-40、B-49、B-54、B-57、B-58、B-73、B-109、B-133、C-27、C-40、C-124 等的保护活性均达到 100%，化合物 A-79、B-28、B-35、B-53、B-74、B-92、B-111、B-125、B-128、B-139、C-88、C-96 等的保护活性为 98%，化合物 A-44、A-61、A-79、B-128b 等的保护活性均大于 95%，化合物 A-16、A-17、A-21、A-27、A-41、B-37、B-95、B-115 等的保护活性均大于 80%；对照化合物 KC9 的抑制率为 30%，对照化合物 KC5 的抑制率为 20%，KC7、KC10、KC15 的抑制率为 10%，KC11、KC16 的抑制率为 0；

[0604] 药液浓度为 25mg/L 时，化合物 A-14、A-45、B-29、B-57、B-133、C-27、C-40 等的保护活性均达到 100%，化合物 A-15、A-44、A-79、B-35、B-40、B-49、B-53、B-58、B-109、B-125、B-128、B-139、C-124 的保护活性均不低于 90%，化合物 B-92、B-111、B-115 等的保护活性不低于 80%；对照化合物 KC9 的抑制率为 20%，STM-2 抑制率为 10%，KC4、KC5、KC7、KC10、KC11、KC15 的抑制率为 0；

[0605] 药液浓度为 12.5mg/L 时，化合物 B-35、B-58、B-139 等的保护活性均为 98%，化合物 A-14、B-133、C-124 等的保护活性不低于 90%；

[0606] 药液浓度为 6.25mg/L 时，化合物 B-35、B-58、B-139 等的保护活性不低于 85%，化合物 B-133 的保护活性为 80%。

[0607] (2) 对玉米锈病的活体保护活性：

[0608] 药液浓度为 400mg/L 时，化合物 A-15、A-43、A-46、A-59、B-1、B-14、B-38、B-50、B-52、B-54、B-55、B-57、B-58、B-62、B-69、B-70、B-73、B-74、B-75、B-92、B-111、B-128b、B-149、C-33、C-39、C-41、C-49、C-50、C-98、C-99、C-114、C-125 等的保护活性均为 100%，化合物 A-42、A-44、A-87、B-15、B-41、B-132、B-144、B-146、C-40、C-97 等的保护活性均不低于 95%，化合物 B-130、B-132、B-144、C-30 等的活性均不低于 90%，化合物 A-19、A-23、A-85、C-29、C-46、C-89 等的保护活性均为 80%；对照化合物 KC1、KC2、KC3、KC4、KC5、KC6、KC8、KC12、KC13、KC14、KC15、KC16、KC17、KC18、KC19、KC20、KC22、KC24、KC25、KC26、KC27、STM-1 的抑制率均为 0；

[0609] 药液浓度为 100mg/L 时，化合物 A-87、B-50、B-52、B-55、B-73、B-75、B-92、C-40、C-41 等的保护活性均为 100%，化合物 A-43、A-46、B-69、B-146、B-149、C-49、C-97 等的保护活性不低于 90%，化合物 A-15、A-42、B-54、B-57、B-74 等的保护活性均不低于 80%；

[0610] 药液浓度为 25mg/L 时，化合物 B-50、B-52 等的活性均不低于 98%，化合物 C-41 的活性为 90%，化合物 A-46、A-87、B-54、B-57、B-75、C-40、C-49 等的活性均不低于 80%；

[0611] 药液浓度为 6.25mg/L 时，化合物 A-46、B-50、B-52、B-75 等的活性均不低于 70%。

[0612] (3) 对小麦白粉病的活体保护活性：

[0613] 药液浓度为 400mg/L 时，化合物 B-50、B-52、C-50、C-82、C-91、C-98 等的保护活性为 100%，化合物 A-42 等的保护活性为 98%，化合物 B-128b 等的保护活性为 80%；对照

化合物 KC1、KC2、KC3、KC4、KC5、KC6、KC7、KC8、KC12、KC13、KC15、KC20、KC21、KC22、STM-1、STM-2 的抑制率均为 0，KC14 的抑制率为 30%；

[0614] 药液浓度为 100mg/L 时，化合物 B-52、C-50 等的保护活性为 98% 以上，化合物 C-91 等的保护活性为 95%，化合物 A-42、C-98 等的保护活性为 80%；对照化合物 KC14 的抑制率为 0；

[0615] 药液浓度为 25mg/L 时，化合物 A-42、C-50、C-91 等的保护活性均不低于 75%；

[0616] 药液浓度为 6.25mg/L 时，化合物 C-91 等的保护活性为 70%。

[0617] 实施例 28：部分化合物及对照药剂的药效对比试验

[0618] 进行了部分化合物与对照药剂及中间体的活性对比试验，测试结果见表 21-表 24（表中“/”表示未测试）。

[0619] 表 21 对水稻稻瘟病菌的抑制率

[0620]

化合物编号	对水稻稻瘟病菌抑制率(%)		
	0.3 mg/L	0.1 mg/L	0.03 mg/L
A-43	100	100	100
A-46	100	100	100
A-87	100	100	100
B-28	100	100	80
B-29	100	50	0
B-30	100	50	0
B-35	100	80	50
B-39	100	80	0
B-41	80	0	0
B-42	100	80	50
B-49	100	100	100
B-50	100	50	0
B-51	100	50	0
B-52	100	100	100
B-53	100	100	100
B-54	100	0	0
B-58	100	50	0
B-62	100	80	0
B-73	80	0	0
B-74	100	50	0
B-75	100	80	0
B-128	100	100	100
B-128b	100	80	80
B-133	100	100	100
C-45	100	100	100
C-46	100	100	100
C-49	100	100	100
C-50	100	100	100
C-118	100	100	100
C-124	100	100	100
KC1	0	0	0
KC2	0	0	0
KC3	0	0	0
KC4	0	0	0
KC5	0	0	0
KC6	0	0	0
KC7	0	0	0
KC8	0	0	0
KC10	0	0	0

[0621]

KC11	0	0	0
KC12	0	0	0
KC14	0	0	0
KC15	0	0	0
KC21	0	0	0
KC22	0	0	0
KC23	0	0	0
KC25	0	0	0
KC26	0	0	0
KC28	0	0	0
STM-1	0	0	0
STM-2	50	/	/
百菌清	100	30	0
氟啶胺	100	80	50

[0622] 表 22 对黄瓜灰霉病菌的抑制率

[0623]

化合物编号	对黄瓜灰霉病菌抑制率(%)			
	8.3 mg/L	2.8 mg/L	0.9 mg/L	0.3 mg/L
A-15	100	100	100	100
A-43	100	100	100	100
B-29	80	80	50	/
B-35	100	100	100	100
B-42	100	100	80	50
B-49	100	100	100	50
B-50	100	100	100	0
B-51	100	80	80	/
B-52	100	100	100	0
B-53	100	100	100	0
B-54	100	100	100	100
B-57	100	100	80	/
B-58	100	100	100	80
B-74	100	100	80	/
B-75	100	100	100	80
C-45	100	100	100	100
C-46	100	100	100	100
KC1	0	0	0	0
KC2	0	0	0	0
KC3	0	0	0	0
KC4	100	50	0	0
KC5	/	/	0	0
KC6	/	/	0	0
KC7	0	0	0	0
KC8	0	0	0	0
KC9	80	0	0	0

[0624]

KC10	80	0	0	0
KC11	50	0	0	0
KC12	80	0	0	0
KC13	0	0	0	0
KC14	0	0	0	0
KC15	0	0	0	0
KC19	0	0	0	0
KC20	0	0	0	0
KC21	0	0	0	0
KC22	0	0	0	0
KC23	0	0	0	0
KC24	0	0	0	0
KC25	0	0	0	0
KC26	0	0	0	0
KC27	0	0	0	0
KC28	0	0	0	0
STM-1	0	0	0	0
STM-2	0	0	0	0
百菌清	100	100	100	80

[0625] 表 23 对玉米锈病的活体保护活性

[0626]

化合物编号	保护活性(%)			
	400 mg/L	100 mg/L	25 mg/L	6.25 mg/L
A-46	100	95	85	75
A-87	100	100	80	50
B-49	100	95	30	0
B-50	100	100	100	80
B-52	100	100	98	70
B-53	100	80	50	30
B-54	100	90	80	65
B-55	100	100	25	0
B-57	100	85	80	60
B-62	100	60	30	0
B-73	98	100	70	30
B-74	100	95	70	40
B-75	100	100	90	75
C-40	100	100	80	30
C-41	100	100	90	50
C-49	100	90	80	50
KC1	0	0	0	0
KC2	0	0	0	0
KC3	0	0	0	0
KC4	0	0	0	0
KC5	/	/	0	0

[0627]

KC6	0	0	0	0
KC8	0	0	0	0
KC12	0	0	0	0
KC13	0	0	0	0
KC14	0	0	0	0
KC15	0	0	0	0
KC16	0	0	0	0
KC17	0	0	0	0
KC18	0	0	0	0
KC19	0	0	0	0
KC29	0	0	0	0
KC21	80	/	/	/
KC22	0	0	0	
KC24	0	0	0	0
KC25	0	0	0	0
KC26	0	0	0	0
KC27	0	0	0	0
STM-1	0	0	0	0
STM-2	70	/	/	/
百菌清	50	/	/	/

[0628] 表 24 对黄瓜霜霉病的活体保护活性

[0629]

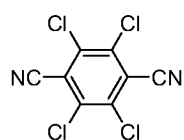
化合物编号	保护活性(%)			
	100 mg/L	50 mg/L	25 mg/L	12.5 mg/L
B-28	100	98	80	20
B-29	100	100	100	30
B-35	100	98	98	98
B-40	100	100	98	30
B-42	95	75	15	/
B-54	100	100	75	/
B-57	100	100	100	30
B-58	100	100	98	98
B-73	100	100	50	/
B-74	100	98	80	/
B-133	100	100	100	95
B-139	100	98	98	100
KC1	0	0	0	0
KC2	0	0	0	0
KC3	0	0	0	0
KC5	/	/	0	0
KC7	20	10	0	0
KC8	0	0	0	0
KC9	65	30	20	/

[0630]

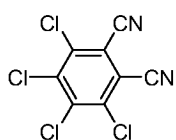
KC10	20	10	0	0
KC11	0	0	0	0
KC12	0	0	0	0
KC13	0	0	0	0
KC14	0	0	0	0
KC15	20	10	0	0
KC16	20	0	0	0
KC17	0	0	0	0
KC20	0	0	0	0
KC21	70	/	/	/
KC22	0	0	0	0
KC24	0	0	0	0
KC25	0	0	0	0
KC27	0	0	0	0
STM-1	0	0	0	0
百菌清	100	80	30	/

[0631] 对照化合物 KC1 至 KC28 均为发明人自制 (KC1 至 KC20 结构见背景技术部分, KC21 至 KC28 结构如下), 其中化合物 KC21 和 KC22 的结构此前未见报道; STM-1 和 STM-2 为原料中间体 (购买); KC23-25 是 CN101391981 中报道的化合物; KC26 是 JP11292835A 和 JP10182995A 中公开的化合物, 没有活性报道; KC27 是 JP10182995A 中公开的化合物, 没有活性报道; KC28 是专利 US3965109 公开的化合物, 有杀菌和除草活性。

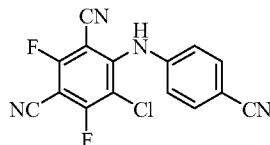
[0632]



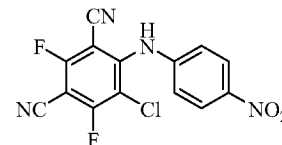
STM-1



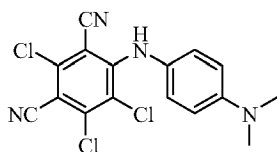
STM-2



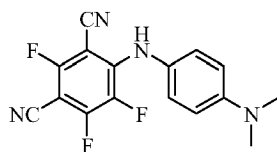
KC21



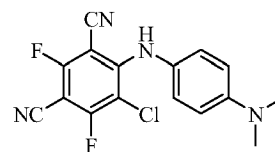
KC22



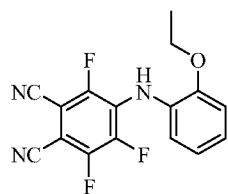
KC23



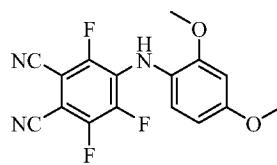
KC24



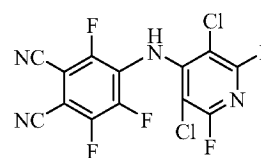
KC25



KC26



KC27



KC28