



(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 109890206 A

(43)申请公布日 2019.06.14

(21)申请号 201780063684.1

(22)申请日 2017.10.11

(30)优先权数据

201611035246 2016.10.14 IN

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2019.04.15

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/IB2017/056277 2017.10.11

(87)PCT国际申请的公布数据

W02018/069842 EN 2018.04.19

(71)申请人 印度商皮埃企业有限公司

地址 印度古尔冈

(72)发明人 玛如堤·N·奈克

维夏·亚修克·玛哈詹

古拉伯·依克纳斯·瓦尔奴

玛诺·甘帕特·卡勒

维克朗·辛·贾拉

苏露·G·曼住纳塔

哈佳拉瓦迪·M·凡卡泰沙

桑陶许·斯里达·奥卡尔

鲁奇·贾克 贾汀·沙曼塔

亚历山大·G·M·克劳森纳

康斯坦丁·波夏尼

(74)专利代理机构 北京国昊天诚知识产权代理有限公司 11315

代理人 南霆 程爽

(51)Int.Cl.

A01N 37/52(2006.01)

A01N 43/40(2006.01)

A01N 43/84(2006.01)

C07C 257/12(2006.01)

C07D 265/30(2006.01)

C07D 211/12(2006.01)

A01P 3/00(2006.01)

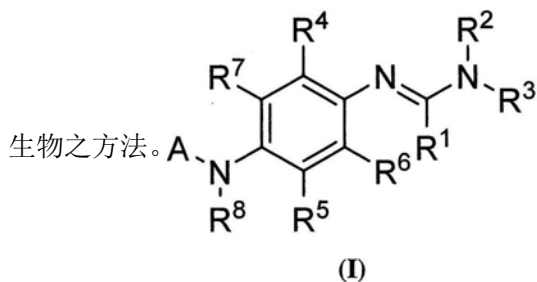
权利要求书14页 说明书93页

(54)发明名称

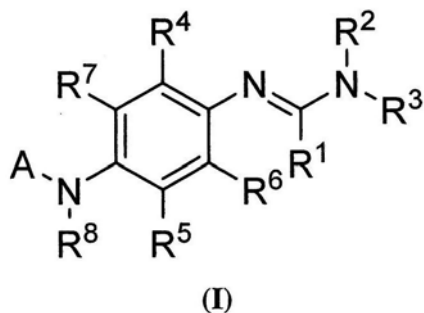
4-经取代之苯胺衍生物及其在对抗不欲之植物病原微生物以保护作物上之用途

(57)摘要

本发明系关于通式(I)之4-经取代之苯胺衍生物,其中,R₁至R₈及A具有内文所定义之意义。本发明系进一步关于其制备方法与该化合物对抗不欲之植物病原微生物之用途,以及为此目的包括该苯胺衍生物之试剂,全部系根据本发明。本发明系进一步关于根据本发明,通过施用通式(I)之该4-经取代之苯胺衍生物到此等不欲之微生物及/或到其栖息地来对抗不欲之植物病原微



1. 一种通式 (I) 之化合物



其中,

R^1 系选自下列所组成之群组: 氢、CN、 SR'' 、 $S(O)_nR''$ 、 OR'' 、 C_{1-12} -烷基、 C_{1-12} -烷氧基、 C_{1-12} -烷基硫基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{3-8} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基; 其中在环状环系统中, 一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代: N、O、及 $S(O)_n$;

R^2 及 R^3 系独立地选自下列所组成之群组: 氢、CN、 $S(O)_nR''$ 、 OR' 、 $(C=O)-R''$ 、 C_{1-12} -烷基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{3-8} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基、 C_{5-18} -芳基、 C_{7-19} -芳烷基、 C_{7-19} -烷芳基; 其中在环状环系统中, 一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代: N、O、及 $S(O)_n$;

与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起: C、N、O、S 并视需要包括选自下列所组成群组的 1 至 3 环员: $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 及 SiR'_2 之 R^1 及 R^2 、 R^2 及 R^3 或 R^1 及 R^3 可形成 4 至 7 员环, 对于其部分, 可经一或多个 X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、及 $CONR'_2$ 取代; 且其中, R^1 、 R^2 、及 R^3 之基团全部可视需要经选自下列所组成群组之一或多个基团取代: X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、及 $CONR'_2$;

R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 系独立地选自下列所组成之群组: 氢、 X 、CN、SCN、 SF_5 、 $S(O)_nR''$ 、 SiR'_3 、 OR'' 、 $NR'R''$ 、 $(C=O)-R''$ 、 $CR'-NR''$ 、 C_{1-12} -烷基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{1-12} -卤烷氧基、 C_{1-12} -卤烷基硫基、 C_{3-8} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基、 C_{3-8} -环烷基氧基、 C_{3-8} -环烷基硫基、 C_{5-18} -芳基、 C_{7-19} -芳烷基、 C_{7-19} -烷芳基; 其中在环状环系统中, 一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代: N、O、及 $S(O)_n$; 且上述基团全部可视需要经选自下列所组成群组之一或多个基团取代: X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、及 $CONR'_2$; 或

其中, 与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起: C、N、O、S 并视需要包括选自下列所组成群组的 1 至 3 环员: $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 及 SiR'_2 之 R^4 及 R^7 或 R^5 及 R^6 可形成 4 至 7 员环, 对于其部分, 可经一或多个 X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、及 $CONR'_2$ 取代; 及其中, R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 之基团全部可视需要经选自下列所组成群组之一或多个基团取代: X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、及 $CONR'_2$;

R^8 系选自下列所组成之群组: 氢、CN、SCN、 $S(O)_nR''$ 、 SiR'_3 、 $NR'R''$ 、 $(C=O)-R''$ 、 $CR'=NR''$ 、 C_{1-12} -烷基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{3-8} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基、 C_{5-18} -芳基、 C_{7-19} -芳烷基、 C_{7-19} -烷芳基、杂环基、 C_{3-8} -杂环基烷基; 其中在环状环系统中, 一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代: N、O、及 $S(O)_n$; 且上述基团全部可经选自下列所组成群组之一或多个基团取代: X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、

SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂；或其中，

A系选自下列所组成之群组：稠合或非稠合之C₆₋₁₈-芳基、C₅₋₁₈-杂芳基，其中，一或多个碳原子经选自下列的杂原子取代：N、O、S，并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员：C(=O)、C(=S)、S(O)_m及SiR'₂，其视需要经一或多个R⁹之基团取代；其中，

R⁹系选自下列所组成之群组：氢、X、CN、SCN、SF₅、R''、OR''、NO₂、NR''₂、SiR'₃、(C=O)-R''、S(O)_nR''、OS(O)_nR''、OSiR'₃、NR'S(O)_nR''、C₁₋₈-烷基-S(O)_nR''、C₁₋₈-烷基-(C=O)-R''、CR'=NR''、S(O)_nC₅₋₁₈-芳基、S(O)_nC₇₋₁₉-芳烷基、S(O)_nC₇₋₁₉-烷芳基、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₁₂-烯基、C₂₋₁₂-炔基、C₁₋₁₂-卤烷基、C₂₋₁₂-卤烯基、C₂₋₁₂-卤炔基、C₁₋₁₂-烷氧基、C₁₋₁₂-烷基硫基、C₁₋₁₂-卤烷氧基、C₁₋₁₂-卤烷基硫基、C₃₋₁₂-环烷基、C₄₋₈-环烯基、C₅₋₈-环炔基、C₃₋₈-环烷基氧基、C₃₋₈-环烷基硫基、C₇₋₁₉-芳烷基、C₇₋₁₉-烷芳基；双环C₅₋₁₂-烷基、C₇₋₁₂-烯基；其中在环状环系统中，一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代：N、O、及S(O)_n；且上述基团全部可经选自下列所组成群组之一或多个基团取代：X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂；或与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起：C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员：C(=O)、C(=S)、S(O)_m及SiR'₂之二个R⁹可形成4至10员环，对于其部分，可经一或多个X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂取代；

以及其中，R⁸及R⁹之基团全部可视需要经选自下列所组成群组之一或多个基团取代：X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂；

其中，

X代表卤素；

其中，

R'代表氢、直链或支链C₁₋₁₂-烷基或环状C₃₋₁₀-烷基，其视需要经一或多个X取代；

R''代表氢；NR'₂、OR'、直链或支链C₁₋₁₂-烷基、C₁₋₁₂-卤烷基、环状C₃₋₈-烷基，其视需要经一或多个选自下列所组成群组之基团取代：X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂、视需要经一或多个R'取代之C₅₋₁₈-芳基；

其中，

m及n代表整数，其中n=0、1或2；且m=1或2；

及该化合物之农事上可接受之盐、金属络合物、异构物/结构异构物、立体异构物、非镜像异构物、镜像异构物、互变异构物、或N-氧化物。

2. 根据权利要求1所述的通式(I)之化合物，其中，该各取代基系独立地选自：

R¹为氢、C₁₋₆-烷基、C₁₋₆-烷氧基、C₁₋₆-烷基硫基、C₁₋₆-卤烷基、C₃₋₈-环烷基；

R²及R³为C₁₋₆-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₁₋₆-烷氧基、C₁₋₆-烷基硫基、C₁₋₆-卤烷基、C₃₋₈-环烷基；

与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起：C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员：C(=O)、C(=S)、S(O)_m及SiR'₂之R¹及R²、R²及R³或R¹及R³可形成4至7员环，对于其部分，可经一或多个X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂取代；

R⁴及R⁵为X、CN、S(O)_nR''、NR'R''、(C=O)-R''、CR'=NR''、C₁₋₆-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₁₋₆-卤烷基、C₁₋₆-卤烷基硫基、C₃₋₈-环烷基、C₃₋₈-环烷基硫基；

R⁶及R⁷为氢、X、CN、S(O)_nR''、NR'R''、(C=O)-R''、CR'=NR''、C₁₋₆-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔

基、C₁₋₆-卤烷基、C₁₋₆-卤烷基硫基、C₃₋₈-环烷基、C₃₋₈-环烷基硫基；

与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起：C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员：C(=O)、C(=S)、S(O)_n及SiR'₂之R⁴及R⁷或R⁵及R⁶可形成4至7员环，对于其部分，可经一或多个X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂取代；

R⁸为氢、CN、S(O)_nR''、NR'R''、(C=O)-R''、CR'=NR''、C₁₋₆-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₁₋₆-卤烷基、C₃₋₈-环烷基、C₃₋₈-杂环基、C₃₋₈-杂环基烷基；

R⁹为X、CN、SCN、SF₅、R''、OR''、NO₂、NR''₂、SiR'₃、(C=O)-R''、S(O)_nR''、OS(O)_nR''、OSiR'₃、NR'S(O)_nR''、C₁₋₈-烷基-S(O)_nR''、C₁₋₆-烷基-(C=O)-R''、CR'=NR''、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₁₋₆-卤烷基、C₂₋₆-卤烯基、C₁₋₁₂-烷氧基、C₁₋₁₂-烷基硫基、C₁₋₁₂-卤烷氧基、C₁₋₁₂-卤烷基硫基、C₃₋₈-环烷基、C₄₋₈-环烯基、C₃₋₈-环烷基氧基、C₃₋₈-环烷基硫基或与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起：C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员：C(=O)、C(=S)、S(O)_n及SiR'₂之二个R⁹可形成4至10员环，对于其部分，可经一或多个X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂取代；

A为苯基、萘基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、异恶唑基、异噻唑基、吡唑基、𫍇唑基、咪唑基、恶二唑基、噻唑基、噻二唑基、三唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、三嗪基、𪔐𪔐基、苯并咪唑基、𪔐𪔐基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、苯并噻唑基、苯并噻唑基、喹啉基、异喹啉基、喹唑啉基、噌喏基；其经一或多个R⁹取代；

其中，R¹至R⁹可进一步视需要经一或多个选自下列所组成群组之基团取代：X、R''、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂；

及该化合物之农事上可接受之盐、异构物/结构异构物、立体异构物、非镜像异构物、镜像异构物、互变异构物、或N-氧化物。

3. 根据权利要求1、2或4所述的通式(I)之化合物，其中，该各取代基系独立地选自：

R¹为氢或C₁₋₆-烷基；

R²及R³为C₁₋₆-烷基、C₁₋₆-卤烷基；

R⁴及R⁵为X、CN、C₁₋₆-烷基、C₁₋₆-卤烷基、C₃₋₈-环烷基；

R⁶及R⁷为氢、X、C₁₋₆-烷基、C₁₋₆-卤烷基；

R⁸为氢、CN、S(O)_nR''、(C=O)-R''、C₁₋₆-烷基、C₁₋₆-卤烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₃₋₈-环烷基、C₃₋₆-杂环基、C₃₋₆-杂环基烷基；

R⁹为X、CN、SCN、SF₅、R''、OR''、NO₂、NR''₂、SiR'₃、(C=O)-R''、S(O)_nR''、C₁₋₆-烷基-S(O)_nR''、OS(O)_nR''、OSiR'₃、NR'S(O)_nR''、C₁₋₆-烷基-(C=O)-R''、CR'=NR''、SC₁₋₆-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₁₋₆-卤烷基、C₂₋₆-卤烯基、C₁₋₁₂-烷氧基、C₁₋₁₂-烷基硫基、C₁₋₁₂-卤烷氧基、C₁₋₁₂-卤烷基硫基、C₃₋₈-环烷基、C₄₋₈-环烯基、C₃₋₈-环烷基氧基、C₃₋₈-环烷基硫基或与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起：C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员：C(=O)、C(=S)、S(O)_n及SiR'₂之二个R⁹可形成4至10员环，对于其部分，可经一或多个X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂取代；

A为苯基、萘基、噻吩基、噻唑基、异噻唑基、噻二唑基、𫍇唑基、异恶唑基、恶二唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基及喹啉基；其经一或多个R⁹取代；

其中，R¹至R⁹可进一步视需要经一或多个选自下列所组成群组之基团取代：X、R''、OR'、

SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂;

及该化合物之农事上可接受之盐、异构物/结构异构物、立体异构物、非镜像异构物、镜像异构物、互变异构物、或N-氧化物。

4. 根据权利要求1、2或3中任一项所述的化合物,其中,通式(I)之化合物为:

N'-(2,5-二甲基-4-(苯基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(苯基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(N-苯基甲基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-甲基-4-(全氟丙烷-2-基)苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-氯苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((3,4-二氯苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3,4,5-三氟苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(间甲苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3,4-二氯苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3-甲氧基苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(三氟甲基)苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(对甲苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-甲氧基苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(N-苯基甲基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-氯苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-氯苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-甲氧基苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-甲氧基-3-甲基苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3,4-二甲氧基苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3,5-二甲氧基苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(间甲苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(对甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(间甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(对甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((2-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((3-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((4-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-氯苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-苯基乙酰胺

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(吡啶-2-基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-氯苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((4-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((2-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((3-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺

N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((哌啶-1-基亚甲基)胺基)苯胺

N-烯丙基-N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-异丙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-溴苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((3-氯苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-溴苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((2-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(间甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(邻甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(邻甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(邻甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-溴苯基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-溴苯基)(甲基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(邻甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺

化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((2,6-二氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((2,6-二氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((2,6-二氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((2,6-二氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((2-氯-6-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((2-氯-6-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((2-氯-6-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(N-苯基乙基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((2,4-二氯-6-(三氟甲基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲

酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((2-氯-6-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲

酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((4-(二甲基胺基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((4-(二甲基胺基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((3-(二氟甲氧基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(4-((3-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

N'-(2-氯-4-((4-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2,5-二氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2,5-二氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((5-甲基-2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2,5-二氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2,5-二氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(5-甲基-2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((2-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺

N'-(2-氯-4-(N-(2-氟苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氟苯基)乙酰胺

N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N,N-二甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-(乙基(2-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺

5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-硫吗啉基亚甲基)胺基)苯胺

N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)(甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氯苯基)乙酰胺;

N'-(2-氯-4-(N-(2-氯苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-(乙基(苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-苯基乙酰胺;

N'-(2-氯-4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-(乙基(3-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-(N-(3-甲氧基苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2,5-二甲基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2,5-二甲基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氟苯基)丙酰胺;

N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-甲氧基苯基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氟苯基)丙酰胺;

N'-(2-氯-4-(N-(4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((2-氟-5-甲基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(5-氟-4-((2-氟苯基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((2-氟-5-甲基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((2-氟-5-甲基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(苯基胺基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-氯苯基)胺基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)胺基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(间甲苯基胺基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-苯基丙酰胺;

N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(3-甲氧基苯基)乙酰胺;

N'-(2-氯-4-((4-氟-3-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-4-((4-氟-3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-溴-6-氟-3-甲基-4-(苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-((5-侧氧基-5,6,7,8-四氢萘-2-基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-溴-6-氟-3-甲基-4-(甲基(苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-((1-甲基吡啶-5-基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-((5-侧氧基-5,6,7,8-四氢萘-2-基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(甲基(苯基)胺基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)(甲基)胺基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(甲基(间甲苯基)胺基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N'-(7-((2-甲氧基苯基)胺基)-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N-甲基-N'-(7-(对甲苯基胺基)-2,3-二氢-1H-茛-4-基)甲酰亚胺化物;

N'-(7-((4-氯苯基)胺基)-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N-乙基-N-甲基-N'-(4-(苯基胺基)萘-1-基)甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(吡啶-2-基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(吡啶-2-基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

N'-(2-氯-5-甲基-4-(吡啶-2-基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物。

5. 一种控制或预防植物病原微生物之组成物,包括如上述权利要求中任一项之通式(I)之化合物及一或多种惰性载体。

6. 一种组成物,包括如上述权利要求中任一项之通式(I)之化合物及或一或多种选自下列之活性相容化合物:杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物性杀虫剂、除草剂、植物生长调节剂、抗生素、肥料及或其混合物。

7. 根据权利要求5或6所述的组成物,其中,相对于该组成物的总重量,具有通式(I)之化合物的浓度范围为1至90重量%,较佳地,相对于该组成物的总重量为5至50重量%。

8. 一种如上述权利要求中任一项之通式(I)之化合物之用途,其系用于控制农业作物及或园艺作物之植物病原真菌、细菌、昆虫、线虫、螨。

9. 一种如权利要求1至4项之通式(I)之化合物或如权利要求5至7项中任一项之组成物之用途,其系用于控制或预防农业作物及或园艺作物之植物病原真菌。

10. 一种如权利要求5至7项中任一项之组成物之用途,其系用于控制或预防农业作物及或园艺作物之植物病原真菌、细菌、昆虫、线虫、螨。

11. 一种如权利要求1至4项中任一项之通式(I)之化合物或如权利要求5至7项中任一项之组成物之用途,其中,该农业作物为谷类、玉米、稻米、大豆及其他豆科植物、果实及果树、坚果和坚果树、柑橘和柑橘树、任何园艺植物、瓜科、油质植物、烟草、咖啡、茶、可可树、甜菜、甘蔗、棉花、马铃薯、番茄、洋葱、胡椒及其他蔬菜、及观赏类。

12. 一种控制或防止有用植物受农业作物及或园艺作物中之植物病原微生物感染之方法,其中,将如权利要求1至4项中任一项之通式(I)之化合物或如权利要求5至7项中任一项之组成物施用到植物、到其部分或其所在地。

13. 一种控制或防止有用植物受到农业作物及或园艺作物中之植物病原微生物感染之方法,其中,将如权利要求1至4项中任一项之通式(I)之化合物或如权利要求5至7项中任一项之组成物施用到植物的种子。

14. 一种控制或防止农业作物及或园艺作物中之植物病原微生物之方法,使用如权利要求1至4项中任一项之通式(I)之化合物或如权利要求5至7项中任一项之组成物,其系由以每公顷的农业或园艺作物范围施用化合物或组成物之有效剂量范围为1g至5kg的量组成。

4-经取代之苯胺衍生物及其在对抗不欲之植物病原微生物 以保护作物上之用途

技术领域

[0001] 本发明系关于意于对抗不欲之植物病原微生物以保护作物上之化合物。更精确地,本发明之标的系关于用于对抗不欲之植物病原微生物以保护作物上之4-经取代之苯胺衍生物。

背景技术

[0002] 控制由植物病原微生物导致对作物的损害在达到高作物效率上极度重要。例如,植物疾病损害观赏、蔬菜、牧场、谷物、及果实作物可导致显著生产力降低且因而造成消费者成本增加。商业上可获得许多产物来控制此等损害。持续需要更有效,成本更低,毒性更小,环境更安全,或/或具有不同的作用方式的新化合物。文献中揭露的某些苯胺衍生物为除害虫剂中之杀微生物活性成分。例如,W02000046184、W02003093224、W02003024219、W02005089547及W02005120234揭露单独或作为组成物部分使用苯胺衍生物,特别是苯基脒作为杀真菌剂。某些苯基苯甲酰胺化合物、产生此等化合物之方法及其用于控制不欲之微生物系揭露于W02004005242。

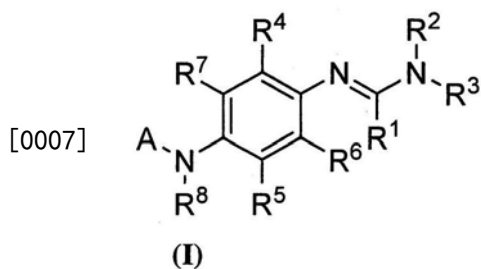
[0003] US4173637揭露苯基脒化合物及包含这些化合物之组成物作为杀虫剂。JP08291146揭露具有优异除草活性之N-取代之苯基磺酰胺化合物,特别是稻田除草剂。W02008110314揭露氟烷基苯基脒作为杀真菌化合物、其制备方法及使用此等化合物保护种子免于非所欲之微生物的方法。一另一PCT公开案W02011095462揭露包括甲酰胺之苯胺衍生物、制备彼等之方法及包括这些衍生物之杀虫、杀螨、杀线虫或灭螺组成物。

[0004] 先前技术中描述的苯胺衍生物之有效性良好,但是在许多情况中留下一些需求的东西。因此,农业上一向有高度兴趣使用新颖除害虫化合物以避免及/或控制对已知活性成分有抗性之微生物,诸如真菌或细菌病原体或害虫之发展。因此对于使用比已知的彼等更有活性之新颖化合物有高度兴趣,具有减少欲使用之活性化合物之量的目的,同时维持至少等同于已知化合物的有效性。

[0005] 吾等已发现新的化合物家族,其具有上述效果或优点。新的化合物家族,即4-经取代之苯胺衍生物,其中,根据本发明,苯基环经取代,使得无法预期且显著地较高活性对抗不欲之微生物诸如真菌或细菌病原体或害虫。

发明内容

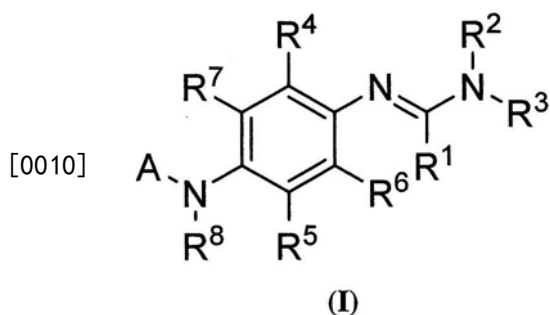
[0006] 本发明系关于通式(I)之4-经取代之苯胺衍生物



[0008] 其中,取代基的定义系于前述详细描述中定义。

具体实施方式

[0009] 因此,本发明系关于通式 (I) 之化合物



[0011] 其中,

[0012] R^1 系选自下列所组成之群组:氢、CN、 SR'' 、 $S(O)_nR''$ 、 OR'' 、 C_{1-12} -烷基、 C_{1-12} -烷氧基、 C_{1-12} -烷基硫基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{3-8} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基;其中在环状环系统中,一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代:N、O、及 $S(O)_n$;

[0013] R^2 及 R^3 系独立地选自下列所组成之群组:氢、CN、 $S(O)_nR''$ 、 OR' 、 $(C=O)-R''$ 、 C_{1-12} -烷基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{3-8} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基、 C_{5-18} -芳基、 C_{7-19} -芳烷基、 C_{7-19} -烷芳基;其中在环状环系统中,一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代:N、O、及 $S(O)_n$;

[0014] 与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起:C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员: $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 及 SiR'_2 之 R^1 及 R^2 、 R^2 及 R^3 或 R^1 及 R^3 可形成4至7员环,对于其部分,可经一或多个X、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、及 $CONR'_2$ 取代;且其中, R^1 、 R^2 、及 R^3 之基团全部可视需要经选自下列所组成群组之一或多个基团取代:X、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、及 $CONR'_2$;

[0015] R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 系独立地选自下列所组成之群组:氢、X、CN、SCN、 SF_5 、 $S(O)_nR''$ 、 SiR'_3 、 OR'' 、 $NR'R''$ 、 $(C=O)-R''$ 、 $CR'-NR''$ 、 C_{1-12} -烷基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{1-12} -卤烷氧基、 C_{1-12} -卤烷基硫基、 C_{3-8} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基、 C_{3-8} -环烷基氧基、 C_{3-8} -环烷基硫基、 C_{5-18} -芳基、 C_{7-19} -芳烷基、 C_{7-19} -烷芳基;其中在环状环系统中,一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代:N、O、及 $S(O)_n$;且上述基团全部可视需要经选自下列所组成群组之一或多个基团取代:X、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、及 $CONR'_2$;或

[0016] 其中,与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起:C、N、

O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员： $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 及 SiR'_2 之 R^4 及 R^7 或 R^5 及 R^6 可形成4至7员环，对于其部分，可经一或多个 X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、及 $CONR'_2$ 取代；及其中， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 之基团全部可视需要经选自下列所组成群组之一或多个基团取代： X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、及 $CONR'_2$ ；

[0017] R^8 系选自下列所组成之群组：氢、 CN 、 SCN 、 $S(O)_nR''$ 、 SiR'_3 、 $NR'R''$ 、 $(C=O)-R''$ 、 $CR'=NR''$ 、 C_{1-12} -烷基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{3-8} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基、 C_{5-18} -芳基、 C_{7-19} -芳烷基、 C_{7-19} -烷芳基、杂环基、 C_{3-8} -杂环基烷基；其中在环状环系统中，一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代： N 、 O 、及 $S(O)_n$ ；且上述基团全部可经选自下列所组成群组之一或多个基团取代： X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、及 $CONR'_2$ ；或其中，

[0018] A 系选自下列所组成之群组：稠合或非稠合之 C_{6-18} -芳基、 C_{5-18} -杂芳基，其中，一或多个碳原子经选自下列的杂原子取代： N 、 O 、 S ，并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员： $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 及 SiR'_2 ，其视需要经一或多个 R^9 之基团取代；其中，

[0019] R^9 系选自下列所组成之群组：氢、 X 、 CN 、 SCN 、 SF_5 、 R'' 、 OR'' 、 NO_2 、 NR''_2 、 SiR'_3 、 $(C=O)-R''$ 、 $S(O)_nR''$ 、 $OS(O)_nR''$ 、 $OSiR'_3$ 、 $NR'S(O)_nR''$ 、 C_{1-8} -烷基- $S(O)_nR''$ 、 C_{1-8} -烷基- $(C=O)-R''$ 、 $CR'=NR''$ 、 $S(O)_nC_{5-18}$ -芳基、 $S(O)_nC_{7-19}$ -芳烷基、 $S(O)_nC_{7-19}$ -烷芳基、 C_{1-12} -烷基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{2-12} -卤炔基、 C_{1-12} -烷氧基、 C_{1-12} -烷基硫基、 C_{1-12} -卤烷氧基、 C_{1-12} -卤烷基硫基、 C_{3-12} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{5-8} -环炔基、 C_{3-8} -环烷基氧基、 C_{3-8} -环烷基硫基、 C_{7-19} -芳烷基、 C_{7-19} -烷芳基；双环 C_{5-12} -烷基、 C_{7-12} -烯基；其中在环状环系统中，一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代： N 、 O 、及 $S(O)_n$ ；且上述基团全部可经选自下列所组成群组之一或多个基团取代： X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、及 $CONR'_2$ ；或与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起： C 、 N 、 O 、 S 并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员： $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 及 SiR'_2 之二个 R^9 可形成4至10员环，对于其部分，可经一或多个 X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、及 $CONR'_2$ 取代；

[0020] 以及其中， R^8 及 R^9 之基团全部可视需要经选自下列所组成群组之一或多个基团取代： X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、及 $CONR'_2$ ；

[0021] 其中，

[0022] X 代表卤素；

[0023] 其中，

[0024] R' 代表氢、直链或支链 C_{1-12} -烷基或环状 C_{3-10} -烷基，其视需要经一或多个 X 取代；

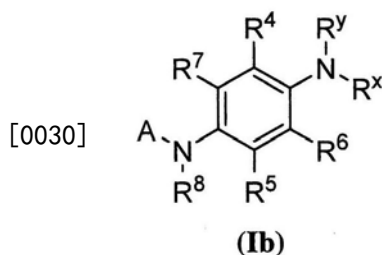
[0025] R'' 代表氢； NR'_2 、 OR' 、直链或支链 C_{1-12} -烷基、 C_{1-12} -卤烷基、环状 C_{3-8} -烷基，其视需要经一或多个选自下列所组成群组之基团取代： X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、及 $CONR'_2$ 、视需要经一或多个 R' 取代之 C_{5-18} -芳基；

[0026] 其中，

[0027] m 及 n 代表整数，其中 $n=0$ 、1或2；且 $m=1$ 或2；

[0028] 及该化合物之农事上可接受之盐、金属络合物、异构物/结构异构物、立体异构物、非镜像异构物、镜像异构物、互变异构物、或 N -氧化物。

[0029] 根据一另外具体实施例，通式(Ib)之化合物进一步可如下描述



[0031] 其中,

[0032] R^x 及 R^y 系选自下列所组成之群组:氢、羟基、CN、NO₂、COOR'、S(O)_nR''、OR'、(C=O)-R''、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₁₂-烯基、C₂₋₁₂-炔基、C₃₋₈-环烷基、C₄₋₈-环烯基、C₅₋₈-环炔基、C₅₋₁₈-芳基、C₇₋₁₉-芳烷基、C₇₋₁₉-烷芳基;其中在环状环系统中,一或多个碳原子可经选自下列所组成之群组的杂原子取代:N、O、及S(O)_n;或

[0033] 与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起:C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员:C(=O)、C(=S)、S(O)_m及SiR'₂之 R^x 及 R^y 可形成3至7员环,对于其部分,可经一或多个X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₂、COOR'、CN、及CONR'₂取代;

[0034] 且其中,所有其他取代基 R^4 至 R^9 系如第一具体实施例中所定义。

[0035] 在一另一具体实施例较佳取代中,通式(I)之化合物的 R^1 为氢、C₁₋₁₂-烷基、C₁₋₁₂-烷氧基、C₁₋₁₂-烷基硫基、C₁₋₁₂-卤烷基、C₃₋₈-环烷基;

[0036] 在一另一具体实施例更佳取代中,通式(I)之化合物的 R^1 为氢、C₁₋₆-烷基;

[0037] 在一另一具体实施例较佳取代中,通式(I)之化合物的 R^2 及 R^3 为C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₁₂-炔基、C₁₋₁₂-烷氧基、C₁₋₁₂-烷基硫基、C₁₋₁₂-卤烷基、C₃₋₈-环烷基;

[0038] 在一另一具体实施例中,与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起:C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员:C(=O)、C(=S)、S(O)_m及SiR'₂之 R^1 及 R^2 、 R^2 及 R^3 或 R^1 及 R^3 可形成4至7员环,对于其部分,可经一或多个X、R'、OR'、SR'及CN取代;

[0039] 在一另一具体实施例中,和与其所附接之原子一起之取代 R^1 及 R^2 、 R^2 及 R^3 或 R^1 及 R^3 的较佳环形成结构为吡啶、吡咯啉、咪唑啉、恶唑啉、哌啶、吗啉、硫吗啉、哌嗪、1-甲基哌嗪、1-甲基吡咯啉、1-甲基哌啶、3-甲基-1,3-硫杂氮杂环己烷(3-methyl-1,3-thiazinane);

[0040] 在一另一具体实施例较佳取代中,通式(I)之化合物的 R^4 及 R^5 为X、CN、S(O)_nR''、NR'R''、(C=O)-R''、CR'=NR''、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₁₋₁₂-卤烷基、C₁₋₁₂-卤烷基硫基、C₃₋₈-环烷基、C₃₋₈-环烷基硫基。

[0041] 在一另一具体实施例较佳取代中,通式(I)之化合物的 R^6 及 R^7 为氢、X、CN、S(O)_nR''、NR'R''、(C=O)-R''、CR'=NR''、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₁₋₁₂-卤烷基、C₁₋₁₂-卤烷基硫基、C₃₋₈-环烷基、C₃₋₈-环烷基硫基。

[0042] 在一另一具体实施例较佳取代中,通式(I)之化合物上的 R^8 为氢、CN、S(O)_nR''、NR'R''、(C=O)-R''、CR'=NR''、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₆-烯基、C₂₋₆-炔基、C₁₋₁₂-卤烷基、C₃₋₈-环烷基、C₃₋₆-杂环基、C₃₋₆-杂环基烷基;

[0043] 在一另一具体实施例较佳取代中,通式(I)之化合物上的 R^9 为X、CN、SCN、SF₅、R''、OR''、NO₂、NR''₂、SiR'₃、(C=O)-R''、S(O)_nR''、OS(O)_nR''、OSiR'₃、NR'S(O)_nR''、C₁₋₈-烷基-S(O)

nR'' 、 C_{1-8} -烷基- $(C=O)-R''$ 、 $CR'=NR''$ 、 SC_{1-12} -烷基、 C_{2-12} -烯基、 C_{2-12} -炔基、 C_{1-12} -卤烷基、 C_{2-12} -卤烯基、 C_{1-12} -烷氧基、 C_{1-12} -烷基硫基、 C_{1-12} -卤烷氧基、 C_{1-12} -卤烷基硫基、 C_{3-12} -环烷基、 C_{4-8} -环烯基、 C_{3-8} -环烷基氧基、 C_{3-8} -环烷基硫基。

[0044] 在一另一具体实施例中,与其所附接之原子一起或与选自下列所组成之群组的另外原子一起:C、N、O、S并视需要包括选自下列所组成群组的1至3环员:C(=O)、C(=S)、S(O)_m及SiR'₂之二个R⁹取代可形成4至10员环,对于其部分,可经一或多个X、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂取代;

[0045] 在一另一具体实施例中,较佳A为苯基、萘基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、噻唑基、异恶唑基、异噻唑基、噻二唑基、吡唑基、呋唑基、咪唑基、恶二唑基、三唑基、吡啶基、噻嗪基、嘧啶基、吡嗪基、三嗪基、吡啶基、苯并咪唑基、吡唑基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、苯并噻唑基、苯并噻唑基、喹啉基、异喹啉基、喹唑啉基、噌喹基(cinnonyl);其经一或多个R⁹取代。

[0046] 在一另一具体实施例中,A为苯基、萘基、噻吩基、噻唑基、异噻唑基、噻二唑基、呋唑基、异恶唑基、恶二唑基、吡啶基、噻嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基;其经一或多个R⁹取代。

[0047] 在一另一具体实施例中,R¹至R⁸可进一步视需要经一或多个选自下列所组成群组之基团取代:X、R''、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、及CONR'₂;

[0048] 在一另一具体实施例中,较佳通式(I)之化合物为:

[0049] N'-(2,5-二甲基-4-(苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(N'-(2,5-dimethyl-4-(phenylamino)phenyl)-N-ethyl-N-methylformimidamide);

[0050] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0051] N'-(2-氯-5-甲基-4-(苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0052] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0053] N'-(2,5-二甲基-4-(N-苯基甲基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0054] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-甲基-4-(全氟丙烷-2-基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0055] N'-(4-((4-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0056] N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0057] N'-(4-((3,4-二氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0058] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3,4,5-三氟苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0059] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(间甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0060] N'-(2-氯-4-((3,4-二氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0061] N'-(2-氯-4-((3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0062] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰

亚胺化物；

[0063] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(对甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0064] N'-(2-氯-4-((2-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0065] N'-(2-氯-5-甲基-4-(N-苯基甲基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0066] N'-(2-氯-4-((2-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0067] N'-(2-氯-4-((4-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0068] N'-(2-氯-4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0069] N'-(2-氯-4-((4-甲氧基-3-甲基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0070] N'-(2-氯-4-((3,4-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0071] N'-(2-氯-4-((3,5-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0072] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(间甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0073] N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0074] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(对甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0075] N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0076] N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0077] N'-(2,5-二甲基-4-(间甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0078] N'-(2,5-二甲基-4-(对甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0079] N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0080] N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0081] N'-(4-((2-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0082] N'-(2-氯-4-((2-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0083] N-乙基-N'-(4-((2-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0084] N-乙基-N'-(4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0085] N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化

物;

[0086] N-乙基-N'-(4-((3-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0087] N-乙基-N'-(4-((4-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0088] N'-(4-((2-氯苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0089] N-(4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-苯基乙酰胺;

[0090] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(吡啶-2-基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0091] N'-(4-((4-氯苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0092] N-乙基-N'-(4-((4-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0093] N-乙基-N'-(4-((2-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0094] N-乙基-N'-(4-((3-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0095] N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0096] N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0097] N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺;

[0098] N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0099] N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((哌啶-1-基亚甲基)胺基)苯胺;

[0100] N-烯丙基-N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0101] N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-异丙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0102] N'-(4-((2-溴苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0103] N'-(4-((3-氯苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0104] N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0105] N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0106] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0107] N'-(2,5-二甲基-4-((4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0108] N'-(2,5-二甲基-4-((3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0109] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0110] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0111] N'-(2,5-二甲基-4-((3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺

化物；

[0112] N'-(4-((2-溴苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0113] N-乙基-N'-(4-((2-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0114] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0115] N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0116] N'-(2-氯-5-甲基-4-(间甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0117] N'-(2-氯-4-((3-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0118] N'-(2-氯-5-甲基-4-(邻甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0119] N'-(2-氯-4-((4-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0120] N'-(2,5-二甲基-4-(邻甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0121] N'-(2-氯-4-((4-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0122] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(邻甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0123] N'-(4-((2-溴苯基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0124] N'-(4-((2-溴苯基)(甲基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0125] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(邻甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0126] N'-(2-氯-4-((2-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0127] N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0128] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0129] N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0130] N'-(2-氯-4-((3-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0131] N'-(2-氯-4-((4-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0132] N'-(2-氯-4-((3-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0133] N'-(2-氯-4-((4-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0134] N'-(2,5-二甲基-4-((3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

- [0135] N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0136] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0137] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0138] N'-(4-((2,6-二氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0139] N'-(2-氯-4-((2,6-二氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0140] N'-(4-((2,6-二氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0141] N'-(2-氯-4-((2,6-二氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0142] N'-(4-((2-氯-6-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0143] N'-(2-氯-4-((2-氯-6-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0144] N'-(4-((2-氯-6-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0145] N'-(2,5-二甲基-4-((4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0146] N'-(4-((2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0147] N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0148] N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0149] N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0150] N'-(2,5-二甲基-4-((4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0151] N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0152] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0153] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0154] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0155] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0156] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0157] N'-(2-氯-5-甲基-4-(N-苯基乙基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0158] N'-(2-氯-4-((2,4-二氯-6-(三氟甲基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0159] N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0160] N'-(2-氯-4-((2-氯-6-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0161] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0162] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0163] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0164] N'-(2,5-二甲基-4-((2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0165] N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0166] N'-(4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0167] N'-(2,5-二甲基-4-((4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0168] N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0169] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0170] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0171] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0172] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0173] N'-(4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0174] N'-(2,5-二甲基-4-((3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲

酰亚胺化物；

[0175] N'-(2,5-二甲基-4-((4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0176] N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0177] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0178] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0179] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0180] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0181] N'-(2,5-二甲基-4-((3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0182] N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0183] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0184] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0185] N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0186] N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0187] N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0188] N'-(2-氯-4-((4-(二甲基胺基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0189] N'-(4-((4-(二甲基胺基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0190] N'-(2-氯-4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0191] N'-(2-氯-4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0192] N'-(4-((3-(二氟甲氧基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0193] N'-(4-((3-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0194] N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0195] N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0196] N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0197] N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0198] N'-(2-氯-4-((4-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0199] N'-(4-((2,5-二氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0200] N'-(2-氯-4-((2,5-二氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0201] N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0202] N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0203] N'-(2,5-二甲基-4-((5-甲基-2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0204] N'-(4-((2,5-二氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0205] N'-(2-氯-4-((2,5-二氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0206] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(5-甲基-2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0207] N'-(4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0208] N'-(2-氯-4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0209] N'-(4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0210] N'-(2-氯-4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0211] N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0212] N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0213] N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0214] N'-(4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0215] N'-(2-氯-4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0216] N'-(4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0217] N'-(2-氯-4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0218] N'-(2,5-二甲基-4-((2-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0219] N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0220] N'-(2-氯-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0221] 5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺;

[0222] N'-(2-氯-4-(N-(2-氟苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0223] N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氟苯基)乙酰胺;

[0224] N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N,N-二甲基甲酰亚胺化物;

[0225] N'-(2-氯-4-(乙基(2-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0226] 5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺;

[0227] 5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-硫吗啉基亚甲基)胺基)苯胺;

[0228] N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0229] N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)(甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0230] N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氯苯基)乙酰胺;

[0231] N'-(2-氯-4-(N-(2-氯苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0232] N'-(4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0233] N'-(2-氯-4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0234] N'-(4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0235] N'-(2-氯-4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-

甲基甲酰亚胺化物；

[0236] N'-(2-氯-4-(乙基(苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0237] N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-苯基乙酰胺；

[0238] N'-(2-氯-4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0239] N'-(2-氯-4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0240] N'-(2-氯-4-(乙基(3-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0241] N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0242] N'-(2-氯-4-(N-(3-甲氧基苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0243] N'-(4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0244] N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0245] N'-(4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0246] N'-(4-((2,5-二甲基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0247] N'-(2-氯-4-((2,5-二甲基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0248] N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氯苯基)丙酰胺；

[0249] N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-甲氧基苯基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0250] N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0251] N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氟苯基)丙酰胺；

[0252] N'-(2-氯-4-(N-(4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0253] N'-(2,5-二甲基-4-((3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0254] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物；

[0255] N-乙基-N'-(4-((2-氟-5-甲基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物；

- [0256] N-乙基-N'-(5-氟-4-((2-氟苯基)氨基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0257] N-乙基-N'-(4-((2-氟-5-甲基苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0258] N'-(2-氯-4-((2-氟-5-甲基苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0259] N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(苯基氨基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0260] N'-(4-((2-氯苯基)氨基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0261] N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)氨基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0262] N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(间甲苯基氨基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0263] N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)氨基)亚甲基)氨基)-2-甲基苯基)-N-苯基丙酰胺;
- [0264] N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)氨基)亚甲基)氨基)-2-甲基苯基)-N-(3-甲氧基苯基)乙酰胺;
- [0265] N'-(2-氯-4-((4-氟-3-甲氧基苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0266] N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-甲氧基苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0267] N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-甲氧基苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0268] N'-(4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0269] N'-(4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0270] N'-(2-氯-4-((4-氟-3-甲氧基苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0271] N'-(2-溴-6-氟-3-甲基-4-(苯基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0272] N'-(2-氯-5-甲基-4-((5-侧氧基-5,6,7,8-四氢萘-2-基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0273] N'-(2-溴-6-氟-3-甲基-4-(甲基(苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0274] N'-(2-氯-5-甲基-4-((1-甲基吡啶-5-基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0275] N'-(2,5-二甲基-4-((5-侧氧基-5,6,7,8-四氢萘-2-基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0276] N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(甲基(苯基)氨基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0277] N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)(甲基)氨基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;
- [0278] N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(甲基(间甲苯基)氨基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0279] N-乙基-N'-(7-((2-甲氧基苯基)氨基)-2,3-二氢-1H-茚-4-基)-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0280] N-乙基-N-甲基-N'-(7-(对甲苯基氨基)-2,3-二氢-1H-茚-4-基)甲酰亚胺化物;

[0281] N'-(7-((4-氯苯基)氨基)-2,3-二氢-1H-茚-4-基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0282] N-乙基-N-甲基-N'-(4-(苯基氨基)萘-1-基)甲酰亚胺化物;

[0283] N'-(2,5-二甲基-4-(吡啶-2-基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0284] N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(吡啶-2-基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物及

[0285] N'-(2-氯-5-甲基-4-(吡啶-2-基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;

[0286] *使用Chemdraw Professional 16.0产生的化合物名称

[0287] 化合物中不对称中心的数量而定,根据本发明之化合物任一可以一或多种光学、几何或掌性异构物形式存在。本发明因此同等地关于所有光学异构物及其外消旋或非外消旋(scalemic)混合物(术语“非外消旋(scalemic)”表示不同比例之镜像异构物的混合物),且关于以所有比例之所有可能立体异构物的混合物。非镜像异构物及/或光学异构物可根据发明所属技术领域中具有通常知识者本身已知的方法分离。

[0288] 视化合物中双键数量而定,根据本发明之化合物任一亦可以一或多种几何异构物形式存在。本发明因此同等地关于所有几何异构物及关于所有以所有比例之可能的混合物。几何异构物可根据发明所属技术领域中具有通常知识者本身已知的一般方法分离。

[0289] 视其制备、纯化储存及各种其他影响因素而定,根据本发明之化合物任一亦可以一或多种无定形或同形或多形形式存在。本发明因此关于以所有比例之所有可能之无定形、同形及多形形式。可根据发明所属技术领域中具有通常知识者本身已知的一般方法制备及/或分离及/或纯化无定形、同形及多形形式。

[0290] 于上述描述中,单独或在化合物用语诸如“烷基硫基”或“卤烷基”使用之术语“烷基”包括直链或支链烷基,诸如,甲基、乙基、正丙基、异丙基、或不同的丁基、戊基或己基异构物。

[0291] “烯基”包括直链或支链烯烃,诸如,乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、及不同的丁烯基、戊烯基及己烯基异构物。“烯基”亦包括多烯诸如,1,2-丙二烯基及2,4-己二烯基。

[0292] “炔基”包括直链或支链炔烃诸如,乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基及不同的丁炔基、戊炔基及己炔基异构物。“炔基”亦可包括多个三键之部分诸如,2,5-己二炔基。

[0293] “环烷基”或“环烷基”包括,例如,环丙基、环丁基、环戊基、及环己基。环烯基包括,例如,环丙烯基、环丁烯基、环戊烯基、及环己烯基。环炔基同样地指环状戊炔基、己炔、庚炔基及辛炔基。

[0294] “环烷基氧基”包括,例如,环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基。

[0295] “环烷基硫基”包括,例如,环丙基硫基、环丁基硫基、环戊基硫基。

[0296] 本文所用之术语“芳基”为包含任何以碳为主之芳香族基团的基团,包括,但不限于苯基、萘、联苯、蒽等。芳基可经取代或未经取代。此外,芳基可为单一环结构或包括为稠合环结构或经由一或多种桥接基团诸如,碳-碳键附接的多个环结构。

[0297] 术语“芳烷基”系指包括如上定义之烷基部分的芳基烃基团。例子包括苯甲基、苯

基乙基、及6-萘基己基。如本文所用,术语“芳烯基”系指包括如上定义之烯基部分及如上定义之芳基部分的芳基烃基团。例子包括苯乙烯基、3-(苯甲基)丙-2-烯基、及6-萘基己-2-烯基。

[0298] 术语“烷芳基”系指带有烷基之芳基;如本文所用,术语“烷芳基”包括经取代及未经取代之基团两者。烷芳基之一例子为4-甲基苯基。

[0299] “烷氧基”包括,例如,甲氧基、乙氧基、正丙基氧基、异丙基氧基及不同的丁氧基、戊氧基及己基氧基异构物。

[0300] “烷基硫基”包括支链或直链烷基硫基部分诸如,甲基硫基、乙基硫基、及不同丙基硫基、丁基硫基、戊基硫基及己基硫基异构物。

[0301] 与环连接的术语“杂”系指其中至少一环原子不为碳且可包含1至4个独立选自氮、氧及硫所组成群组之杂原子的环,前提为各环包括不超过4个氮、不超过2个氧及不超过2个硫。

[0302] 术语“杂环”意指其中至少一环原子不为碳且可包含杂原子独立选自氮、氧、硫、磷、硼等所组成群组之环状环系统。

[0303] 术语“杂环”可进一步分类为“非芳香族杂环”及“芳香族杂环或杂芳基”。

[0304] 术语“非芳香族杂环”包括稠合或未稠合3至15员、较佳地3至12员、饱和或完全或部分不饱和杂环、单环状或多环状(螺、稠合、桥联、无稠合)杂环,其中,杂原子系选自群组:氧、氮及硫;且若环包括超过一个氧原子,其未直接相邻;非芳香族杂环之非限制性例子包括氧杂环丁烷基、环氧乙烷基;氮杂环丙烷基;噻喃基(thiiranyl)、吡啶基、硫杂环丁烷基(thiethanyl)、二硫杂环丁烷基(dithiethanyl)、二吡啶基、2-四氢呋喃基;3-四氢呋喃基;2-四氢噻吩基;3-四氢噻吩基;2-吡咯啉基;3-吡咯啉基;3-异恶唑啉基;4-异恶唑啉基;5-异恶唑啉基;3-异四氢噻唑基;4-异四氢噻唑基;2-四氢哌喃基;4-四氢哌喃基。此定义亦适用于作为复合取代基一部份之杂环基,例如杂环基烷基(杂环基团包括上述定义之烷基部分)等,除非在他处具体定义。

[0305] 如本文所用术语“杂芳基芳基”为包含稠合或未稠合3至15员、较佳地3至12员更佳地5或6员;单环状或多环状不饱和环系统、包含选自下列群组之杂原子:氧、氮、硫、磷、硼等之基团。

[0306] 5员杂芳基之非限制性例子包括2-呋喃基;3-呋喃基;2-噻吩基;3-噻吩基;2-吡咯基;3-吡咯基;3-异恶唑基;4-异恶唑基;5-异恶唑基;3-异噻唑基;4-异噻唑基;5-异噻唑基;3-吡唑基;4-吡唑基;5-吡唑基;2-恶唑基;4-恶唑基;5-恶唑基;2-噻唑基;4-噻唑基;5-噻唑基;2-咪唑基;4-咪唑基;1,2,4-恶二唑-3-基;1,2,4-恶二唑-5-基;1,2,4-噻二唑-3-基;1,2,4-噻二唑-5-基;1,2,4-三唑-3-基;1,3,4-恶二唑-2-基;1,3,4-噻二唑-2-基及1,3,4-三唑-2-基;1-吡咯基;1-吡唑基;1,2,4-三唑-1-基;1-咪唑基;1,2,3-三唑-1-基;1,3,4-三唑-1-基等。

[0307] 6员杂芳基之非限制性例子包括2-吡啶基;3-吡啶基;4-吡啶基;3-嗒嗒基;4-嗒嗒基;2-嘧啶基;4-嘧啶基;5-嘧啶基;2-吡嗪基;1,3,5-三嗪-2-基;1,2,4-三嗪-3-基;1,2,4,5-四嗪3-基等。

[0308] 苯并稠合5-员杂芳基之非限制性例子包括吡啶-1-基;吡啶-2-基;吡啶-3-基;吡啶-4-基;吡啶-5-基;吡啶-6-基;吡啶-7-基;苯并咪唑-1-基;苯并咪唑-2-基;苯并咪唑-4-

基;苯并咪唑-5-基;吡唑-1-基;吡唑-3-基;吡唑-4-基;吡唑-5-基;吡唑-6-基;吡唑-7-基;吡唑-2-基;1-苯并呋喃-2-基;1-苯并呋喃-3-基;1-苯并呋喃-4-基;1-苯并呋喃-5-基;1-苯并呋喃-6-基;1-苯并呋喃-7-基;1-苯并噻吩-2-基;1-苯并噻吩-3-基;1-苯并噻吩-4-基;1-苯并噻吩-5-基;1-苯并噻吩-6-基;1-苯并噻吩-7-基;1,3-苯并噻唑-2-基;1,3-苯并噻唑-4-基;1,3-苯并噻唑-5-基;1,3-苯并噻唑-6-基;1,3-苯并噻唑-7-基;1,3-苯并恶唑-2-基;1,3-苯并恶唑-4-基;1,3-苯并恶唑-5-基;1,3-苯并恶唑-6-基;1,3-苯并恶唑-7-基等。

[0309] 苯并稠合6-员杂芳基之非限制性例子包括喹啉-2-基;喹啉-3-基;喹啉-4-基;喹啉-5-基;喹啉-6-基;喹啉-7-基;喹啉-8-基;异喹啉-1-基;异喹啉-3-基;异喹啉-4-基;异喹啉-5-基;异喹啉-6-基;异喹啉-7-基;异喹啉-8-基等。

[0310] 术语“卤素”单独或在化合物用语诸如“卤烷基”,包括氟、氯、溴或碘。再者,当用于化合物用语诸如“卤烷基”时,该烷基可部分或完全经可为相同或不同之卤素原子取代。“卤烷基”之非限制性例子包括氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、1,1-二氯-2,2,2-三氟乙基、及1,1,1-三氟丙-2-基。

[0311] 术语“卤烯基”、“卤炔基”、“卤烷氧基”、“卤烷基硫基”类似地定义,除了取代烷基,存在烯基、炔基、烷氧基及烷基硫基作为取代基之一部分。

[0312] 在取代基基团中的碳原子总数由“Ci-j”字首指出,其中i及j为1至21之数字。例如,C₁₋₃烷氧基表示甲氧基到丙氧基。在上述主张中,当式I之化合物包括一或多种杂环状环时,所有取代基通过任何可获得之碳或氮通过取代该碳或氮上的氢而附到接这些环。

[0313] 当化合物经带有下标(显示该取代基之数目可超过1)的取代基取代时,该取代基(当其超过1时)系独立地选自所定义之取代基群组。再者,当下标显示范围,如(R)_{i-j}时,则取代基数目可选自介于包含i和j之间的整数。

[0314] 当基团包含可为氢之取代基,例如R¹或R²时,则当此取代基为氢时,公认为此等同于该基团未经取代。

[0315] 本发明系进一步关于控制不需要之微生物之组成物,包括至少一种式(I)之化合物及一或多种惰性载剂。惰性载剂进一步包括农业上适合之助剂、溶剂、稀释剂、界面活性剂及/或增效剂等。

[0316] 本发明系进一步关于控制不需要之微生物的组成物,包括至少一种式(I)之化合物及/或一或多种选自下列之活性相容化合物:杀真菌剂、杀菌剂、杀螨剂、杀虫剂、杀线虫剂、除草剂、生物性杀虫剂、植物生长调节剂、抗生素、肥料及/或其混合物。

[0317] 本发明系进一步关于组成物,其中,具有通式(I)化合物的浓度范围相对于该组成物的总重量,自1至90重量%,较佳地相对于该组成物的总重量,自5至50重量%。

[0318] 本发明亦系关于控制不需要之微生物的方法,其中,施用式(I)之化合物到微生物及/或在其栖息地。

[0319] 本发明进一步提供保护种子对抗不需要之微生物的方法,通过使用经至少一种式(I)之化合物处理之种子。

[0320] 式(I)之化合物可具有有效杀微生物活性且在农业或园艺作物保护及在保护此等

材料中可用于控制不需要之微生物,诸如,真菌、昆虫、螨、线虫及细菌。

[0321] 式(I)之化合物可具有非常良好的杀真菌特性且可用在作物保护,例如控制根肿菌纲(Plasmodiophoromycetes)、卵菌纲(Oomycetes)、壶菌纲(Chytridiomycetes)、接合菌纲(Zygomycetes)、子囊菌纲(Ascomycetes)、担子菌纲(Basidiomycetes)及半知菌类(Deuteromycetes)。

[0322] 式(I)之化合物可用作作物保护之杀线虫剂,例如,用于控制小杆圆虫目(Rhabditida)、伪针线虫目(Dorylaimida)、及Tryplonchida。

[0323] 式(I)之化合物可用作作物保护之杀虫剂,例如,用于控制鳞翅目(Lepidoptera)、鞘翅目(Coleoptera)、半翅目(Hemiptera)、同翅目(Homoptera)、缨翅目(Thysanoptera)、双翅目(Diptera)、直翅目(Orthoptera)及等翅目(Isoptera)。

[0324] 式(I)之化合物可用作作物保护之杀螨剂,例如,用于控制节蜱总科(Eriophyoidea)、叶螨总科(Tetranychoidae)、走螨总科(Eupodoidea)及细螨科(Tarsonemidae)。

[0325] 式(I)之化合物可用作作物保护之杀菌剂,例如,用于控制假单胞菌科(Pseudomonadaceae)、根瘤菌科(Rhizobiaceae)、肠杆菌科(Enterobacteriaceae)、棒状杆菌科(Corynebacteriaceae)及链丝菌科(Streptomycetaceae)。

[0326] 式(I)之化合物可用作除草剂且有助于对抗广谱之经济上重要的单-及双子叶有害植物。单子叶阔叶杂草物种可包括来自一年生组的燕麦属(Avena)、黑麦草属(Lolium)、看麦娘属(Alopecurus)、鹧草属(Phalaris)、稗属(Echinochloa)、马唐属(Digitaria)、狗尾草属(Setaria)与莎草属(Cyperus)物种及多年生物种鹅观草属(Agrocyron)、狗牙根属(Cynodon)、白茅属(Imperata)与蜀黍属(Sorghum)及亦多年生莎草属(Cyperus)物种。双子叶阔叶杂草物种可包括在一年生系之猪殃殃属(Galium)、堇菜属(Viola)、婆婆纳属(Veronica)、野芝麻属(Lamium)、繁缕属(Stellaria)、苋属(Amaranthus)、白芥属(Sinapis)、番薯属(Ipomoea)、金午时花属(Sida)、菊科母菊属(Matricaria)与苣荬属(Abutilon)、及亦在多年生阔叶杂草例子中的旋花属(Convolvulus)、蓟属(Cirsium)、酸模属(Rumex)与蒿属(Artemisia)。发生在稻米的有害植物诸如,例如,稗属(Echinochloa)、慈菇属(Sagittaria)、泽泻属(Alisma)、荸荠属(Eleocharis)、莞属(Scirpus)与莎草属(Cyperus),可由式(I)之化合物控制。

[0327] 可使用式(I)之化合物于治疗性或保护性控制植物病原真菌。本发明因此亦系关于通过使用本发明活性成分或组成物而控制植物病原真菌之治疗性及保护性方法,其系施用于种子、植物或植物部分、果实或植物生长的土壤。

[0328] 可使用式(I)之化合物于控制或预防农业作物及或园艺作物之植物病原真菌、细菌、昆虫、线虫、螨。

[0329] 可使用式(I)之化合物于作物保护,其中,农业作物为谷类、玉米、稻米、大豆及其他豆科植物、果实与果树、坚果和坚果树、柑橘和柑橘树、任何园艺植物、瓜科、油质植物、烟草、咖啡、茶、可可树、甜菜、甘蔗、棉花、马铃薯、番茄、洋葱、胡椒及其他蔬菜、及观赏类。

[0330] 根据本发明,如上述定义载剂为天然或合成、有机或无机物质,其为了更好的应用性(特别是应用到植物或植物部分或种子),与活性成分混合或组合。可为固体或液体的载剂一般为惰性且应适于用在农业。

[0331] 有用的固体载剂包括例如铵盐与天然岩石粉,诸如,高岭土、黏土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土,及合成岩石粉,诸如,细分硅石、氧化铝与硅酸盐;用于颗粒的有用的固体载剂包括:例如,压碎及分份的天然岩石诸如,方解石、大理石、浮石、海泡石与白云石,及亦有无机及有机粉的合成颗粒、与有机材料诸如,纸、锯屑、椰子壳、玉米穗轴与烟草茎的颗粒;有用的乳化剂及/或泡沫成形剂包括:例如非离子性和阴离子性乳化剂,诸如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚、例如烷基芳基聚二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯及亦有蛋白质水解产物;适合的分散剂为非离子性及/或离子性物质,例如来自下述类别:醇-POE及/或-POP醚、酸及/或POP POE酯、烷基芳基及/或POP POE醚、脂肪及/或POP POE加成物、POE-及/或POP-多元醇衍生物、POE-及/或POP-山梨醇酐或-糖加成物、烷基或芳基硫酸酯、烷基-或芳基磺酸酯与烷基或芳基磷酸酯或对应之PO-醚加成物。另外,合适的为寡聚物或聚合物,例如衍生自乙烯系单体、自丙烯酸、自EO及/或PO单独或组合,例如,(聚)醇或(聚)胺之彼等。亦可能使用木质素及其磺酸衍生物、未改质及改质之纤维素、芳香族及/或脂肪族磺酸以及其与甲醛之加成物。

[0332] 活性成分可本身施用或转化成惯常调配物或以其调配物形式或由此制备的使用形式,诸如,即可使用溶液、乳剂、水系或油系悬浮液、粉剂、可湿性粉剂、糊剂、可溶性粉剂、可溶性锭剂、粉尘、可溶性颗粒、散布用颗粒、悬乳剂浓缩物、浸泡活性成分的天然产物、浸泡活性成分的合成物质、肥料还有在聚合物物质中之微胶囊。以惯常方式完成施用,例如通过浇水、喷洒、雾化、育苗箱、散布、喷粉、发泡、传播等。亦可能通过超低容量的方法部署活性成分或注射活性成分制剂/活性成分本身到土壤。亦可能处理植物的种子。

[0333] 活性成分亦可特意进一步转化成奈米调配物以进一步改良水溶性、热安定性、生物有效性、感官特性、及生理效能。

[0334] 再者,调配物类型的选择将视特定用途而定。

[0335] 可以本身已知的方式制备所述之调配物,例如通过混合活性成分与至少一种惯常增效剂、溶剂或稀释剂、乳化剂、分散剂及/或黏合剂或固定剂、润湿剂、防水剂,若适合与干燥剂及UV安定剂且若适合与染料及颜料、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、黏着剂、吉贝素还有其他处理助剂。

[0336] 本发明不仅包括已准备好使用且可以适合的设备部署到植物或种子之调配物,亦包括使用前必须以水稀释之商用浓缩物。

[0337] 所用的助剂可为适合赋予特定特性到组成物本身及/或到自彼衍生之制剂(例如喷雾液、拌种)之该些物质,诸如,某些技术特性及/或又特定生物特性。典型助剂包括增效剂、溶剂及载剂。

[0338] 适合的增效剂为,例如,水、极性及非极性有机化学液体,例如来自下述类别:芳香族及非芳香族烃(诸如,石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇及多元醇(其可视需要亦经取代、醚化及/或酯化)、酮类(诸如,丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪及油类)及(聚)醚、未经取代及经取代之胺、酰胺、内酰胺(诸如,N-烷基吡咯啉酮)及内酯、砒与亚砒(诸如,二甲基亚砒)。

[0339] 咸了解液化气体增效剂或载剂指为在标准温度及标准压力下为气体的液体,例如气溶胶推进剂,诸如,卤烃、抑或丁烷、丙烷、氮及二氧化碳。

[0340] 在调配物中,可能使用增黏剂诸如,羧基甲基纤维素、呈粉剂、颗粒或胶乳之天然及合成聚合物,诸如,阿拉伯胶、聚乙烯醇及聚乙烯乙酸酯,抑或天然磷脂,诸如,脑磷脂及

卵磷脂与合成磷脂。另外的添加剂可为矿物质、蔬菜油及甲基化种子油。

[0341] 若所使用的增效剂为水,亦可能使用,例如,有机溶剂作为助剂溶剂。有用的液体溶剂基本上为:芳香族诸如,二甲苯、甲苯或烷基苯、氯化芳香族或氯化脂肪族烃类诸如,氯苯、氯乙烯或二氯甲烷,脂肪族烃类诸如,环己烷或石蜡、例如石油分馏物,醇类诸如,丁醇或二醇及其醚与酯,酮类诸如,丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮、强极性溶剂诸如,二甲基甲酰胺与二甲基亚砷、抑或水。

[0342] 包含式(I)之化合物之组成物可另外包含进一步组分,例如界面活性剂。适合的界面活性剂为具有离子性或非离子性特性之乳化剂及/或泡沫成形剂、分散剂或润湿剂、或这些界面活性剂之混合物。其例子为聚丙烯酸之盐、木质素磺酸之盐、酚磺酸或萘磺酸之盐、环氧乙烷与脂肪醇或与脂肪酸或与脂肪胺之聚缩物、经取代之酚(较佳地为烷基酚或芳基酚)、磺基琥珀酸酯之盐、牛磺酸衍生物(较佳地为牛磺酸烷酯)、聚乙氧基化醇或酚之磷酸酯、多元醇之脂肪酯、及包含硫酸酯、磺酸酯与磷酸酯的化合物之衍生物,例如烷基芳基聚二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯、蛋白质水解产物、木质亚硫酸盐废液及甲基纤维素。若活性成分之一及/或惰性载体之一为不可溶于水且当施用在水中作用时,则存在界面活性剂为必要的。界面活性剂之比例为本发明组成物之介于5及40重量%。

[0343] 可能使用染料诸如,无机颜料,例如氧化铁、氧化钛及普鲁士蓝、及有机染料诸如,茜素染料、偶氮染料及金属酞青素染料、及微量营养素诸如铁、锰、硼、铜、钴、钼及锌之盐。

[0344] 进一步添加剂可为香料、矿物质或植物、视需要经改质之油类、蜡及营养素(包括微量营养素),诸如铁、锰、硼、铜、钴、钼及锌之盐。

[0345] 额外的组分可为安定剂,诸如冷安定剂、防腐剂、抗氧化剂、光安定剂、或其他改良化学及/或物理安定性之试剂。

[0346] 若适合,其他额外的组分亦可存在,例如保护胶体、黏合剂、黏着剂、增稠剂、触变物质、渗透剂、安定剂、螯合剂、复合物成形剂。一般而言,活性成分可与任何通常用于调配目地的固体或液体添加物组合。

[0347] 调配物一般包含介于0.05至99重量%、0.01至98重量%、较佳地介于0.1至95重量%、更佳地介于0.5至90%之活性成分、最佳地介于10至70重量%。

[0348] 上述之调配物可用于控制不需要之微生物,其中将包含式(I)之化合物的组成物施用到微生物及/或在其栖息地。

[0349] 可本身使用根据本发明式(I)之化合物、以及盐、N-氧化物、金属复合物、立体异构物或多形体或在其调配物中且可与已知的混合伙伴混合以扩大,例如,活性谱或避免抗性发展。已知的混合伙伴包括,例如,已知的杀真菌剂、杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、生物性杀虫剂及杀菌剂。亦可能为与其他已知的活性成分诸如,除草剂、或与肥料及生长调节剂、安全剂及/或讯息化合物一起的混合物。

[0350] 本文以非限制方式提供此等化学成分之例子。彼等的一些在本文以其已知且描述的通用名称提起,例如在Pesticide Manual 17th Ed.或可在网际网路搜寻(例如在www.alanwood.net/pesticides)。其他依照IUPAC命名规则通过其系统名称描述。

[0351] 以下描述的类别(A)至(O)之所有命名的混合伙伴可(若其官能基允许)视需要与适合的碱或酸形成盐类、显示为立体异构物(即使没有在每种情况下具体提到)或为多形体。其亦了解为包括在本文。这些例子为

[0352] A) 麦角固醇生物合成之抑制剂,例如 (A01) 杀螟丹 (aldimorph)、(A02) 阿扎康唑 (azaconazole)、(A03) 比多农 (bitertanol)、(A04) 糠菌唑 (bromuconazole)、(A05) 环丙唑醇 (cyproconazole)、(A06) 二氯三莖醇 (diclobutrazole)、(A07) 戴芬克座 (difenoconazole)、(A08) 达克座 (diniconazole)、(A09) 达克座-M、(A10) 多德芬 (dodemorph)、(A11) 多德芬乙酸酯、(A12) 依普座 (epoxiconazole)、(A13) 依塔克座 (etaconazole)、(A14) 芬瑞莫乳剂 (fenarimol)、(A15) 芬布克座 (fenbuconazole)、(A16) 芬黑沙麦 (fenhexamid)、(A17) 芬普定 (fenpropidin)、(A18) 芬普福 (fenpropimorph)、(A19) 福昆克座 (fluquinconazole)、(A20) 福普斗 (flurprimidol)、(A21) 护硅得 (flusilazole)、(A22) 护汰芬 (flutriafol)、(A23) 福克座 (furconazole)、(A24) 顺式福克座 (furconazole-cis)、(A25) 菲克利 (hexaconazole)、(A26) 依灭列 (imazalil)、(A27) 依灭列硫酸 (imazalilsulfate)、(A28) 易胺座 (imibenconazole)、(A29) 易克座 (ipconazole)、(A30) 灭特座 (metconazole)、(A31) 迈克尼 (myclobutanil)、(A32) 纳替泛 (naftifine)、(A33) 尼瑞莫 (nuarimol)、(A34) 欧斯克座 (oxpoconazole)、(A35) 巴克素 (paclobutrazol)、(A36) 派福柔 (pefiirazoate)、(A37) 平克座 (penconazole)、(A38) 皮波宁 (piperalin)、(A39) 扑克拉 (prochloraz)、(A40) 普克利 (propiconazole)、(A41) 波沙克座 (prothioconazole)、(A42) 比堤克 (pyributicarb)、(A43) 比芬诺 (pyrifenox)、(A44) 昆诺克座 (quinconazole)、(A45) 西克座 (simeconazole)、(A46) 萆孢菌素 (spiroxamine)、(A47) 得克利 (tebuconazole)、(A48) 特宾泛 (terbinafine)、(A49) 四克利 (tetraconazole)、(A50) 三泰芬 (triadimefon)、(A51) 三泰隆 (triadimenol)、(A52) 三得芬 (tridemorph)、(A53) 赛福座 (triflumizole)、(A54) 赛福宁 (triforine)、(A55) 三替克座 (triticonazole)、(A56) 单克座 (uniconazole)、(A57) 单克座 (uniconazole)-p、(A58) 维宁克座 (viniconazole)、(A59) 佛瑞克座 (voriconazole)、(A60) 1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 环庚醇、(A61) 甲基-1-(2,2-二甲基-2,3-二氢-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸酯、(A62) N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基硅基) 丙氧基] 苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(A63) N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基硅基) 丙氧基] 苯基} 亚胺基甲酰胺、(A64) 0-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基]-1H-咪唑-1-硫代羧酸酯 (0-[1-(4-methoxyphenoxy)-3,3-dimethylbutan-2-yl]-1H-imidazole-1-carbothioate)、(A65) 啖菌唑 (pyrisoxazole)、(A66) 2-{{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A67) 1-{{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(A68) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(A69) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A70) 2-{{[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A71) 2-{{[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A72) 1-{{[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(A73) 1-{{[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(A74) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{{[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(A75) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{{[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二

氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(A76) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A77) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A78) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A79) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A80) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A81) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A82) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A83) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(A84) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(A85) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(A86) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、(A87) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(A88) 2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(A89) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(A90) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(A91) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(A92) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(A93)  (1S,2R,5R)-5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(A94) (1R,2S,5S)-5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(A95) 5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇。

[0353] B) 在复合物I或II之呼吸链抑制剂,例如(B01)拜沙芬(bixafen)、(B02)玻斯卡立(boscalid)、(B03)卡波辛(carboxin)、(B04)赛博酰胺(cypropamide)、(B05)二氟林(diflumerim)、(B06)芬福南(fenfuram)、(B07)福派南(fluopyram)、(B08)福多宁(flutolanil)、(B09)氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、(B10)福拉比(furametpyr)、(B11)福麦洛(furmecyclo)、(B12)异派然(isopyrazam)(同差向异构体(syn-epimeric)外消旋物1RS,4SR,9RS及反差向异构体(anti-epimeric)外消旋物1RS,4SR,9SR之混合物)、(B13)异派然(isopyrazam)(反差向异构体(anti-epimeric)外消旋物1RS,4SR,9SR)、(B14)异派然(isopyrazam)(反差向异构体(anti-epimeric)镜像异构物1R,4S,9S)、(B15)异派然(isopyrazam)(反差向异构体(anti-epimeric)镜像异构物1S,4R,9R)、(B16)异派然(isopyrazam)(同差向异构体(syn-epimeric)外消旋物1RS,4SR,9RS)、(B17)异派然(isopyrazam)(同差向异构体(syn-epimeric)镜像异构物1R,4S,9R)、(B18)异派然(isopyrazam)(同差向异构体(syn-epimeric)镜像异构物1S,4R,9S)、(B19)灭普宁(mepronil)、(B20)嘉保信(oxycarboxin)、(B21)氟唑菌苯胺(penflufen)、(B22)吡噻菌胺(penthiopyrad)、(B23)吡唑杀菌剂(pydiflumetofen)、(B24)先正达(sedaxane)、(B25)赛氟灭(thifluzamide)、(B26) 1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B27) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-

吡唑-4-甲酰胺、(B28) 3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B29) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙烷-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B30) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(B31) 苯并烯氟菌唑 (benzovindiflupyr)、(B32) N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-甲桥伸萘 (methanonaphthalen)-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B33) N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-甲桥伸萘 (methanonaphthalen)-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B34) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B35) 1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B36) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B37) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B38) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B39) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B40) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B41) 1,3,5-三甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B42) 1,3,5-三甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B43) 苯达宁 (benodanil)、(B44) 2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺、(B45) 艾索非他灭 (isofetamid)、(B46) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B47) N-(4'-氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B48) N-(2',4'-二氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B49) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B50) N-(2',5'-二氟联苯-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B51) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B52) 5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B53) 2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]烟碱酰胺、(B54) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B55) N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B56) 3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B57) N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B58) 2-氯-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)烟碱酰胺、(B59) 2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]烟碱酰胺、(B60) 4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1,3-噻唑-5-甲酰胺、(B61) 5-氟-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B62) 2-氯-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]烟碱酰胺、(B63) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B64) 5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B65) 2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]烟碱酰胺、(B66) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B67) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B68) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B69) 3-(二氟甲基)-N-甲氧基-1-甲基-N-

[1-(2,4,6-三氯苯基)丙烷-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B70) 3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B71) 3-(二氟甲基)-N-[(3,R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(B72) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺。

[0354] C) 在复合物III之呼吸链抑制剂,例如 (C01) 唑啉菌胺 (ametocetradin)、(C02) 安美速 (amisulbrom)、(C03) 啉菌酯 (azoxystrobin)、(C04) 赛座灭 (cyazofamid)、(C05) 甲香菌酯 (coumethoxystrobin)、(C06) 丁香菌酯 (coumoxystrobin)、(C07) 醚菌胺 (dimoxystrobin)、(C08) 因司唑宾 (enoxastrobin)、(C09) 恶唑菌酮 (famoxadone)、(C10) 咪唑菌酮 (fenamidone)、(C11) 烯肟菌酯 (fenaminstrobin)、(C12) 氟菌螨酯 (flufenoxystrobin)、(C13) 氟啉菌酯 (fluoxastrobin)、(C14) 克收欣 (kresoxim)-甲基、(C15) 苯氧菌胺 (metominostrobin)、(C16) 满得宾 (mandestrobin)、(C17) 肟醚菌胺 (oryastrobin)、(C18) 啉氧菌酯 (picoxystrobin)、(C19) 百克敏 (pyraclostrobin)、(C20) 唑胺菌酯 (pyrametostrobin)、(C21) 唑菌酯 (pyraoxystrobin)、(C22) 吡菌苯威 (pyribencarb)、(C23) 氯啉菌酯 (triclopyricarb)、(C24) 三氟敏 (trifloxystrobin)、(C25) (2E)-2-(2-[[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟啉啉-4-基]氧基]苯基)-2-(甲氧基亚胺基)-N-甲基乙酰胺、(C26) (2E)-2-(甲氧基亚胺基)-N-甲基-2-(2-[(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]胺基)氧基]甲基]苯基)乙酰胺、(C27) (2E)-2-(甲氧基亚胺基)-N-甲基-2-{2-[(E)-{(1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基)亚胺基)甲基]苯基}乙酰胺、(C28) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基)苯基]亚乙基]胺基)氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亚胺基)-N-甲基乙酰胺、(C29) 芬那冰 (fenaminostrobin)、(C30) 5-甲氧基-2-甲基-4-(2-[(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]胺基)氧基]甲基]苯基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(C31) 甲基 (2E)-2-[2-[(环丙基[(4-甲氧基苯基)亚胺基]甲基]硫烷基)甲基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸酯、(C32) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-甲酰胺基-2-羟基苯甲酰胺、(C33) 2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(C34) 2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(C35) (2E, 3Z)-5-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亚胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺。

[0355] D) 有丝分裂及细胞分裂的抑制剂,例如 (D01) 免赖得 (benomyl)、(D02) 贝芬替 (carbendazim)、(D03) 氯芬唑 (chlorfenazole)、(D04) 鲍灭尔 (diethofencarb)、(D05) 依杀伯 (ethaboxam)、(D06) 氟吡菌胺 (fluopicolide)、(D07) 麦穗宁 (fiiberidazole)、(D08) 宾克隆 (pencycuron)、(D09) 噻苯咪唑 (thiabendazole)、(D10) 多保净 (thiophanate)-甲基、(D11) 多保净 (thiophanate)、(D12) 苯酰菌胺 (zoxamide)、(D13) 5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]啉啉、(D14) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒嗪。

[0356] E) 能够具有多点 (multisite) 作用之化合物,例如 (E01) 波尔多 (bordeaux) 混合物、(E02) 杀菌丹 (captan)、(E03) 克菌仙丹 (captan)、(E04) 四氯异苯腈 (chlorothalonil)、(E05) 氢氧化铜、(E06) 环烷酸铜 (coppernaphthenate)、(E07) 氧化铜、(E08) 氧氯化铜、(E09) 硫酸铜 (2+)、(E10) 苯氟磺胺 (dichlofluanid)、(E11) 腈硫脲

(dithianon)、(E12) 多果定(dodine)、(E13) 多果定(dodine) 游离碱、(E14) 福美铁(ferbam)、(E15) 氟灭菌丹(fluorofolpet)、(E16) 灭菌丹(folpet)、(E17) 双胍辛胺(guazatine)、(E18) 双胍辛胺(guazatine) 乙酸酯、(E19) 克热净(iminoctadine)、(E20) 克热净苯磺酸盐(iminoctadine albesilate)、(E21) 克热净三乙酸盐、(E22) 代森锰铜(mancopper)、(E23) 代森锰锌(mancozeb)、(E24) 代森锰(maneb)、(E25) 代森联(metiram)、(E26) 代森联(metiram) 锌、(E27) 奥辛-铜、(E28) 普罗帕脒(propamidine)、(E29) 甲基代森锌(propineb)、(E30) 包含硫及硫制品之多硫化钙、(E31) 得恩地(thiram)、(E32) 甲苯氟磺胺(tolylfluanid)、(E33) 代森锌(zineb)、(E34) 福美锌(ziram)、(E35) 敌菌灵(anilazine)。

[0357] F) 能够诱导宿主防御之化合物,例如(F01) 拉酸式苯(acibenzolar)-S-甲基、(F02) 异噻菌胺(isotianil)、(F03) 烯丙苯噻唑(probenazole)、(F04) 噻酰菌胺(tiadinil)、(F05) 昆布多醣(laminarin)。

[0358] G) 胺基酸及/或蛋白质生物合成之抑制剂,例如(G01) 胺扑灭(andoprim)、(G02) 灭瘟素(blasticidin)-S、(G03) 噻菌环胺(cyprodinil)、(G04) 春日霉素(kasugamycin)、(G05) 春日霉素(kasugamycin) 盐酸盐水合物、(G06) 噻菌胺(mepanipyrim)、(G07) 噻霉胺(pyrimethanil)、(G08) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基) 喹啉、(G09) 氧四环素(oxytetracycline)、(G10) 链霉素(streptomycin)。

[0359] H) ATP生产之抑制剂,例如(H01) 三苯醋锡、(H02) 三苯锡氯(fentin chloride)、(H03) 三苯羟锡(fentinhydroxide)、(H04) 硅噻菌胺(silthiofam)。

[0360] I) 细胞壁合成之抑制剂,例如(I01) 苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(I02) 达灭芬(dimethomorph)、(I03) 氟吗啉(flumorph)、(I04) 丙森锌(iprovalicarb)、(I05) 双炔酰菌胺(mandipropamid)、(I06) 保粒霉素(polyoxins)、(I07) 多抗霉素(polyoxorim)、(I08) 焦曲菌素(validamycin) A、(I09) 伐利芬那(valifenalate)、(I10) 保粒霉素B(polyoxin B)、(I11) (2E)-3-(4-三级丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基) 丙-2-烯-1-酮、(I12) (2Z)-3-(4-三级丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基) 丙-2-烯-1-酮。

[0361] J) 脂质及膜合成之抑制剂,例如(J01) 联苯、(J02) 二氯甲氧苯(chloroneb)、(J03) 大克蓝(dicloran)、(J04) 护粒松(edifenphos)、(J05) 依得利(etridiazole)、(J06) 爱多卡(iodocarb)、(J07) 丙基喜乐松(iprobenfos)、(J08) 亚赐圃(isoprothiolane)、(J09) 普拔克(propamocarb)、(J10) 普拔克(propamocarb) 盐酸盐、(J11) 扑菌硫(prothiocarb)、(J12) 定菌磷(pyrazophos)、(J13) 五氯硝基苯(quintozene)、(J14) 四氯硝基苯(tecnazene)、(J15) 托克弗司(toclofos)-甲基。

[0362] K) 黑色素生物合成之抑制剂,例如(K01) 环丙酰菌胺(carpropamid)、(K02) 双氯氰菌胺(diclocymet)、(K03) 氰菌胺(fenoxanil)、(K04) 邻苯二甲内酯、(K05) 吡咯喹隆(pyroquilon)、(K06) 脱普洛卡(tolprocarb)、(K07) 三赛唑(tricyclazole)。

[0363] L) 核酸合成之抑制剂,例如(L01) 苯霜灵(benalaxyl)、(L02) 苯霜灵(benalaxyl)-M(克拉莱西(kiralaxyl))、(L03) 磺嘧菌灵(bupirimate)、(L04) 克劳拉康(clozylacon)、(L05) 二甲嘧酚(dimethirimol)、(L06) 乙菌定(ethirimol)、(L07) 呋霜灵(furalaxyl)、(L08) 恶霉灵(hymexazol)、(L09) 甲霜灵(metalaxyl)、(L10) 甲霜灵-M(高效甲霜灵(mefenoxam))、(L11) 甲呋酰胺(ofurace)、(L12) 恶霜灵(oxadixyl)、(L13) 奥索利酸

(oxolinic acid)、(L14) 辛噻酮(octhilinone)。

[0364] M) 讯息传递之抑制剂,例如(M01)乙菌利(chlozolate)、(M02)拌种咯(fenpiclonil)、(M03)咯菌腈(fludioxonil)、(M04)异菌脲(iprodione)、(M05)腐霉利(procymidone)、(M06)奎诺克西芬(quinoxifen)、(M07)伐菌唑灵(vinclozolin)、(M08)普奎那兹(proquinazid)。

[0365] N) 能作为解联剂之化合物,例如(N01)双苯唑菌醇(binapacryl)、(N02)消螨普(dinocap)、(N03)噻菌脲(ferimzone)、(N04)氟啶胺(fluzinam)、(N05)敌螨普(meptyldinocap)。

[0366] O) 另外的化合物,例如(O01)苯噻清(benthiazole)、(O02)苯噻恶嗪(bethoxazin)、(O03)卡巴西霉素(capsimycin)、(O04)香芹酮(carvone)、(O05)灭螨猛(chinomethionat)、(O06)必利农(pyriofenone)(克拉杂芬(chlazafenone))、(O07)铜合浦单剂(cufraneb)、(O08)赛扶芬纳米(cyflufenamid)、(O09)霜脲氰(cymoxanil)、(O10)解草磺酰胺(cyprosulfamide)、(O11)棉隆(dazomet)、(O12)咪菌威(debacarb)、(O13)双氯酚(dichlorophen)、(O14)二氯苯唑(dichlobentiazox)、(O15)哒菌清(diclomezine)、(O16)燕麦枯(difenzoquat)、(O17)甲基硫酸燕麦枯(difenzoquat metilsulfate)、(O18)二苯基胺、(O19)安费诺(ecomate)、(O20)芬普扎米(fenpyrazamine)、(O21)芬黑沙米(fenhexamine)、(O22)氟米脱弗(flumetover)、(O23)氟氯菌核利(fluoroimide)、(O24)磺菌胺(flusulfamide)、(O25)福鲁替尼(flutianil)、(O26)三乙膦酸铝(fosetyl-aluminium)、(O27)三乙膦酸钙(fosetyl-calcium)、(O28)三乙膦酸钠(fosetyl-sodium)、(O29)六氯苯、(O30)伊马美新(irumamycin)、(O31)异噻菌胺(isothianil)、(O32)磺菌威(methasulfocarb)、(O33)异硫氰酸甲酯、(O34)美查芬隆(metrafenone)、(O35)灭粉霉素(mildiomycin)、(O36)纳他霉素(natamycin)、(O37)二甲二硫胺甲酸镍、(O38)酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、(O39)恶莫克(oxamocarb)、(O40)氧芬新(oxyfenthin)、(O41)五氯酚及盐、(O42)苯氧司林(phenothrin)、(O43)皮卡布西(picarbutrazox)(O44)磷酸及其盐、(O45)普潘莫卡三乙膦酸盐(propamocarb-fosetate)、(O46)丙诺新钠盐(propanosine-sodium)、(O47)吡吗啉(pyrimorph)、(O48)匹拉米德(pyraziflumid)(O49)吡咯尼群(pyrrolnitrine)、(O50)特布氟啶(tebufloquin)、(O51)酞枯酸(tecloftalam)、(O52)特尼伐尼(tolnifanide)、(O53)咪唑嗪(triazoxide)、(O54)水杨菌胺(trichlamide)、(O55)氰菌胺(zarilamid)、(O56) (3S,6S,7R,8R)-8-苯甲基-3-[(3-[(异丁酰基氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基)羰基]胺基]-6-甲基-4,9-二侧氧基-1,5-二氧杂环壬烷-7-基-2-甲基丙酸酯、(O57) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(O58) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(O59) 奥赛普林(oxathiapiprolin)、(O60) 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基-1H-咪唑-1-羧酸酯、(O61) 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、(O62) 2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]噻啶-4(3H)-酮、(O63) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫杂环己烯并(dithiino)[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(O64) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5R)-5-苯基-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(O65) 2-[5-

甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苯基-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(066) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-]-基]-1-{4-[4-(5-苯基-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基}乙酮、(067) 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-苯并哌喃-4-酮、(068) 2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、(069) 2-苯基酚及盐、(070) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(071) 3,4,5-三氯吡啶-2,6-二甲腈、(072) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基喹啉、(073) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基喹啉、(074) 3-氯-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基喹啉、(075) 5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(076) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(077) 5-氟-2-[(4-氟苯甲基)氧基]嘧啶-4-胺、(078) 5-氟-2-[(4-甲基苯甲基)氧基]嘧啶-4-胺、(079) 5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(080) 乙基(2Z)-3-胺基-2-氰基-3-苯基丙烯酸酯、(081) N'-(4-{[3-(4-氯苯甲基)-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(082) N-(4-氯苯甲基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(083) N-[(4-氯苯基) (氰基) 甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(084) N-[(5-溴-3-氯吡啶-2-基) 甲基]-2,4-二氯烟碱酰胺、(085) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟碱酰胺、(086) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘烟碱酰胺、(087) N-{ (E)-[(环丙基甲氧基)亚胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺、(088) N-{ (Z)-[(环丙基甲氧基)亚胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺、(089) N'-{4-[(3-三级丁基-4-氰基-1,2-噻唑-5-基)氧基]-2-氯-5-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(090) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氢萘-1-基)-1,3-噻唑-4-甲酰胺、(091) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲酰胺、(092) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲酰胺、(093) 戊基{6-[((1-甲基-1H-四唑-5-基) (苯基) 亚甲基]胺基}氧基}甲基吡啶-2-基}胺甲酸酯、(094) 啡嗪-1-羧酸、(095) 喹啉-8-醇、(096) 喹啉-8-醇硫酸盐(2:1)、(097) 三级丁基{6-[((1-甲基-1H-四唑-5-基) (苯基) 亚甲基]胺基}氧基}甲基吡啶-2-基}胺甲酸酯、(098) (5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基)(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮、(099) N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔-1-基]氧基}-3-甲氧基苯基)thy1]-N2-(甲基磺酰基)缬酰胺、(0100) 4-侧氧基-4-[(2-苯基乙基)胺基]丁酸、(0101) 丁-3-炔-1-基{6-[((Z)- (1-甲基-1H-四唑-5-基) (苯基) 亚甲基]胺基}氧基}甲基吡啶-2-基}胺甲酸酯、(0102) 4-胺基-5-氟嘧啶-2-醇(互变异构物形式:4-胺基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(0103) 丙基3,4,5-三羟基苯甲酸酯、(0104) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-恶唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(0105) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-恶唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(0106) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-恶唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(0107) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)苯甲酰胺、(0108) 2-(6-苯甲基吡啶-2-基)喹啉、(0109) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹啉、(0110) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(0111) 脱落酸、(0112) N'-[5-溴-6-(2,3-二氢-1H-茛-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基

亚胺基甲酰胺、(0113) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0114) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0115) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0116) N'-{5-溴-6-[(cis-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0117) N'-{5-溴-6-[(反式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0118) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0119) N-环丙基-N-(2-环丙基苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0120) N-(2-三级丁基苯甲基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0121) N-(5-氯-2-乙基苯甲基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0122) N-(5-氯-2-异丙基苯甲基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0123) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0124) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0125) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0126) N-(2-环戊基-5-氟苯甲基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0127) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0128) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0129) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苯甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0130) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0131) N-(2-三级丁基-5-甲基苯甲基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0132) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苯甲基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0133) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苯甲基]-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0134) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苯甲基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0135) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苯甲基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0136) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酰胺、(0137) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧基甲酰胺、(0138) N'-{(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0139) N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0140) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(0141) 9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氢-1,4-苯并氧氮呼、(0142) 2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]苯基}丙-2-醇、(0143) 2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]-6-氟苯基}丙-2-醇、(0144) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(0145) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(0146) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(0147) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(0148) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(0149) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(0150) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(0151) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯

基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(0152) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(0153) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(0154) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(0155) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(0156) N'-(4-{3-[(二氟甲基)硫烷基]苯氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0157) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(1,1,2,2-四氟乙基)硫烷基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0158) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0159) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,3,3-四氟丙基)硫烷基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0160) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(五氟乙基)硫烷基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0161) N'-(4-{[3-(二氟甲氧基)苯基]硫烷基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0162) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]硫烷基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0163) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基]硫烷基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0164) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苯基]硫烷基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0165) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(五氟乙氧基)苯基]硫烷基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺、(0166) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(0167) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(0168) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(0169) 2-{3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(0170) 2-{3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯、(0171) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(0172) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(0173) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(0174) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(0175) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、h(0176) 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(0177) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(0178) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(0179) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌

啉-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯、(0180) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-恶唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯、(0181) (3S,6S,7R,8R)-8-苯甲基-3-{3-[(异丁酰基氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶胺基}-6-甲基-4,9-二侧氧基-1,5-二氧杂环壬烷-7-基异丁酸酯。

[0367] 如上所述,式(I)之化合物可与一或多种选自下列之活性相容化合物混合:杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂类别。杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂类别之活性成分由其已知且描述于,例如在The Pesticide Manual 17th Ed.的常见名称于本文指明或可在网际网路搜寻(例如在www.alanwood.net/pesticides)。

[0368] (1) 乙酰胆碱脂酶(AChE)抑制剂诸如,胺甲酸酯,例如棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、恶虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、布嘉信(butocarboxim)、丁酮威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、爱芬克(ethiofencarb)、丁基灭必虱(fenobucarb)、覆灭螨(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、灭必虱(isoprocab)、灭虫威(methiocarb)、纳乃得(methomyl)、必芬治(metolcarb)、殴杀灭(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫敌克(thiodicarb)、硫伐隆(thiofanox)、丁硫克百威(triazamate)、混灭威(trimethacarb)、XMC及灭尔虱(xylylcarb)或有机磷酸酯、诸如,殴杀松(acephate)、亚灭松(azamethiphos)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷(azinphos-methyl)、硫线磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲磷(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、香豆磷(coumaphos)、氰乃松(cyanophos)、灭赐松(demeton)-S-甲基、大利松(diazinon)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、双特松(dicrotophos)、大灭松(dimethoate)、二甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、EPN、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、氨磺磷(famphur)、芬灭松(fenamiphos)、扑灭松(fenitrothion)、芬杀松(fenthion)、噻唑膦(fosthiazate)、飞达松(heptenophos)、乙米西弗(imicyafos)、异柳磷(isofenphos)、异丙基O-(甲氧基氨基硫基-磷酰基)水杨酸酯、加福松(isoxathion)、马拉松(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、达马松(methamidophos)、灭大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亚素灵(monocrotophos)、二溴磷(naled)、殴灭松(omethoate)、氧基灭赐松(oxydemeton)-甲基、巴拉松(parathion)、巴拉松(parathion)-甲基、赛达松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益灭松(phosmet)、福赐米松(phosphamidon)、辛硫磷(phoxim)、虫螨磷(pirimiphos)-甲基、布飞松(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、白克松(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、拜裕松(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、亚培松(temephos)、托福松(terbufos)、杀虫威(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(triclorfon)及繁米松(vamidothion)。

[0369] (2) GABA-闸控氯离子通道拮抗剂,诸如,环二烯有机氯,例如氯丹与安杀番(endosulfan)或苯基吡唑(非普洛(fiproles)),例如依斯洛(ethiprole)与芬普尼(fipronil)。

[0370] (3) 钠通道调节剂/电压依赖性钠通道阻断剂,诸如,拟除虫菊酯(pyrethroids),

例如阿纳宁 (acrinathrin)、烯丙菊酯 (allethrin)、d-顺式-反式烯丙菊酯 (allethrin)、d-反式烯丙菊酯 (allethrin)、毕芬宁 (bifenthrin)、百亚烈宁 (bioallethrin)、百亚烈宁 (bioallethrin) S-环戊烯基异构物、灭虫菊 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、赛扶宁 (cyfluthrin)、β-赛扶宁 (cyfluthrin)、赛洛宁 (cyhalothrin)、λ-赛洛宁 (cyhalothrin)、γ-赛洛宁 (cyhalothrin)、赛灭宁 (cypermethrin)、α-赛灭宁 (cypermethrin)、β-赛灭宁 (cypermethrin)、θ-赛灭宁 (cypermethrin)、ζ-赛灭宁 (cypermethrin)、赛酚宁 (cyphenothrin) [(1R)-反式-异构物]、第灭宁 (deltamethrin)、益避宁 (empenthrin) [(EZ)-(1R)-异构物]、益化利 (esfenvalerate)、依芬宁 (etofenprox)、芬普宁 (fenpropathrin)、芬化利 (fenvalerate)、护赛宁 (flucythrinate)、氟氯苯氰菊酯 (flumethrin)、福化利 (tau-fluvalinate)、合芬宁 (halfenprox)、依普宁 (imiprothrin)、克特宁 (kadethrin)、莫氟杀林 (momfluorothrin)、氯菊酯 (permethrin)、酚丁灭虱 (phenothrin) [(1R)-反式-异构物]、炔丙菊酯 (prallethrin)、除虫菊酯 (pyrethrins) (除虫菊 (pyrethrum))、苜呋菊酯 (resmethrin)、硅护芬 (silafluofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、治灭宁 (tetramethrin)、治灭宁 (tetramethrin) [(1R)-异构物]、泰灭宁 (tralomethrin) 及四氟苯菊酯 (transfluthrin) 或 DDT 或 甲氧滴滴涕 (methoxychlor)。

[0371] (4) 烟碱酸乙酰胆碱受体 (nAChR) 竞争调节剂, 诸如, 新类尼古丁 (neonicotinoids), 例如亚灭培 (acetamiprid)、可尼丁 (clothianidin)、达特南 (dinotefuran)、益达胺 (imidacloprid)、烯啶虫胺 (nitenpyram)、赛果培 (thiacloprid) 及赛速安 (thiamethoxam) 或尼古丁或氟啶虫胺脒 (sulfoxaflor) 或氟比拉二福隆 (flupyradifurone)。

[0372] (5) 烟碱酸乙酰胆碱受体 (nAChR) 异位调节剂, 诸如, 多杀霉素类 (spinosyns), 例如赐诺特 (spinetoram) 及赐诺杀 (spinosad)。

[0373] (6) 麸胺酸盐-闸控氯离子通道 (GluCl) 异位调节剂, 诸如, 阿维菌素类 (avermectins)/米尔贝霉素 (milbemycins), 例如阿巴汀 (abamectin)、因灭汀 (emamectin) 苯甲酸盐、雷皮菌素 (lepimectin) 及密灭汀 (milbemectin)。

[0374] (7) 青春荷尔蒙模拟物, 诸如, 青春荷尔蒙类似物, 例如烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene) 及烯虫丙酯 (methoprene) 或芬诺克 (fenoxycarb) 或百利普芬 (pyriproxyfen)。

[0375] (8) 具有未知或非特异性作用机制的活性化合物, 诸如, 烷基卤化物例如作为甲基溴化物及其他烷基卤化物或氯化苦或氟化物或硼酸盐或吐酒石或甲基异氰酸酯产生剂。

[0376] (9) 弦音器 (Chordotonal organ) TRPV 通道调节剂, 诸如, 吡啶甲亚胺 (azomethine) 衍生物, 例如派灭净 (pymetrozine) 及派利氟喹拿松 (pyrifluquinazon) 或氟尼胺 (氟尼胺 (Flonicamid))。

[0377] (10) 螨生长抑制剂, 例如克芬螨 (clofentezine)、合赛多 (hexythiazox) 及氟螨嗪 (diflovidazin) 或依杀螨 (etoxazole)。

[0378] (11) 昆虫肠中肠之微生物破坏剂, 例如苏力菌以色列亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、苏力菌逢泽氏亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、苏力菌库斯克亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、苏力菌拟步行虫亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*) 及

球形杆菌 (*Bacillus sphaericus*) 与BT作物蛋白质:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A 105、Cry2Ab、Vip3a、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1。

[0379] (12) 粒线体ATP合成酶抑制剂诸如,有机锡杀螨剂例如亚环锡(azocyclotin)、三环锡(cyhexatin)及芬布赐(fenbutatin oxide)或汰芬诺克(diafenthiuron)或毆螨多(propargite)或得脱螨(tetradifon)。

[0380] (13) 经由中断质子梯度之氧化磷酸化作用之解联剂,例如克凡派(chlorfenapyr)、DNOC及氟虫胺(sulfluramid)。

[0381] (14) 烟碱酸乙酰胆碱受体(nAChR)通道阻断剂诸如,免速达(bensultap)、培丹(cartap)-盐酸盐、硫锡安(thiocyclam)及杀虫双(thiosultap)-钠。

[0382] (15) 几丁质生物合成之抑制剂,第0型,诸如,双三福隆(bistrifluoron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟螨脲(flucycloxuron)、氟虫脲(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、禄芬隆(lufenuron)、诺伐隆(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)及三福隆(triflumuron)。

[0383] (16) 几丁质生物合成之抑制剂,第1型,诸如,布芬净(buprofezin)。

[0384] (17) 蜕皮破坏剂(特别是在双翅类昆虫(Dipteran))、诸如,赛灭净(cyromazine)。

[0385] (18) 蜕皮激素受体促效剂,诸如,克灭芬诺(chromafenozide)、卤芬诺(halofenozide)、甲氧芬赛(methoxyfenozide)及得芬诺(tebufenozide)。

[0386] (19) 章鱼胺受体促效剂,诸如,双甲脒(amitraz)。

[0387] (20) 粒线体复合物III电子传递抑制剂,诸如,爱美松(hydramethylnon)或亚醯螨(acequinocyl)或噻螨酯(flucacrypyrim)或必芬螨(bifenazate)。

[0388] (21) 粒线体复合物I电子传递抑制剂,例如,METI杀螨剂及杀虫剂,例如芬杀螨(fenazaquin)、芬普螨(fenpyroximate)、毕汰芬(pyrimidifen)、毕达本(pyridaben)、得芬瑞(tebufenpyrad)及脱芬瑞(tolfenpyrad)或鱼藤酮(rotenone)(Derris)。

[0389] (22) 电压依赖性钠通道阻断剂,诸如,因得克(indoxacarb)或美氟综(metaflumizone)。

[0390] (23) 乙酰基CoA羧基酶之抑制剂,诸如,特窗酸及四密酸(tetramic acid)衍生物,例如赐派芬(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)及赐派灭(spirotetramat)。

[0391] (24) 粒线体复合物IV电子传递抑制剂,诸如,磷化物,例如磷化铝、磷化钙、磷化锌及磷或氰化物。

[0392] (25) 粒线体复合物II电子传递抑制剂,诸如, β -开托利(ketonitrile)衍生物,例如赛必芬螨(cyenopyrafen)与赛芬螨(cyflumetofen)或羧酰苯胺(carboxanilide)。

[0393] (28) 莱恩素(Ryanodine)受体调节剂,诸如,二酰胺,例如克安勃(chlorantraniliprole)、氰虫酰胺(cyantraniliprole)及氟大灭(flubendiamide)。

[0394] (29) 在未定义之目标位置的弦音器(Chordotonal organ)调节剂,诸如,氟尼胺(Flonicamid)。

[0395] 有未知或不确定的作用模式的另外活性成分,诸如,阿啡多片(afidopyropen)、阿芙索纳(afoxolaner)、印楝素(azadirachtin)、异噻虫啉(benclothiaz)、苯螨特(benzoximate)、必芬螨(bifenazate)、溴氟酰胺(broflanilide)、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨猛(chinomethionat)、冰晶石(cryolite)、环溴虫酰胺

(cyclaniliprole)、环氧虫啉(cycloxaprid)、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、二氯泰兹(dicloromezotiaz)、大克螨(dicofol)、氟螨四嗪(diflovidazin)、氟奎因(flometoquin)、氯氟氰虫酰胺(fluzaindolizine)、氟噻虫砒(fluensulfone)、噻虫胺(flufenerim)、氟菌酯(flufenoxystrobin)、丁烯氟虫腈(flufiprole)、菲杀砒(fluhexafon)、氟吡菌酰胺(fluopyram)、氟拉内(fluralaner)、氟米塔麦(fluxametamide)、呋喃虫酰肼(fufenozide)、戊吡虫胍(guadipyr)、七氟菊酯(heptafluthrin)、吡虫啉(imidaclothiz)、异菌脲(iprodione)、罗岚尼(lotilaner)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、呱虫啉(paichongding)、吡虫啉(pyflubumide)、三氟甲吡醚(pyridalyl)、吡啉啉啉(pyrifluquinazon)、噻菌酯(pyriminostrobin)、杀罗尼(sarolaner)、四氢吡吩(tetramethylfluthrin)、四硝基吡咯(tetraniliprole)、四氯虫酰胺(tetrachlorantraniliprole)、汰线芬(tioxazafen)、三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)与碘甲烷;再者,依据坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*) (I-1582, BioNeem, Votivo)之制品,以及如下之已知活性化合物:1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(已知来自W02006043635)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(已知来自W02003106457)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟碱酰胺(已知来自W02006003494)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(已知来自W02009049851)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-侧氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯(已知来自W02009049851)、4-(丁-2-in-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(已知来自W02004099160)、4-(丁-2-in-1-基氧基)-6-(3-氯苯基)嘧啶(已知来自W02003076415)、PF1364(CAS-注册号1204776-60-2)、甲基-2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)-5-氯-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼羧酸酯(已知来自W02005085216)、甲基-2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基肼羧酸酯(已知来自W02005085216)、甲基-2-[2-({[3-溴-1-(3-氯-吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼羧酸酯(已知来自W02005085216)、甲基-2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯-吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)苯甲酰基]-2-乙基肼羧酸酯(已知来自W02005085216)、N-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(已知来自CN102057925)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-恶唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧桥噻坦(oxidothietan)-3-基)苯甲酰胺(已知来自W02009080250)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(已知来自W02012029672)、1-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基]-4-侧氧基-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇盐(1-[(2-chloro-1,3-thiazol-5-yl)methyl]-4-oxo-3-phenyl-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olate)(已知来自W02009099929)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-侧氧基-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇盐(已知来自W02009099929)、4-(3-{2,6-二氯-4-[(3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氧基]苯氧基}丙氧基)-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(已知来自CN101337940)、N-[2-(三级丁基胺甲酰基)-4-氯-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(已知来自W02008134969)、丁基-[2-(2,4-二氯苯

基)-3-侧氧基-4-氧杂螺[4.5]癸-1-烯-1-基]碳酸酯(揭露于CN102060818)、3(E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-伸二氢吡啶基]-1,1,1-三氟丙-2-酮(已知来自W02013144213)、N-(甲基磺酰基)-6-[2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]吡啶-2-甲酰胺(已知来自W02012000896)、N-[3-(苯甲基胺甲酰基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(已知来自W02010051926)。

[0396] 式(I)之化合物可用于处理数种真菌病原体。依据本发明可处理的真菌疾病病原体之非限制性例子包括:

[0397] 白粉病病原体,例如布氏白粉菌属(*Blumeria species*),例如禾本科布氏白粉菌(*Blumeria graminis*);单囊壳属(*Podosphaera species*),例如白叉丝单囊壳(*Podosphaera leucotricha*);单丝壳属(*Sphaerotheca species*),例如红豆白粉病菌(*Sphaerotheca fuliginea*);钩丝壳属(*Uncinula species*),例如葡萄钩丝壳(*Uncinula necator*);白粉菌属(*Erysiphe species*),例如胡瓜白粉病(*Erysiphe cichoracearu*)所导致的疾病;

[0398] 锈病病原体,例如梨锈病菌属(*Gymnosporangium species*),例如梨锈病菌(*Gymnosporangium sabinae*);咖啡锈病属(*Hemileia species*),例如驼孢锈病菌(*Hemileia vastatrix*);锈菌属(*Phakopsora species*),例如大豆锈病菌(*Phakopsora pachyrhiz*)或山马蝗层锈菌(*Phakopsora meibomiae*);锈病菌属(*Puccinia species*),例如小麦赤锈病菌(*Puccinia recondita*),小麦秆锈病(*Puccinia graminis*)或小麦条锈病(*Puccinia striiformis*);豌豆锈病菌属(*Uromyces species*),例如疣顶单胞锈菌(*Uromyces appendiculatus*)所导致的疾病;

[0399] 来自卵菌纲(*Oomycetes*)群组的病原体,例如白锈病菌属(*Albugo species*),例如白锈菌(*Albugo candida*);莴苣露菌病菌属(*Bremia species*),例如莴苣龙舌尖露菌病菌(*Bremia lactucae*);墓卜露菌病菌属(*Peronospora species*),例如豌豆露菌病菌(*Peronosporapisi*)或芸苔霜霉(*P.Brassicae*);疫病菌属(*Phytophthora species*),例如马铃薯晚疫霉(*Phytophthora infestans*);单轴霉属菌种(*Plasmopara species*),例如葡萄生单轴霉(*Plasmopara viticola*);假霜霉属菌种(*Pseudoperonospora species*),例如葎草假霜霉(*Pseudoperonospora humuli*)或古巴假霜霉(*Pseudoperonospora cubensis*);草苗立枯病菌属(*Pythium species*),例如终极腐霉(*Pythium ultimum*)所导致的疾病;

[0400] 例如,由链格孢菌属(*Alternaria species*),例如早疫病链格孢菌(*Alternaria solani*);褐斑病菌属(*Cercospora species*),例如甜菜褐斑病菌(*Cercospora beticola*);星病菌属(*Cladosporium species*),例如黄瓜黑星病菌(*Cladosporium cucumerinum*);孢腔菌属(*Cochliobolus species*),例如禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*)(分生孢子型:内脐蠕孢属(*Drechslera*),同:麦类胡麻叶枯病菌属)或稻胡麻叶枯病菌(*Cochliobolus miyabeanus*);刺盘孢属菌种(*Colletotrichum species*),例如豆刺盘孢(*Colletotrichum lindemuthanium*);孔雀斑菌属菌(*Cycloconium species*),例如油橄榄孔雀斑菌(*Cycloconium oleaginum*);生间座壳属菌种(*Diaporthe species*),例如柑橘生间座壳(*Diaporthe citri*);痂囊腔菌属菌种(*Elsinoe species*),例如柑橘痂囊腔菌(*Elsinoefawcettii*);盘长孢属菌种(*Gloeosporium species*),例如悦色盘长孢(*Gloeosporium laeticolor*);小丛壳属菌种(*Glomerella species*),例如围小丛壳

(*Glomerella cingulata*);球座菌属菌种(*Guignardia species*),例如葡萄球座菌(*Guignardia bidwelli*);小球腔菌属菌种(*Leptosphaeria species*),例如十字花科小球腔菌(*Leptosphaeria maculans*);瘟霉菌属菌种(*Magnaporthe species*),例如稻瘟霉菌(*Magnaporthe grisea*);镰刀霉菌属菌种(*Microdochium species*),例如雪霉叶枯病菌(*Microdochium nivale*);球腔菌属菌种(*Mycosphaerella species*),例如禾生球腔菌(*Mycosphaerella graminicola*),花生球腔菌(*Mycosphaerella arachidicola*)或斐济球腔菌(*Mycosphaerella fijiensis*);叶枯病菌属菌种(*Phaeosphaeria species*),例如小麦叶枯病菌(*Phaeosphaeria nodorum*);核腔菌属菌种(*Pyrenophora species*),例如圆核腔菌(*Pyrenophora teres*)或褐斑病核腔菌(*Pyrenophora tritici repentis*);柱隔孢菌属菌种(*Ramularia species*),例如柱隔孢叶斑病菌(*Ramularia collo-cygni*)或棉白霉病菌(*Ramularia areola*);喙孢属菌种(*Rhynchosporium species*),例如黑麦喙孢(*Rhynchosporium secalis*);壳针孢属菌种(*Septoria species*),例如芹菜壳针孢(*Septoria apii*)或番茄壳针孢(*Septoria lycopersici*);壳多孢菌属菌种(*Stagonospora species*),例如小麦叶枯病菌(*Stagonospora nodorum*);核瑚菌属菌种(*Typhula species*),例如肉孢核瑚菌(*Typhula incarnata*);黑星菌属菌种(*Venturia species*),例如苹果黑星菌(*Venturia inaequalis*)所导致的叶斑病(leaf blotch disease)及叶枯病(leafwilt disease);

[0401] 例如,由伏革菌属(*Corticium species*),例如禾伏革菌(*Corticium graminearum*);镰孢属菌种(*Fusarium species*),例如尖镰孢(*Fusarium oxysporum*);顶囊壳属菌种(*Gaeumannomyces species*),例如禾顶囊壳(*Gaeumannomyces graminis*);根肿菌属菌种(*Plasmodiophora species*),例如芸苔根肿菌(*Plasmodiophora brassicae*);丝核菌属菌种(*Rhizoctonia species*),例如立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*);帚梗柱孢属菌种(*Sarocladium species*),例如稻叶鞘腐败病菌(*Sarocladium oryzae*);小核属菌种(*Sclerotium species*),例如稻腐小核菌(*Sclerotium oryzae*);小麦基腐病菌(*Tapesia species*),例如针形眼纹病菌(*Tapesia acuformis*);根串珠霉属菌种(*Thielaviopsis species*),例如根串珠霉(*Thielaviopsis basicola*);灵芝菌属(*Ganoderma species*),例如灵芝(*Ganoderma lucidum*)所导致的根与茎疾病;

[0402] 例如,由链格孢菌属(*Alternaria species*),例如链格孢菌(*Alternaria spp.*);曲霉属(*Aspergillus species*),例如黄曲菌(*Aspergillus flavus*);枝孢属(*Cladosporium species*),例如白杨煤病菌(*Cladosporium cladosporioides*);麦角菌属(*Claviceps species*),例如麦角菌(*Claviceps purpurea*);链孢霉属(*Fusarium species*),例如大刀链孢(*Fusarium culmorum*);赤霉属(*Gibberella species*),例如玉蜀黍赤霉(*Gibberella zeae*);雪霉叶枯菌属(*Monographella species*),例如雪腐明梭孢(*Monographella nivalis*);壳多孢属(*Stagnospora species*),例如颖枯壳多孢(*Stagnospora nodorum*)所导致的穗与圆锥花序疾病(包括玉米芯);

[0403] 黑穗病真菌,例如轴黑粉菌属(*Sphacelotheca species*),例如丝轴黑粉菌(*Sphacelotheca reiliana*);腥黑粉菌属(*Tilletia species*),例如小麦网腥黑粉菌(*Tilletia caries*)或小麦矮腥黑穗病菌(*Tilletia controversa*);条黑粉菌属(*Urocystis species*),例如隐条黑粉菌(*Urocystis occulta*);黑粉菌属(*Ustilago*

species),例如裸黑粉菌(*Ustilago nuda*)所导致的疾病;

[0404] 例如,由曲霉属(*Aspergillus species*),例如黄曲菌(*Aspergillus flavus*);灰霉菌属(*Botrytis species*),例如灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*);青霉属(*Penicillium species*),例如扩展青霉菌(*Penicillium expansum*)或产紫青霉菌(*Penicillium purpurogenum*);根霉菌属(*Rhizopus species*),例如匍枝根霉(*Rhizopus stolonifer*);小核菌属(*Sclerotinia species*),例如核盘菌(*Sclerotinia sclerotiorum*);轮枝孢属(*Verticillium species*),例如黄萎轮枝孢菌(*Verticillium alboatrum*)所导致的果实腐烂;

[0405] 例如,由链格孢菌属(*Alternaria species*),例如芸苔链格孢(*Alternaria brassicicola*);丝囊霉属(*Aphanomyces species*),例如根腐丝囊霉(*Aphanomyces euteiches*);壳二孢属(*Ascochyta species*),例如扁豆壳二孢(*Ascochyta lentis*);曲菌属(*Aspergillus species*),例如柄曲霉(*Aspergillus flavus*);枝孢属(*Cladosporium species*),例如多主枝孢(*Cladosporium herbarum*);旋胞腔菌属(*Cochliobolus species*),例如禾旋胞腔菌(*Cochliobolus sativus*;(分生孢子型:内脐蠕孢属(*Drechslera*),双极霉属(*Bipolaris*),同:麦类胡麻叶枯病菌属);炭疽菌属(*Colletotrichum species*),例如马铃薯炭疽病菌(*Colletotrichum coccodes*);链孢霉属(*Fusarium species*),例如大刀链孢(*Fusarium culmorum*);赤霉属(*Gibberella species*),例如玉蜀黍赤霉(*Gibberella zeae*);壳球孢属(*Macrophomina species*),例如菜豆壳球孢(*Macrophomina phaseolina*);雪腐病菌属(*Microdochium species*),例如红色雪腐菌(*Microdochium nivale*);雪霉叶枯菌属(*Monographella species*),例如雪腐明梭孢(*Monographella nivalis*);青霉属(*Penicillium species*),例如扩展青霉菌(*Penicillium expansum*);茎点霉属(*Phoma species*),例如黑胫茎点霉(*Phoma lingam*);拟茎点霉属(*Phomopsis species*),例如大豆拟茎点霉(*Phomopsis sojae*);疫霉属(*Phytophthora species*),例如恶疫霉(*Phytophthora cactorum*);核腔菌属(*Pyrenophora species*),例如麦类核腔菌(*Pyrenophora graminea*);稻瘟病菌属(*Pyricularia species*),例如稻瘟病菌(*Pyricularia oryzae*);腐霉属(*Pythium species*),例如终极腐霉(*Pythium ultimum*);丝核菌属(*Rhizoctonia species*),例如立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*);根霉属(*Rhizopus species*),例如水稻根霉菌(*Rhizopus oryzae*);小菌核属(*Sclerotium species*),例如小核菌(*Sclerotium rolfsii*);壳针孢属(*Septoria species*),例如颖枯壳针孢(*Septoria nodorum*);核瑚菌属(*Typhula species*),例如内孢核瑚菌(*Typhula incarnata*);轮枝孢属(*Verticillium species*),例如大丽花轮枝孢(*Verticillium dahliae*)所导致的种子和土壤传播的腐烂与枯萎病,还有幼苗疾病;

[0406] 例如,由丛赤壳属(*Nectria species*),例如癭丛赤壳(*Nectria galligena*)所导致的癌、虫癭与簇叶;

[0407] 例如,由核盘菌属(*Monilinia species*),例如核果链核盘菌(*Monilinia laxa*)所导致的枯萎病;

[0408] 例如,由外担菌属(*Exobasidium species*),例如坏损外担菌(*Exobasidium vexans*);外囊菌属(*Taphrina species*),例如畸型外囊菌(*Taphrina deformans*)所导致的叶子、花卉与果实变形;

[0409] 例如,由埃斯卡菌属(*Esca species*),例如葡萄厚膜孢菌(*Phaeomoniella chlamydospora*),青霉悬铃木菌(*Phaeoacremonium aleophilum*)或地中海层卧孔菌(*Fomitiporia mediterranea*);灵芝菌属(*Ganoderma species*),例如小笠原灵芝(*Ganoderma boninense*)所导致的木本植物的退化性疾病;

[0410] 例如,由葡萄孢属(*Botrytis species*),例如灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*)所导致的花卉及种子的疾病;

[0411] 例如,由丝核菌属(*Rhizoctonia species*),例如立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*);麦类胡麻叶枯病菌属(*Helminthosporium species*),例如腐衣长蠕孢(*Helminthosporium solani*)所导致的植物块茎疾病;

[0412] 细菌病原体,例如黄单胞菌属(*Xanthomonas species*),例如水稻细菌性疮痂病菌(*Xanthomonas campestris*pv.*Oryzae*);假单胞菌属(*Pseudomonas species*),例如丁香假单胞菌甜瓜致病变种(*Pseudomonas syringae* pv.*lachrymans*);欧文氏菌属(*Erwinia species*),例如解淀粉欧文氏菌(*Erwinia amylovora*);罗尔斯通氏菌属(*Ralstonia species*),例如青枯病菌(*Ralstonia solanacearum*)所导致的疾病;

[0413] 例如,由黑根腐病(野百合丽赤壳菌(*Calonectria crotalariae*))、炭腐病(charcoal rot)(菜豆壳球孢菌(*Macrophomina phaseolina*))、立枯病或枯萎病(*fusarium blight or wilt*)、根腐病、及荚果和颈腐病(尖孢镰刀菌(*Fusarium oxysporum*))、豌豆直喙镰孢(*Fusarium orthoceras*)、半裸镰孢(*Fusarium semitectum*)、木贼镰孢(*Fusarium equiseti*))、根腐坏死病(*mycoleptodiscus root rot*)(大豆褐红坏死菌(*Mycoleptodiscus terrestris*))、新赤壳属(*neocosmospora*)(侵菅新赤壳(*Neocosmospora vasinfecta*))、荚果及茎枯萎病(菜豆间座壳(*Diaporthe phaseolorum*))、茎溃疡病(菜豆间座壳大豆变种(*Diaporthe phaseolorum* var.*caulivora*))、疫霉腐病(*phytophthora rot*)(大雄疫霉(*Phytophthora megasperma*))、褐茎腐病(brown stem rot)(大豆褐茎腐病菌(*Phialophora gregata*))、腐霉腐病(*pythium rot*)(瓜果腐霉(*Pythium aphanidermatum*))、畸雌腐霉(*Pythium irregulare*)、德巴利腐霉(*Pythium debaryanum*)、姜软腐霉(*Pythium myriotylum*)、终极腐霉(*Pythium ultimum*))、丝核菌属根腐病(*rhizoctonia root rot*)、茎腐病(stem decay)、及猝倒病(damping-off)(立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*))、核盘霉属茎腐病(*sclerotinia stem decay*)(核盘菌(*Sclerotinia sclerotiorum*))、核盘霉属斑点叶枯病(*sclerotinia southern blight*)(小核菌(*Sclerotinia rolfisii*))、根串珠霉属根腐病(*thielaviopsis root rot*)(根串球霉(*Thielaviopsis basicola*))所导致的在根和茎基部的真菌疾病。

[0414] 依据本发明可处理的植物包括下述:蔷薇科(*Rosaceae sp.*) (例如仁果类诸如,苹果、梨、杏、樱桃、杏仁和桃子)、茶藨子科(*Ribesioideae sp.*)、胡桃科(*Juglandaceae sp.*)、桦木科(*Betulaceae sp.*)、漆树科(*Anacardiaceae sp.*)、壳斗科(*Fagaceae sp.*)、桑科(*Moraceae sp.*)、木犀科(*Oleaceae sp.*)、猕猴桃科(*Actinidaceae sp.*)、樟科(*Lauraceae sp.*)、芭蕉科(*Musaceae sp.*) (例如香蕉树及种植园)、茜草科(*Rubiaceae sp.*) (例如咖啡)、山茶科(*Theaceae sp.*)、梧桐科(*Sterculiaceae sp.*)、芸香科(*Rutaceae sp.*) (例如柠檬、柑橘及葡萄柚);葡萄科(例如葡萄);茄科(*Solanaceae sp.*) (例如蕃茄、胡椒)、百合科

(Liliaceae sp.)、菊科 (Asteraceae sp.) (例如莴苣)、伞形科 (Umbelliferae sp.)、十字花科 (Cruciferae sp.)、藜科 (Chenopodiaceae sp.)、瓜科 (例如黄瓜)、葱科 (Alliaceae sp.) (例如韭菜、洋葱)、蝶形花科 (Papilionaceae sp.) (例如豌豆); 主要作物植物、诸如, 黍草科 (Poaceae) / 禾本科 (Gramineae sp.) (例如玉米、草地、谷类, 如小麦、黑麦、稻米、大麦、燕麦、粟及小黑麦)、菊科 (Asteraceae sp.) (例如向日葵)、十字花科 (Brassicaceae sp.) (例如白菜、红甘蓝, 花椰菜、花菜、球芽甘蓝, 柏菜、大头菜、萝卜, 及油菜、芥菜、辣根及水芹)、豆科 (Fabaceae sp.) (例如豆类、花生)、蝶形花科 (Papilionaceae sp.) (例如黄豆)、茄科 (Solanaceae sp.) (例如马铃薯)、藜科 (Chenopodiaceae sp.) (例如甜菜、饲用甜菜、瑞士甜菜, 甜菜根); 锦葵科 (例如棉花); 花园及树林中之有用植物与观赏植物; 以及这些植物之各者的基因改造变种。

[0415] 依据本发明可处理所有植物及植物部分。此处咸了解植物意所有植物与植物种群, 诸如, 所欲及不欲之野生植物或作物植物 (包括天然产生之作物植物)。作物植物可为可由习知育种及优化方法或由生物技术及基因工程方法或这些方法的组合获得的植物, 包括基因转殖植物及包括由植物育种者的权利保护或未保护之植物栽培品种。植物部分咸了解意指所有地上与地下植物的部分及器官, 诸如幼枝、叶、花卉和根, 其例子包括叶、针叶、柄、茎、花卉、果实、果实及种子, 还有根、块茎和根茎。植物部分亦包括收获材料及植物与生殖繁殖材料, 例如插条、块茎、根茎、裔芽 (slip) 与种子。

[0416] 本发明进一步包括处理种子的方法, 特别是以至少一种式 (I) 之化合物及其组成物处理的种子类 (休眠、引发、发芽、甚至有根和叶)。本发明种子用在保护种子和从种子萌芽的植物免于植物病原有害之真菌的方法。在这些方法中, 使用以至少一种本发明之活性成分处理的种子。

[0417] 优化所用之活性成分的量亦为所欲, 以提供对种子、发芽植物及萌芽幼苗最佳可能保护, 免于植物病原真菌的攻击, 但不会因所用的活性成分损害植物本身。特别是, 处理种子的方法亦应考量基因转殖植物的内在表现型, 以达到以最少量所用的作物保护组成物对种子与发芽植物的最优保护。

[0418] 本发明因而亦系关于通过以本发明组成物处理种子而保护种子、发芽植物与萌芽幼苗对抗动物害虫及/或植物病原有害微生物攻击的方法。本发明亦系关于根据本发明之组成物用于处理种子的用途, 以保护种子、发芽植物与萌芽幼苗对抗动物害虫及/或植物病原微生物。本发明进一步系关于种子, 其已经本发明组成物处理以保护免于动物害虫及/或植物病原微生物。

[0419] 本发明的优点之一为以这些组成物处理种子不仅保护种子本身, 亦保护萌芽之后所得植物免于动物害虫及/或植物病原有害微生物。以此方法, 在播种之时或其后马上立刻处理作物保护植物, 以及播种之前种子处理。同样被认为是有利的是本发明活性成分或组成物可特别同样用于基因转殖种子, 于此例中, 从此种子生长的植物能够表现作用对抗害虫、除草损害或非生物压力的蛋白质。以本发明活性成分或组成物, 例如杀虫蛋白质处理此等种子可造成控制某些害虫。令人惊讶的是, 在此例中可观察到进一步的协同效果, 其另外增加保护对抗由害虫、微生物、杂草或非生物压力造成攻击的有效性。

[0420] 式 (I) 之化合物适合于保护用于农业、温室、森林或园艺之任何植物品种的种子。更特别的是, 种子为谷类 (诸如, 小麦、大麦、黑麦、小米和燕麦)、油菜、玉米、棉花、大豆、稻

米、马铃薯、向日葵、豆类、咖啡、甜菜(如甜菜和饲料甜菜)、花生、蔬菜(诸如番茄、黄瓜、洋葱和莴苣)、草坪与观赏植物的种子。特别重要的是处理小麦、大豆、油菜、玉米与稻米的种子。

[0421] 亦如下所述者,以本发明活性成分或组成物处理基因转殖种子为特别显著。此系指包含至少一异种基因(允许表现多胜肽或蛋白质,例如具有杀虫特性)的植物种子。基因转殖种子中的这些异种基因可源自例如,杆菌属、根瘤菌属、假单胞菌属、锯杆菌属、木霉属、棒状杆菌属、菌根菌属(*Glomus*)或胶状青霉菌属(*Gliocladium*)等属的微生物。这些异种基因较佳地源自杆菌属,在此例中,基因产物有效对抗欧洲玉米螟及/或西方玉米根虫。特佳地,异种基因源自苏力菌(*Bacillus thuringiensis*)。

[0422] 在本发明内文中,本发明组成物单独或在适合的调配物中施用到种子。较佳地,种子是在其中在处理过程中充分稳定而无损害发生的状态下处理。一般而言,种子可在收获及播种之后一段时间之间的任何时期处理。惯常使用已经从植物中分离出来,并且脱离了芯、壳、柄、外皮、毛发或果实果肉的种子。例如,可能使用已经收获,清洗并干燥至水分含量小于15重量%的种子。或者,亦可能使用干燥之后例如,已以水处理然后再次干燥的种子,或引发之后的种子,或储存在引发条件下的种子或预发芽种子,或播种在培育托盘、带或纸上的种子。

[0423] 当处理种子时,一般必须确定选择本发明组成物施用到种子的量及/或另外添加物的量,使得种子发芽不受损,或所得植物不受损害。此在某些施用率下可表现出植物毒性效果的活性成分的例子必须特别确定。

[0424] 可直接施用式(I)之化合物,即没有包含任何其他成分且不用稀释。一般而言,较佳以适合的调配物形式施用组成物到种子。适合的调配物及种子处理方法对发明所属技术领域中具有通常知识者而言为已知。可转换式(I)之化合物成与种子上应用相关的惯常调配物,诸如,溶液、乳剂、悬浮液、粉剂、泡沫、浆体或与其他种子涂覆组成物诸如,成膜材料、造粒材料、细铁或其他金属粉剂、颗粒、失活种子的涂覆材料、还有ULV调配物组合。

[0425] 在处理种子以协助可植性(plantability)中,种子可以聚合物涂覆。聚合物涂布包含黏合剂、蜡及颜料、与以有效于稳定悬浮液之量的一或多种安定剂。黏合剂可为选自下列所组成群组的聚合物:乙烯基乙酸酯-乙烯共聚物、乙烯基乙酸酯均聚物、乙烯基乙酸酯-丙烯酸共聚物、乙烯基丙烯酸、丙烯酸、乙烯-氯乙烯、乙烯基醚顺丁烯二酸酐、或丁二烯苯乙烯。可使用其他类似聚合物。

[0426] 以已知方式制备这些调配物,通过混合活性成分或活性成分组合与惯常添加剂,例如惯常增效剂及溶剂或稀释剂、染料、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、黏着剂、吉贝素、还有水。

[0427] 根据本发明可用的可存在于拌种调配物之有用染料为惯常用于此等目的的所有染料。可能使用难溶于水的颜料,或可溶性于水的染料。例子包括已知名称为Rhodamine B、C.I. 颜料红112及C.I. 溶剂红1的染料。

[0428] 根据本发明可用的可存在于拌种调配物之有用润湿剂为促进湿润且习知用于活性农用化学成分的调配物之所有物质。优先使用的为烷基萘磺酸酯,诸如,二异丙基-或二异丁基萘磺酸酯。

[0429] 根据本发明可用的可存在于拌种调配物之有用分散剂及/或乳化剂为习知用于活

性农用化学成分的调配物的所有非离子性、阴离子性与阳离子性分散剂。优先使用的为非离子性或阴离子性分散剂或非离子性或阴离子性分散剂之混合物。有用的非离子性分散剂特别包括环氧乙烷/环氧丙烯嵌段聚合物、烷基酚聚二醇醚与三苯乙基(tristyrlyl)酚聚二醇醚、及其磷酸化或硫酸化衍生物。适合的阴离子性分散剂特别是木质磺酸盐、聚丙烯酸盐与芳基磺酸酯/甲醛缩合物。

[0430] 根据本发明可用的可存在于拌种调配物之消泡剂为习知用于活性农用化学成分的调配物的所有泡沫抑制物质。聚硅氧消泡剂与硬脂酸镁可以优先使用。

[0431] 根据本发明可用的可存在于拌种调配物之防腐剂为在农用化学组成物中有用于此等目的的所有物质。例子包括双氯酚与苯甲基醇半缩甲醛(hemiformal)。

[0432] 根据本发明可用的可存在于拌种调配物之二次增稠剂为在农用化学组成物中有用于此等目的的所有物质。较佳例子包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶(xanthan)、改质黏土与细分硅石。

[0433] 根据本发明可用的可存在于拌种调配物之黏着剂为有用于拌种产物之所有惯常黏合剂。较佳例子包括聚乙烯基吡咯啉酮、聚乙烯乙酸酯、聚乙烯醇与填充体。

[0434] 根据本发明可用的种子上应用之调配物可用以直接或事先用水稀释后处理各种不同类型的种子。例如,以水稀释自此获得的浓缩物或制品可用以拌种谷类诸如,小麦、大麦、黑麦、燕麦和小黑麦的种子,还有玉米、大豆、稻米、油菜、豌豆、豆类、棉花、向日葵、与甜菜的种子,抑或各种不同蔬菜种子。依据本发明可用的调配物或其稀释制品亦可用于基因转殖植物种子。在此例中,另外的协同效果亦可发生在与表现所产生之物质的交互作用中。

[0435] 对于以依据本发明可用的调配物,或通过加水自此制备的制品处理种子,惯常于种子上应用有用的所有混合单位为有用。特别是,种子上应用中的程序是将种子置于混合器,加入特定所欲量的调配物(本身或事先用水稀释后),及混合所有东西直到所有施用调配物均匀分布在种子上。如适当,随后进行干燥操作。

[0436] 依据本发明可用的调配物的施用率可在相当广的范围内变化。以调配物中活性成分的具体内容及种子为指导。各单一活性成分的施用率一般介于每公斤的种子0.001至15g之间,较佳地介于每公斤的种子0.01至5g之间。

[0437] 当使用式(I)之化合物作为杀真菌剂时,施用率可在相当广的范围内变化,视施用类型而定。本发明活性成分施用率为:

[0438] 在处理植物部分的例子,例如叶子:从0.1至10000g/ha,较佳地从10至1000g/ha,更佳地从30至300g/ha(在通过洒水或滴水施用的例子,甚至可能减少施用率,特别是当使用惰性基材诸如,岩棉或珍珠岩时);

[0439] 在种子处理的例子中:每100kg的种子从0.1至200g,较佳地每100kg的种子从1至150g,更佳地每100kg的种子从2.5至25g,甚更佳地每100kg的种子从2.5至12.5g;

[0440] 在土壤处理的例子:从0.1至10000g/ha,较佳地从1至5000g/ha。

[0441] 这些施用率仅仅是作为例子,并不限制本发明的目的。

[0442] 在一些例子中,式(I)之化合物可在特定浓度或施用率下亦用作为除草剂、安全剂、生长调节剂或试剂以改良植物特性,或作为杀微生物剂,例如作为杀真菌剂、抗霉菌剂、杀菌剂、杀病毒剂(包括对抗类病毒之组成物)或作为对抗ML0(似霉浆菌之有机体)及RL0(似立克次体之有机体)之组成物。

[0443] 式(I)之化合物介入植物的生理过程且因而亦可用作植物生长调节剂。植物生长调节剂可对植物产生各种效果。物质的效果主要取决于与植物发展阶段相关的施用时间、植物品种,还有施用到植物的活性成分量或其环境与施用的类型。在各例中,生长调节剂应具有对作物植物特别所欲效果。

[0444] 生长调节效果,包括早期发芽、较佳的萌芽、更多发育根系系统及/或改良之根系生长、增加分蘖能力、更有效分蘖、早期开花、增加植物高度及/或生物量、茎缩短、改良幼枝生长、核/穗数目、穗数目/m²、走茎数目及/或花卉数目、增强收获指数、较大的叶子、较少死亡的基叶、改良的叶序、早期成熟/早期收果、均质成熟(homogenous riping)、增加谷粒填充持续时间、较佳收果、较大果实/蔬菜尺寸、萌芽抗性与减少伏倒(lodging)。

[0445] 增加或改良产率是指每公顷总生物量、每公顷产量、核/果实重量、种子尺寸及/或百升重量以及改良之产物品质,包含:

[0446] 与尺寸分布(核、果实等)相关的改良加工性、均质成熟、谷类湿度、较佳碾磨、较佳酿酒、较佳酿造、增加果汁产量、收获力、消化率、沉降值、降落数(falling number)、果荚稳定性、储存稳定性、改良纤维长度/强度/均匀、增加青贮喂养动物之牛乳及/或肉质、适应烹调及油炸;

[0447] 进一步包括有关改良果实/谷类品质、尺寸分布(核、果实等)之市场性改良,增加储存/保存期、坚实/柔软、味道(芳香、质地等)、等级(大小、形状、浆果数等)、每串浆果/果实数、脆度、新鲜度、用蜡覆盖、生理障碍之频率、颜色等;

[0448] 进一步包括增加所欲成分,诸如,例如蛋白质含量、脂肪酸、油含量、油品质、胺基酸组成物、糖含量、酸含量(pH)、糖/酸比例(Brix)、多酚、淀粉含量、营养品质、面筋含量/指数、能量含量、味道等;

[0449] 且进一步包括降低不欲之成分诸如,例如较少霉菌毒素、较少黄曲毒素、土霉味物质含量(geosmin level)、酚的芳香(aromas)、漆氧化酵素(lacchase)、多酚氧化酶及过氧化酶、硝酸盐含量等。

[0450] 可使用植物生长调节化合物,例如,以延缓植物营养生长。此生长抑制是有经济利益的,例如,在草的例子中,因为其因此可能减少观赏花园、公园与运动设备、在人行道、在机场或在果实作物中除草的频率。也重要的是抑制草本及木本植物在人行道及在管道附近或架空电缆、或相当普遍在其中旺盛的植物生长是不需要的之地区的生长。

[0451] 也重要的是使用生长调节剂抑制谷物纵向生长。此减少或完全消除在收获之前植物伏倒的风险。此外,在谷类的例子中生长调节剂可加强杆,其亦对抗伏倒。运用生长调节剂以缩短及加强杆使得部署更高肥料体积已增加产量,而无谷物作物伏倒的任何风险。

[0452] 在许多作物植物中,营养生长抑制允许更密的种植,且其因而可能基于土壤表面达到较高产量。以此方法获得的较小植物的另一优点为作物较易培育与收获。

[0453] 营养植物生长的减少还可能导致增加或改良之产量,因为营养物 and 同化物对花和果实的形成比对植物的营养部分更有利。

[0454] 或者,生长调节剂也可以用来促进营养生长。当收获营养植物部分时,这是非常有利的。然而,促进营养生长也可能促进生殖生长,形成更多的同化物,导致更多或更大的果实。

[0455] 再者,在生长或产量的有利效果可通过改良之营养物使用效能,特别是氮(N)-使

用效能、磷(P)-使用效能、水使用效能、改良之蒸散作用、呼吸作用及/或CO₂同化作用率、较佳结瘤、改良之Ca-代谢等而达到。

[0456] 同样地,生长调节剂可用于改变植物组成,其接着可造成改良收获产物的品质。在生长调节剂的影响下,可形成单性结实果实。此外,可能影响花卉的性别。亦可能产生不育花粉,其对于杂交种子的育种及生产是非常重要的。

[0457] 生长调节剂的使用可控制植物的分枝。一方面而言,通过破坏顶点优势,可能促进侧幼枝的发展,其特别在培育观赏植物中为高度所欲,亦合并抑制生长。另一方面而言,亦可能抑制侧幼枝的生长。此效果特别有利,例如,在培育烟草或培育番茄。

[0458] 在生长调节剂的影响下,可控制植物上叶子的量,使得在所欲的时间达到植物的落叶。此落叶在收获棉花机制中扮演主要角色,但亦有利于协助其他作物收获,例如在葡萄栽培。植物落叶也可以在移植前降低植物的蒸散作用。

[0459] 再者,生长调节剂可调控植物衰老,其可造成绿叶面积持续时间延长、较长谷粒填充期、改良之产量品质等。

[0460] 生长调节剂可同样用于调节果实裂开。一方面而言,可能避免过早果实裂开。另一方面而言,亦可能促进果实裂开或甚至花发育不全以达到所欲的质量(“疏落”)。此外,为了允许机械收获或协助手动收获,可能在收获时间使用生长调节剂以减少所需用于分离果实的力气。

[0461] 在收获之前或之后,生长调节剂亦可用于达到较快抑或延迟收获材料的成熟。此特别有利,因为其允许最佳调整符合市场的需求。甚者,生长调节剂在一些例子中可改良果实颜色。此外,生长调节剂亦可用于在一定时间内同步成熟。这建立了在单一操作中完成机械或手动收获的先决条件,例如在烟草、番茄或咖啡的例子。

[0462] 通过使用生长调节剂,另外可能影响种子或植物芽的休眠,使得植物诸如,在培育之凤梨或观赏植物,在其通常不倾向如此的时间,例如,发芽、萌芽或开花。在有霜冻风险的地区,可能需要藉助生长调节剂延迟种子萌芽或发芽,以避免因为晚霜造成的损害。

[0463] 最后,生长调节剂可诱导植物对霜冻、干旱或土壤的高盐度的抗性。此允许培育植物在通常不适合此目的的区域。

[0464] 式(I)之化合物在植物中也表现出强大的增强效果。因此,其可用于动员植物的防御对抗讨厌微生物的攻击。

[0465] 本文中的植物增强(抗性诱导)物质为能够刺激植物的防御系统之物质,使得处理过的植物在随后接种讨厌微生物时对这些微生物发展出高度的抗性。

[0466] 此外,在本发明的植物生理学效果的内文下,包括以下:

[0467] 非生物压力耐受性,包含对高或低温度的耐受性、干旱耐受性及干旱压力之后的恢复力、水使用效能(与减少水消耗相关)、水灾耐受性、臭氧压力和UV耐受性、对化学品像重金属、盐类、除害虫剂等之耐受性。

[0468] 生物压力耐受性包含增加真菌抗性、增加对抗线虫、病毒与细菌的抗性。在本发明的内文下,生物压力耐受性较佳地包括增加真菌抗性与增加对抗线虫之抗性。

[0469] 增加植物活力,包括植物健康/植物品质和种子活力,减少站立失败,改良外观,增加压力期后的恢复力,改良天然颜色(如叶绿素含量,保绿效果等)和改良光合作用效率。

[0470] 此外,式(I)之化合物可减少收获材料与自此制备的食物与饲料中的霉菌毒素含

量。霉菌毒素包括特别但不仅限于以下：脱氧雪腐镰刀菌烯醇 (deoxynivalenol) (DON)、雪腐镰刀菌烯醇、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-与HT2-毒素、伏马镰孢毒素 (fumonisins)、玉米赤霉烯酮 (zearalenon)、串珠镰刀菌素 (moniliformin)、镰菌素 (fusarin)、二乙酰氧基赭曲毒素 (diaceotoxyscirpenol) (DAS)、白僵菌素 (beauvericin)、恩镰孢菌素 (enniatin)、镰菌增殖蛋白 (fusaroproliferin)、富沙醇 (fusarenol)、赭曲毒素 (ochratoxins)、棒曲霉素、麦角生物碱及黄曲毒素，其可由，例如，通过下述真菌产生：镰孢属菌种 (*Fusarium spec.*)、诸如，锐形镰孢菌 (*F.acuminatum*)、亚细亚镰孢菌 (*F.asiaticum*)、燕麦镰孢 (*F.avenaceum*)、克鲁克威尔镰孢菌 (*F.crookwellense*)、禾秆镰孢菌 (*F.culmorum*)、禾本科镰孢 (*F.graminearum*) (玉蜀黍赤霉菌)、木贼镰孢菌、水稻恶苗病菌 (*F.fujikoroi*)、香蕉镰孢菌 (*F.musarum*)、尖镰孢菌、层出镰孢 (*F.proliferatum*)、早熟禾镰孢 (*F.poa*)、小麦冠腐病菌 (*F.pseudograminearum*)、接骨木镰孢 (*F.sambucinum*)、蔗草镰孢 (*F.scirpi*)、半裸镰孢 (*F.semitectum*)、茄镰孢菌、拟分枝孢镰孢 (*F.sporotrichoides*)、兰西瑟镰孢 (*F.langsethiae*)、胶孢镰孢 (*F.subglutinans*)、三隔镰孢 (*F.tricinctum*)、轮状镰孢 (*F.verticillioides*) 等，还有通过曲菌属 (*Aspergillus spec.*)，诸如，黄曲霉 (*A.flavus*)、寄生曲菌、集峰曲霉 (*A.nomius*)、赭曲霉 (*A.ochraceus*)、棒曲霉 (*A.clavatus*)、土曲霉 (*A.terreus*)、杂色曲霉 (*A.versicolor*)、青霉菌属 (*Penicillium spec.*) 诸如，疣孢青霉 (*P.verrucosum*)、鲜绿青霉 (*P.viridicatum*)、桔青霉 (*P.citrinum*)、扩展青霉 (*P.expansum*)、棒形青霉 (*P.claviforme*)、洛克福耳青霉 (*P.roqueforti*)、麦角菌属 (*Claviceps spec.*) 诸如，麦角菌 (*C.purpurea*)、梭形麦角菌 (*C.fusiformis*)、雀稗麦角菌 (*C.paspali*)、高粱麦角菌 (*C.africana*)、葡萄穗霉属 (*Stachybotrys spec.*) 及其他。

[0471] 式 (I) 之化合物亦可用于保护材料、保护产业材料对抗植物病原真菌之攻击与破坏。

[0472] 此外，式 (I) 之化合物可单独或与其他活性成分组合用作为防污组成物。

[0473] 于本文中的产业材料咸了解意指已经准备用于产业的无生命的材料。例如，由本发明组成物保护免于微生物改变或破坏的产业材料可为黏着剂、胶、纸、墙纸和板/硬纸板、纺织品、地毯、皮革、木材、纤维和纸巾、油漆和塑胶物件、冷却润滑剂及可受到微生物感染或破坏的其他材料。生产工厂及建筑物的部件，例如可能会被微生物的增殖所破坏之冷却水回路、冷却和加热系统以及通风和空调单元亦可描述于欲保护的材料之范畴。在本发明范畴的产业材料较佳地包括黏着剂、胶料、纸张和卡片、皮革、木材、油漆、冷却润滑剂和传热流体、更佳地木材。

[0474] 式 (I) 之化合物可以避免不利影响、例如腐烂、腐朽、变色、脱色或形成霉菌。

[0475] 在处理木材的例子中，式 (I) 之化合物亦可用于对抗容易在木料上或内部生长的真菌疾病。术语“木料”意指所有类型的木材种类，及这种木材用于建筑的所有类型的工作，例如实木材、高密度木材、层压木材和胶合板。根据本发明处理木料的方法主要包括接触根据本发明组成物；此包括例如接施用、喷洒、浸渍、注射或任何其他适合的手段。

[0476] 此外，式 (I) 之化合物可以用来保护与盐水或咸水接触的物体，特别是船体、隔板、网、建筑物、系泊和讯号系统，免受污染。

[0477] 亦可运用式 (I) 之化合物保护储存货物。储存货物咸了解意指蔬菜或动物来源的天然物质或为天然来源的其加工产物，且长期保护为所欲。

[0478] 蔬菜来源的储存货物,例如植物或植物部分诸如,茎、叶、块茎、种子、果实、谷粒,可以新鲜收获保护或通过(预)干燥、润湿、粉碎、研磨、压榨或烘烤加工后保护。储存货物亦包括木料,均未加工,诸如,建筑木料、电线杆和屏障,或呈制成品形式,诸如,家具。动物来源的储存货物为,例如,兽皮、皮革、毛皮和毛发。本发明组成物可避免不利影响诸如,腐烂、腐朽、变色、脱色或形成霉菌。

[0479] 能够降解或改变产业材料的微生物包括,例如,细菌、真菌、酵母菌、藻类和黏液有机体。式(I)之化合物较佳地作用对抗真菌,尤其是霉菌、木材-变色与木材-破坏真菌(子囊菌纲(Ascomycetes)、担子菌纲(Basidiomycetes)、半知菌类(Deuteromycetes)与接合菌纲(Zygomycetes)),及对抗黏液有机体和藻类。例子包括下列属的微生物:交错道霉菌属诸如,细极交错道霉菌属(*Alternaria tenuis*);曲菌属(*Aspergillus*)诸如,黑曲菌(*Aspergillus niger*);毛壳菌属(*Chaetomium*)、诸如,球毛壳(*Chaetomium globosum*);粉孢革菌属,例如粉孢革菌(*Coniophora puetana*);香菇属,例如虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*);青霉属,例如灰绿青霉(*Penicillium glaucum*);多孔菌属,例如变色多孔菌(*Polyporus versicolor*);短梗霉属,例如出芽短梗霉(*Aureobasidium pullulans*);硬皮茎点霉属,例如绿木霉(*Sclerophoma pityophila*);木霉属、诸如,绿色木霉(*Trichoderma viride*);长喙壳菌属(*Ophiostoma*)种、枯萎病菌属(*Ceratocystis*)种、腐殖霉属(*Humicola*)种、彼得壳属(*Petriella*)种、毛束霉属(*Trichurus*)种、革盖菌属(*Coriolus*)种、黏褶菌属(*Gloeophyllum*)种、侧耳属(*Pleurotus*)种、茯苓属(*Poria*)种、龙介虫属(*Serpula*)种与干酪菌属(*Tyromyces*)种、分子孢子菌属(*Cladosporium*)种、拟青霉属(*Paecilomyces*)种、毛霉属(*Mucor*)种、大肠杆菌属,例如大肠杆菌;假单胞菌属诸如,绿脓杆菌(*Pseudomonas aeruginosa*);葡萄球菌属诸如,金黄色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)、念珠菌属(*Candida*)种及酵母菌属种,诸如啤酒酵母菌(*Saccharomyces cerevisiae*)。

[0480] 此外,式(I)之化合物亦具有非常良好的抗霉效果。其具有非常广的抗霉活性谱,尤其是对抗皮霉菌与酵母菌、霉菌及双相真菌(例如对抗念珠菌属(*Candida species*)诸如,白假丝酵母(*Candida albicans*)、秃假丝酵母(*Candida glabrata*))、与絮状表皮癣菌(*Epidermophyton floccosum*)、曲菌属(*Aspergillus species*)诸如,黑曲菌(*Aspergillus niger*)与烟曲霉(*Aspergillus fumigatus*)、发癣菌属(*Trichophyton species*)诸如须发癣菌(*Trichophyton mentagrophytes*)、小孢霉菌属(*Microsporon species*)诸如,狗小孢霉(*Microsporon canis*)与头癣小孢霉(*M.audouinii*)。这些真菌的列举并不构成对所涵盖的霉菌谱的限制,且仅为说明性。

[0481] 化合物亦可用于控制在鱼类和甲壳类养殖中的重要真菌病原体,例如,在鳟鱼中的异丝水霉、在小龙虾中的寄生水霉。

[0482] 式(I)之化合物因而可用在医疗和非医疗应用两者。

[0483] 式(I)之化合物可本身使用、呈其调配物形式使用或呈自此制备的使用形式使用,诸如,即可使用溶液、悬浮液、可湿性粉剂、糊剂、可溶性粉剂、粉尘与颗粒。施用可以惯常方式完成,例如通过浇水、喷洒、雾化、散布、喷粉、发泡、传播等。亦可能通过超低容量法或将活性成分制品/活性成分本身注入土壤中部署活性成分。亦可能处理植物种子。

[0484] 依据本发明可能处理所有植物与其部分,较佳地与野生植物物种及植物栽培品

种,或由习知生物育种方法(诸如,杂交或原生质体融合)获得者,还有其部分。在进一步较佳具体实施例中,处理通过基因工程方法,若适当与习知方法(Genetically Modified Organisms)结合,获得的基因转殖植物与植物栽培品种,及其部分。术语“部分”或“植物的部分”或“植物部分”已于上面解释。更佳地,商业上可获得或正使用的植物栽培品种之植物依据本发明处理。植物栽培品种咸了解意指具有新特性(“性状”)且由习知育种、由突变作用或由重组DNA技术获得的植物。其可为栽培品种、变种、生物型或基因型。

[0485] 根据本发明的处理方法可用于处理基因改造有机体(GMOs),例如植物或种子。基因改造植物(或基因转殖植物)为其中异种基因已稳定地整合到基因组中的植物。表现“异种基因”基本上意指基因,其在植物外被提供或组合且当导入核中时,叶绿体或粒线体基因组给予转形之植物新或改良之农艺或其他特性,此系通过表现有兴趣之蛋白质或多胜肽或通过下调节或静默其他存在于植物中的基因(使用例如,反义技术、共抑制技术、RNA干扰-RNAi-技术或微小RNA-miRNA-技术)。位于基因组中的异种基因亦称为转殖基因。由其在植物基因组中特定位置所定义的转殖基因称为转形或基因转殖事件。

[0486] 较佳地根据本发明处理的植物及植物栽培品种包括具有为这些植物赋予特别有利的有用性状(通过育种和/或生物技术手段获得)之遗传物质的所有植物。

[0487] 亦较佳地根据本发明处理的植物及植物栽培品种对一或多种生物压力有抗性,即该植物显示较佳防御对抗动物及微生物害虫,诸如,对抗线虫、昆虫、螨、植物病原真菌、细菌、病毒及/或类病毒。

[0488] 亦可根据本发明处理的植物及植物栽培品种为对一或多种非生物压力有抗性的该些植物。非生物压力情况可包括,例如,干旱、低温暴露、热暴露、渗透压力、淹水、增加的土壤盐度、增加的矿物质暴露、臭氧暴露、高光线暴露、有限可用率的氮营养素、有限可用率的磷营养素、遮荫避免。

[0489] 亦可根据本发明处理的植物及植物栽培品种为由增强产量特征来特性化的该些植物。在该植物增加产量可为例如,改良植物生理、生长与发育诸如、水使用效能、保水效能、改良氮使用、增强碳同化作用、改良光合成、提高发芽效能及加速成熟的结果。产量再者可受到改良之植物结构(在压力及无压力情况下)影响,包括但不限于早期开花、对杂交种子生产的开花控制、幼苗活力、植物尺寸、节间数和距离、根生长、种子尺寸、果实尺寸、荚尺寸、荚数或穗数、每荚或穗的种子数、种子质量、增强种子填充、减少种子扩散、减少荚裂开和抗倒伏性。再者,产量性状包括种子组成诸如,碳水化合物含量与组成,例如棉或淀粉、蛋白质含量、油含量与组成、营养价值、减少抗营养化合物、改良加工性和较佳的储存稳定性。

[0490] 可根据本发明处理的植物为已经表现杂种或杂交活力特征(其一般导致较高产量、活力、健康及对生物与非生物压力的抗性)的杂交植物。

[0491] 可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(由植物生物技术方法诸如,基因工程获得)为除草剂-耐受性植物,即对一或多种给予的除草剂有耐受性之植物。此等植物可由基因转形,或由选择含有赋予此种除草剂耐受性突变的植物而获得。

[0492] 亦可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(由植物生物技术方法诸如,基因工程获得)为抗昆虫之基因转殖植物,即对某些目标昆虫的攻击有抗性的植物。此等植物可由基因转形,或由选择含有赋予此种昆虫抗性突变的植物而获得。

[0493] 亦可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(由植物生物技术方法诸如,基因工

程获得) 为对非生物压力有耐受性。此等植物可由基因转形, 或由选择含有赋予此种压力抗性突变的植物而获得。

[0494] 亦可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(由植物生物技术方法诸如, 基因工程获得) 显示收获产物的改变数量、质量及/或储存稳定性及/或收获产物的特定成分改变的性质。

[0495] 亦可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(可由植物生物技术方法诸如, 基因工程获得) 为植物, 诸如有改变纤维特征之棉花植物。此等植物可由基因转形, 或由选择含有赋予此种改变纤维特征突变的植物而获得。

[0496] 亦可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(可由植物生物技术方法诸如, 基因工程获得) 为植物, 诸如有改变油概况特征之油菜或相关芸薹属植物。此等植物可由基因转形, 或由选择含有赋予此种改变油概况特征突变的植物而获得。

[0497] 亦可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(可由植物生物技术方法诸如, 基因工程获得) 为植物, 诸如有改变种子破碎特征的油菜或相关芸薹属植物。此等植物可由基因转形, 或由选择含有赋予此种改变种子破碎特征突变的植物而获得, 且包括植物诸如, 有延迟或减少种子破碎的油菜植物。

[0498] 亦可根据本发明处理的植物或植物栽培品种(可由植物生物技术方法诸如, 基因工程获得) 为植物, 诸如有改变转译后蛋白质修饰模式的烟草植物。

[0499] 因此, 本发明化合物已在表1及2说明。

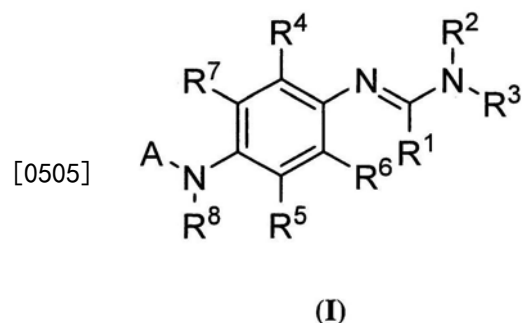
[0500] 下列表格以非限制性方式说明根据本发明化合物的实施例。在下述实施例中, 如在质谱法中所观察, $M+1$ (或 $M-1$) 分别意指分子离子峰加或减 1a.m.u. (原子质量单位)。所选择之实施例的 $^1\text{H-NMR}$ 数据以 $^1\text{H-NMR}$ -峰列表形式记载。对各个讯号峰列出了以 ppm 为单位的 δ 值和圆括号中的质子数。

[0501] 为了校正 ^1H 光谱的化学位移, 吾等使用四甲基硅烷及/或所用溶剂的化学位移, 尤其是在于 DMSO 中测量光谱的例子。因此, 在 NMR 峰列表中, 四甲基硅烷峰可出现, 但非必要。

[0502] $^1\text{H-NMR}$ 峰列表类似于经典 $^1\text{H-NMR}$ (因此通常印刷且包含所有峰, 列在经典 NMR-说明)。

[0503] 另外其可显示像溶剂之经典 $^1\text{H-NMR}$ 印刷讯号、目标化合物的立体异构物 (亦为本发明之目标)、及/或杂质峰。

[0504] 表1提供通式 (I) 之化合物



[0506]

编号	化合物名称	分析数据
1.	N'-(2,5-二甲基-4-(苯基氨基)苯基)-N-乙	实施例：1

[0507]

	基-N-甲基甲酰亚胺化物	
2.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：2
3.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(苯基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：3
4.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：4
5.	N'-(2,5-二甲基-4-(N-苯基甲基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：5
6.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-甲基-4-(全氟丙烷-2-基)苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.5 (s, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.63 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 3.36 (q, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.73 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 478.1
7.	N'-(4-((4-氯苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：6
8.	N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：7
9.	N'-(4-((3,4-二氯苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：8
10.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3,4,5-三氟苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：9
11.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(间甲苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：10

[0508]

12.	N'-(2-氯-4-((3,4-二氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 11
13.	N'-(2-氯-4-((3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 12
14.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	Example:13 ¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.44 (d, 2H), 7.15 (s, 1H), 6.96 (d, 1H), 6.53 (d, 2H), 3.45-3.35 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 384.15
15.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(对甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 14
16.	N'-(2-氯-4-((2-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 15
17.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(N-苯基甲基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 16
18.	N'-(2-氯-4-((2-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 17
19.	N'-(2-氯-4-((4-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 18
20.	N'-(2-氯-4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 19
21.	N'-(2-氯-4-((4-甲氧基-3-甲基苯基)(甲	实施例: 20

[0509]

	基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	
22.	N'-(2-氯-4-((3,4-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 21
23.	N'-(2-氯-4-((3,5-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 22
24.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(间甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (s, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.95 (t, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.64 (s, 1H), 6.44-6.41 (m, 3H), 3.37 (q, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):310.2
25.	N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.78 (s, 1H), 6.98 (t, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.77 (s, 1H), 6.20 (dd, 1H), 6.00 (dd, 1H), 5.95 (t, 1H), 3.62 (d, 3H), 3.45-3.40 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 3.02 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1):326.1
26.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(对甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 6.90 (d, 2H), 6.81 (s, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.34 (d, 2H), 3.37 (q, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.99 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.96 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1):310.1
27.	N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 24
28.	N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 23
29.	N'-(2,5-二甲基-4-(间甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (s, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.95 (t, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.64 (s, 1H), 6.44-6.41 (m, 3H), 3.37 (q, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):295.8
30.	N'-(2,5-二甲基-4-(对甲苯基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (s, 1H), 6.95-6.83 (m, 4H), 6.60-6.56 (m, 3H), 3.40-3.37 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.06 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1):296.4

[0510]

31.	N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (s, 1H), 7.07 (q, 2H), 6.75 (d, 1H), 6.65 (s, 1H), 6.32 (q, 2H), 3.28 (q, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.89 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.94 (s, 3H), 1.17 (s, 9H), 1.09 (t, 3H); (M+1):352.1
32.	N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.14-7.10 (m, 2H), 6.97 (s, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.63-6.60 (m, 3H), 3.36 (q, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.19 (s, 9H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 338.4
33.	N'-(4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (s, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.26-7.22 (m, 1H), 7.03-6.95 (m, 2H), 6.60 (d, 2H), 3.35 (q, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.89 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.08 (t, 3H); (M+1):330.2
34.	N'-(2-氟-4-((2-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (s, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.09-7.03 (m, 3H), 6.89 (s, 1H), 6.70 (td, 1H), 6.39 (dd, 1H), 3.49-3.28 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 336.55
35.	N-乙基-N'-(4-((2-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.37-7.11 (m, 4H), 7.02 (d, 1H), 6.80-6.78 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 3.41-3.33 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 300.15
36.	N-乙基-N'-(4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (s, 1H), 7.04-6.97 (m, 2H), 6.84-6.79 (m, 2H), 6.72 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.35-3.25 (m, 2H), 3.06 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 314.30
37.	N'-(2-氟-4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.08-7.03 (m, 2H), 6.94 (s, 1H), 6.92-6.87 (m, 2H), 6.83 (s, 1H), 3.38-3.24 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 334.05
38.	N-乙基-N'-(4-((3-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 7.47 (s, 1H), 7.06 (td, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.67 (s, 1H), 6.36-6.31 (m, 1H), 6.25 (dd, 1H), 6.18 (dt, 1H), 3.61-3.25 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 3.03 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.21 (t, 3H); (M+1): 314.35
39.	N-乙基-N'-(4-((4-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 7.46 (s, 1H), 6.82-6.78 (m, 3H), 6.65 (s, 1H), 6.41-6.34 (m, 2H), 3.48-3.32 (m, 2H), 3.16 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.03 (s, 3H), 1.22 (t, 3H); (M+1): 314.15

[0511]

	化物	
40.	N'-(4-((2-氯苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：25
41.	N-(4-(((乙基(甲基)氨基)亚甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-苯基乙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.26-7.06 (m, 6H), 6.66 (s, 1H), 3.37-3.28(m, 2H), 2.87 (s, 3H), 2.10 (s, 6H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):324.1
42.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(吡啶-2-基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.10 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.39-7.34 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.58 (dd, 1H), 6.05 (d, 1H), 3.46-3.34 (m, 2H), 3.25 (s, 3H), 3.00 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 318.10
43.	N'-(4-((4-氯苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.11-7.08 (m, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.65 (s, 1H), 6.62-6.58 (m, 2H), 3.37 (q, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 316.10
44.	N-乙基-N'-(4-((4-氟苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 7.43 (s, 1H), 6.92-6.86 (m, 3H), 6.75-6.71 (m, 2H), 6.64 (s, 1H), 5.55-4.48 (m, 1H), 3.39-3.43 (m, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.24 (t, 3H); (M+1): 300.25
45.	N-乙基-N'-(4-((2-甲氧基苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 7.45 (s, 1H), 7.05 (s, 1H), 6.86-6.70 (m, 4H), 6.64 (s, 1H), 5.71 (s, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.39-3.38 (m, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.20 (t, 3H); (M+1): 312.20
46.	N-乙基-N'-(4-((3-氟苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 7.44 (s, 1H), 7.10 (dd, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.50-6.37 (m, 3H), 5.33 (s, 1H), 3.43-3.37 (m, 2H), 3.21 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.19 (t, 3H); (M+1): 300.10
47.	N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 7.53 (s, 1H), 7.23 (s, 1H), 7.05 (ddd, 1H), 6.96 (t, 1H), 6.85-6.73 (m, 3H), 5.38 (s, 1H), 3.36 (q, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.29-1.23 (m, 3H);(M+1):320.1
48.	N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例：26
49.	N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺	实施例：28

[0512]

50.	N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 27
51.	N-(3-氯苯基)-N, 2, 5-三甲基-4-((吡啶-1-基亚甲基) 胺基)苯胺	实施例: 29
52.	N-烯丙基-N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	实施例: 31
53.	N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-异丙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.11-7.07 (m, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.60-6.58 (m, 1H), 6.36-6.35 (m, 2H), 3.79-3.65 (m, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.83 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.22 (d, 6H); (M+1): 344.4
54.	N'-(4-((2-溴苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.46-7.43 (m, 2H), 7.26-7.13 (m, 1H), 7.08-7.04 (m, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.66 (d, 2H), 6.59-6.55 (m, 1H), 6.32 (dd, 1H), 2.93 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 362.0
55.	N'-(4-((3-氯苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 7.45 (s, 1H), 7.06 (t, 1H), 6.97 (s, 1H), 6.70-6.68 (m, 2H), 6.64 (d, 1H), 6.56 (dd, 1H), 6.27 (s, 1H), 3.37- 3.33 (m, 2H), 3.01 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.22 (t, 3H); (M+1): 316.10
56.	N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.57 (s, 1H), 6.78-6.66 (m, 6H), 6.59 (s, 1H), 3.65 (s, 3H), 3.44-3.33 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 2.01(s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 312.0
57.	N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.46-7.44 (m, 1H), 7.26 (t, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.73-6.69 (m, 2H), 6.36 (d, 1H), 3.35-3.29 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 350.30
58.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.51-7.42 (m, 3H), 7.15 (dd, 2H), 6.65 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.35 - 3.29 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 364.15
59.	N'-(2,5-二甲基-4-((4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.89 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.37 (d, 2H), 6.88 (s, 1H), 6.67-6.64 (m, 3H), 3.35 (q, 2H), 2.92

[0513]

	基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	(s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 350.15
60.	N'-(2,5-二甲基-4-((3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.66 (s, 1H), 6.58 (dd, 2H), 6.49 (dd, 1H), 6.43 (d, 1H), 3.39-3.35 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 366.15
61.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.40 (d, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.73 (s, 1H), 6.51 (d, 2H), 3.39-3.34 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 364.35
62.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.18 (t, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.52-6.50 (m, 1H), 6.40 (dd, 1H), 6.24 (s, 1H), 3.37-3.31 (m, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 380.35
63.	N'-(2,5-二甲基-4-((3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.01 (t, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.63 (s, 1H), 6.50-6.47 (m, 2H), 6.40-6.37 (m, 1H), 3.54-3.26 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 328.15
64.	N'-(4-((2-溴苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 7.58-7.53 (m, 2H), 7.30-7.26 (m, 1H), 6.99 (dd, 1H), 6.92 (td, 1H), 6.64 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.35-3.21 (m, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 376.05
65.	N-乙基-N'-(4-((2-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.57 (s, 1H), 6.88-6.84 (m, 2H), 6.74-6.71 (m, 2H), 6.60 (dd, 1H), 6.52 (s, 1H), 3.67 (s, 3H), 3.47-3.33 (m, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.83 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 326.35
66.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.03 (t, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.49 (dd, 1H), 6.28 (t, 1H), 6.18 (dd, 1H), 3.54-3.26 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 342.25
67.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.09-7.04 (m, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.57-6.56 (m, 2H), 6.47-6.45 (m, 1H), 3.47-3.45 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 348.10

[0514]

68.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(间甲苯基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.76 (s, 1H), 7.30-7.14 (m, 1H), 7.08-6.89 (m, 2H), 6.89-6.71 (m, 1H), 6.56-6.38 (m, 3H), 3.51-3.19 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.19 (s, 6H), 1.20 (t, 3H); (M+1): 316.1
69.	N'-(2-氯-4-((3-甲氧基苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.06-7.01 (m, 2H), 6.84 (s, 1H), 6.30-6.24 (m, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.47-3.36 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 332.1
70.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(邻甲苯基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.97-7.91 (m, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.73 (td, 1H), 6.61 (s, 1H), 6.46 (d, 1H), 3.34-3.22 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 316.10
71.	N'-(2-氯-4-((4-氯苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (d, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.15 (d, 2H), 7.05 (s, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.67 (d, 2H), 3.44-3.36 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 337.10
72.	N'-(2,5-二甲基-4-(邻甲苯基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (s, 1H), 7.03 (d, 1H), 6.92-6.88 (m, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.63-6.57 (m, 2H), 6.39 (s, 1H), 6.30 (d, 1H), 3.39-3.33 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 296.20
73.	N'-(2-氯-4-((4-甲氧基苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.84-6.78 (m, 5H), 3.40-3.37 (m, 2H), 3.33 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.15-1.10 (t, 3H); (M+1): 332.15
74.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(邻甲苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (s, 1H), 7.13 (t, 2H), 6.96-6.91 (m, 2H), 6.80 (s, 1H), 6.74 (s, 1H), 3.37 (q, 2H), 2.93 (s, 6H), 1.96 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 330.20
75.	N'-(4-((2-溴苯基)氨基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (s, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.13-7.09 (m, 1H), 7.03 (s, 1H), 6.88 (d, 2H), 6.65 (td, 1H), 6.39 (dd, 1H), 3.46-3.36 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.03 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 381.95
76.	N'-(4-((2-溴苯基)(甲基)氨基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 7.33 (t, 1H), 7.03-6.96 (m, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.40-3.28 (m, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 1.93 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 395.7
77.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(邻甲苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.57 (s, 1H), 7.14-7.10 (m, 1H), 7.06-7.05 (m, 1H), 6.94-6.92 (m, 1H), 6.87 (td, 1H), 6.58 (s, 1H), 6.52 (s, 1H), 3.53-3.33 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.89 (s, 3H), 2.02 (s, 6H), 1.86 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 310.25
78.	N'-(2-氯-4-((2-甲氧基苯基)氨基)-5-甲基	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 6.98 (s, 1H), 6.94-6.91 (m, 1H), 6.84

[0515]

	苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	(s, 1H), 6.76-6.69 (m, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.46 (dd, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.34 (q, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 332.1
79.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (d, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.09 (d, 2H), 6.90 (d, 1H), 6.81 (t, 1H), 6.40 (d, 1H), 3.44-3.35 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 370.15
80.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70-7.57 (m, 3H), 7.26-7.22 (m, 2H), 6.80-6.77 (m, 2H), 3.40-3.26 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 384.20
81.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.03 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.43 (d, 2H), 7.11 (s, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.71 (d, 2H), 3.44-3.35 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 370.05
82.	N'-(2-氯-4-((3-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 2H), 7.13 (dd, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.48 (dd, 1H), 6.45-6.40 (m, 1H), 6.34 (dt, 1H), 3.43-3.36 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 320.10
83.	N'-(2-氯-4-((4-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.02-6.96 (m, 3H), 6.84 (s, 1H), 6.76-6.72 (m, 2H), 3.40-3.32 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 320.05
84.	N'-(2-氯-4-((3-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.14-7.08 (m, 2H), 6.94 (d, 1H), 6.43-6.38 (m, 1H), 6.21-6.17 (m, 2H), 3.45-3.36 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 3.00 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 334.15
85.	N'-(2-氯-4-((4-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.99-6.90 (m, 3H), 6.45-6.42 (m, 2H), 3.40-3.25 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 334.20
86.	N'-(2,5-二甲基-4-((3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.27 (t, 1H), 6.88-6.80 (m, 4H), 6.67 (s, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 350.15
87.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.85 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.33 (t, 1H), 7.08 (d, 1H), 6.96-6.87 (m, 4H), 3.46-3.35 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 370.10

[0516]

	物	
88.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (s, 1H), 7.33 (t, 1H), 7.15 (s, 1H), 6.97-6.93 (m, 2H), 6.69-6.64 (m, 2H), 3.46-3.33 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 384.15
89.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (s, 1H), 7.29 (t, 1H), 6.88-6.85 (m, 2H), 6.72 (s, 1H), 6.66-6.60 (m, 2H), 3.41-3.39 (m, 2H), 3.16 (s, 3H), 2.95 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.94 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 364.30
90.	N'-(4-((2,6-二氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.55 (s, 1H), 7.07-6.95 (m, 3H), 6.56 (d, 2H), 6.31 (s, 1H), 3.35-3.29 (m, 1H), 2.89 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 318.35
91.	N'-(2-氯-4-((2,6-二氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 1H), 7.15-7.05 (m, 3H), 6.80 (d, 2H), 6.39 (s, 1H), 3.35-3.31 (m, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 338.1
92.	N'-(4-((2,6-二氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.55-7.49 (m, 1H), 7.10-6.96 (m, 3H), 6.84 (s, 1H), 6.49 (s, 1H), 3.35-3.24 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 2.89 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.86 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 332.35
93.	N'-(2-氯-4-((2,6-二氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (s, 1H), 7.16-7.11 (m, 1H), 7.07-7.02 (m, 3H), 6.70 (s, 1H), 3.47-3.34 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 352.15
94.	N'-(4-((2-氯-6-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.55 (s, 1H), 7.30-7.28 (m, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.01 (td, 1H), 6.55 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.22 (s, 1H), 3.35-3.28 (d, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 334.7
95.	N'-(2-氯-4-((2-氯-6-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.28-7.23 (m, 1H), 7.13 (td, 1H), 6.78 (d, 2H), 6.27 (s, 1H), 3.39-3.34 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 354.1
96.	N'-(4-((2-氯-6-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.55 (s, 1H), 7.31-7.28 (m, 1H), 7.18-7.14 (m, 2H), 6.81 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 3.35-3.28 (d, 2H), 3.14 (s, 3H), 2.89 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.09 (t, 3H); (M+1): 348.65

[0517]

	化物	
97.	N'-(2,5-二甲基-4-((4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.05 (s, 1H), 7.64-7.53 (m, 3H), 6.89 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.59 (d, 2H), 3.49-3.32 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 408.15
98.	N'-(4-((2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 2H), 7.61-7.59 (m, 1H), 7.16 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 6.35 (s, 1H), 3.41-3.35 (m, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.08 (t, 3H); (M+1): 418.10
99.	N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.21-7.17 (m, 2H), 7.05-7.01 (m, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.67-6.61 (m, 2H), 6.35 (dd, 1H), 3.35 (s, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 366.1
100.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.23-7.21 (m, 1H), 7.11-7.07 (m, 1H), 7.01 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 6.77-6.70 (m, 1H), 6.42 (dd, 1H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 386.65
101.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.79-7.62 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.65-6.51 (m, 3H), 3.44-3.35 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 386.40
102.	N'-(2,5-二甲基-4-((4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.06 (d, 2H), 6.87 (s, 1H), 6.64-6.61 (m, 3H), 3.35-3.31 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 366.05
103.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (d, 2H), 7.12 (d, 2H), 7.08 (s, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.73-6.69 (m, 2H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 386.35
104.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (s, 1H), 7.26-7.22 (m, 1H), 7.17-7.15 (m, 1H), 7.00 (dd, 1H), 6.94-6.90 (m, 1H), 6.60 (d, 2H), 3.35-3.31 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.10 (t,

[0518]

	胺化物	3H); (M+1): 380.15
105.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.31-7.27 (m, 1H), 7.21-7.19 (m, 1H), 7.10 (dd, 1H), 7.02-6.97 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.42-3.32 (m, 2H), 3.06 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 400.65
106.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.08 (d, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.43 (dd, 2H), 3.34-3.29 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 380.10
107.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.12-7.10 (m, 3H), 6.94 (d, 1H), 6.49-6.45 (m, 2H), 3.45-3.32 (m, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 400.70
108.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.42 (dd, 1H), 6.28 (s, 1H), 3.45-3.33 (m, 2H), 3.15 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 400.60
109.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(N-苯基乙基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.36-7.34 (m, 4H), 7.23-7.16 (m, 1H), 6.90 (d, 1H), 3.33 (m, 4H), 2.96 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.22 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 394.35
110.	N'-(2-氯-4-((2,4-二氯-6-(三氟甲基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.82 (s, 2H), 7.71 (s, 1H), 7.36 (s, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.50 (s, 1H), 3.34 (q, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 439.95
111.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.17 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.59 (d, 2H), 7.12 (s, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.65 (d, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 428.0
112.	N'-(2-氯-4-((2-氯-6-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物;	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.26-7.24 (m, 2H), 7.03 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 3.39-3.24 (m, 2H), 3.16 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 1.69 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 368.95

[0519]

113.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (s, 1H), 7.57 (d, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.73 (s, 1H), 6.45 (d, 2H), 3.40-3.24 (m, 2H), 3.19 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 422.2.
114.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 7.57 (d, 2H), 7.13 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.45 (d, 2H), 3.43-3.30 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 442.15
115.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.08-7.03(m, 2H), 6.92 (d, 1H), 6.54 (dd, 1H), 6.31 (t, 1H), 6.20 (dd, 1H), 3.32-3.26 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 362.15
116.	N'-(2,5-二甲基-4-((2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.21-7.15 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.64-6.60 (m, 2H), 6.33 (dd, 1H), 3.34-3.30 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 382.10
117.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.30-7.26 (m, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.92 (d, 1H), 6.73 (td, 1H), 6.37 (dd, 1H), 3.45-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 402.15
118.	N'-(4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62-7.12 (m, 4H), 6.87 (s, 1H), 6.77-6.76 (m, 2H), 6.70-6.65 (m, 2H), 3.34-3.40 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 364.15
119.	N'-(2,5-二甲基-4-((4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.91 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.37 (d, 2H), 6.89 (s, 1H), 6.67-6.62 (m, 3H), 3.48-3.33 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 382.20
120.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.03 (s, 1H), 7.74-7.65 (m, 1H), 7.42 (d, 2H), 7.11 (s, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.69 (d, 2H), 3.44-3.33 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 402.10

[0520]

121.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63-7.43 (m, 3H), 7.22 (dd, 1H), 7.02 (td, 1H), 6.66 (s, 1H), 6.33 (s, 1H), 3.46-3.33 (m, 2H), 3.01 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 396.40
122.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (s, 1H), 7.54-7.49 (m, 2H), 7.27 (dd, 1H), 7.10 (td, 1H), 6.88 (d, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.38-3.32 (m, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 416.15
123.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.39 (d, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.48 (d, 2H), 3.34-3.26 (m, 2H), 3.16 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 396.40
124.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.43 (d, 2H), 7.15 (s, 1H), 6.96 (d, 1H), 6.51 (d, 2H), 3.46-3.33 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 416.15
125.	N'-(4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.40 (t, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.78 (d, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 6.50 (d, 1H), 3.50-3.34 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 378.35
126.	N'-(2,5-二甲基-4-((3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (d, 2H), 7.21 (t, 1H), 6.88-6.78 (m, 4H), 6.66 (s, 1H), 3.50-3.23 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 382.30
127.	N'-(2,5-二甲基-4-((4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.10 (d, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.62-6.59 (m, 3H), 3.48-3.33 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 328.30
128.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.14 (d, 2H), 7.04 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.69 (d, 2H), 3.41-3.34 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 348.10
129.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (s, 1H), 7.25 (t, 1H), 6.85-6.81 (m, 2H), 6.72 (s, 1H), 6.61-6.55 (m, 2H), 3.34-3.31 (m, 2H), 3.01 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 396.40

[0521]

	基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3.14 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.94 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 396.40
130.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-((三氟甲基)硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.28 (t, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.96-6.93 (m, 2H), 6.68 (d, 1H), 6.63 (s, 1H), 3.46-3.33 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 416.15
131.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.11 (d, 2H), 6.80 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.39 (d, 2H), 3.38-3.34 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 342.25
132.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.13 (d, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.42 (d, 2H), 3.34-3.25 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 362.15
133.	N'-(2,5-二甲基-4-((3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.82 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.27 (t, 1H), 7.04-7.01 (m, 2H), 6.88 (s, 1H), 6.78-6.76 (m, 1H), 6.68 (s, 1H), 3.46-3.28 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.03 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 408.15
134.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.95 (s, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.33 (t, 1H), 7.10-7.07 (m, 3H), 6.91 (s, 1H), 6.84 (d, 1H), 3.46-3.43 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 428.65
135.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.31 (t, 1H), 7.04 (dd, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.73 (s, 2H), 6.67 (d, 1H), 3.35-3.33 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 422.3
136.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3-(五氟-16-氢硫基(sulfaneyl))苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (s, 1H), 7.34 (t, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 6.75 (s, 1H), 6.69 (d, 1H), 3.46-3.40 (m, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.13-1.16 (m, 3H); (M+1): 442.15
137.	N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.27 (s, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.00 (s, 2H), 6.91 (s, 1H), 6.72 (s, 1H), 3.34-3.30 (m,

[0522]

	二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2.92 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 418.35
138.	N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)氨基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.38 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.05 (s, 2H), 6.96 (s, 1H), 3.45-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 438.15
139.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((3-((三氟甲基)硫基)苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.79 (s, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.27 (t, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.90-6.85 (m, 3H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 402.15
140.	N'-(2-氯-4-((4-(二甲基氨基)苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 6.83-6.79 (m, 3H), 6.75-6.68 (m, 4H), 3.48-3.23 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.79 (s, 6H), 2.11 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 345.20
141.	N'-(4-((4-(二甲基氨基)苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.55 (s, 1H), 6.71 (d, 3H), 6.66-6.63 (m, 2H), 6.54 (d, 2H), 3.35-3.31 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.76 (s, 6H), 2.10 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 325.25
142.	N'-(2-氯-4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73-7.63 (m, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.88-6.83 (m, 3H), 6.75 (dd, 1H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 384.20
143.	N'-(2-氯-4-((3-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 6.58 (t, 1H), 6.54 (dd, 1H), 3.45-3.33 (m, 2H), 3.14 (s, 3H), 3.00 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 398.95
144.	N'-(4-((3-(二氟甲氧基)苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (s, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27-6.90 (m, 2H), 6.87 (s, 1H), 6.65 (s, 1H), 6.45 (dd, 1H), 6.35 (dd, 1H), 6.31 (t, 1H), 3.35 (q, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 348.40
145.	N'-(4-((3-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.30-6.93 (m, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.37 (dd, 1H), 6.24 (dd, 1H), 6.14

[0523]

	基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	(t, 1H), 3.34 (q, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 362.50
146.	N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (s, 2H), 7.30-6.93 (m, 3H), 6.87 (s, 1H), 6.52 (dd, 1H), 6.44 (dd, 1H), 6.39 (t, 1H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.08 (t, 3H); (M+1): 368.35
147.	N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (s, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.15-6.77 (m, 4H), 6.64-6.60 (m, 3H), 3.35 (q, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 348.40
148.	N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.47 (s, 1H), 7.17-6.73 (m, 4H), 6.74-6.64 (m, 1H), 6.47-6.35 (m, 2H), 3.52-3.31 (m, 2H), 3.05 (s, 3H), 2.81 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.06 (t, 3H); (M+1): 362.50
149.	N'-(2,5-二甲基-4-((2-(三氟甲氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.19-6.81 (m, 5H), 6.74-6.70 (m, 2H), 3.41-3.34 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 368.35
150.	N'-(2-氯-4-((4-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.16-6.79 (m, 5H), 6.47-6.43 (m, 2H), 3.45-3.32 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 382.0
151.	N'-(4-((2,5-二氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64-7.51 (m, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.12-7.05 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.37-6.32 (m, 1H), 6.02-5.97 (m, 1H), 3.35-3.30 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 318.3
152.	N'-(2-氯-4-((2,5-二氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.16-7.10 (m, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 6.45 (tt, 1H), 6.18-6.14 (m, 1H), 3.44-3.33 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 338.15
153.	N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.85 (s, 2H), 6.77 (s, 1H), 3.46-3.35 (m, 2H), 3.25 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.95 (s, 3H),

[0524]

	基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	1.13 (t, 3H); (M+1): 432.45
154.	N'-(4-((3,5-双(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.76 (s, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.87 (s, 2H), 3.41 (q, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 452.20
155.	N'-(2,5-二甲基-4-((5-甲基-2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.77 (s, 1H), 6.66 (s, 1H), 6.51 (d, 1H), 6.14 (s, 1H), 3.36 (q, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.09 (t, 3H); (M+1): 364.4
156.	N'-(4-((2,5-二氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.54 (s, 1H), 7.04-6.97 (m, 1H), 6.73 (s, 1H), 6.63-6.53 (m, 3H), 3.35-3.27 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.06 (s, 6H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 332.15
157.	N'-(2-氯-4-((2,5-二氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (bs, 1H), 7.08-7.01 (m, 1H), 6.96 (s, 1H), 6.85 (d, 1H), 6.75-6.69 (m, 1H), 6.67-6.61 (m, 1H), 3.43-3.33 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 352.7
158.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(5-甲基-2-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 6.96 (d, 2H), 6.64 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.35-3.27 (m, 2H), 3.06 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 378.2
159.	N'-(4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (bs, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.19 (s, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.32 (d, 1H), 3.35-3.30 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 384.6
160.	N'-(2-氯-4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.37 (dd, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.91 (d, 1H), 6.36 (d, 1H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 405.2
161.	N'-(4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63-7.57 (m, 3H), 7.14 (d, 1H), 6.64 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.35-3.27 (m, 2H), 3.07

[0525]

	基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	(s, 3H), 2.89 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.11-1.07 (m, 3H) (M+1): 398.2
162.	N'-(2-氯-4-((4-氯-2-(三氟甲基)苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59-7.70 (m, 3H), 7.26 (d, 1H), 6.82 (s, 2H), 3.42-3.33 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.10-1.16 (m, 3H); (M+1): 419
163.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(2-(甲基硫基)苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.18 (dd, 1H), 7.10 (td, 1H), 7.06 (td, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.82 (dd, 1H), 6.74 (s, 1H), 3.30-3.28 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.86 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 363.15
164.	N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.42 (dd, 2H), 6.26 (dd, 1H), 6.18 (t, 1H), 3.45-3.34 (m, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.95 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 383.00
165.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((2-(甲基硫基)苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.07-7.03 (m, 1H), 6.90 (s, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.81 (td, 1H), 6.77 (s, 1H), 6.49 (dd, 1H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 349.10
166.	N'-(4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68-7.62 (m, 3H), 7.34 (dd, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.32 (d, 1H), 3.36 (q, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.11-1.16 (m, 3H); (M+1): 384.55
167.	N'-(2-氯-4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.77-7.66 (m, 3H), 7.40-7.37 (m, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.35 (d, 1H), 3.46-3.35 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 404.15
168.	N'-(4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60-7.62 (m, 3H), 7.24 (d, 1H), 6.64 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.35 (q, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 398.60
169.	N'-(2-氯-4-((2-氯-4-(三氟甲基)苯基)(甲基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74-7.63 (m, 3H), 7.29 (d, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 3.43-3.35 (m, 2H), 3.09

[0526]

	基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	(s, 3H), 2.95 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.11-1.14 (m, 3H); (M+1): 418.20
170.	N'-(2,5-二甲基-4-((2-(甲基硫基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.02-6.98 (m, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.69-6.65 (m, 2H), 6.60 (s, 1H), 6.37 (dd, 1H), 3.35-3.29 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 328.45
171.	N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.18-7.13 (m, 1H), 6.98-6.91 (m, 2H), 6.65 (s, 1H), 6.58-6.54 (m, 2H), 3.35-3.23 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 416.25
172.	N'-(2-氯-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (d, 2H), 7.24-7.19 (m, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.96-6.70 (m, 2H), 6.66-6.62 (m, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 436.10
173.	5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.21-7.16 (m, 1H), 6.93-6.66 (m, 3H), 6.38 (dt, 1H), 6.27 (dd, 1H), 3.39 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.14-1.07 (t, 3H); (M+1): 430.1
174.	N'-(2-氯-4-(N-(2-氟苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74-7.65 (m, 3H), 7.42-7.36 (m, 1H), 7.35-7.29 (m, 1H), 7.26-7.22 (m, 1H), 6.88 (d, 1H), 3.44-3.32 (m, 2H), 3.20 (d, 3H), 2.95 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 398.15
175.	N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氟苯基)乙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.84-7.77 (m, 6H), 6.86-6.74 (m, 1H), 3.34-3.32 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 362.20
176.	N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N,N-二甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.03-7.01 (m, 2H), 6.94 (s, 1H), 6.87-6.82 (m, 2H), 6.82 (s, 1H), 3.07 (s, 3H), 3.00 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.01 (s, 3H); (M+1): 320.50
177.	N'-(2-氯-4-(乙基(2-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.08-7.00 (m, 3H), 6.88-6.80 (m, 3H), 3.52 (q, 2H), 3.37 (q, 2H), 2.94 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.14-1.07 (m, 6H); (M+1): 348.10
178.	5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.08-7.01 (m, 2H), 6.96 (s, 1H), 6.92-6.79 (m, 2H), 5.74 (s, 1H), 3.63-3.60 (m, 4H), 3.54-3.50 (m, 4H), 3.07 (s, 3H), 2.02 (s, 3H); (M+1): 362.10

[0527]

179.	5-氯-N-(2-氟苯基)-N,2-二甲基-4-((N-硫吗啉基亚甲基)胺基)苯胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.08-7.03 (m, 2H), 6.95 (s, 1H), 6.93-6.87 (m, 3H), 3.84-3.80 (m, 2H), 3.64-3.60 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.62-2.60 (m, 4H), 2.02 (s, 3H); (M+1): 379.00
180.	N-乙基-N'-(5-氯-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.80 (s, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.22-7.17 (m, 1H), 6.99-6.66 (m, 5H), 3.41-3.36 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.12 (t, 3H) (M+1): 420.50
181.	N-乙基-N'-(5-氯-4-((4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)(甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.95-6.67 (m, 2H), 6.53 (dt, 1H), 6.46 (q, 1H), 3.43-3.33 (m, 2H), 3.16 (s, 3H), 2.95 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.16-1.08 (m, 3H); (M+1): 434.1
182.	N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氯苯基)乙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 6.95-7.66 (m, 5H), 6.90 (s, 1H), 3.39 (q, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.93 (s, 3H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 378.05
183.	N'-(2-氯-4-(N-(2-氯苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.87 (dd, 1H), 7.65-7.76 (m, 2H), 7.54 (dd, 1H), 7.42 (td, 1H), 7.39-7.35 (m, 1H), 6.87 (d, 1H), 3.43-3.44 (m, 2H), 3.24 (s, 3H), 2.95 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 414.10
184.	N'-(4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.36-7.08 (m, 3H), 6.88 (s, 1H), 6.66 (s, 1H), 6.63-6.59 (m, 2H), 3.36-3.21 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 364.50
185.	N'-(2-氯-4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.83 (s, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.39-7.10 (m, 3H), 7.09 (s, 1H), 6.89-6.83 (m, 1H), 6.67 (d, 2H), 3.44-3.35 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 384.35
186.	N'-(4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (s, 1H), 7.35-7.07 (m, 3H), 6.83 (s, 1H), 6.69 (d, 1H), 6.48-6.43 (m, 2H), 3.40-3.38 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 2.99 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 378.55
187.	N'-(2-氯-4-((4-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.37-7.09 (m, 4H), 6.95 (d, 1H), 6.49-6.46 (m, 2H), 3.40-3.35 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 399.0

[0528]

	甲基甲酰亚胺化物	
188.	N'-(2-氯-4-(乙基(苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.12-7.06 (m, 2H), 7.05 (d, 1H), 6.93 (d, 1H), 6.59 (t, 1H), 6.42 (d, 2H), 3.56 (q, 2H), 3.45-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.15(m, 3H), 1.06 (t, 3H); (M+1): 330.35
189.	N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-苯基乙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.38-7.16 (m, 6H), 6.92 (d, 1H), 3.39 (q, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.88 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 344.15
190.	N'-(2-氯-4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.49-7.09 (m, 5H), 6.93 (s, 1H), 6.75 (td, 1H), 6.43 (dd, 1H), 3.34-3.26 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.34 (t, 3H); (M+1): 385.00
191.	N'-(2-氯-4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (s, 1H), 7.53-7.23 (m, 3H), 7.13-7.07 (m, 2H), 6.83 (d, 1H), 6.67 (s, 1H), 3.45-3.41 (m, 2H), 3.00 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 398.35
192.	N'-(2-氯-4-(乙基(3-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.87 (s, 1H), 7.10-6.77 (m, 3H), 6.28-6.20 (m, 1H), 6.07-5.91 (m, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.60-3.50 (m, 2H), 3.43-3.23 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.35 (t, 3H), 0.98 (t, 3H); (M+1): 361.45
193.	N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.96-7.52 (m, 2H), 7.39-6.77 (m, 4H), 6.63-6.53 (m, 2H), 3.43-3.33 (m, 2H), 3.00 (s, 3H), 1.92 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 386.15
194.	N'-(2-氯-4-(N-(3-甲氧基苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.79-7.61 (m, 2H), 7.29 (t, 1H), 6.94-6.81 (m, 4H), 3.84-3.74 (m, 5H), 3.47 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 411.00
195.	N'-(4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.17-6.84 (m, 2H), 6.53 (dd, 1H), 6.60-6.36 (m, 2H), 6.46 (dd, 1H), 3.28-3.13 (m, 2H), 2.50(s, 3H), 1.91 (s, 6H), 1.62 (t, 3H); (M+1): 366.55

[0529]

196.	N'-(2-氯-4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.79 (s, 1H), 7.34-7.12 (m, 1H), 7.18-7.12 (m, 2H), 6.97 (d, 1H), 6.39-6.25 (m, 1H), 6.28-6.25 (m, 1H), 3.38-3.34 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.50 (s, 6H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 401.00
197.	N'-(4-((3-(二氟甲氧基)-4-氟苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (s, 1H), 7.29-6.92 (m, 2H), 6.81 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.35-6.29 (m, 1H), 6.18 (dt, 1H), 3.52-3.30 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.17(s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.25 (t, 3H); (M+1): 380.55
198.	N'-(4-((2,5-二甲基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (s, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.63 (s, 1H), 6.41 (d, 1H), 6.34 (s, 1H), 6.12 (s, 1H), 3.36 (q, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 2.12 (s, 6H), 2.01 (s, 3H), 1.11 (t, 3H) (M+1): 310.45
199.	N'-(2-氯-4-((2,5-二甲基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 6.97 (d, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.55 (d, 2H), 6.28 (s, 1H), 3.41-3.36 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 331.1
200.	N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氯苯基)丙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (s, 1H), 7.57-5.31 (5H), 6.90 (s, 1H), 3.38 (q, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.30-2.20 (m, 5H), 1.15 (t, 3H), 1.04 (t, 3H); (M+1): 393.45
201.	N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-甲氧基苯基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69-7.52 (m, 1H), 7.20 (s, 1H), 6.91-6.69 (m, 6H), 3.72-3.50 (m, 2H), 3.42 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 316.55
202.	N-乙基-N'-(5-氟-4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.76 (s, 1H), 6.98-6.95 (m, 1H), 6.79-6.75 (m, 3H), 6.60-6.57 (m, 2H), 3.67 (s, 3H), 3.39 (q, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.20 (t, 3H); (M+1): 330.40
203.	N-(5-氯-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(2-氟苯基)丙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.57-7.04 (m, 5H), 7.00-6.57 (m, 1H), 3.35-3.29 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.27-1.90 (m, 5H), 1.18 (t, 3H), 1.05 (t, 3H); (M+1): 376.55
204.	N'-(2-氯-4-(N-(4-氟-3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)甲基磺酰胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.78-7.67 (m, 2H), 7.52-7.45 (m, 2H), 7.41-7.37 (m, 1H), 7.02-6.74 (m, 2H), 3.46-3.34 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.10-1.15 (m, 3H); (M+1): 514.95

[0530]

205.	N'-(2,5-二甲基-4-((3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) 7.61 (s, 1H), 7.17-6.39 (m, 8H), 3.36 (q, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.00 (s, 3H); 2.28 (s, 3H), 1.27 (t, 3H); (M+1): 398.55
206.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (s, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.83 (t, 1H), 6.70 (d, 1H), 6.46 (d, 1H), 6.41-6.39 (m, 1H), 6.14 (s, 1H), 3.39-3.31 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 412.1
207.	N-乙基-N'-(4-((2-氟-5-甲基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (s, 1H), 6.96-6.91 (m, 2H), 6.79 (s, 1H), 6.64 (s, 1H), 6.42-6.39 (m, 1H), 6.21 (dd, 1H), 3.35 (q, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.10-2.03 (m, 9H), 1.13-1.10 (m, 3H); (M+1): 313.6
208.	N-乙基-N'-(5-氟-4-((2-氟苯基)胺基)-2-甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.89-6.96 (m, 2H), 6.75-6.69 (m, 2H), 6.63 (t, 1H), 3.38 (q, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 304.5
209.	N-乙基-N'-(4-((2-氟-5-甲基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (s, 1H), 6.87 (dd, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.64-6.59 (m, 3H), 3.39 (q, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 328.60
210.	N'-(2-氯-4-((2-氟-5-甲基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 6.90-6.95 (m, 2H), 6.82 (s, 1H), 6.71-6.68 (m, 2H), 3.35-3.25 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 349.05
211.	N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(苯基胺基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73-7.68 (m, 2H), 7.15-6.99 (m, 3H), 6.77-6.66 (m, 4H), 3.39-3.27 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.12-1.36 (m, 3H); (M+1): 286.35
212.	N'-(4-((2-氯苯基)胺基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 7.31 (dd, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 6.98 (d, 1H), 6.78-6.72 (m, 2H), 6.52 (d, 1H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 320.1
213.	N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)胺基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 7.37- 6.71 (m, 7H), 3.49-3.28 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.39 (s, 9H), 0.86 (t, 3H); (M+1): 342.7

[0531]

214.	N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(间甲基胺基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.79 (s, 1H), 7.43-7.34 (m, 1H), 7.03-6.96 (m, 2H), 6.74 (d, 1H), 6.55-6.49 (m, 3H), 3.43-3.30 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.03(s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.24 (t, 3H); (M+1): 300.4
215.	N-(5-氟-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-苯基丙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.85 (s, 1H), 7.55-7.04 (m, 6H), 6.99-6.84 (m, 1H), 3.40-3.19 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.30-1.88 (m, 5H), 1.18 (s, 3H), 1.04 (t, 3H); (M+1): 358.25
216.	N-(5-氟-4-(((乙基(甲基)胺基)亚甲基)胺基)-2-甲基苯基)-N-(3-甲氧基苯基)乙酰胺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.81 (s,1H), 7.51-7.08 (m, 2H), 7.12-6.69 (m, 4H), 3.64 (s, 3H), 3.45-3.30 (m, 2H), 2.84 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.81 (s, 3H),1.08 (t, 3H); (M+1): 375.05
217.	N'-(2-氟-4-((4-氟-3-甲氧基苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.78 (s, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.12-6.91 (m, 2H), 6.88-6.74 (m, 1H), 6.59-6.51 (m, 1H), 6.26-6.11 (m, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.54-3.27 (m, 2H), 3.03(s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.28 (t, 3H); (M+1): 351.05
218.	N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.94-6.88 (m, 2H), 6.63 (s, 1H), 6.48 (dd, 1H), 6.10 (dt, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.39-3.32 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 330.55
219.	N-乙基-N'-(4-((4-氟-3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 6.97-6.91 (m,1H), 6.85-6.66 (m, 1H), 6.25-6.20 (m, 1H), 5.87-5.84 (m, 1H), 5.78-5.75 (m, 1H), 3.64 (s, 3H), 3.39-3.30 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 344.60
220.	N'-(4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.84-6.47 (m, 5H), 6.70-6.54 (m, 2H), 6.39 (dd, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.31 (s, 3H),1.89 (s, 3H), 1.24 (t, 3H); (M+1): 364.45
221.	N'-(4-((2-((二氟甲基)硫基)苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.42-7.27 (m, 2H), 7.13-6.97 (m, 3H), 6.62 (d, 1H), 6.45 (d, 1H), 3.34-3.29 (m, 2H), 3.00 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 378.50
222.	N'-(2-氟-4-((4-氟-3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (s, 1H), 6.89-7.69 (m, 3H), 6.25 (dd, 1H), 5.88 (td, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.30-3.26 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.33 (s, 3H),

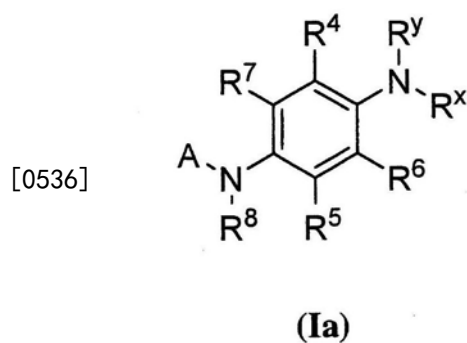
[0532]

	亚胺化物	1.13(t, 3H); (M+1): 365.05
223.	N'-(2-溴-6-氟-3-甲基-4-(苯基氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (d, 2H), 7.14-7.11 (m, 2H), 6.95 (d, 1H), 6.71-6.67 (m, 3H), 3.29-3.24 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.34 (t, 3H); (M+1): 365.35
224.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((5-侧氧基-5,6,7,8-四氢萘-2-基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.16 (s, 1H), 7.82-7.65 (m, 2H), 7.16-7.05 (m, 1H), 6.95-6.87 (m, 1H), 6.59-6.51 (m, 1H), 6.40-6.20 (m, 1H), 3.48-3.28 (m, 2H), 3.06 (m, 3H), 2.80-2.73 (m, 2H), 2.48-2.42 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.98-1.91 (m, 2H), 1.24-1.10 (t, 3H); (M+1): 370.15
225.	N'-(2-溴-6-氟-3-甲基-4-(甲基(苯基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (s, 1H), 7.31-7.04 (m, 3H), 6.70-6.66 (m, 1H), 6.48 (dd, 2H), 3.51-3.31 (m, 2H), 3.15 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 379.50
226.	N'-(2-氯-5-甲基-4-((1-甲基吡啶-5-基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69-7.49 (m, 1H), 6.81-6.69 (m, 3H), 6.67-6.59 (m, 2H), 6.47-6.40 (m, 1H), 3.38-3.24 (m, 2H), 3.26-3.05 (m, 2H), 3.01-2.85 (m, 3H), 2.85-2.73 (m, 2H), 2.66 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.22 (t, 3H); (M+1): 357.15
227.	N'-(2,5-二甲基-4-((5-侧氧基-5,6,7,8-四氢萘-2-基)氨基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.07 (s, 1H), 7.63 (d, 2H), 6.87 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.48 (dd, 1H), 6.31 (d, 1H), 3.35-3.30 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.72 (t, 2H), 2.42-2.39 (m, 2H), 2.12 (m, 2H), 2.05 (s, 3H), 1.92 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 350.35
228.	N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(甲基(苯基)氨基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.16-7.00 (m, 3H), 6.80-6.56 (m, 4H), 3.46-3.33 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.24-1.13 (m, 3H); (M+1):300.01
229.	N'-(4-((4-(三级丁基)苯基)(甲基)氨基)-5-氟-2-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 7.16 (d, 3H), 6.98 (d, 2H), 6.75 (d, 1H), 6.51 (d, 1H), 3.46-3.35 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.25 (s, 9H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 356.5
230.	N-乙基-N'-(5-氟-2-甲基-4-(甲基(间甲苯基)氨基)苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.03-6.99 (m, 2H), 6.78 (d, 1H), 6.51-6.37 (m, 3H), 3.34 (s, 3H), 3.15 (q, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.24-1.13 (m, 3H);(M+1):314.1
231.	N-乙基-N'-(7-((2-甲氧基苯基)氨基)-2,3-二氢-1H-茚-4-基)-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 6.90 (dd, 1H), 6.83-6.79 (m, 1H), 6.72 (td, 1H), 6.66 (td, 1H), 6.62-6.58 (m, 2H), 6.38 (s, 1H), 3.81 (2, 3H), 3.44-3.32 (m, 2H), 2.86 (s, 3H), 2.75-2.81 (m, 2H), 2.66 (t, 2H), 1.88-1.95 (m, 2H), 1.10 (t, 3H);

[0533]	232.	N-乙基-N-甲基-N'-(7-(对甲苯基胺基)-2,3-二氢-1H-茛-4-基)甲酰亚胺化物	(M+1): 324.30 ¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73-7.52 (m, 1H), 7.25-6.56 (m, 6H), 6.59 (dd, 1H), 3.34 (q, 2H), 2.68-2.91 (m, 6H), 2.33-1.89 (m, 6H), 1.34-1.10 (m, 3H); (M+1): 308.1
	233.	N'-(7-((4-氯苯基)胺基)-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68-7.55 (m, 2H), 7.17-7.12 (m, 2H), 6.92-6.60 (m, 4H), 3.34-3.42 (m, 2H), 2.92-2.67 (m, 5H), 2.52-2.50 (m, 2H), 2.08-1.89(m, 2H), 1.34-0.80 (m, 3H); (M+1): 328.15
	234.	N-乙基-N-甲基-N'-(4-(苯基胺基)萘-1-基)甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.39 (s, 1H), 7.97-7.80 (m, 3H), 7.44 (td, 2H), 7.26-6.63 (m, 7H), 3.58-3.22 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 1.40 (t, 3H); (M+1): 304.55
	235.	N'-(2,5-二甲基-4-(吡啶-2-基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.96 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.60-7.58 (m, 1H), 7.42-7.31 (m, 1H), 7.03 (s, 1H), 6.62 (s, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.42 (d, 1H), 3.35-3.31 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 283.30
	236.	N'-(2,5-二甲基-4-(甲基(吡啶-2-基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.08 (s, 1H), 7.73-7.47 (m, 1H), 7.33-7.28 (m, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.52 (dd, 1H), 5.97 (d, 1H), 3.41-3.40 (m, 2H), 3.24 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 297.40
	237.	N'-(2-氯-5-甲基-4-(吡啶-2-基胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.03-8.02 (m, 2H), 7.65 (d, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.49-7.45 (m, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.64-6.61 (m, 2H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 303.30

[0534] *使用Chemdraw Professional 16.0(化学绘制专业人员16.0)生成化合物名称

[0535] 表2提供通式 (Ia) 之化合物



[0537]

编号	化合物名称	分析数据
----	-------	------

[0538]

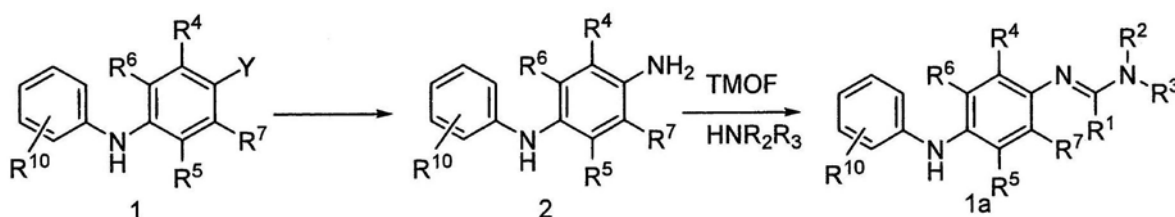
238	N1- (4-氯苯基) -2,5-二甲基苯-1,4-二胺	(M+1): 247
239	N' - (2-氯-4 - ((2-氟苯基) (甲基) 氨基) -5-甲基苯基) -N- 异丙基甲酰胺	¹ H-NMR, DMSO-d ₆) δ 7.47 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.08-7.02 (m, 2H), 6.93-6.87 (m, 3H), 6.76 (s, 1H), 4.00-3.85 (m, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.15 (d, 3H), 1.22 (d, 3H); (M+1): 335.80

[0539] *使用Chemdraw Professional 16.0 (化学绘制专业人员16.0) 生成化合物名称

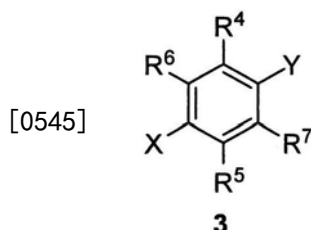
[0540] 可以已知方式,以反应式1至2所述的各种方法制备通式(I) 及/或在表1及2所定义的本发明化合物。

[0541] 反应式1

[0542]

[0543] 式1a化合物可在催化性pTSA存在下,以原甲酸三甲酯(trimethylorthoformate)处理化合物2,接着与式HNR₂R₃的二级胺反应,如US20110130282所述,而合成。

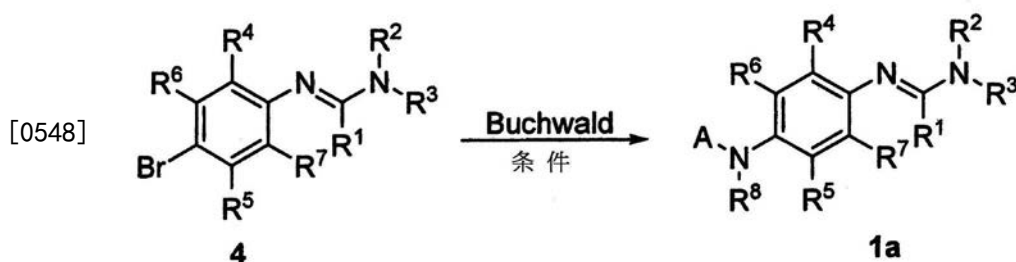
[0544] 化合物1为重要的中间体,其中Y为硝基或经保护之胺官能性且可由反应式3之化合物而合成



[0545]

[0546] 其中X为卤素且Y为硝基或经保护之胺官能性,具有如述于European Journal of Organic Chemistry, 2016 (10), page no.1908-1914; Green Chemistry, 2016, 16 (7), page no.3494-3500; 及Tetrahedron Letters, 2014, 55 (30), page no.4098-4101的对应苯胺衍生物。

[0547] 反应式2



[0548]

[0549] 式1a化合物亦可以适当经取代之苯胺,使用如述于J. Med. Chem 2012, vol. 55, 19, page no. 8538-48; Synlett 2012, vol. 23, 13, page no. 2504-10; 及Journal of Organic

Chemistry, 2010, vol. 75, 19, page no. 6477-88之Buchwald条件处理化合物4而合成。

[0550] 式4化合物可使用对应苯胺衍生物及使用已知文献方法转化彼等为脒而合成。

[0551] 本发明以下述非限制性实施例进一步说明。新颖化合物的结构通过NMR及/或下述给予之其他适当分析予以确认。

[0552] 实施例1

[0553] 制备N'-[2,5-二甲基-4-(苯基胺基)苯基]-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0554] 步骤A: 2,5-二甲基-N-苯基苯-1,4-二胺

[0555] 对4-苯胺基-2,5-二甲基硝基苯 (1.3g, 5.365mmol) 在1,4-二恶烷及浓HCl (1:1) (30ml) 中之搅拌溶液, 加入氯化锡(II) (3.62g, 16.097mmol)。在100℃加热反应混合物3-4小时。完成反应之后, 冷却反应混合物到室温且以碳酸氢钠小心地碱化到pH7-8。以5%甲醇/二氯甲烷 (3×100ml) 萃取水层。以水 (1×100ml)、盐水溶液 (1×100ml) 洗涤合并之有机层。以无水硫酸钠干燥有机层。过滤及在高真空下蒸发有机层以获得残质, 之后由急速层析法, 使用0-80%乙酸乙酯:己烷作为冲提液纯化以提供呈固体之2,5-二甲基-N-苯基苯-1,4-二胺 (0.9g)。LCMS (M+H) 249.75

[0556] 步骤B: N'-[2,5-二甲基-4-(苯基胺基)苯基]-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0557] 对4-苯胺基-2,5-二甲基苯胺 (0.8g, 3.791mmol) 在原甲酸三甲酯 (80ml) 中之搅拌溶液, 加入PTSA (0.02g, 0.113mmol) 且在100℃加热反应混合物6小时。在胺完全消失之后, 冷却反应混合物且蒸发挥发物。将1,4-二恶烷 (20ml) 加到残质, 接着加入N-乙基甲基胺 (0.45g, 7.582mmol)。在100℃加热反应混合物1-2小时。完成反应之后, 蒸发挥发物以获得残质, 之后由急速层析法, 以0-60%乙酸乙酯:己烷作为冲提液洗出而纯化以提供呈胶状物之N'-[2,5-二甲基-4-(苯基胺基)苯基]-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺 (0.25g)。¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 7.60 (bs, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.08 (t, J=7.8Hz, 2H), 6.88 (s, 1H), 6.64 (d, J=7.3Hz, 3H), 6.60 (t, J=7.3Hz, 1H), 3.51-3.35 (m, 2H), 3.02-2.84 (bs, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.12 (t, J=7.1Hz, 3H)。

[0558] 实施例2

[0559] 制备N'-{2,5-二甲基-4-[甲基(苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0560] 步骤A: 制备4-N-甲基苯胺基-2,5-二甲基苯胺

[0561] 对4-N-甲基苯胺基-2,5-二甲基硝基苯 (2.0g, 7.80mmol) 在1,4-二恶烷及浓HCl (1:1) (50ml) 中之搅拌溶液, 加入氯化锡(II) (3.62g, 16.097mmol)。在100℃加热反应混合物3-4小时。完成反应之后, 冷却反应混合物到室温且以碳酸氢钠小心地碱化到pH7-8。以5%甲醇/二氯甲烷 (3×100ml) 萃取水层。以水 (1×100ml)、盐水溶液 (1×100ml) 洗涤合并之有机层。以无水硫酸钠干燥有机层。过滤及在高真空下蒸发有机层以获得残质, 之后由急速层析法, 使用0-80%乙酸乙酯:己烷作为冲提液纯化以提供呈固体之4-N-甲基苯胺基-2,5-二甲基苯胺 (1.5g)。LCMS (M+H) 227.40。

[0562] 步骤B: 制备N'-{2,5-二甲基-4-[甲基(苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0563] 对4-N-甲基苯胺基-2,5-二甲基苯胺 (0.7g, 3.317mmol) 在原甲酸三甲酯 (80ml) 中之搅拌溶液, 加入PTSA (0.02g, 0.099mmol)。在100℃加热反应混合物6小时。完成反应之后, 冷却并蒸发反应混合物。对残质加入1,4-二恶烷, 接着加入N-乙基甲基胺 (0.392g,

6.635mmol)。在100℃加热反应混合物2小时。完成反应之后,蒸发挥发物。由急速层析法,以0-60%乙酸乙酯:己烷洗出而纯化残质以获得呈胶状物之N'-{2,5-二甲基-4-[甲基(苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺(0.25)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.73-7.51(bs,1H),7.09(t,J=8.0Hz,2H),6.82(s,1H),6.69(s,1H),6.61-6.54(m,1H),6.42(d,J=7.8Hz,2H),3.49-3.34(m,2H),3.11(s,3H),2.93(s,3H),2.12(s,3H),1.97(s,3H),1.13(t,J=7.1Hz,3H)。

[0564] 实施例3

[0565] 制备N'-[2-氯-5-甲基-4-(苯基胺基)苯基]-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0566] 步骤A:制备4-苯胺基-2-氯-5-甲基苯胺

[0567] 对4-苯胺基-2-氯-5-甲基硝基苯(2g,7.61mmol)、铁(2.12g,3.80mmol)及氯化铵(2.1g,3.80mmol)在乙醇-水(1:1.50ml)混合物中之搅拌溶液在9℃加热2小时。完成反应之后,内容物经硅钙石过滤。浓缩滤液并以乙酸乙酯(300ml)稀释,之后以饱和碳酸氢钠溶液洗涤。分离有机层,以无水硫酸钠干燥并浓缩以获得粗化合物,其由急速管柱层析法纯化以获得呈胶状物之4-苯胺基-2-氯-5-甲基苯胺(1.6g)。LCMS(M+H) 233.74

[0568] 步骤B:制备N'-[2-氯-5-甲基-4-(苯基胺基)苯基]-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0569] 对4-苯胺基-2-氯-5-甲基苯胺(0.8g,3.791mmol)在原甲酸三甲酯(80ml)中之搅拌溶液,加入PTSA(0.02g,0.1137mmol)且在100℃加热反应混合物6小时。完成反应之后,冷却反应混合物且蒸发挥发物。将1,4-二恶烷加到残质,接着加入N-乙基甲基胺(0.45g,0.65ml,7.582mmol)。在100℃加热反应混合物2小时。完成反应之后,减压下蒸发挥发物。由急速层析法,以0-60%乙酸乙酯:己烷洗出而纯化粗化合物以提供N'-[2-氯-5-甲基-4-(苯基胺基)苯基]-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺(0.25g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.76-7.56(br,1H),7.32(s,1H),7.14(t,J=7.8Hz,2H),7.06(s,1H),6.85(s,1H),6.72(d,J=8.2Hz,2H),6.68(t,J=7.3Hz,1H),3.42(m,2H),3.04-2.85(br,3H),2.11(s,3H),1.13(t,J=6.9Hz,3H)。

[0570] 实施例4

[0571] 制备N'-{2-氯-5-甲基-4-[甲基(苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0572] 步骤A:制备5-氯-N-2-二甲基-N-苯基苯-1,4-二胺

[0573] 对5-氯-N,2-二甲基-4-硝基-N-苯基苯胺(2g,7.24mmol)、铁(2.02g,36.17mmol)及氯化铵(1.93g,36.17mmol)在乙醇-水(1:1,50ml)混合物中之搅拌溶液在90℃加热2小时。完成反应之后,内容物经硅钙石过滤。浓缩滤液并以乙酸乙酯(300ml)稀释且之后以饱和碳酸氢钠溶液洗涤。分离有机层,以无水硫酸钠干燥并浓缩以获得粗化合物,其由急速管柱层析法纯化以获得呈固体之5-氯-N-2-二甲基-N-苯基苯-1,4-二胺(1.7g)。LCMS(M+H) 227.32。

[0574] 步骤B:制备N'-{2-氯-5-甲基-4-[甲基(苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0575] 对5-氯-N-2-二甲基-N-苯基苯-1,4-二胺(0.9g,3.6mmol)在原甲酸三甲酯(50ml)中之搅拌溶液,加入PTSA(0.02g,0.11mmol)且在100℃加热反应混合物6小时。完成反应之后,蒸发挥发物。对残质加入1,4-二恶烷,接着加入N-乙基甲基胺(0.45g,0.65ml,7.582mmol)。在100℃加热反应2小时。完成反应之后,蒸发挥发物且由急速层析法,以0-

60%乙酸乙酯:己烷洗出而纯化残质以提供N'-{2-氯-5-甲基-4-[甲基(苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺(0.8g)。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ7.79-7.63(br, 1H), 7.13(td, J=7.0, 1.6Hz, 2H), 7.08(s, 1H), 6.97-6.88(br, 1H), 6.64(t, J=7.1Hz, 1H), 6.46(d, J=7.7Hz, 2H), 3.51-3.36(m, 2H), 3.13(s, 3H), 3.05-2.91(br, 3H), 1.99(s, 3H), 1.15(t, J=6.9Hz, 3H)。

[0576] 实施例5

[0577] 制备N-[4-([乙基(甲基)胺基]甲亚基)胺基]-2,5-二甲基苯基]-N-苯基甲烷磺酰胺步骤A如上述实施例中所述的进行。

[0578] 步骤B:制备N-[4-([乙基(甲基)胺基]甲亚基)胺基]-2,5-二甲基苯基]-N-苯基甲烷磺酰胺

[0579] 对(N-(4-胺基-2,5-二甲基苯基)-N-苯基甲烷磺酰胺(0.5g, 1.722mmol)在原甲酸三甲酯(20.00ml)中之搅拌溶液加入对甲苯磺酸单水合物(0.016g, 0.086mmol)。在103℃搅拌反应混合物3小时。3小时之后,蒸发挥发物及在氮氛围下将1,4-二恶烷(20ml)加到残质。加入N-甲基乙胺(1.018g, 17.22mmol)并在103℃下搅拌3小时。完成反应之后,蒸发挥发物以获得粗化合物,其之后由急速管柱层析法纯化以获得所欲之N'-(2,5-二甲基-4-(N-苯基甲基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.294g)。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ7.73-7.53(br, 1H), 7.35(m, 4H), 7.28(s, 1H), 7.23-7.14(m, 1H), 6.69(s, 1H), 3.49-3.36(bs, 1H), 3.32-3.28(bs, 1H), 3.24(s, 3H), 3.02-2.87(br, 3H), 2.19(s, 3H), 2.16(s, 3H), 1.12(t, J=7.1Hz, 3H)。

[0580] 实施例6

[0581] 制备N'-{4-[(4-氯苯基)(甲基)胺基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0582] 步骤A:制备N-1-(4-氯苯基)-N'-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺

[0583] 对N-(4-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-硝基苯胺(0.6g, 2.064mmol)在乙醇(16ml)与水(4.00ml)中之溶液加入氯化铵(0.442g, 8.25mmol)及铁(1.152g, 20.64mmol)。在65℃搅拌反应混合物2小时。完成反应之后,反应冷却到室温且通过硅藻土过滤。蒸发滤液以获得残质,其于水中取得且以乙酸乙酯萃取。以水(2×100ml)、盐水溶液(1×100ml)洗涤乙酸乙酯层。收集有机层,以无水硫酸钠干燥。有机层过滤、蒸发以获得残质,其由急速层析法纯化以获得所欲之N1-(4-氯苯基)-N1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.5g)。LCMS(M+H) 261.77。

[0584] 步骤B:制备N'-{4-[(4-氯苯基)(甲基)胺基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0585] 对N-1-(4-氯苯基)-N'-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.5g, 1.917mmol)在原甲酸三甲酯(20ml)中之搅拌溶液加入对甲苯磺酸单水合物(0.036g, 0.192mmol)。在105℃搅拌反应团3小时。完成反应之后,蒸发挥发物。将二恶烷(20.00ml)加到残质,接着N-甲基乙胺(1.133g, 19.17mmol)且搅拌反应混合物3小时。完成反应之后,蒸发挥发物以获得粗产物,其由制备型HPLC纯化以获得所欲之N'-(4-((4-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.35g)。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ7.71-7.55(br, 1H), 7.12(dd, J=7.1, 2.1Hz, 2H), 6.83(s, 1H), 6.70(s, 1H), 6.40(dd, J=6.9, 2.3Hz, 2H), 3.48-3.34(bs, 1H), 3.31-3.25(bs, 1H), 3.11(s, 3H), 3.02-2.86(br, 3H), 2.12(s, 3H), 1.95(s, 3H),

1.13 (t, J=7.1Hz, 3H)。

[0586] 实施例7

[0587] 制备N'-{4-[(3-氯苯基)(甲基)胺基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺步骤A:制备N-1-(3-氯苯基)-N'-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺

[0588] 对N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-硝基苯胺(0.5g, 1.720mmol)在乙醇(15ml)与水(3.00ml)中之溶液加入氯化铵(0.46g, 8.6mmol)与铁(0.960g, 17.20mmol)。在65℃搅拌反应混合物2小时。完成反应之后,冷却反应混合物到室温,通过硅钙石过滤。蒸发滤液以获得残质,其于水中取得且以乙酸乙酯萃取。以无水硫酸钠干燥乙酸乙酯层,蒸发以获得残质,其由急速层析法纯化以获得所欲之N-1-(3-氯苯基)-N1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.4g)。LCMS (M+H) 262.77。

[0589] 步骤B:制备N'-{4-[(3-氯苯基)(甲基)胺基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0590] 对N-1-(3-氯苯基)-N'-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.4g, 1.534mmol)在原甲酸三甲酯(16ml)中之搅拌溶液加入对甲苯磺酸单水合物(0.029g, 0.153mmol)。在105℃搅拌反应混合物3小时。完成反应之后,蒸发挥发物。对残质加入二恶烷(16.00ml),接着N-甲基乙胺(0.907g, 15.34mmol)且在室温搅拌3小时。完成反应之后,蒸发挥发物以获得粗化合物,其之后由急速管柱层析法纯化以获得所欲之N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.23g)。¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ7.74-7.55 (br, 1H), 7.10 (t, J=8.5Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.60 (dot, J=7.3, 1.1Hz, 1H), 6.36 (m, 2H), 3.50-3.34 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 3.03-2.87 (bs, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.13 (t, J=7.1Hz, 3H)。

[0591] 实施例8

[0592] 制备N'-{4-[(3,4-二氯苯基)(甲基)胺基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0593] 步骤A:制备N-1-(3,4-二氯苯基)-N-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺

[0594] 对N-(3,4-二氯苯基)-N'-1,2,5-三甲基-4-硝基苯胺(0.6g, 1.845mmol)在乙醇(15ml)与水(3.75ml)中之搅拌溶液加入氯化铵(0.395g, 7.38mmol)与铁(1.030g, 18.45mmol)于其中。之后在65℃搅拌反应2小时。完成反应之后,通过硅钙石过滤反应混合物。蒸发滤液以获得残质,其介于乙酸乙酯与水之间分层。分离乙酸乙酯层,以无水硫酸钠干燥及蒸发以获得残质,其由急速层析法纯化以获得所欲之N-1-(3,4-二氯苯基)-N'-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.5g)。LCMS (M+H) 296.31。

[0595] 步骤B:制备N'-{4-[(3,4-二氯苯基)(甲基)胺基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0596] 对N-1-(3,4-二氯苯基)-N'-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.5g, 1.694mmol)在原甲酸三甲酯(20ml)中之搅拌溶液加入对甲苯磺酸单水合物(0.016g, 0.085mmol)。在105℃搅拌反应混合物3小时之后。蒸发挥发物且之后将二恶烷(20.00ml)加到残质,接着加入N-甲基乙胺(1.001g, 16.94mmol)。搅拌反应混合物3小时。完成反应之后,蒸发挥发物且由管柱层析法纯化粗产物以获得所欲之N'-(4-((3,4-二氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(270mg)。¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ7.77-7.52 (br, 1H), 7.29

(d, J=9.2Hz, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.73 (s, 1H), 6.55 (d, J=2.3Hz, 1H), 6.35 (dd, J=9.2, 2.3Hz, 1H), 3.52-3.35 (m, 2H), 3.13 (s, 3H), 3.03-2.87 (bs, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.13 (t, J=6.9Hz, 3H)。

[0597] 实施例9

[0598] 制备N'-{2-氯-5-甲基-4-[甲基(3,4,5-三氟苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0599] 步骤A: 5-氯-N,2-二甲基-N-(3,4,5-三氟苯基)苯-1,4-二胺

[0600] 对5-氯-N,2-二甲基-4-硝基-N-(3,4,5-三氟苯基)苯胺(0.53g, 1.603mmol)在乙醇-水混合物中之搅拌溶液加入铁(0.895g, 16.03mmol)与氯化铵(0.857g, 16.03mmol)。在90℃加热反应混合物2小时。完成反应之后,通过硅藻石过滤反应混合物,浓缩且以乙酸乙酯(30ml)稀释,以饱和碳酸氢钠洗涤,分离有机层,以无水硫酸钠干燥且浓缩以获得粗化合物,其由急速层析法纯化以获得呈浅棕色胶状物之5-氯-N-1,2-二甲基-N1-(3,4,5-三氟苯基)苯-1,4-二胺(0.35g)。LCMS (M+H) 301.71。

[0601] 步骤B: 制备N'-{2-氯-5-甲基-4-[甲基(3,4,5-三氟苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0602] 对5-氯-N-1,2-二甲基-N'-1-(3,4,5-三氟苯基)苯-1,4-二胺(0.3g, 0.998mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.019g, 0.100mmol)加入且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,在高真空下蒸发挥发物,以1,4-二恶烷(8ml)稀释内容物,在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.139ml, 1.596mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,在高真空下蒸发二恶烷且由急速管柱层析法,使用35-90%乙酸乙酯:己烷纯化以获得呈胶状物之N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(3,4,5-三氟苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.299g)。¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ7.83-7.64 (br, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.00-6.92 (br, 1H), 6.20 (dd, J=12.0, 6.0Hz, 2H), 3.49-3.34 (m, 2H), 3.13 (s, 3H), 3.05-2.92 (br, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.15 (t, J=6.9Hz, 3H)。

[0603] 实施例10

[0604] 制备N'-{2-氯-5-甲基-4-[甲基(3-甲基苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0605] 步骤A: 5-氯-N,2-二甲基-N-(3-甲基苯基)苯-1,4-二胺

[0606] 对5-氯-N,2-二甲基-4-硝基-N-(间甲苯基)苯胺(0.55g, 1.892mmol)、铁(1.056g, 18.92mmol)、及氯化铵(1.012g, 18.92mmol)在乙醇-水混合物中之搅拌溶液在90℃加热2小时。完成反应之后,通过硅藻石过滤反应混合物,浓缩且以乙酸乙酯(30ml)稀释,以饱和碳酸氢钠洗涤,分离有机层,以无水硫酸钠干燥且浓缩以获得残质,其由急速管柱层析法纯化以获得呈浅棕色胶状物之5-氯-N-1,2-二甲基-N1-(间甲苯基)苯-1,4-二胺(0.34g)。LCMS (M+H) 261.77。

[0607] 步骤B: 制备N'-{2-氯-5-甲基-4-[甲基(3-甲基苯基)胺基]苯基}-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0608] 对5-氯-N-1,2-二甲基-N-1-(间甲苯基)苯-1,4-二胺(0.34g, 1.304mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.025g, 0.130mmol)

且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,在真空下蒸发挥发物,以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质,在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.181ml,2.086mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发二恶烷且由急速管柱层析法,使用35-90%乙酸乙酯:己烷纯化残质以获得呈胶状物之N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(间甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.155g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.83-7.61(br,1H),7.07(s,1H),7.02(t,J=8.0Hz,1H),6.98-6.87(br,1H),6.25(dd,J=8.0,2.1Hz,1H),6.08-5.94(m,2H),3.65(s,3H),3.51-3.35(m,2H),3.11(s,3H),3.04-2.90(br,3H),1.99(s,3H),1.15(t,J=6.9Hz,3H)。

[0609] 实施例11

[0610] 制备N'-(2-氯-4-[(3,4-二氯苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0611] 步骤A如上述实施例中所述的进行。

[0612] 步骤B:制备N'-(2-氯-4-[(3,4-二氯苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0613] 对5-氯-N-1-(3,4-二氯苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.32g,1.014mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.019g,0.101mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,蒸发内容物,以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质,在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.141ml,1.622mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发二恶烷且由急速管柱层析法,使用35-90%乙酸乙酯:己烷纯化残质以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((3,4-二氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.302g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.83-7.64(br,1H),7.32(d,J=9.2Hz,1H),7.14(s,1H),7.02-6.89(br,1H),6.60(d,J=2.7Hz,1H),6.36(dd,J=8.9,3.0Hz,1H),3.50-3.34(m,2H),3.14(s,3H),3.05-2.89(br,3H),1.98(s,3H),1.15(t,J=6.9Hz,3H)。

[0614] 实施例12

[0615] N'-(2-氯-4-[(3-甲氧基苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0616] 步骤A如上述实施例中所述的进行。

[0617] 步骤B:制备N'-(2-氯-4-[(3-甲氧基苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0618] 对5-氯-N-1-(3-甲氧基苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.3g,1.084mmol)在原甲酸三甲酯(12ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.021g,0.108mmol)且在105℃加热反应内容物3小时。完成反应之后,在高真空下蒸发挥发物以获得残质,其在1,4-二恶烷(12ml)中取得。加入经添加的N-乙基甲基胺(0.151ml,1.734mmol)且在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发挥发物且由急速管柱层析法,使用35-90%乙酸乙酯:己烷纯化残质以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((3-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.347g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.81-7.62(br,1H),7.06(s,1H),7.00(t,J=7.8Hz,1H),6.97-6.88(br,1H),6.47(d,J=7.3Hz,1H),6.29(s,1H),6.25(dd,8.0,2.0Hz,1H),3.51-3.35(m,2H),3.11(s,3H),3.05-2.91(br,3H),

2.18 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.15 (t, J=7.1Hz, 3H)。

[0619] 实施例13

[0620] N'-(2-氯-5-甲基-4-{甲基[4-(三氟甲基)苯基]胺基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0621] 步骤A如上述实施例中所述的进行。

[0622] 步骤B:制备N'-(2-氯-5-甲基-4-{甲基[4-(三氟甲基)苯基]胺基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0623] 对5-氯-N-1,2-二甲基-N1-(4-(三氟甲基)苯基)苯-1,4-二胺(0.35g, 1.112mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.021g, 0.111mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。在完成起使材料转换之后,蒸发挥发物且以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.155ml, 1.779mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发二恶烷并由制备型HPLC纯化粗化合物以获得呈浅黄色胶状物之N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(4-(三氟甲基)苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.359g)。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ7.83-7.66(br, 1H), 7.45(d, J=8.7Hz, 2H), 7.16(s, 1H), 7.03-6.92(br, 1H), 6.55(d, J=8.7Hz, 2H), 3.51-3.35(m, 2H), 3.20(s, 3H), 3.05-2.90(br, 3H), 1.98(s, 3H), 1.16(t, J=6.9Hz, 3H)。

[0624] 实施例14

[0625] N'-(2-氯-5-甲基-4-[甲基(4-甲基苯基)胺基]苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0626] 步骤A如上述实施例中所述的进行。

[0627] 步骤B:制备N'-(2-氯-5-甲基-4-[甲基(4-甲基苯基)胺基]苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0628] 对5-氯-N-1,2-二甲基-N1-(对甲苯基)苯-1,4-二胺(0.35g, 1.342mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.026g, 0.134mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,在真空下蒸发挥发物,以1,4-二恶烷(10ml)稀释内容物。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.187ml, 2.148mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发二恶烷以获得残质,其由制备型HPLC纯化以获得呈胶状物之N'-(2-氯-5-甲基-4-(甲基(对甲苯基)胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.317g)。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ7.82-7.62(br, 1H), 7.05(s, 1H), 6.94(m, 3H), 6.38(dd, J=11.4, 2.7Hz, 2H), 3.50-3.34(m, 2H), 3.10(s, 3H), 3.05-2.91(br, 3H), 2.17(s, 3H), 1.98(s, 3H), 1.15(t, J=6.9Hz, 3H)。

[0629] 实施例15

[0630] N'-(2-氯-4-[(2-甲氧基苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0631] 步骤A如上述实施例中所述的进行。

[0632] 步骤B:制备N'-(2-氯-4-[(2-甲氧基苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0633] 对5-氯-N1-(2-甲氧基苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.35g, 1.265mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.024g,

0.126mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,蒸发挥发物。以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.176ml,2.023mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,在高真空下蒸发二恶烷且由制备型HPLC纯化残质以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((2-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.310g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.76-7.56(br,1H),7.03-6.89(m,3H),6.81(m,1H),6.79-6.72(br,1H),6.73-6.61(m,1H),3.70(s,3H),3.47-3.34(2H),3.01(s,3H),2.99-2.88(br,3H),1.84(s,3H),1.12(t,J=7.1Hz,3H)。

[0634] 实施例16

[0635] N-[5-氯-4-({-[乙基(甲基)胺基]甲亚基}胺基)-2-甲基苯基]-N-苯基甲烷磺酰胺

[0636] 步骤A如上述实施例中所所述的进行。

[0637] 步骤B:制备N-[5-氯-4-({-[乙基(甲基)胺基]甲亚基}胺基)-2-甲基苯基]-N-苯基甲烷磺酰胺

[0638] 对N-(4-胺基-5-氯-2-甲基苯基)-N-苯基甲烷磺酰胺(0.32g,1.030mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.020g,0.103mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。在完成胺衍生物转换之后,在高真空下蒸发挥发物以获得残质。将1,4-二恶烷(10ml)加到此残质,接着室温加入N-乙基甲基胺(0.233ml,2.68mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,在高真空下蒸发二恶烷且由制备型HPLC纯化残质以获得呈胶状物之-N'-(2-氯-5-甲基-4-(N-苯基甲基磺酰胺基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.07g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.81-7.65(br,1H),7.61(s,1H),7.43-7.33(m,4H),7.23(td,J=5.6,2.9Hz,1H),6.95-6.87(br,1H),3.54-3.34(m,2H),3.27(s,3H),3.03-2.91(br,3H),2.20(s,3H),1.14(t,J=6.9Hz,3H)。

[0639] 实施例17

[0640] N'-(2-氯-4-[(2-氯苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0641] 步骤A如上述实施例中所所述的进行。

[0642] 步骤B:制备-N'-(2-氯-4-[(2-氯苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0643] 对5-氯-N1-(2-氯苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.31g,1.102mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.021g,0.110mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。在高真空下蒸发挥发物。以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.192ml,2.205mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,减压下蒸发二恶烷,由制备型HPLC纯化残质以获得呈浅黄色胶状物之-N'-(2-氯-4-((2-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.359g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.80-7.59(br,1H),7.40(dd,J=7.8,1.4Hz,1H),7.32-7.23(m,1H),7.11-6.99(m,2H),6.84(s,2H),3.47-3.35(m,2H),3.04(s,3H),3.02-2.87(br,3H),1.98(s,3H),1.13(t,J=6.9Hz,3H)。

[0644] 实施例18

[0645] N'-(2-氯-4-[(4-氯苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

胺

[0646] 步骤A如上述实施例中所所述的进行。

[0647] 步骤B:制备N'-(2-氯-4-[(4-氯苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0648] 对5-氯-N1-(4-氯苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.32g,1.138mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.022g,0.114mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。在完成胺转换之后,真空下移除挥发物,以1,4-二恶烷(10ml)稀释内容物,在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.198ml,2.276mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,移除二恶烷且由制备型HPLC纯化残质以获得呈胶状物之-N'-N'-(2-氯-4-((4-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.360g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.86-7.64(br,1H),7.16(dd,J=6.9,2.3Hz,2H),7.11(s,1H),7.01-6.90(br,1H),6.44(dd,J=6.9,2.3Hz,2H),3.51-3.34(m,2H),3.13(s,3H),3.04-2.92(br,3H),1.98(s,3H),1.15(t,J=6.9Hz,3H)。

[0649] 实施例19

[0650] N'-(2-氯-4-[(4-甲氧基苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0651] 步骤A如上述实施例中所所述的进行。

[0652] 步骤B:制备N'-(2-氯-4-[(4-甲氧基苯基)(甲基)胺基]-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚胺基甲酰胺

[0653] 对5-氯-N1-(4-甲氧基苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.3g,1.084mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.021g,0.108mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,在高真空下蒸发挥发物。以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.188ml,2.168mmol)。在75℃加热内容物4小时,由TLC监控。完成反应之后,蒸发二恶烷且由制备型HPLC纯化残质以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((4-甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.079g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.82-7.62(br,1H),7.03(s,1H),6.96-6.85(br,1H),6.77(dd,J=6.9,2.3Hz,2H),6.46(dd,J=6.9,2.3Hz,2H),3.65(s,3H),3.49-3.35(m,2H),3.08(s,3H),3.04-2.92(br,3H),1.99(s,3H),1.15(t,J=6.9Hz,3H)。

[0654] 实施例20

[0655] N'-(2-氯-4-((4-甲氧基-3-甲基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0656] 步骤A如上述实施例中所所述的进行。

[0657] 步骤B:制备N'-(2-氯-4-((4-甲氧基-3-甲基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0658] 对5-氯-N1-(4-甲氧基-3-甲基苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.3g,1.032mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.196g,1.032mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,蒸发挥发物以获得残质,其以1,4二恶烷(10ml)稀释。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.090ml,

1.032mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发二恶烷且由制备型HPLC纯化粗化合物以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((4-甲氧基-3-甲基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.124g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.91-7.57(br,1H),7.03(s,1H),6.98-6.83(br,1H),6.75(d,J=8.7Hz,1H),6.37(d,J=2.7Hz,1H),6.31(dd,J=8.7,2.7Hz,1H),3.68(s,3H),3.51-3.37(m,2H),3.07(s,3H),3.05-2.90(br,3H),2.05(s,3H),1.98(s,3H),1.15(t,J=6.9Hz,3H)。

[0659] 实施例21

[0660] N'-(2-氯-4-((3,4-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0661] 步骤A如上述实施例中所所述的进行。

[0662] 步骤B:制备N'-(2-氯-4-((3,4-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0663] 对5-氯-N1-(3,4-二甲氧基苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.24g,0.782mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.015g,0.078mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下蒸发挥发物。以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.122ml,1.408mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发二恶烷且由制备型HPLC纯化残质以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((3,4-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.192g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.82-7.59(br,1H),7.05(s,1H),6.95-6.84(br,1H),6.75(d,J=8.7Hz,1H),6.19(d,J=2.7Hz,1H),5.95(dd,J=8.7,2.7Hz,1H),3.64(s,3H),3.63(s,3H),3.50-3.34(br,2H),3.10(s,3H),3.04-2.88(br,3H),1.99(s,3H),1.14(t,J=6.9Hz,3H)。

[0664] 实施例22

[0665] N'-(2-氯-4-((3,5-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0666] 步骤A如上述实施例中所所述的进行。

[0667] 步骤B:制备N'-(2-氯-4-((3,5-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0668] 对5-氯-N1-(3,5-二甲氧基苯基)-N-1,2-二甲基苯-1,4-二胺(0.28g,0.913mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.017g,0.091mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下蒸发挥发物。以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.143ml,1.643mmol)。在75℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发二恶烷且由制备型HPLC纯化以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((3,5-二甲氧基苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.267g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.83-7.61(br,1H),7.06(s,1H),6.96-6.86(1H),5.87(s,1H),5.58(s,2H),3.63(s,6H),3.51-3.34(m,2H),3.10(s,3H),3.04-2.87(br,3H),1.99(s,3H),1.14(t,J=6.6Hz,3H)。

[0669] 实施例23

[0670] N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物

[0671] 步骤A如上述实施例中所述的进行。

[0672] 步骤B:制备N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物

[0673] 对N1-(3-甲氧基苯基)-2,5-二甲基苯-1,4-二胺(0.22g,0.908mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.017g,0.091mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下蒸发挥发物。以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质。在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.158ml,1.816mmol)。在90℃加热内容物4小时。完成反应之后,蒸发二恶烷且由制备型HPLC纯化粗化合物以获得呈胶状物之N-乙基-N'-(4-((3-甲氧基苯基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物(0.235g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.70-7.49(bs,1H),6.77(s,1H),6.72(d,J=9.0Hz,2H),6.64(s,1H),6.39(d,J=9.2Hz,2H),3.63(s,3H),3.54-3.19(bs,2H),3.05(s,3H),2.91(s,3H),2.09(s,3H),1.96(s,3H),1.11(t,J=7.1Hz,3H)。

[0674] 实施例24

[0675] N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物

[0676] 步骤A如上述实施例中所述的进行。

[0677] 步骤B:制备N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物

[0678] 对N1-(4-甲氧基苯基)-N-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.31g,1.209mmol)在原甲酸三甲酯(10ml)中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.023g,0.121mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下蒸发挥发物,以1,4-二恶烷(10ml)稀释内容物,在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(0.210ml,2.419mmol)。在90℃加热内容物4小时。完成之后,移除二恶烷且由制备型HPLC,使用甲酸铵缓冲液纯化残质以获得呈浅黄色胶状物之N-乙基-N'-(4-((4-甲氧基苯基)(甲基)氨基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物(0.177g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.70-7.49(bs,1H),6.77(s,1H),6.72(d,J=9.0Hz,2H),6.64(s,1H),6.39(d,J=9.2Hz,2H),3.63(s,3H),3.54-3.19(bs,2H),3.05(s,3H),2.91(s,3H),2.09(s,3H),1.96(s,3H),1.11(t,J=7.1Hz,3H)。

[0679] 实施例25

[0680] N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0681] 步骤A:制备N'-(4-溴-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0682] 对4-溴-2-氯-5-甲基苯胺(2g,9.07mmol)在原甲酸三甲酯中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.173g,0.907mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下移除挥发物,以1,4-二恶烷(15ml)稀释内容物,在室温缓慢加入N-乙基甲基胺(2.365ml,27.2mmol)。在90℃加热内容物4小时。完成反应之后,移除二恶烷且由急速管柱层析法,使用乙酸乙酯:己烷作为冲提液纯化以获得呈浅棕色胶状物之N'-(4-溴-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(2.2g)。LCMS(M+H) 289.60。

[0683] 步骤B:N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)氨基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0684] 对N'-(4-溴-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.521g,

1.800mmol)、2-氟苯胺(0.2g,1.800mmol)、BINAP(0.112g,0.180mmol)、碳酸铯(1.290g,3.96mmol)在甲苯中之搅拌溶液除气15分钟且加入乙酸钡(II)(0.061g,0.090mmol)并进一步除气15更多分钟且在110℃加热内容物8小时。完成反应之后,通过硅钙石过滤内容物,由急速管柱层析法纯化以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((2-氟苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.1318g)。¹H-NMR(400MHz,氯仿-D) δ 7.60-7.36(br,1H),7.23(s,1H),7.11-7.01(m,1H),6.96(t,J=7.6Hz,1H),6.73-6.85(m,3H),5.38(s,1H),3.68-3.22(2H),3.08(s,3H),2.19(s,3H),1.25(t,J=7.2Hz,3H)。

[0685] 实施例26

[0686] N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0687] 步骤A如实施例1中所述进行。

[0688] 步骤B:N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0689] 对3-氯苯胺(1g,7.84mmol)N'-(4-溴-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(2.270g,7.84mmol)、BINAP(0.488g,0.784mmol)、碳酸铯(7.66g,23.52mmol)在甲苯中之搅拌溶液除气15分钟且加入乙酸钡(II)(0.264g,0.392mmol)并进一步除气15更多分钟且在110℃加热内容物8小时。完成反应之后,通过硅钙石过滤内容物,由急速管柱层析法纯化以获得呈胶状物之N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.8g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ 7.73(bs,1H),7.66(s,1H),7.10-7.14(m,1H),7.07(s,1H),6.88(s,1H),6.70-6.63(m,1H),6.58-6.60(m,2H),3.50-3.33(2H),3.04-2.86(3H),2.08(s,3H),1.13(t,J=7.0Hz,3H)。

[0690] 实施例27

[0691] N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物

[0692] 步骤A:制备N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(化合物53)

[0693] 在0℃对来自实施例26的化合物52(0.3g,0.892mmol)、氢化钠(0.043g,1.784mmol)在DMF中之搅拌溶液,加入碘甲烷(0.112ml,1.784mmol)且在室温搅拌2小时。完成反应之后,将反应混合物倒入碎冰中且以乙酸乙酯稀释。以盐水洗涤分离之有机层,以无水硫酸钠干燥。在高真空下蒸发以获得残质,其由制备型HPLC纯化以获得呈浅黄色胶状物之N'-(2-氯-4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-5-甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲酰亚胺化物(0.249g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ 7.83-7.61(1H),7.10-7.14(m,2H),6.95(s,1H),6.63-6.66(m,1H),6.35-6.40(m,2H),3.34-3.45(m,2H),3.13(s,3H),3.05-2.87(3H),1.97(s,3H),1.14(t,J=6.9Hz,3H)。

[0694] 实施例28

[0695] N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺

[0696] 步骤A如实施例1中所述进行。

[0697] 步骤B:制备N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((N-吗啉基亚甲基)胺基)苯胺

[0698] 对N1-(3-氯苯基)-N-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.3g,1.150mmol)在原甲酸三甲酯中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.010g,0.053mmol)且在氮氛围下

105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下移除挥发物。以1,4-二恶烷(10ml)稀释残质,在室温缓慢加入吗啡(0.200ml,2.301mmol)。在90℃加热内容物4小时。完成反应之后,移除二恶烷且由制备型HPLC纯化以获得呈浅黄色胶状物之N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((N-吗啡基亚甲基)胺基)苯胺(0.277g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.69(s,1H),7.07-7.11(m,1H),6.85(s,1H),6.75(s,1H),6.65-6.54(1H),6.34-6.36(m,2H),3.61-3.63(m,4H),3.59-3.38(m,4H),3.11(s,3H),2.11(s,3H),1.96(s,3H)。

[0699] 实施例29

[0700] N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((哌啶-1-基亚甲基)胺基)苯胺

[0701] 步骤A如实施例1中所述进行。

[0702] 步骤B:N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((哌啶-1-基亚甲基)胺基)苯胺

[0703] 对N1-(3-氯苯基)-N-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.3g,1.150mmol)在原甲酸三甲酯中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.015g,0.079mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下移除挥发物,以1,4-二恶烷(10ml)稀释内容物,在室温缓慢加入哌啶(0.228ml,2.301mmol)。在90℃加热内容物4小时,由TLC监控。完成之后,移除二恶烷且由制备型HPLC,使用甲酸铵缓冲液纯化以获得呈灰白色胶状物之N-(3-氯苯基)-N,2,5-三甲基-4-((哌啶-1-基亚甲基)胺基)苯胺(0.231g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.61(s,1H),7.12-7.04(m,1H),6.83(s,1H),6.71(s,1H),6.58-6.60(m,1H),6.34-6.36(m,2H),3.64-3.33(4H),3.11(s,3H),2.11(s,3H),1.95(s,3H),1.59-1.62(m,2H),1.48-1.54(m,4H)。

[0704] 实施例30

[0705] N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-氰基甲酰亚胺化物

[0706] 步骤A如实施例1中所述进行。

[0707] 步骤B:N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-氰基甲酰亚胺化物

[0708] 对N1-(3-氯苯基)-N-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.3g,1.150mmol)在原甲酸三甲酯中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.02g,0.105mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下移除溶剂,以1,4-二恶烷(10ml)稀释内容物。在室温缓慢加入氰胺(0.1g,2.379mmol)。在90℃加热内容物4小时。完成反应之后,移除二恶烷且由制备型HPLC,使用甲酸铵缓冲液纯化以获得呈灰白色固体之N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-氰基甲酰亚胺化物(0.172g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ11.09-10.13(1H),8.81-8.49(1H),7.38(d,J=41.7Hz,1H),7.10-7.14(m,1H),7.05(d,J=13.8Hz,1H),6.66(d,J=7.3Hz,1H),6.46-6.39(1H),6.39-6.31(1H),3.14(3H),2.19(3H),2.01(s,3H)。

[0709] 实施例31

[0710] N-烯丙基-N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物

[0711] 步骤A如实施例1中所述进行。

[0712] 步骤B:N-烯丙基-N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物

[0713] 对N1-(3-氯苯基)-N-1,2,5-三甲基苯-1,4-二胺(0.3g,1.150mmol)在原甲酸三甲

酯中之搅拌溶液,加入催化性量的对甲苯磺酸单水合物(0.02g,0.105mmol)且在氮氛围下105℃中加热反应内容物2小时。完成反应之后,真空下移除溶剂,以1,4-二恶烷(10ml)稀释内容物,在室温缓慢加入N-烯丙基甲基胺(0.205g,2.88mmol)。在90℃加热内容物4小时。完成之后,移除二恶烷且由制备型HPLC,使用甲酸铵缓冲液纯化以获得呈浅棕色胶状物之N-烯丙基-N'-(4-((3-氯苯基)(甲基)胺基)-2,5-二甲基苯基)-N-甲基甲酰亚胺化物(0.227g)。¹H-NMR(400MHz,DMSO-d₆) δ7.69(s,1H),7.07-7.11(m,1H),6.84(s,1H),6.72(s,1H),6.58-6.61(m,1H),6.35(t,J=2.3Hz,2H),5.94-5.77(1H),5.18-5.23(m,2H),4.13-3.78(2H),3.11(s,3H),2.90(bs,3H),2.11(s,3H),1.96(s,3H)。

[0714] 如本文所述,通式(I)之化合物显示极高杀真菌活性,其对许多攻击重要农业作物之植物病原真菌运用。评估本发明化合物对下述之一或多种的活性:

[0715] 生物测试实施例(活体外测试)

[0716] 实施例1:稻瘟病菌(*Pyricularia oryzae*) (稻热病):将化合物溶解于0.3%DMSO且然后在分配到培养皿之前加到马铃薯葡萄糖洋菜培养基。将有化合物的5ml培养基分配到60mm无菌培养盘。固化之后,每盘都种有5mm尺寸取自积极生长的剧毒培养盘周边之菌丝片。在25℃温度及60%相对湿度的生长箱中培育盘7天且测量放射状生长。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时,300ppm之化合物1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、13、16、18、20、24、25、26、27、28、29、30、31、33、34、35、36、38、39、40、42、43、44、45、46、47、48、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、110、111、112、113、115、116、117、118、119、121、122、123、125、126、129、130、131、133、134、135、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、176、177、178、180、181、182、184、185、186、187、188、189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、199、200、201、202、203、205、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、217、218、219、220、221、222、223、224、227、228、229&230在这些测试中给予70至100%控制。

[0717] 实施例2:立枯丝核菌(水稻纹枯病(rice sheath blight)/马铃薯黑痣病(potato black scurf)):将化合物溶解于0.3%DMSO且之后在分配到培养皿之前加到马铃薯葡萄糖洋菜培养基。将有化合物的5ml培养基分配到60mm无菌培养盘。固化之后,每盘都种有5mm尺寸取自积极生长的剧毒培养盘周边之菌丝片。在25℃温度及60%相对湿度的生长箱中培育盘7天且测量放射状生长。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时,300ppm之化合物1、2、3、4、6、7、8、9、10、11、13、14、15、16、18、19、20、21、24、25、26、27、29、30、31、33、34、35、36、38、39、40、42、43、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、70、71、72、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、135、137、139、140、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、173、176、177、180、181、184、185、186、187、188、190、191、192、195、197、198、199、201、202、205、206、207、208、

209、210、211、212、213、214、219、220、221、222、228、229&230在这些测试中给予70至100%控制。

[0718] 实施例3:灰色葡萄孢菌(灰霉菌):将化合物溶解于0.3%DMSO且之后在分配到培养皿之前加到马铃薯葡萄糖洋菜培养基。将有化合物的5ml培养基分配到60mm无菌培养盘。固化之后,每盘都种有5mm尺寸取自积极生长的剧毒培养盘周边之菌丝片。在22℃温度及90%相对湿度的生长箱中培育盘7天且测量放射状生长。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时,300ppm之化合物1、2、3、4、8、9、18、19、33、34、35、38、40、46、47、48、52、53、54、55、57、58、59、60、61、62、63、64、70、72、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、86、87、88、89、93、94、95、97、98、99、100、101、103、104、105、106、107、108、110、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、129、130、133、135、142、143、144、145、146、148、149、150、151、152、153、155、156、157、158、159、160、161、162、166、167、168、169、173、177、181、186、187、197、199、206、207、209、210、211、212、213、214、217、218、219、220、221、223、225、229&230在这些测试中给予70至100%。

[0719] 实施例4:茄链隔孢菌(番茄/马铃薯之早疫病):将化合物溶解于0.3%DMSO且之后在分配到培养皿之前加到马铃薯葡萄糖洋菜培养基。将有化合物的5ml培养基分配到60mm无菌培养盘。固化之后,每盘都种有5mm尺寸取自积极生长的剧毒培养盘周边之菌丝片。在25℃温度及60%相对湿度的生长箱中培育盘7天且测量放射状生长。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时,300ppm之化合物1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、15、16、18、19、20、21、22、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、110、112、115、116、117、118、119、121、123、125、126、127、128、129、130、131、132、133、135、137、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、155、156、157、158、159、160、161、163、164、165、166、167、168、169、170、171、173、176、177、180、181、184、185、186、187、188、189、190、191、192、193、195、196、197、198、199、200、201、202、205、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、229&230在这些测试中给予70至100%控制。

[0720] 实施例5:辣椒炭疽病菌(*Colletotrichum capsici*) (炭疽病):将化合物溶解于0.3%DMSO且之后在分配到培养皿之前加到马铃薯葡萄糖洋菜培养基。将有化合物的5ml培养基分配到60mm无菌培养盘。固化之后,每盘都种有5mm尺寸取自积极生长的剧毒培养盘周边之菌丝片。在25℃温度及60%相对湿度的生长箱中培育盘7天且测量放射状生长。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时,300ppm之化合物2、3、4、7、8、9、11、15、18、19、24、25、26、27、29、31、32、33、34、35、36、38、39、40、43、44、46、48、51、52、53、54、55、57、58、59、60、61、62、63、64、66、71、72、74、75、76、77、79、80、82、83、85、86、88、89、92、93、95、96、97、98、99、100、102、104、106、110、111、112、113、116、117、118、119、121、123、125、126、127、129、131、133、135、141、142、144、145、146、147、148、149、151、152、155、156、157、158、159、160、161、162、166、167、168、169、170、171、173、176、180、181、184、185、186、190、191、195、197、198、199、202、205、206、207、209、210、211、212、213、217、218、219、220、221、222、225&

230在这些测试中给予70至100%控制。

[0721] 实施例6: 番茄壳针孢 (*Septoria lycopersici*) (番茄之叶斑): 将化合物溶解于0.3%DMSO且之后在分配到培养皿之前加到马铃薯葡萄糖洋菜培养基。将有化合物的5ml培养基分配到60mm无菌培养盘。固化之后, 每盘都种有5mm尺寸取自积极生长的剧毒培养盘周边之菌丝片。在25℃温度及70%相对湿度的生长箱中培育盘7天且测量放射状生长。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时, 300ppm之化合物1、2、3、4、6、7、8、9、11、13、15、16、18、19、20、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、43、44、45、46、47、48、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、66、72、77、86、89、98、99、102、106、110、112、116、119、123、125、126、129、135、145、148、155、166、158、159、160、161、166、167、168、169、171、173、180、184、186、188、190、191、194、195、197、198、199、202、205、206、207、208、209、211、212、213、214、217、218、219、220、221、222、223、224、225&230在这些测试中给予80至100%控制。

[0722] 实施例7: 禾秆镰孢菌谷类之基腐病: 将化合物溶解于0.3%DMSO且之后在分配到培养皿之前加到马铃薯葡萄糖洋菜培养基。将有化合物的5ml培养基分配到60mm无菌培养盘。固化之后, 每盘都种有5mm尺寸取自积极生长的剧毒培养盘周边之菌丝片。在25℃温度及60%相对湿度的生长箱中培育盘7天且测量放射状生长。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时, 300ppm之化合物1、7、8、26、27、29、31、35、38、39、40、45、52、53、54、55、57、58、59、60、61、62、64、66、71、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、89、102、104、106、116、117、119、121、123、125、126、129、145、147、148、151、153、155、156、158、159、160、161、166、168、170、172、181、197、205、206、209、210、213、220&221在这些测试中给予70至100%控制。

[0723] 生物测试实施例(温室)

[0724] 实施例A: 稻米中的稻瘟病菌 (*Pyricularia oryzae*) 测试

[0725] 将化合物溶解于2%DMSO/丙酮之后与水混合以校正50ml的喷洒体积。此50ml喷洒溶液溶液倒到喷洒瓶用于进一步施用。

[0726] 为了测试化合物的预防性活性, 使用空心锥形喷嘴在喷洒柜内用规定的施用率以活性化合物制品喷洒养在温室的健康年轻稻米幼苗/植物。处理后一天, 以含有 1.4×10^6 个稻瘟病菌 (*Pyricularia oryzae*) 接种物之孢子悬浮液(无菌水)接种植物。之后将经接种的植物维持在24℃温度及95%相对湿度之温室间供疾病表现。

[0727] 通过在施用后第3、7、10和15天对经处理的植物评级疾病严重性(0-100%等级)来进行化合物效能的视觉评估。化合物的效力(%控制)通过比较治疗中的疾病评级与未处理的控制组来计算。通过记录症状像坏死、黄化和发育不良, 亦评估经喷洒的植物对于化合物的植物毒性效果。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时, 500ppm之化合物54、58、80、129、138&152在这些测试中给予70至100%控制。这些化合物无一对稻米作物显示任何植物毒性。

[0728] 实施例B: 在小麦之禾秆镰孢菌测试

[0729] 将化合物溶解于2%DMSO/丙酮之后与水混合以校正50ml的喷洒体积。此50ml喷洒溶液溶液倒到喷洒瓶用于进一步施用。

[0730] 为了测试化合物的预防性活性, 使用空心锥形喷嘴在喷洒柜内用规定的施用率以

活性化合物制品喷洒养在温室之健康年轻小麦植物。处理后一天,以含有 2×10^6 个禾秆镰孢菌接种物之孢子悬浮液(2%麦芽)接种植物。之后将经接种的植物维持在24℃温度及80-90%相对湿度之温室间供疾病表现。

[0731] 通过在施用后第3、7、10和15天对经处理的植物评级疾病严重性(0-100%等级)来进行化合物效能的视觉评估。化合物的效力(%控制)通过比较治疗中的疾病评级与未处理的控制组来计算。通过记录症状像坏死、黄化和发育不良,亦评估经喷洒的植物对于化合物的植物毒性效果。当与显示广泛疾病发展的未经处理之检查相比时,500ppm之化合物1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、20、21、27、28、31、35、36、82、112、139、151、152、&158在这些测试中给予70至100%控制。这些化合物无一对小麦作物显示任何植物毒性。

[0732] 实施例H:在番茄之灰色葡萄孢菌测试

[0733] 化合物溶解于2%DMSO/丙酮之后与水混合以校正50ml的喷洒体积。此50ml喷洒溶液倒到喷洒瓶用于进一步施用。

[0734] 为了测试化合物的预防性活性,使用空心锥形喷嘴在喷洒柜内用规定的施用率以活性化合物制品喷洒养在温室之健康年轻豆/辣椒植物。处理后一天,以含有 1.2×10^6 个灰色葡萄孢菌接种物之孢子悬浮液(2%麦芽)接种植物。之后将经接种的植物维持在18-20℃温度及90-100%相对湿度之温室间供疾病表现。

[0735] 通过在施用后第3、7、10和15天对经处理的植物评级疾病严重性(0-100%等级)来进行化合物效能的视觉评估。化合物的效力(%控制)通过比较治疗中的疾病评级与未处理的控制组来计算。通过记录症状像坏死、黄化和发育不良,亦评估经喷洒的植物对于化合物的植物毒性效果。当与未处理相比时,500ppm之化合物1、2、3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、43、44、45、46、85、86、87、88、90、96、97、99、100、102、103、123、127、128、129、133、134、135、136、137、138、150、161、162、163&164在这些测试中给予70至100%控制。这些化合物无一对番茄作物显示任何植物毒性。

[0736] 实施例D:在番茄之茄链隔孢菌测试

[0737] 化合物溶解于2%DMSO/丙酮之后与水混合以校正50ml的喷洒体积。此50ml喷洒溶液倒到喷洒瓶用于进一步施用。

[0738] 为了测试化合物的预防性活性,使用空心锥形喷嘴在喷洒柜内用规定的施用率以活性化合物制品喷洒养在温室之健康年轻番茄植物。处理后一天,以含有 0.24×10^6 个茄链隔孢菌接种物之孢子悬浮液(2%麦芽)接种植物。之后将经接种的植物维持在22-24℃温度及90-95%相对湿度之温室间供疾病表现。

[0739] 通过在施用后第3、7、10和15天对经处理的植物评级疾病严重性(0-100%等级)来进行化合物效能的视觉评估。化合物的效力(%控制)通过比较治疗中的疾病评级与未处理的控制组来计算。通过记录症状像坏死、黄化和发育不良,亦评估经喷洒的植物对于化合物的植物毒性效果。当与未处理相比时,500ppm之化合物1、2、3、5、6、8、12、13、14、15、16、17、18、19、20、22、23、24、25、26、28、29、30、31、32、33、35、37、40、43、44、54、66、67、75、88、89、116、117、118、119、123、124、125、129、130、131、132、139、143、148、156、157&158在这些测试中给予70至100%控制。这些化合物无一对番茄作物显示任何植物毒性。

[0740] 实施例E:测试在番茄之Corynespora corrica

[0741] 化合物溶解于2%DMSO/丙酮之后与水混合以校正50ml的喷洒体积。此50ml喷洒溶液溶液倒到喷洒瓶用于进一步施用。

[0742] 为了测试化合物的预防性活性,使用空心锥形喷嘴在喷洒柜内用规定的施用率以活性化合物制品喷洒养在温室之健康年轻番茄植物。处理后一天,以含有 2.6×10^6 个 *Corynespora corrica* 接种物之孢子悬浮液(tween 20水溶液)接种植物。之后将经接种的植物维持在22-24℃温度及90-95%相对湿度之温室间供疾病表现。

[0743] 通过在施用后第3、7、10和15天对经处理的植物评级疾病严重性(0-100%等级)来进行化合物效能的视觉评估。化合物的效力(%控制)通过比较治疗中的疾病评级与未处理的控制组来计算。通过记录症状像坏死、黄化和发育不良,亦评估经喷洒的植物对于化合物的植物毒性效果。

[0744] 当与未处理相比时,500ppm之化合物1、3、13、14、15、16、17、18、19、20&22在这些测试中给予70至100%控制。这些化合物无一对番茄作物显示任何植物毒性。

[0745] 已经参照某些较佳态样描述本发明,考量到说明书,其他态样对于发明所属领域中具有通常知识者而言将变得显而易见。对于发明所属技术领域中具有通常知识者,显然许多修改,对材料与方法两者,可以在不偏离本发明的范畴下实施。